

【公報種別】 特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載
 【部門区分】 第 3 部門第 2 区分
 【発行日】 令和 4 年 7 月 8 日(2022.7.8)

【国際公開番号】 WO2020/010092
 【公表番号】 特表 2021-529833(P2021-529833A)
 【公表日】 令和 3 年 11 月 4 日(2021.11.4)
 【出願番号】 特願 2021-522931(P2021-522931)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 209/40(2006.01)
 A 6 1 P 43/00(2006.01)
 A 6 1 P 35/00(2006.01)
 A 6 1 P 35/02(2006.01)
 A 6 1 K 9/08(2006.01)
 A 6 1 P 37/02(2006.01)
 A 6 1 K 31/404(2006.01)
 C 0 7 D 491/052(2006.01)
 A 6 1 K 31/407(2006.01)
 C 0 7 D 487/04(2006.01)
 A 6 1 K 31/5025(2006.01)
 A 6 1 K 31/51(2006.01)
 A 6 1 K 31/4196(2006.01)
 C 0 7 D 513/04(2006.01)
 A 6 1 K 31/429(2006.01)
 C 0 7 D 495/04(2006.01)
 A 6 1 K 31/4162(2006.01)
 C 0 7 D 471/04(2006.01)
 A 6 1 K 31/437(2006.01)
 A 6 1 K 31/4545(2006.01)
 A 6 1 K 31/506(2006.01)
 A 6 1 K 31/496(2006.01)
 A 6 1 K 31/5377(2006.01)
 A 6 1 K 38/12(2006.01)
 A 6 1 K 39/395(2006.01)
 A 6 1 K 31/337(2006.01)
 A 6 1 K 31/475(2006.01)
 A 6 1 K 31/52(2006.01)
 A 6 1 K 31/7048(2006.01)
 A 6 1 K 31/277(2006.01)
 A 6 1 K 31/282(2006.01)
 C 0 7 D 305/14(2006.01)
 C 0 7 D 473/38(2006.01)
 C 0 7 H 17/04(2006.01)
 C 0 7 D 519/04(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 209/40 C S P
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 43/00 1 2 1

10

20

30

40

50

A 6 1 K 9/08
A 6 1 P 37/02
A 6 1 K 31/404
C 0 7 D 491/052
A 6 1 K 31/407
C 0 7 D 487/04 1 4 0
A 6 1 K 31/5025
A 6 1 K 31/51
C 0 7 D 487/04 1 3 9
A 6 1 K 31/4196
C 0 7 D 513/04 3 2 5
A 6 1 K 31/429
C 0 7 D 495/04 1 0 3
A 6 1 K 31/4162
C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z
A 6 1 K 31/437
C 0 7 D 471/04 1 0 6 A
C 0 7 D 471/04 1 0 6 H
A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 38/12
A 6 1 K 39/395 N
A 6 1 K 31/337
A 6 1 K 31/475
A 6 1 K 31/52
A 6 1 K 31/7048
A 6 1 K 31/277
A 6 1 K 31/282
C 0 7 D 305/14
C 0 7 D 473/38
C 0 7 H 17/04
C 0 7 D 519/04

10

20

30

40

50

【手続補正書】

【提出日】令和4年6月30日(2022.6.30)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

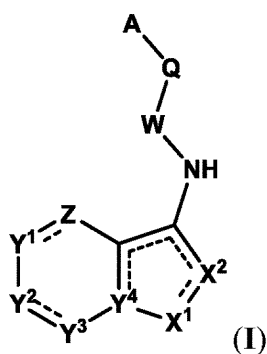
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)：



10

の化合物であって、

式 (I) 中、

Zは、結合、CR¹、C(R³)₂、N、およびNR²からなる群より選択され、

Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは、O、S、CR¹、C(R³)₂、N、およびNR²からなる群より独立して選択され、

Y⁴はCであり、

X¹は、O、S、N、NR²、およびCR¹からなる群より選択され、

X²は、CR⁵であり、

各
=

20

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、およびX²を含む5員環はヘテロアリールであり、

Wは、

(i) C(=O)、

(ii) C(=S)、

(iii) S(O)_{1~2}、

(iv) C(=NR^d)、

(v) C(=NH)、

(vi) C(=C-NO₂)、

(vii) S(O)N(R^d)、および

(viii) S(O)NH

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の (A) または (B) にしたがって定義され：

(A)

QはNHもしくはN(C_{1~6}アルキル)であり、ここで、C_{1~6}アルキルは、1~2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよく、かつ

Aは、

(i) -(YA¹)_n-YA²であって、

・nが0もしくは1であり、

・YA¹が、1~6個のR^aで置換されていてもよいC_{1~6}アルキレンであり、かつ

・YA²が、

(a) 1~4個のR^bで置換されていてもよいC_{3~20}シクロアルキル、

(b) 1~4個のR^cで置換されていてもよいC_{6~20}アリール、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくは

(d) 3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからなる群より独

40

50

立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、該ヘテロシクリルである、

該- $(YA1)_n-YA2$ 、または

(ii) - $Z1-Z2-Z3$ であって、

・ $Z1$ が、1～4個の R^a で置換されていてもよい $C1\sim3$ アルキレンであり、

・ $Z2$ が、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・ $Z3$ が、1～4個の R^a で置換されていてもよい $C2\sim7$ アルキルである、

該- $Z1-Z2-Z3$ 、または

(iii) 1～6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C1\sim10$ アルキル

である、

または、

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、



はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3～16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、

R^1 の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1～2個の R^a で置換されていてもよい $C1\sim6$ アルキル、 $C2\sim6$ アルケニル、 $C2\sim6$ アルキニル、 $C1\sim4$ ハロアルキル、 $C1\sim4$ アルコキシ、 $C1\sim4$ ハロアルコキシ、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい- $(C0\sim3$ アルキレン)- $C3\sim6$ シクロアルキル、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい- $(C0\sim3$ アルキレン)- $C6\sim10$ アリール、- $(C0\sim3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR d 、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該- $(C0\sim3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、- $(C0\sim3$ アルキレン)-5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR d 、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該- $(C0\sim3$ アルキレン)-5～10員のヘテロシクリル、-S(O) $1\sim2$ ($C1\sim4$ アルキル)、-NR e f、-OH、オキソ、-S(O) $1\sim2$ (NR' $''$)、- $C1\sim4$ チオアルコキシ、-NO 2 、-C(=O)($C1\sim4$ アルキル)、-C(=O)O($C1\sim4$ アルキル)、-C(=O)OH、ならびに-C(=O)N(R') (R' $''$)

からなる群より独立して選択され、

R^2 の各出現は、

(i) 1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C1\sim6$ アルキル、

(ii) $C3\sim6$ シクロアルキル、

(iii) 3～10個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、該ヘテロシクリル、

- (iv) -C(O) (C₁~4アルキル)、
- (v) -C(O) O (C₁~4アルキル)、
- (vi) -CON(R') (R'')、
- (vii) -S(O) 1~2 (NR'R'')、
- (viii) -S(O) 1~2 (C₁~4アルキル)、
- (ix) -OH、
- (x) C₁~4アルコキシ、ならびに
- (xi) H

からなる群より独立して選択され、

R³の各出現は、H、1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~6アルキル、C₁~4ハロアルキル、-OH、-F、-Cl、-Br、-NReR^f、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、-C(=O) (C₁~4アルキル)、-C(=O) O (C₁~4アルキル)、-C(=O) OH、-C(=O) N (R') (R'')、-S(O) 1~2 (NR'R'')、-S(O) 1~2 (C₁~4アルキル)、シアノ、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよいC₃~6シクロアルキルからなる群より独立して選択されるか、または同じ炭素上の2つのR³は組み合わさってオキソを形成し、

R⁵は、H、ハロ、C₁~4アルコキシ、OH、オキソ、およびC₁~6アルキルからなる群より選択され、

R^aの各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NReR^f、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、-C(=O) O (C₁~4アルキル)、-C(=O) (C₁~4アルキル)、-C(=O) O H、-CON(R') (R'')、-S(O) 1~2 (NR'R'')、-S(O) 1~2 (C₁~4アルキル)、シアノ、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよいC₃~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^bの各出現は、1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル、C₁~4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NReR^f、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、-C(=O) (C₁~4アルキル)、-C(=O) O (C₁~4アルキル)、-C(=O) OH、-C(=O) N (R') (R'')、-S(O) 1~2 (NR'R'')、-S(O) 1~2 (C₁~4アルキル)、シアノ、1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい(C₀~3アルキレン)-C₆~10アリアル、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい(C₀~3アルキレン)-C₃~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^cの各出現は、

- (i) ハロ、
- (ii) シアノ、
- (iii) 1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル、
- (iv) C₂~6アルケニル、
- (v) C₂~6アルキニル、
- (vi) C₁~4ハロアルキル、
- (vii) C₁~4アルコキシ、
- (viii) C₁~4ハロアルコキシ、
- (ix) 1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい-(C₀~3アルキレン)-C₃~6シクロアルキル、
- (x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀~3アルキレン)-ヘテロシクリル、
- (xi) -S(O) 1~2 (C₁~4アルキル)、
- (xii) -NReR^f、
- (xiii) -OH、
- (xiv) -S(O) 1~2 (NR'R'')、
- (xv) -C₁~4チオアルコキシ、

10

20

30

40

50

(xvi) $-\text{NO}_2$ 、
 (xvii) $-\text{C}(=\text{O})$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、
 (xviii) $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、
 (xix) $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、
 (xx) $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}')(\text{R}'')$ 、
 (xxi) 1～4個の独立して選択される $\text{C}_1\sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($\text{C}_0\sim 3$ アルキレン)- $\text{C}_6\sim 10$ アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、 NR^d 、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択される $\text{C}_1\sim 4$ アルキルで置換されていてもよい、- ($\text{C}_0\sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリール

10

からなる群より独立して選択され、

R^d は、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim 6$ シクロアルキル、 $-\text{C}(\text{O})$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{CON}(\text{R}')(\text{R}'')$ 、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{NR}'\text{R}'')$ 、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、および $\text{C}_1\sim 4$ アルコキシからなる群より選択され、

R^e および R^f の各出現は、H、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim 6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim 6$ シクロアルキル、 $-\text{C}(\text{O})$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{CON}(\text{R}')(\text{R}'')$ 、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{NR}'\text{R}'')$ 、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{OH}$ 、および $\text{C}_1\sim 4$ アルコキシからなる群より独立して選択されるか、または R^e および R^f は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $\text{C}_1\sim 3$ アルキルからなる群より独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) $\text{N}(\text{R}^d)$ 、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子 (R^e および R^f に結合した窒素原子に加えて) とを含み、

20

R^g の各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1\sim 4$ ハロアルキル、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim 6$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim 4$ ハロアルコキシ、 $\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $-\text{OH}$ 、オキソ、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{NR}'\text{R}'')$ 、 $-\text{C}_1\sim 4$ チオアルコキシ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ ($\text{C}_1\sim 4$ アルキル)、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、および $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}')(\text{R}'')$ からなる群より独立して選択され、

30

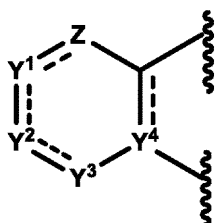
かつ、

R' および R'' の各出現は、Hおよび $\text{C}_1\sim 4$ アルキルからなる群より独立して選択されるか、または R' および R'' は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $\text{C}_1\sim 3$ アルキルからなる群より独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) $\text{N}(\text{R}^d)$ 、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子 (R' および R'' に結合した窒素原子に加えて) とを含み、

但し、以下のa)、b)、およびc)のうちの1つまたは複数が該当し：

a) 以下の環：

40



におけるZ、Y1、Y2、およびY3のうちの1つもしくは複数は、独立して選択されるヘテロ原子である、

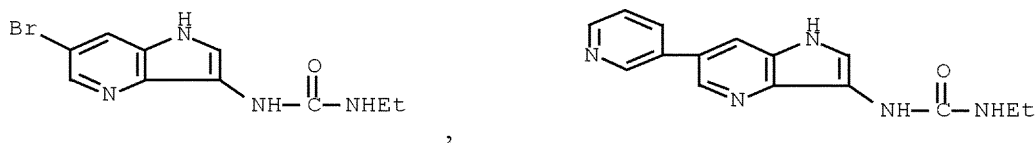
b) Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む該環は部分的に不飽和である、または

50

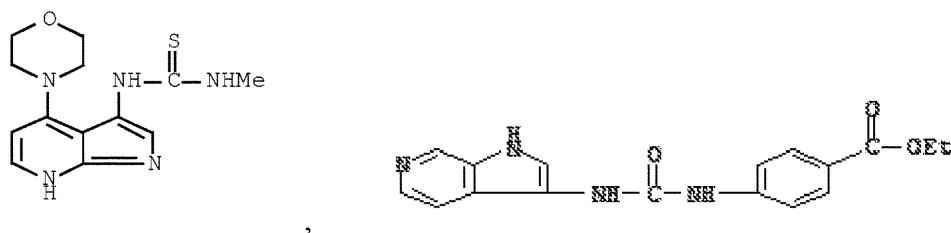
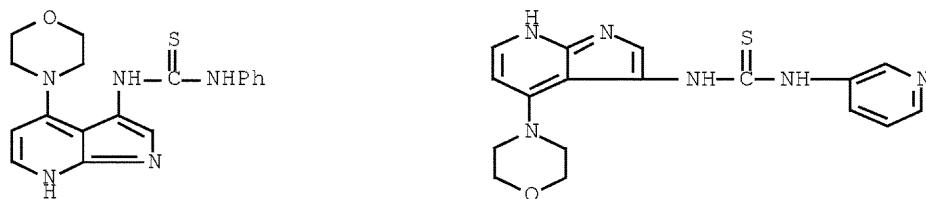
c) Zは結合である、

さらに、但し、Q-Aが(A)にしたがって定義され、Aが、パラ位においてC₄アルキルで一置換されているC₆アリールであり、かつZ、Y₁、Y₂、Y₃、およびY₄を含む該環が芳香族である場合、Z、Y₁、Y₂、Y₃、およびY₄を含む該環は、水素以外の1つまたは複数のR¹で置換されていなければならない、かつ

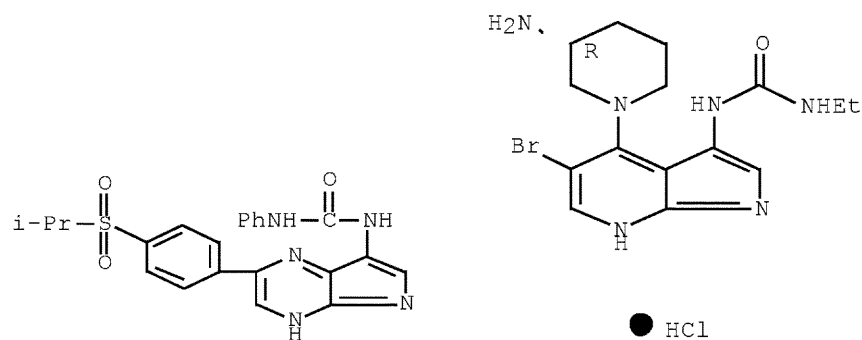
さらに、但し、該化合物は、



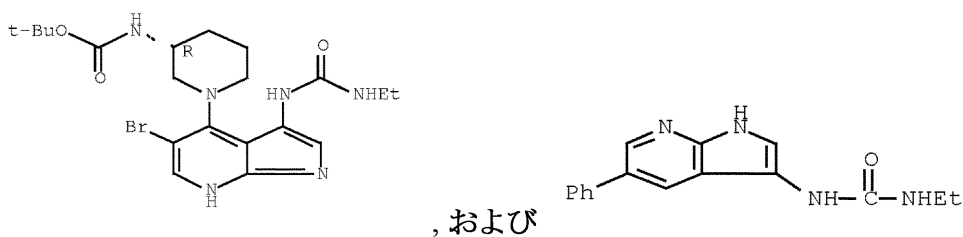
10



20



30



40

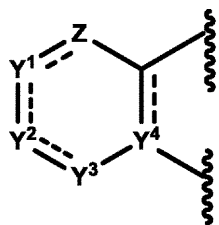
からなる群より選択されない、

該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

【請求項2】

Z、Y₁、Y₂、Y₃、およびY₄を含む環：

50



が芳香族である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

Zが結合以外である、請求項1記載の化合物。

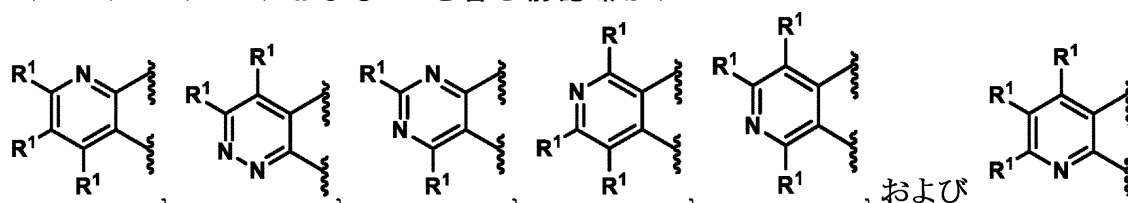
10

【請求項4】

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4のうちの1～2つが独立してNである、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む前記環が、



20

からなる群より選択され、各



が、X1およびX2を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の



がX1への結合点を表す、

請求項1記載の化合物。

30

【請求項6】

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む前記環が部分的に不飽和である、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

X1が、NHである、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

WがC(=O)である、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

QおよびAが(A)にしたがって定義される、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

40

Aが-(YA1)_n-YA2である、請求項9記載の化合物。

【請求項11】

YA1がC₁～3アルキレンであり、任意で、YA1がCH₂またはCH₂CH₂である、請求項10記載の化合物。

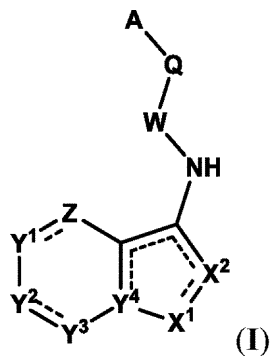
【請求項12】

YA2が、1～4個のR^Cで置換されていてもよいC₆～20アリールであるか、または、YA2が、5～20個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR^Cで置換されていてもよい、請求項10記載の化合物。

50

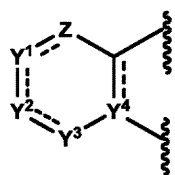
【請求項 13】

式 (I) :



10

の化合物であって、
式 (I) 中、
以下の環：



20

におけるZ、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるヘテロ原子であり、

Zは、CR¹およびNからなる群より選択され、

Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは、CR¹およびNからなる群より独立して選択され、

但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるCR¹であり、

Y⁴はCであり、

X¹はNHであり、

X²はCHであり、

各

30

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、およびX²を含む5員環はヘテロアリアルであり、かつ

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は芳香族であり、

Wは、

(i) C(=O)、

(ii) C(=S)、

(iv) C(=NR^d)、および

(v) C(=NH)

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され：

(A)

QはNHもしくはN(C₁~6アルキル)であり、ここで、C₁~6アルキルは、1~2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよく、かつ

Aは、

(i) -(YA¹)_n-YA²であって、

・nが0もしくは1であり、

40

50

- ・YA1が、1～6個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキレンであり、かつ
- ・YA2が、
 - (a) 1～4個のR^bで置換されていてもよいC₃～20シクロアルキル、
 - (b) 1～4個のR^cで置換されていてもよいC₆～20アリール、
 - (c) 5～20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくは
 - (d) 3～16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、該ヘテロシクリル

10

該-(YA1)_n-YA2、または

- (ii) -Z¹-Z²-Z³であって、
 - ・Z¹が、1～4個のR^aで置換されていてもよいC₁～3アルキレンであり、
 - ・Z²が、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ
 - ・Z³が、1～4個のR^aで置換されていてもよいC₂～7アルキルである、

該-Z¹-Z²-Z³、または

- (iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル
- である、

20

または

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、

30

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3～16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、

R¹の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1～2個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシク

40

50

リル、 $-S(O)_{1\sim2}(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-NR^eR^f$ 、 $-OH$ 、オキソ、 $-S(O)_{1\sim2}(NR'R'')$ 、 $-C_1\sim4\text{チオアルコキシ}$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)O(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、ならびに $-C(=O)N(R')(R'')$

からなる群より独立して選択され、

R^a の各出現は、 $-OH$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-NR^eR^f$ 、 $C_1\sim4\text{アルコキシ}$ 、 $C_1\sim4\text{ハロアルコキシ}$ 、 $-C(=O)O(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-CON(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、シアノ、および1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい $C_3\sim6\text{シクロアルキル}$ からなる群より独立して選択され、

R^b の各出現は、1~6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1\sim10\text{アルキル}$ 、 $C_1\sim4\text{ハロアルキル}$ 、 $-OH$ 、オキソ、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-NR^eR^f$ 、 $C_1\sim4\text{アルコキシ}$ 、 $C_1\sim4\text{ハロアルコキシ}$ 、 $-C(=O)(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)O(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)N(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、シアノ、1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい($C_0\sim3\text{アルキレン}$) $-C_6\sim10\text{アリール}$ 、および1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい($C_0\sim3\text{アルキレン}$) $-C_3\sim6\text{シクロアルキル}$ からなる群より独立して選択され、

R^c の各出現は、

- (i) ハロ、
- (ii) シアノ、
- (iii) 1~6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1\sim10\text{アルキル}$ 、
- (iv) $C_2\sim6\text{アルケニル}$ 、
- (v) $C_2\sim6\text{アルキニル}$ 、
- (vi) $C_1\sim4\text{ハロアルキル}$ 、
- (vii) $C_1\sim4\text{アルコキシ}$ 、
- (viii) $C_1\sim4\text{ハロアルコキシ}$ 、
- (ix) 1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい $-(C_0\sim3\text{アルキレン})-C_3\sim6\text{シクロアルキル}$ 、
- (x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、 N 、 $N(H)$ 、 $N(R^d)$ 、および O からなる群より独立して選択される、 $-(C_0\sim3\text{アルキレン})-\text{ヘテロシクリル}$ 、
- (xi) $-S(O)_{1\sim2}(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、
- (xii) $-NR^eR^f$ 、
- (xiii) $-OH$ 、
- (xiv) $-S(O)_{1\sim2}(NR'R'')$ 、
- (xv) $-C_1\sim4\text{チオアルコキシ}$ 、
- (xvi) $-NO_2$ 、
- (xvii) $-C(=O)(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、
- (xviii) $-C(=O)O(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、
- (xix) $-C(=O)OH$ 、
- (xx) $-C(=O)N(R')(R'')$ 、ならびに
- (xxi) 1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい $-(C_0\sim3\text{アルキレン})-C_6\sim10\text{アリール}$ 、ならびに
- (xxii) ヘテロアリールの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、 N 、 NH 、 NR^d 、 O 、および S からなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択される $C_1\sim4\text{アルキル}$ で置換されていてもよい、 $-(C_0\sim3\text{アルキレン})-5\sim10\text{員のヘテロアリール}$

からなる群より独立して選択され、

R^d は、 $C_1\sim6\text{アルキル}$ 、 $C_3\sim6\text{シクロアルキル}$ 、 $-C(O)(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-C(O)O(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、 $-CON(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim2}(C_1\sim4\text{アルキル})$ 、

10

20

30

40

50

～2 (C₁～4アルキル)、-OH、-CN、およびC₁～4アルコキシからなる群より選択され、

R^eおよびR^fの各出現は、H、C₁～6アルキル、C₁～6ハロアルキル、C₃～6シクロアルキル、-C(O)(C₁～4アルキル)、-C(O)O(C₁～4アルキル)、-CON(R') (R'['])、-S(O)₁～2(NR'R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-OH、およびC₁～4アルコキシからなる群より独立して選択されるか、またはR^eおよびR^fは、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルより独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R^eおよびR^fに結合した窒素原子に加えて)とを含み、

R^gの各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)₁～2(NR'R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R') (R'')からなる群より独立して選択され、かつ、

R'およびR''の各出現は、HおよびC₁～4アルキルからなる群より独立して選択されるか、またはR'およびR''は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルより独立して選択される、1～2個の置換基でそれぞれが置換されている1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R'およびR''に結合した窒素原子に加えて)とを含み、

但し、Q-Aが(A)にしたがって定義され、Aが、パラ位においてn-ブチルなどのC₄アルキルで一置換されているC₆アリールである場合、Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は、水素以外の1つまたは複数のR¹で置換されていなければならない、かつさらに、但し、該化合物は、

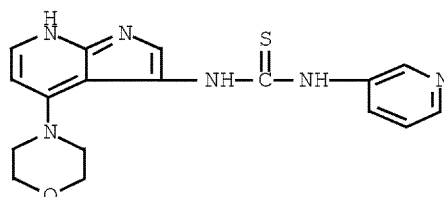
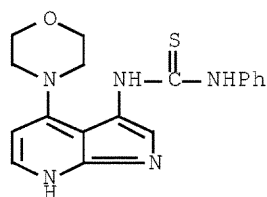
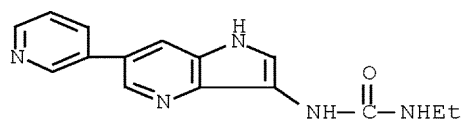
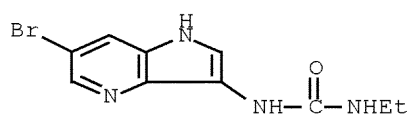
10

20

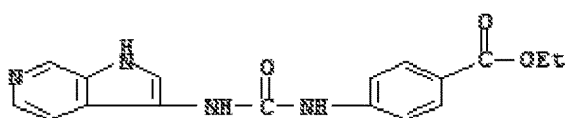
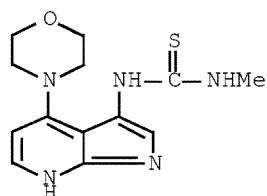
30

40

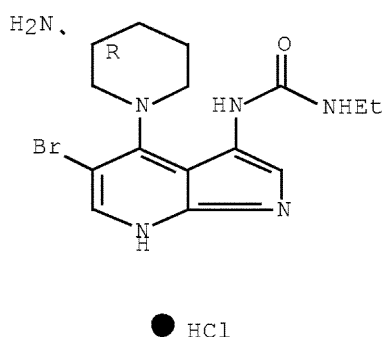
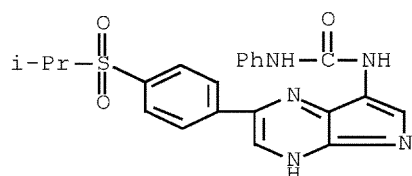
50



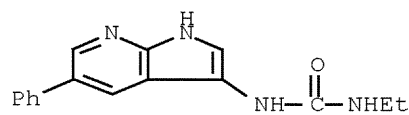
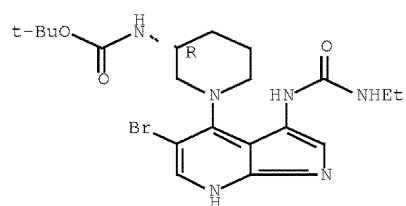
10



20



30



, および

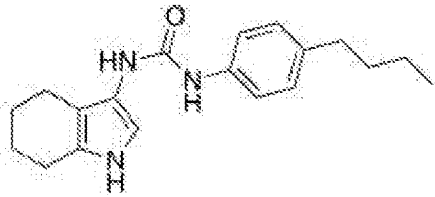
のうちの1つ以外または複数以外である、
該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

40

【請求項14】

以下の化合物：

50

化合物#	最終構造
100	 <chem>CCCC1=CC=C(NC(=O)c2c[nH]c3ccccc23)C=C1</chem>

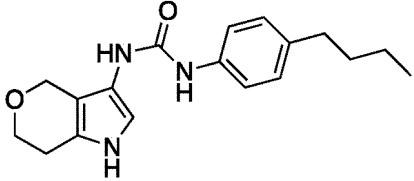
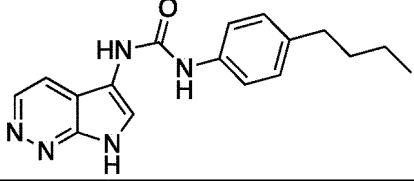
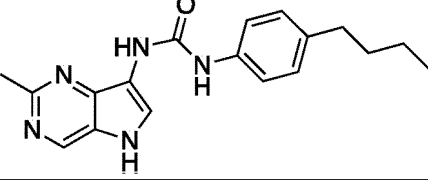
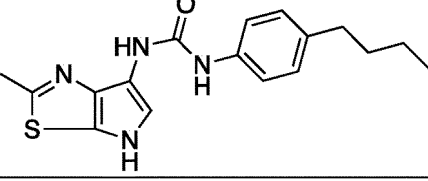
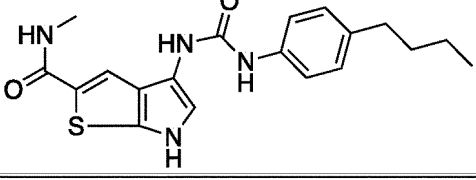
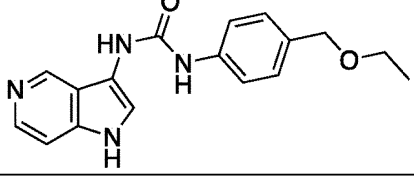
10

20

30

40

50

102	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2OCC3)cc1</chem>
103	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2nnc3)cc1</chem>
104	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2nnc3C)cc1</chem>
106	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2nnc3C)cc1</chem>
107	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2c[nH]c3C(=O)N)cc1</chem>
109	 <chem>CCOCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3c2nnc3)cc1</chem>

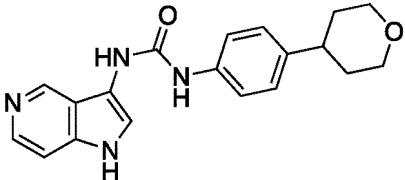
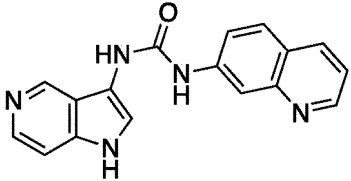
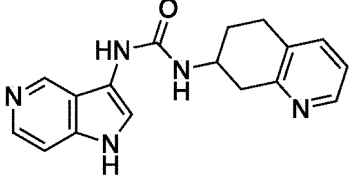
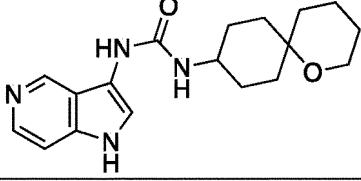
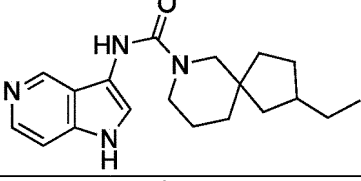
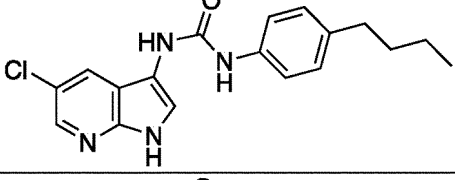
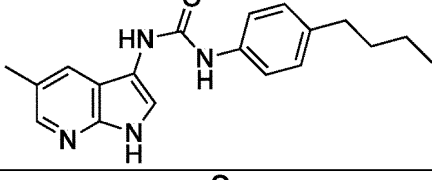
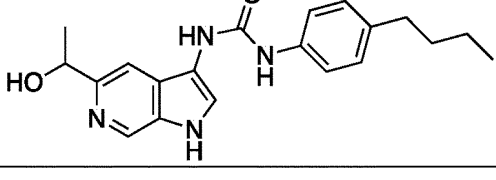
10

20

30

40

50

110	
111	
112	
113	
114	
115	
116	
117	

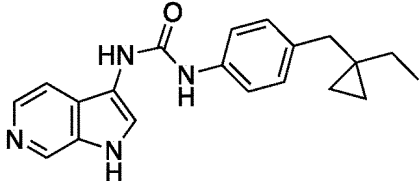
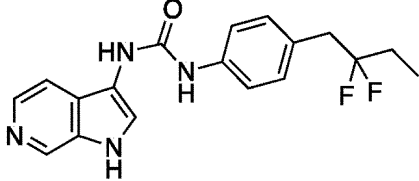
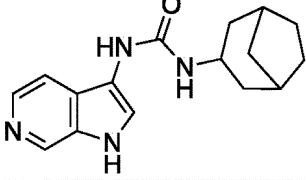
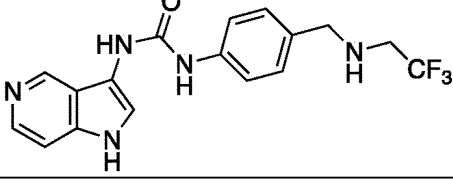
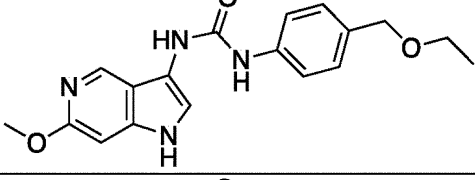
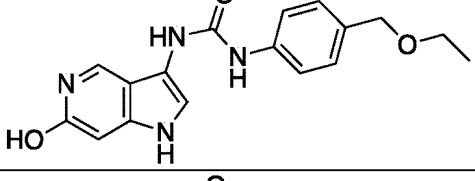
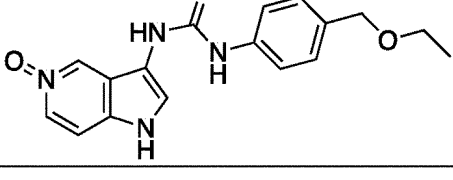
10

20

30

40

50

118	
119	
120	
121	
122	
123	
124	

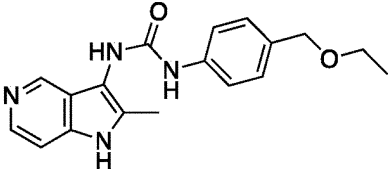
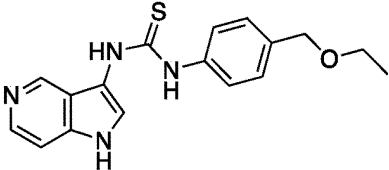
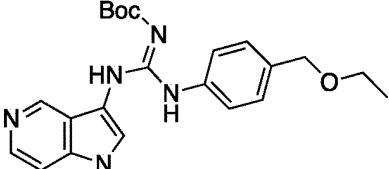
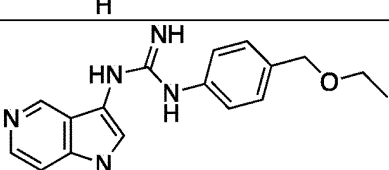
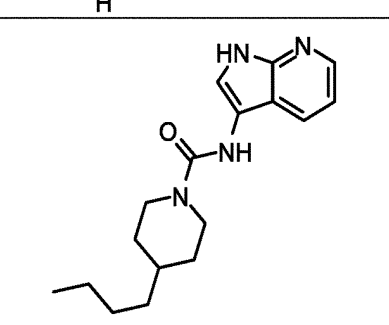
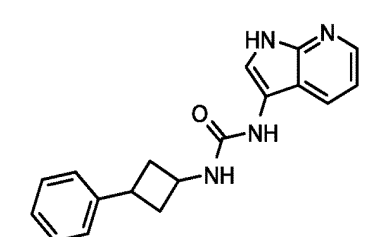
10

20

30

40

50

127	
129	
130	
131	
132	
133	

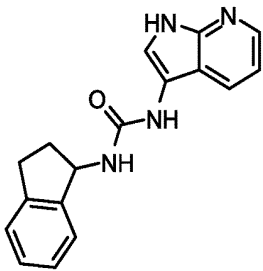
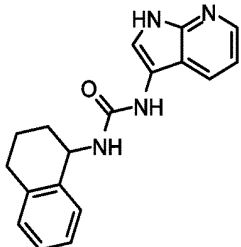
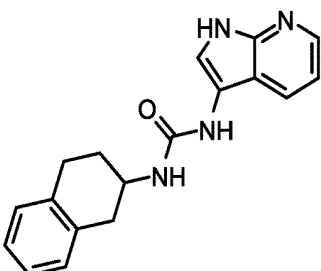
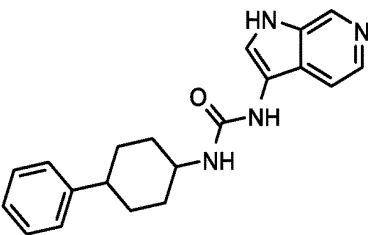
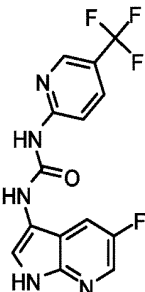
10

20

30

40

50

134	
135	
136	
137	
138	

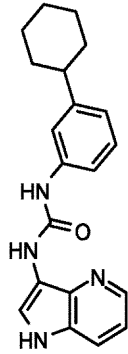
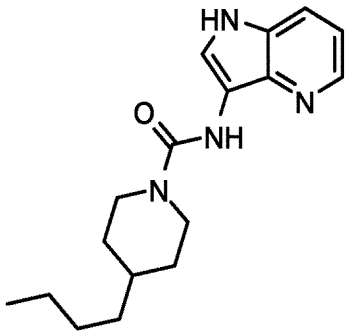
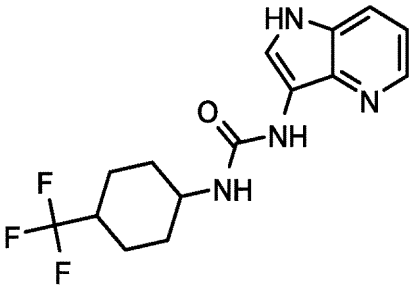
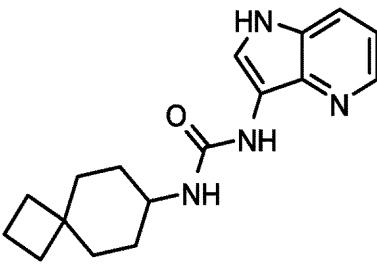
10

20

30

40

50

139	
140	
141	
142	

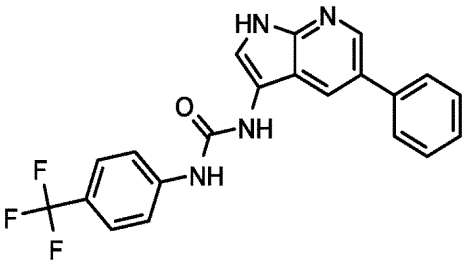
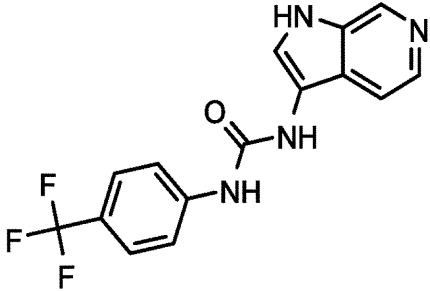
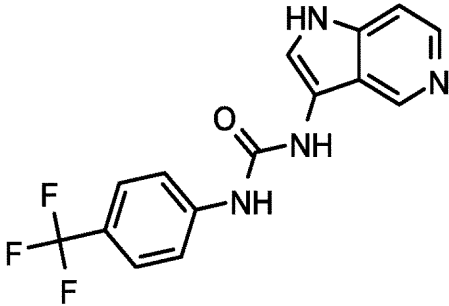
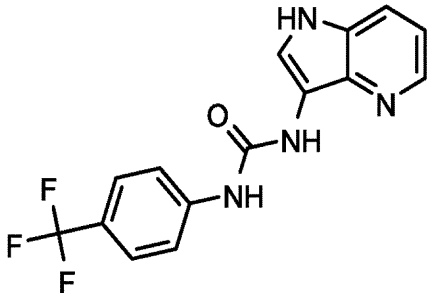
10

20

30

40

50

143	
144	
145	
146	

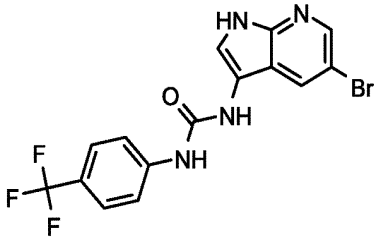
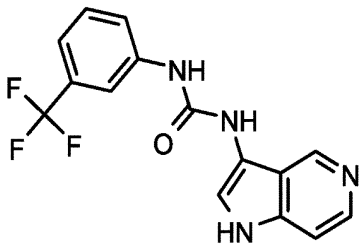
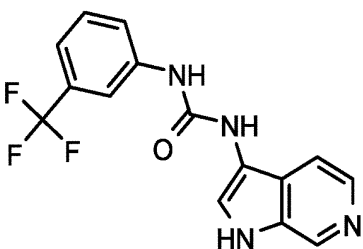
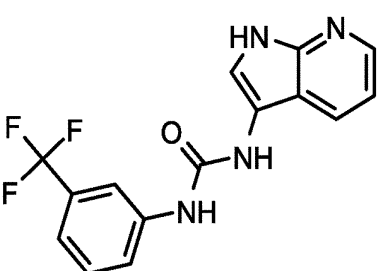
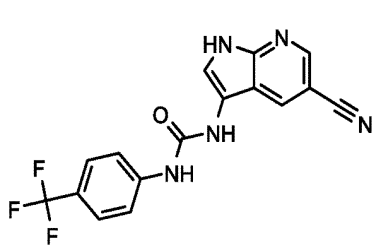
10

20

30

40

50

147	
148	
149	
150	
151	

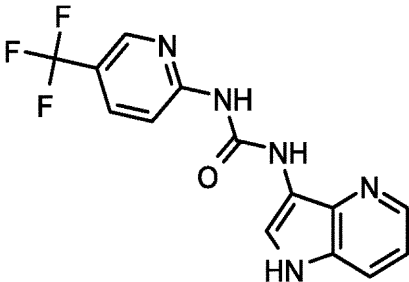
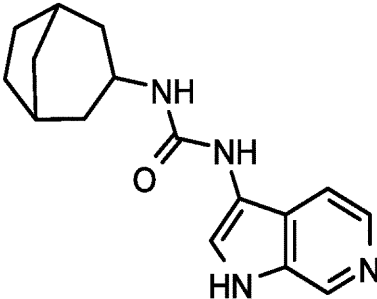
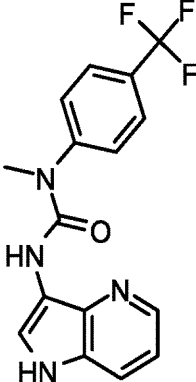
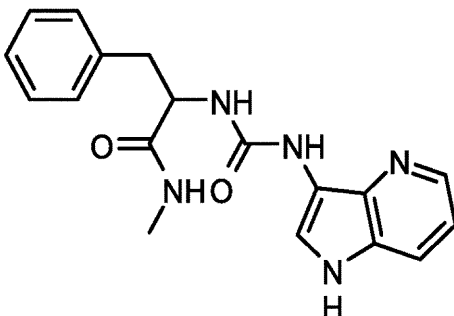
10

20

30

40

50

152	
153	
154	
155	

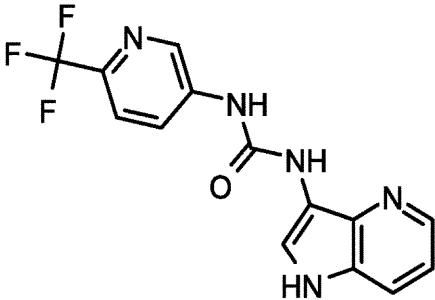
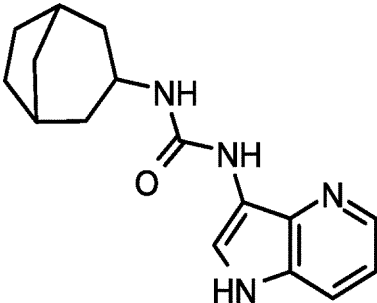
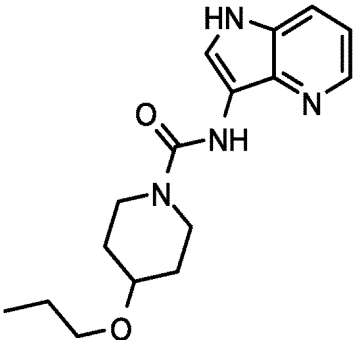
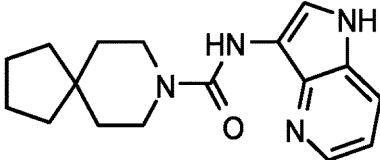
10

20

30

40

50

156	 <chem>FC(F)(F)c1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3ccncc23</chem>
157	 <chem>C12CCC3CC1CCC2C3NC(=O)Nc4c[nH]c5ccncc45</chem>
158	 <chem>CCOC1CCN(CC1)C(=O)Nc2c[nH]c3ccncc23</chem>
159	 <chem>C12CCC3CC1CCC2C3NC(=O)Nc4c[nH]c5ccncc45</chem>

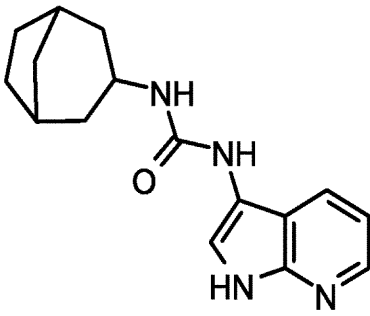
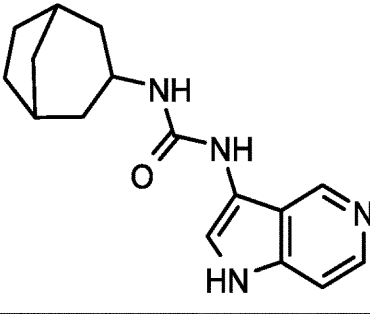
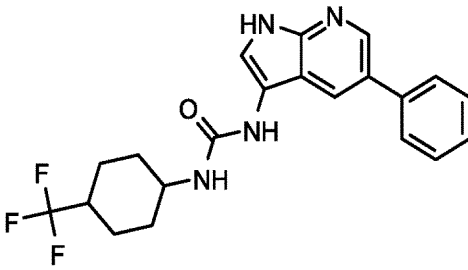
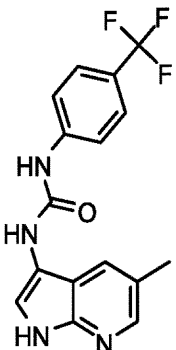
10

20

30

40

50

160	
161	
162	
163	

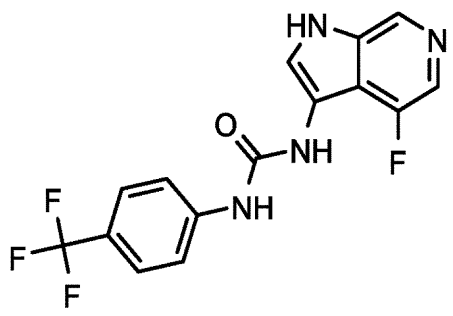
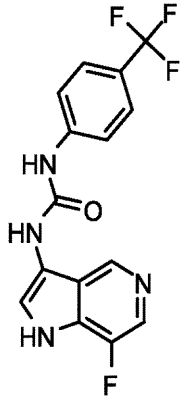
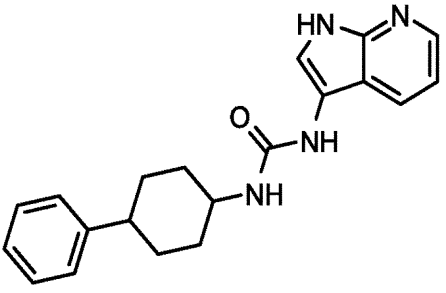
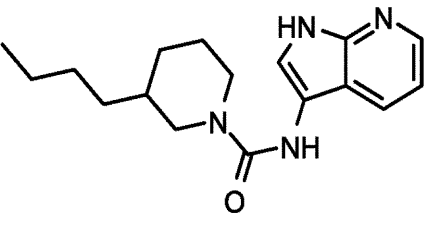
10

20

30

40

50

164	
165	
166	
167	

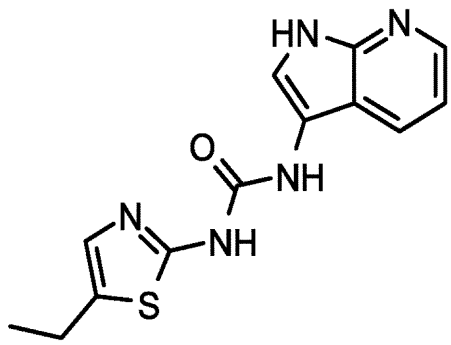
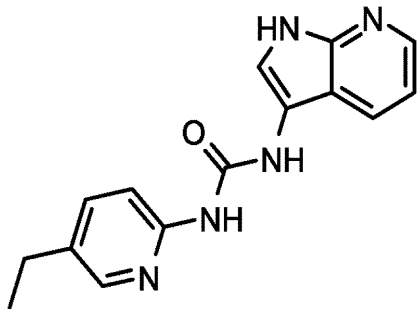
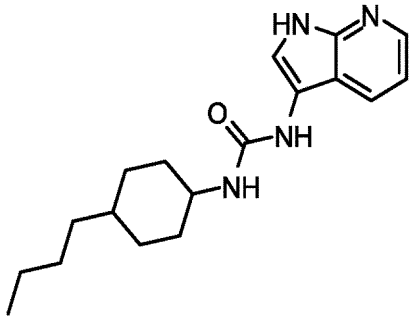
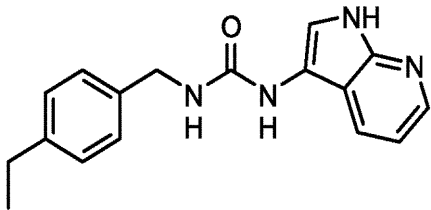
10

20

30

40

50

168	 <chem>CCc1cc[nH]c1C(=O)NNc2c[nH]c3ccccc23</chem>
169	 <chem>CCc1cc[nH]c1C(=O)NNc2c[nH]c3ccccc23</chem>
170	 <chem>CCCCC1CCCCC1NC(=O)NNc2c[nH]c3ccccc23</chem>
171	 <chem>CCc1ccc(cc1)CNC(=O)NNc2c[nH]c3ccccc23</chem>

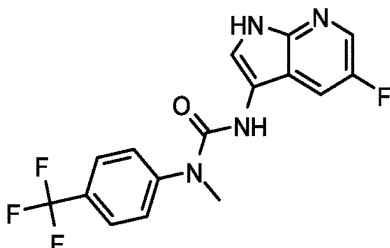
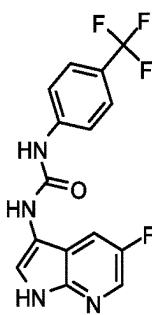
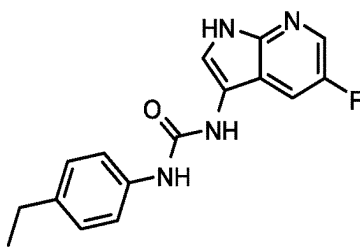
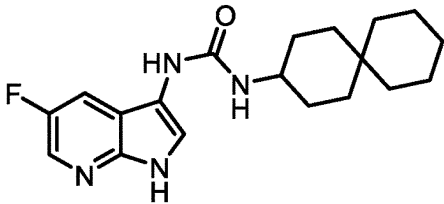
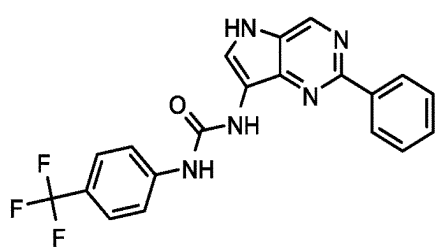
10

20

30

40

50

172	
173	
174	
179	
180	

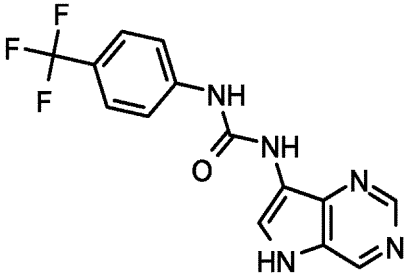
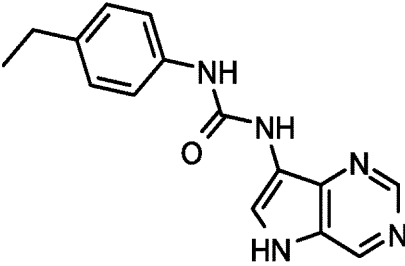
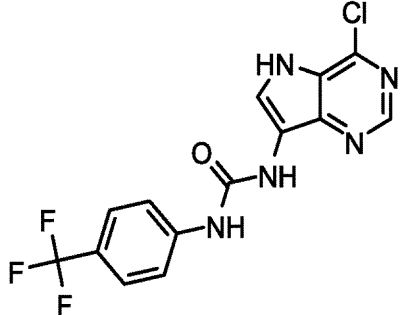
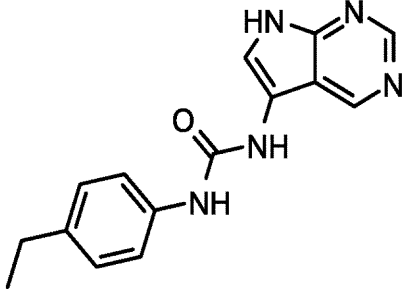
10

20

30

40

50

181	 <chem>CC1=NC2=C(N1)N=CN=C2C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
182	 <chem>CC1=NC2=C(N1)N=CN=C2C(=O)Nc3ccc(CC)cc3</chem>
183	 <chem>ClC1=NC2=C(N1)N=CN=C2C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
183b	 <chem>CC1=NC2=C(N1)N=CN=C2C(=O)Nc3ccc(CC)cc3</chem>

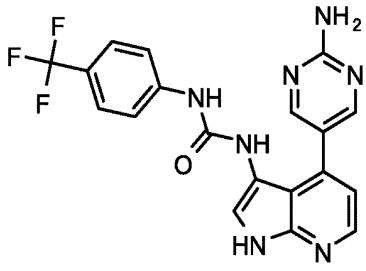
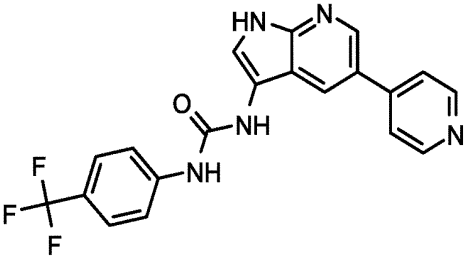
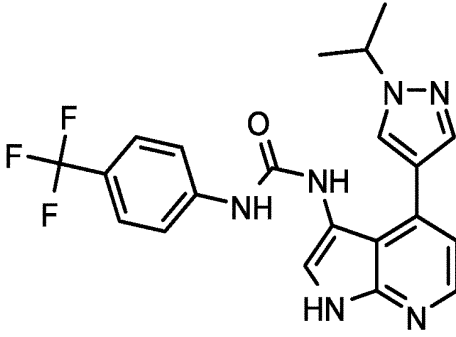
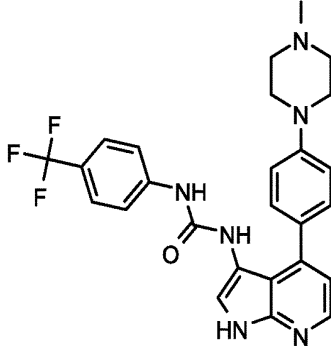
10

20

30

40

50

184	
185	
186	
187	

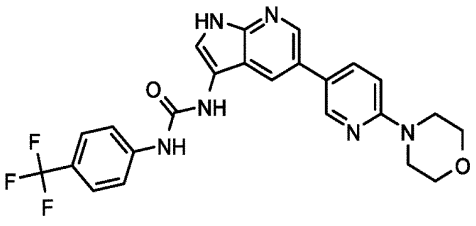
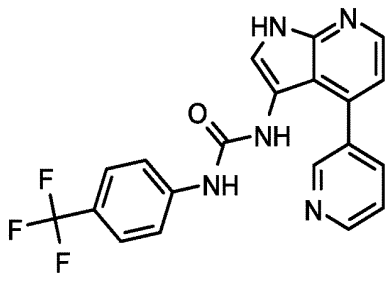
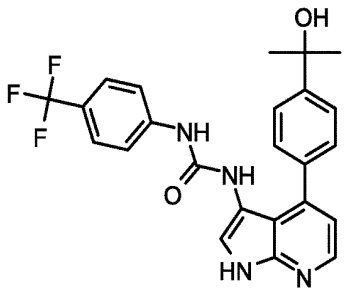
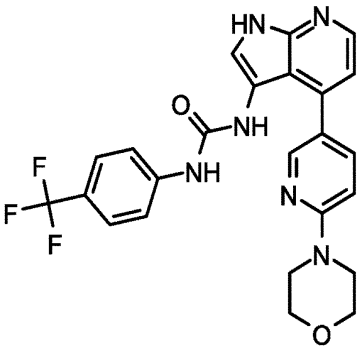
10

20

30

40

50

188	
189	
190	
191	

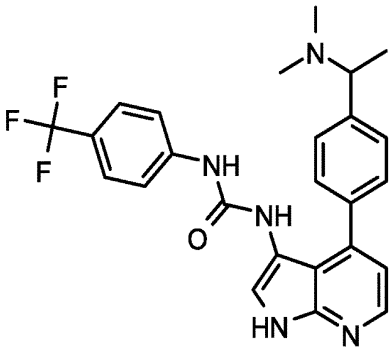
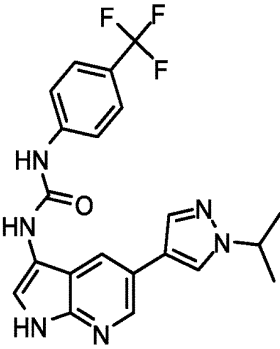
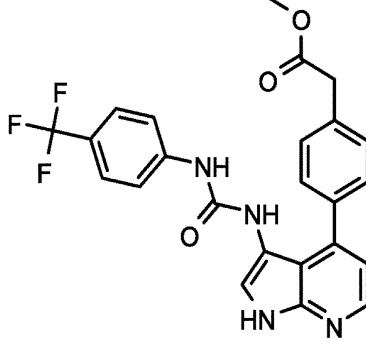
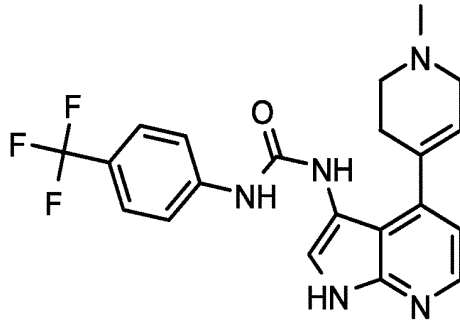
10

20

30

40

50

192	
193	
194	
195	

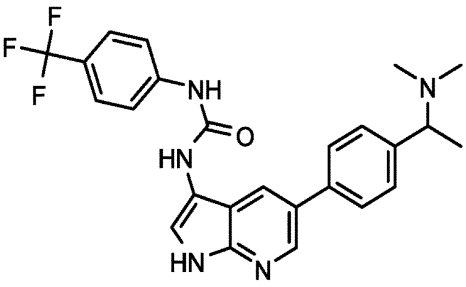
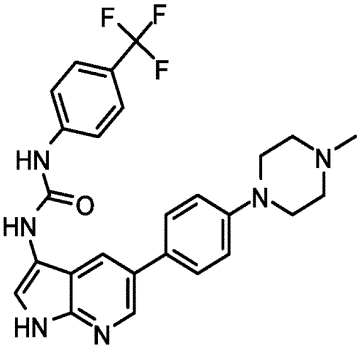
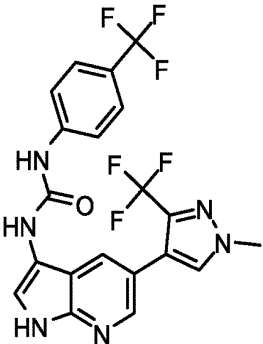
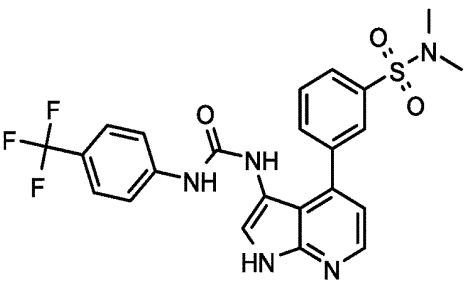
10

20

30

40

50

196	
197	
198	
199	

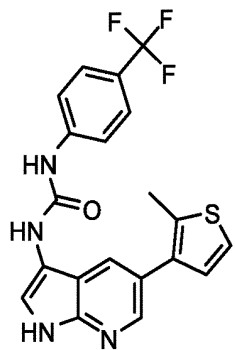
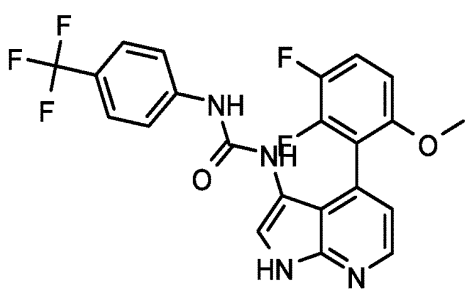
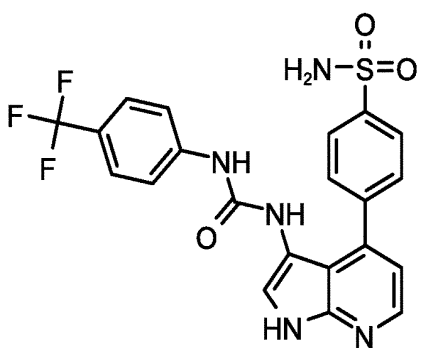
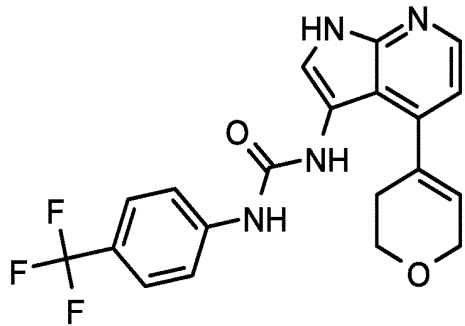
10

20

30

40

50

200	 <chem>Cc1ccsc1-c2cc3c(c[nH]2)c(=O)nc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)c3</chem>
201	 <chem>COc1cc(F)ccc1-c2cc3c(c[nH]2)c(=O)nc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)c3</chem>
202	 <chem>NS(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(c[nH]2)c(=O)nc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)c3</chem>
203	 <chem>C1=CC=C(C=C1O)-c2cc3c(c[nH]2)c(=O)nc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)c3</chem>

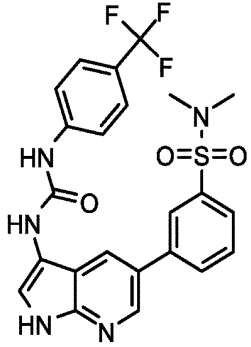
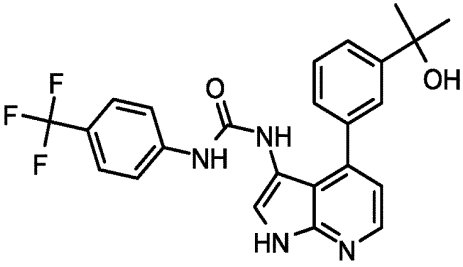
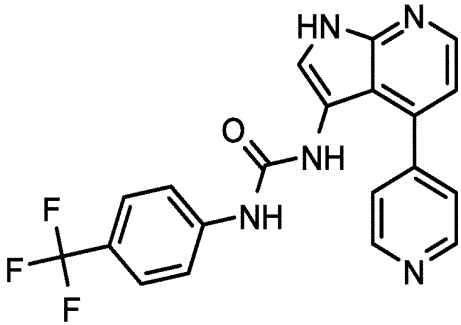
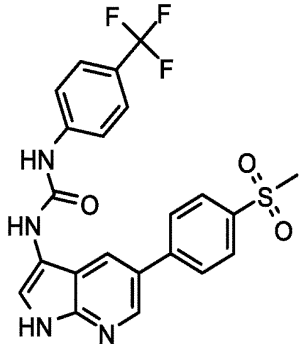
10

20

30

40

50

204	
205	
206	
207	

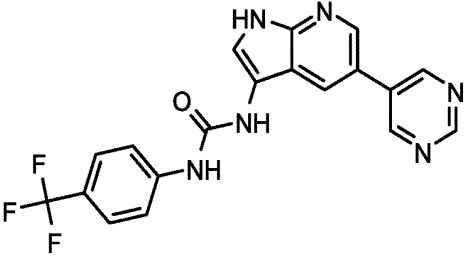
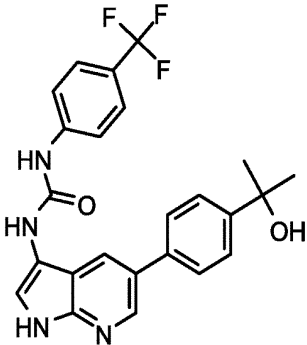
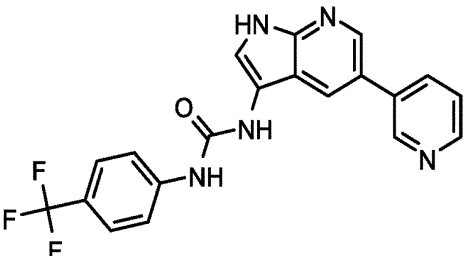
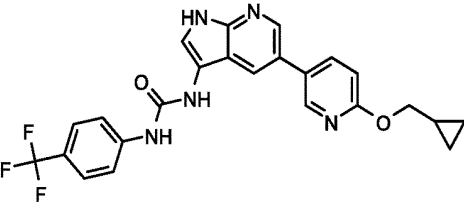
10

20

30

40

50

208	
209	
210	
211	

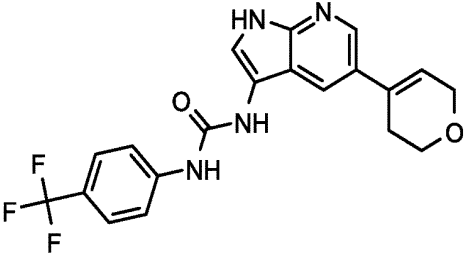
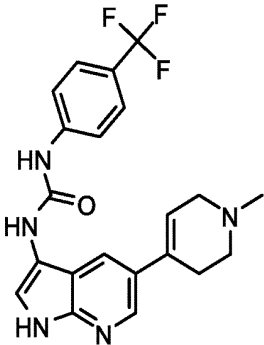
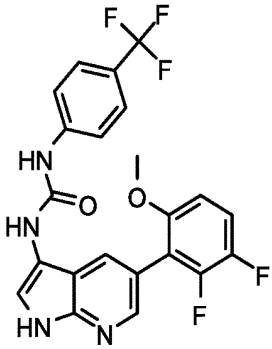
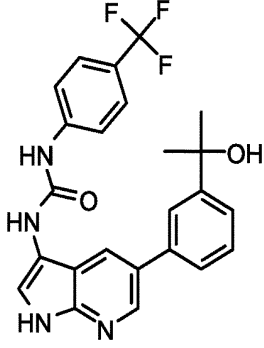
10

20

30

40

50

212	
213	
214	
215	

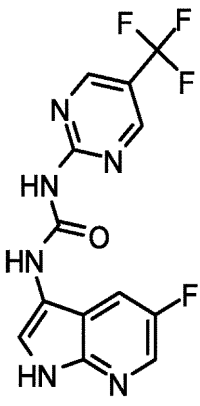
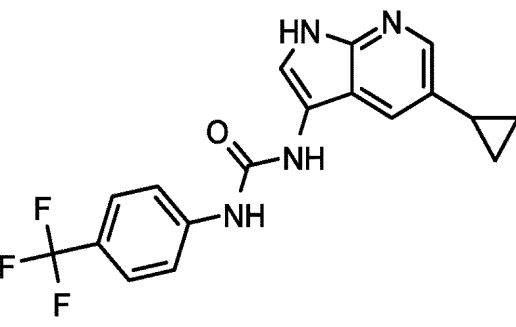
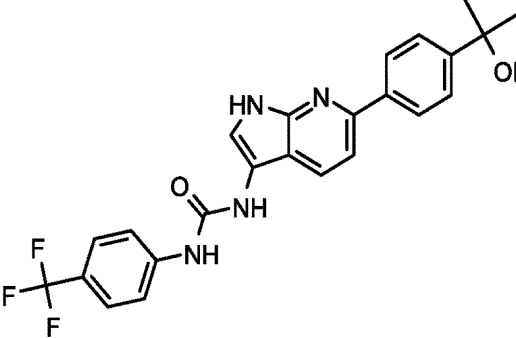
10

20

30

40

50

216	 <chem>FC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)NC(=O)Nc3cc(C(F)(F)F)nn3</chem>
217	 <chem>FC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)NC(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
218	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cc2)C(=CN3)NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>

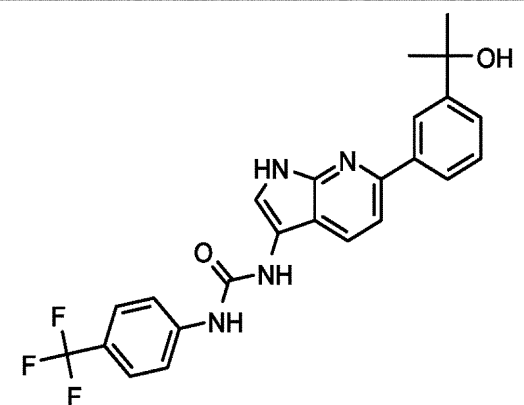
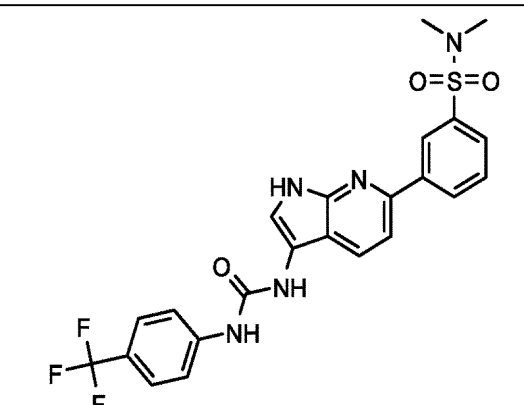
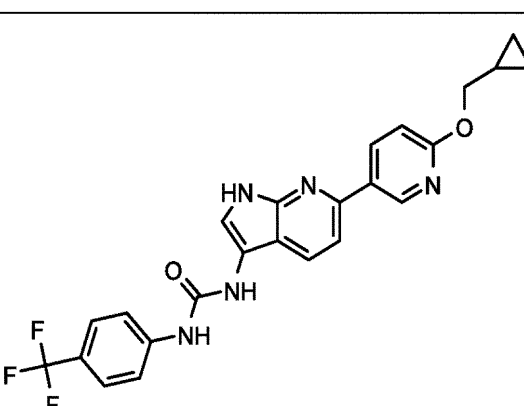
10

20

30

40

50

219	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>
220	 <chem>CN(C)S(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>
221	 <chem>C1CC1COc1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>

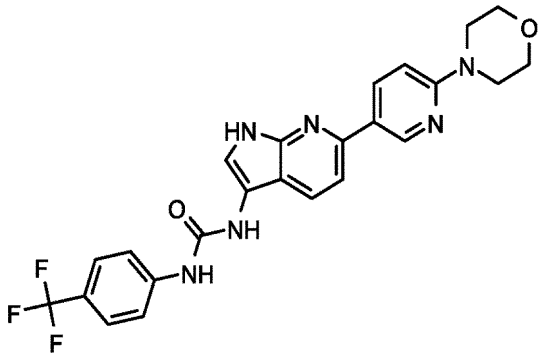
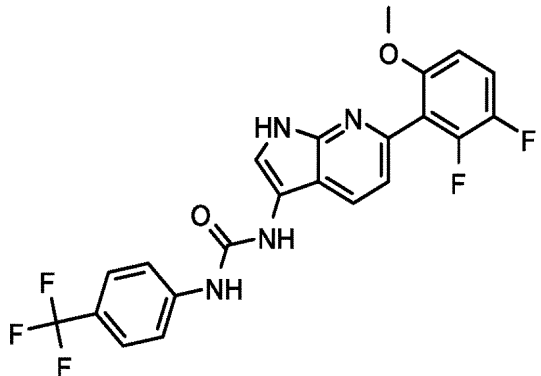
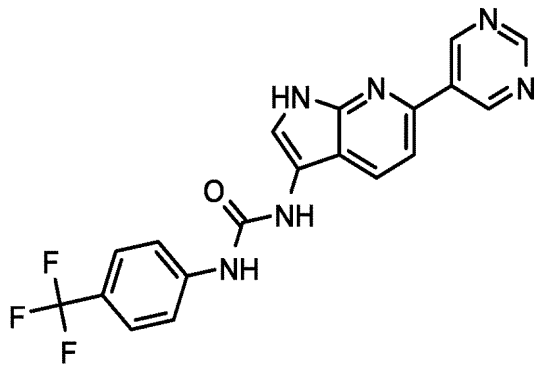
10

20

30

40

50

222	
223	
224	

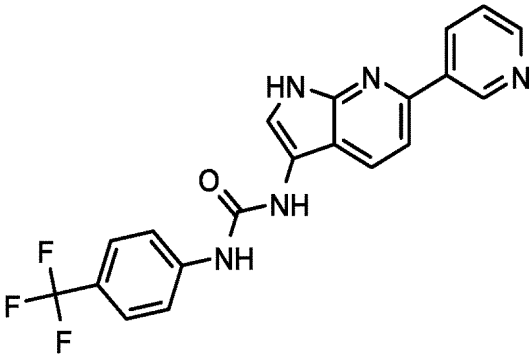
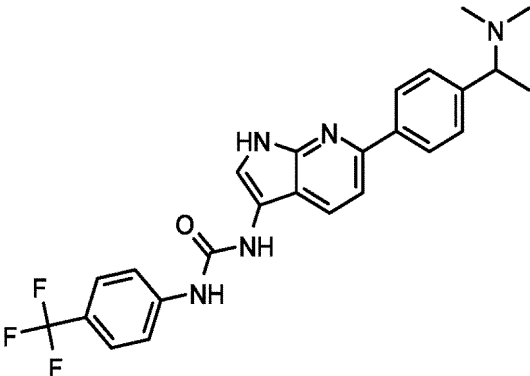
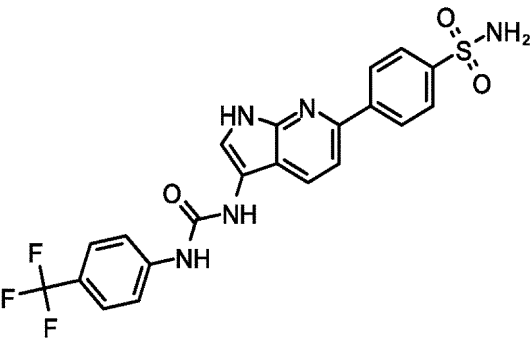
10

20

30

40

50

225	
226	
227	

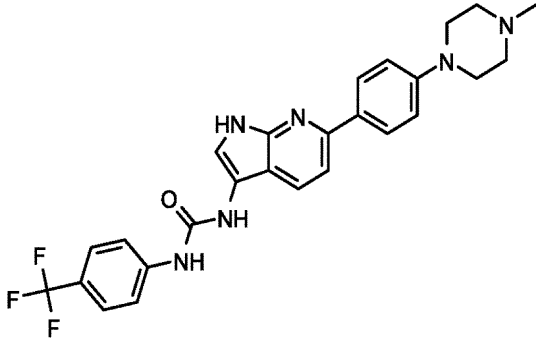
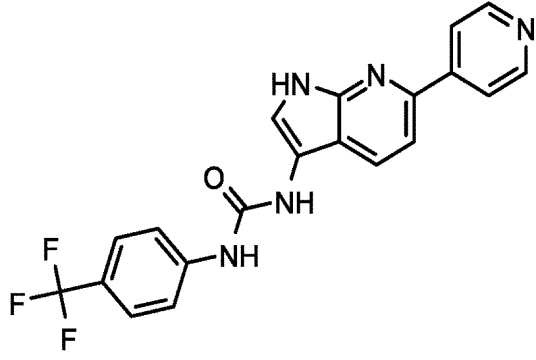
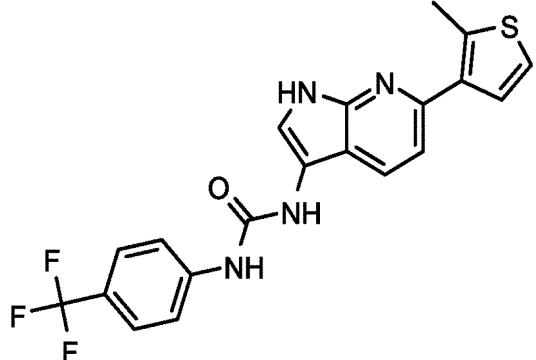
10

20

30

40

50

228	
229	
230	

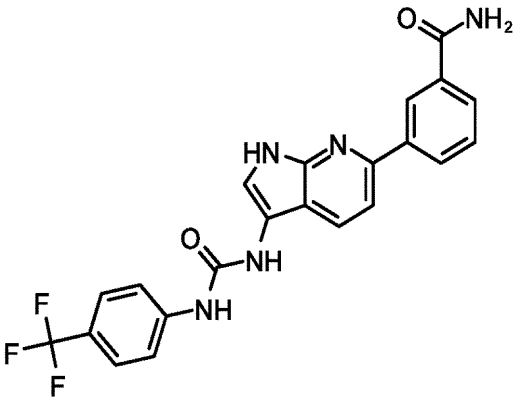
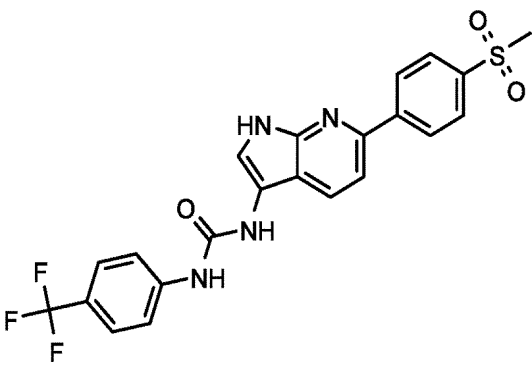
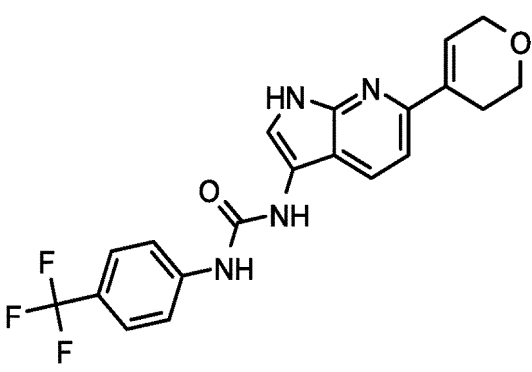
10

20

30

40

50

231	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cc2)nc4c3c[nH]4C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
232	 <chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cc2)nc4c3c[nH]4C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
233	 <chem>C1=CC=C(C=C1C2=CC=CC=C2O)C3=CC=CC=C3C4=CC5C(=CC=C4N5)C(=O)Nc6ccc(cc6)C(F)(F)F</chem>

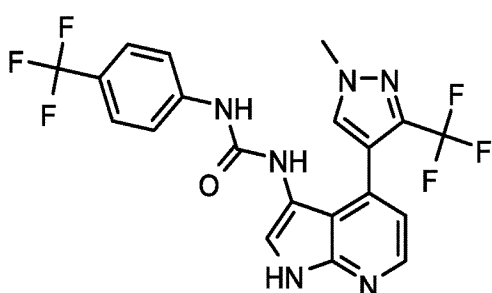
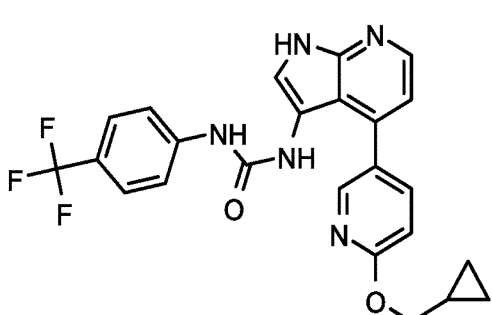
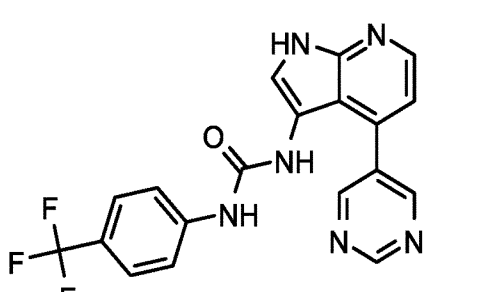
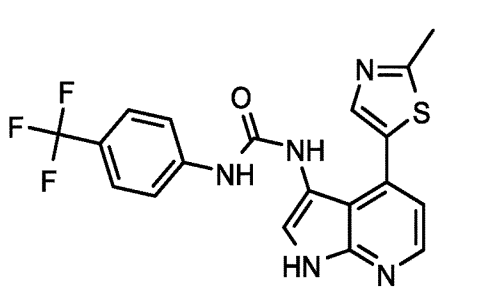
10

20

30

40

50

234	
235	
236	
237	

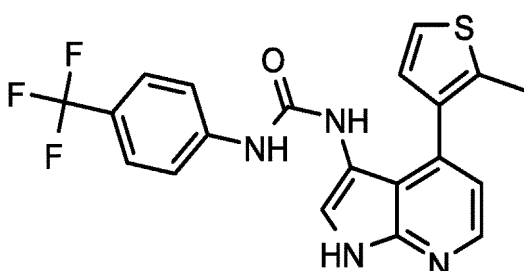
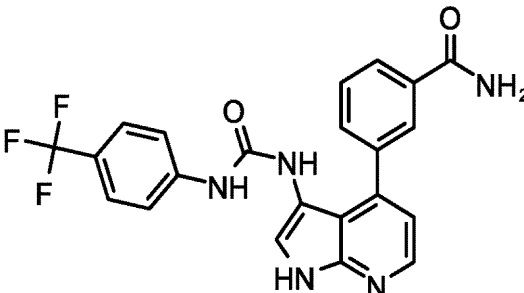
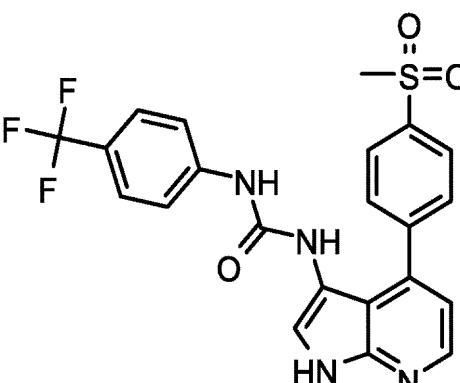
10

20

30

40

50

238	 <chem>Cc1ccsc1-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>
239	 <chem>NC(=O)c1ccc(-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cc1</chem>
240	 <chem>O=S(=O)c1ccc(-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cc1</chem>

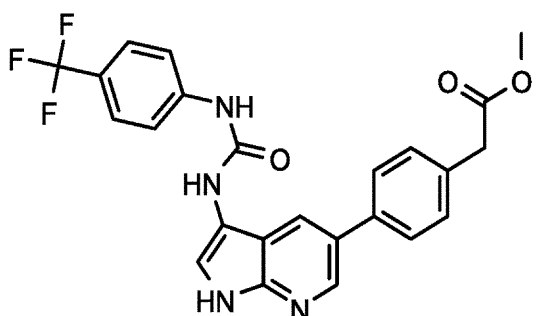
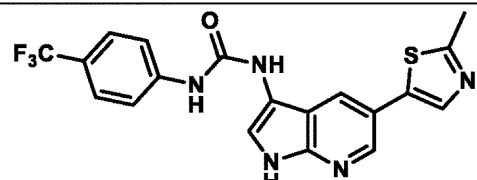
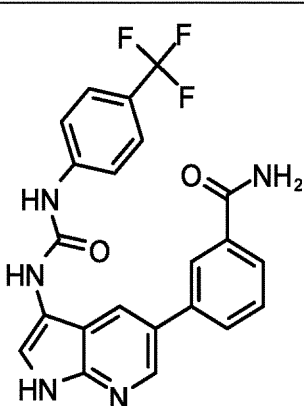
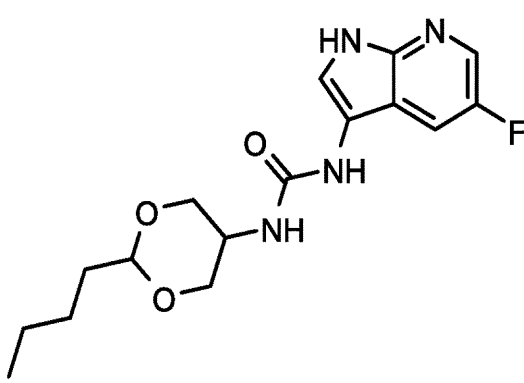
10

20

30

40

50

241	 <chem>COC(=O)Cc1ccc(cc1)-c2cc3nc4c(c3c[nH]4)N(C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F)c5[nH]c6ccccc65</chem>
242	 <chem>Cc1cc2nc3c(c1s2)N(C(=O)Nc4ccc(cc4)C(F)(F)F)c5[nH]c6ccccc65</chem>
243	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3nc4c(c3c[nH]4)N(C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F)c6[nH]c7ccccc76</chem>
244	 <chem>CCOC(=O)Cc1ccc(cc1)-c2cc3nc4c(c3c[nH]4)N(C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F)c6[nH]c7ccccc76</chem>

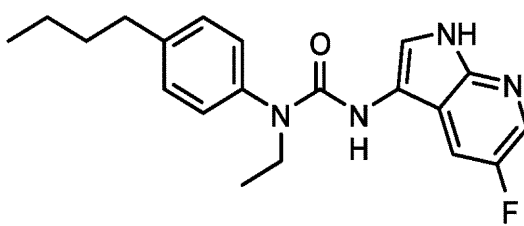
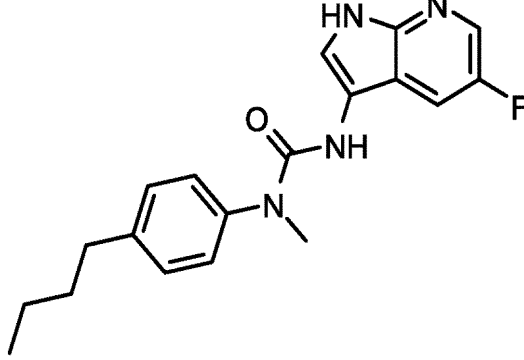
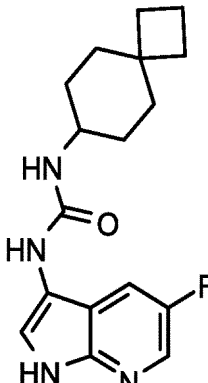
10

20

30

40

50

245	 <chem>CCCC1=CC=C(N(C)C(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)ccn23)C=C1</chem>
246	 <chem>CCCC1=CC=C(N(C)C(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)ccn23)C=C1</chem>
247	 <chem>CCCC1=CC=C(N(C)C(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)ccn23)C=C1</chem>

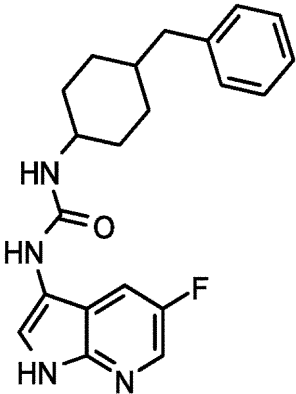
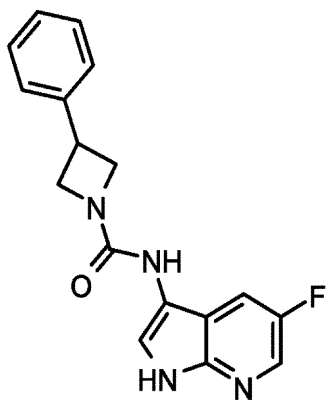
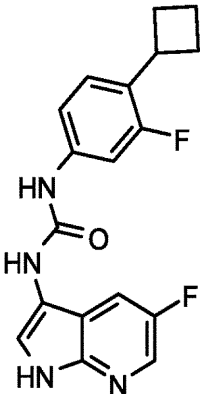
10

20

30

40

50

248	
249	
250	

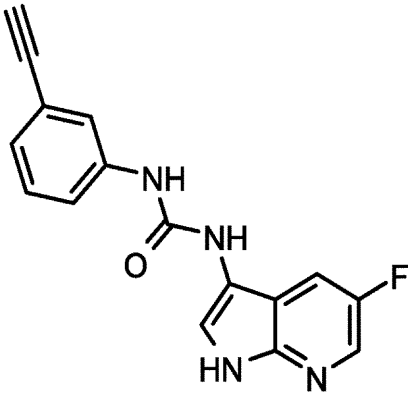
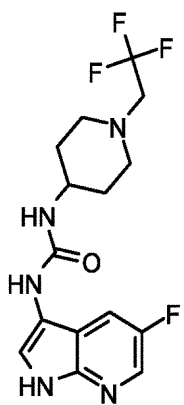
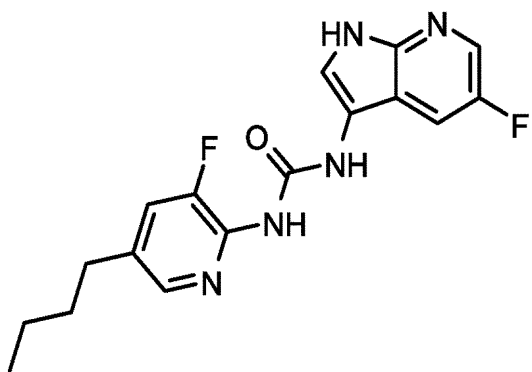
10

20

30

40

50

251	
252	
253	

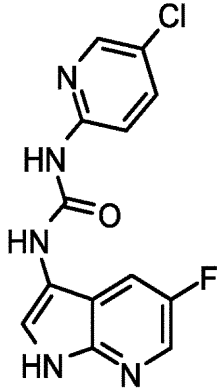
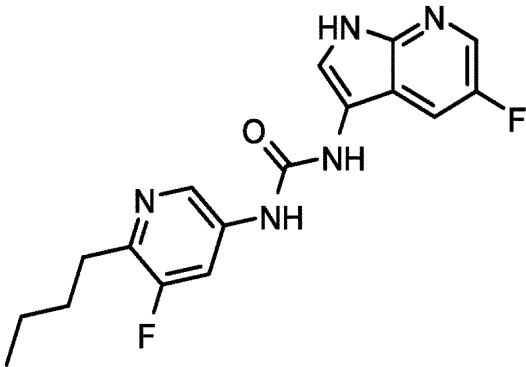
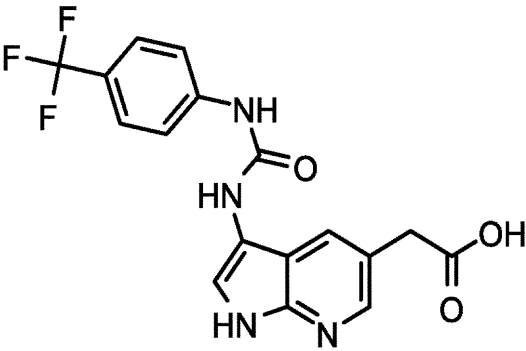
10

20

30

40

50

254	 <chem>Clc1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)ncn32</chem>
255	 <chem>CCc1cc(F)ncn1NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)ncn32</chem>
256	 <chem>OC(=O)CCc1cc2c[nH]c3cc(F)ncn32Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>

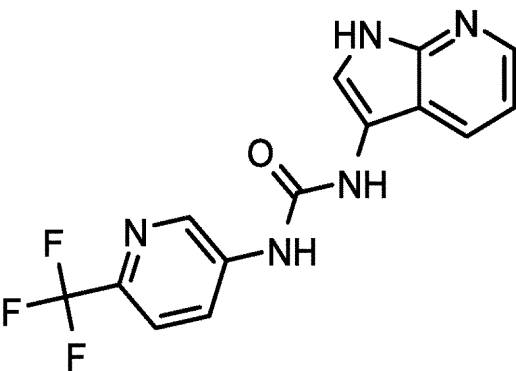
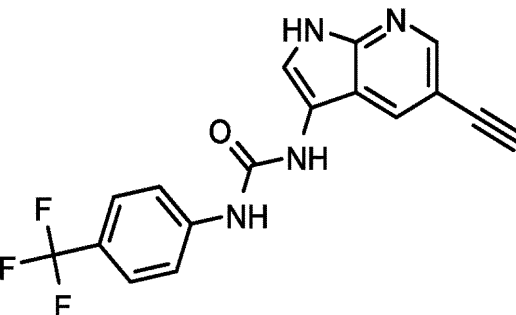
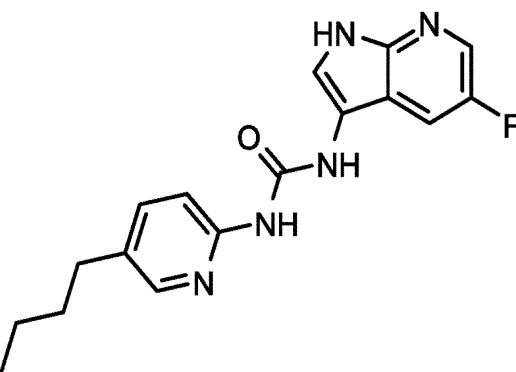
10

20

30

40

50

257	 <chem>FC(F)(F)c1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23</chem>
258	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(C#C)cc32)cc1</chem>
259	 <chem>CCCCc1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)cc32</chem>

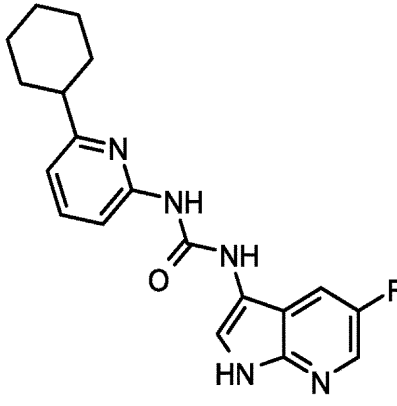
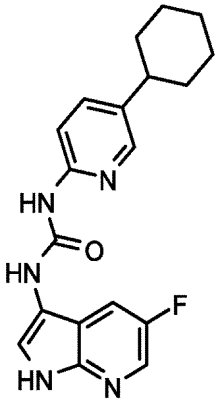
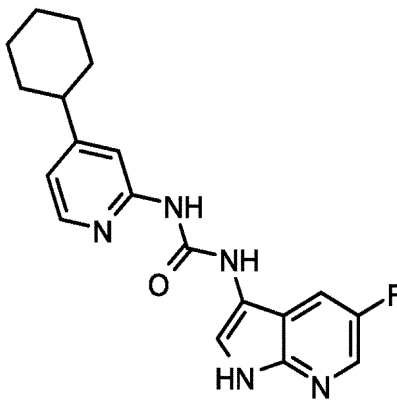
10

20

30

40

50

260	 <chem>C1CCCCC1c2ccc(NC(=O)Nc3c[nH]c4cc(F)cn34)cc2</chem>
261	 <chem>C1CCCCC1c2ccc(NC(=O)Nc3c[nH]c4cc(F)cn34)cn2</chem>
262	 <chem>C1CCCCC1c2ccncc(NC(=O)Nc3c[nH]c4cc(F)cn34)c2</chem>

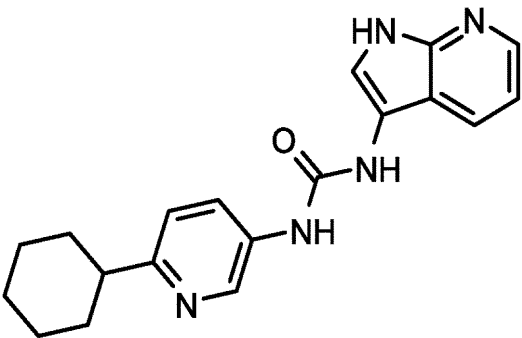
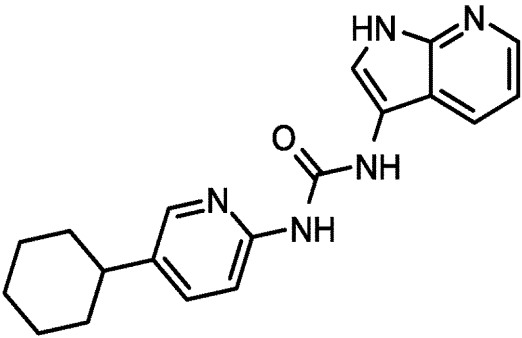
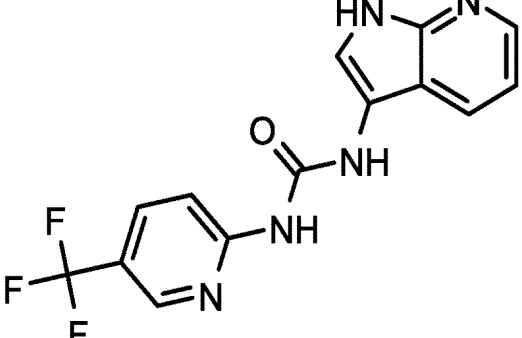
10

20

30

40

50

263	
264	
265	

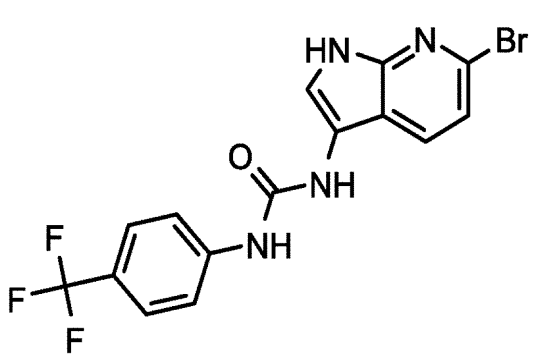
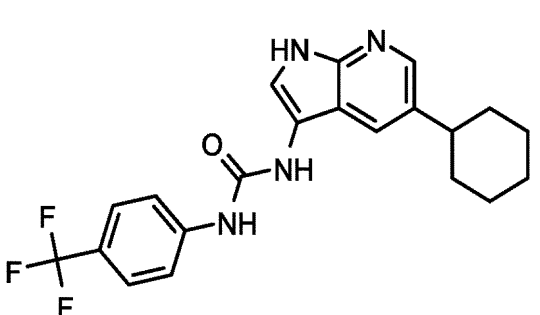
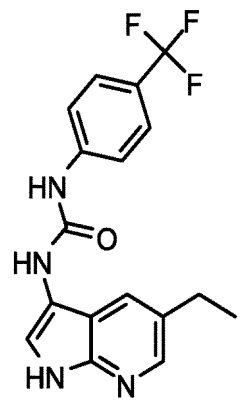
10

20

30

40

50

266	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(c[nH]2)C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
267	 <chem>C1CCC(CC1)c2cc3c(c[nH]3)C(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>
268	 <chem>CCc1cc2c(c[nH]2)C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>

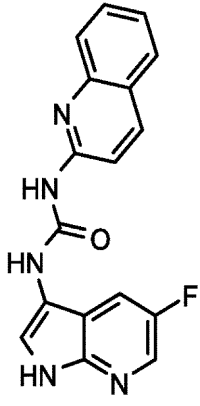
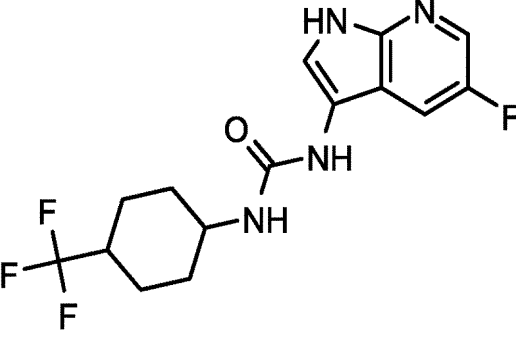
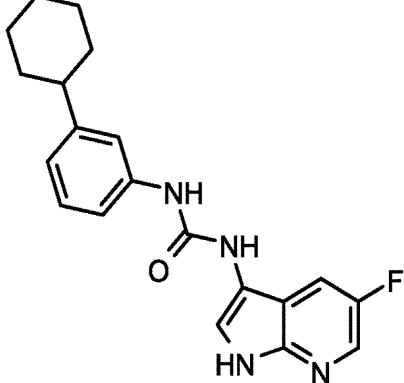
10

20

30

40

50

269	
270	
271	

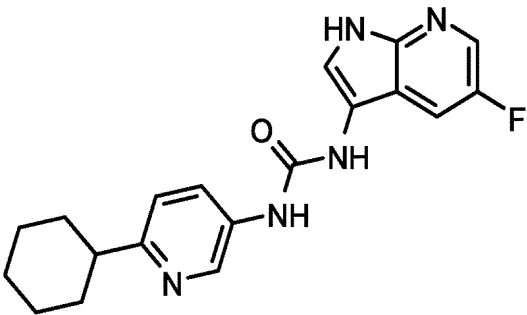
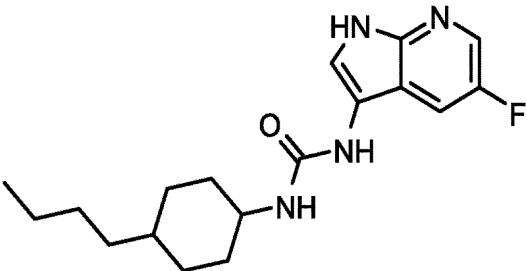
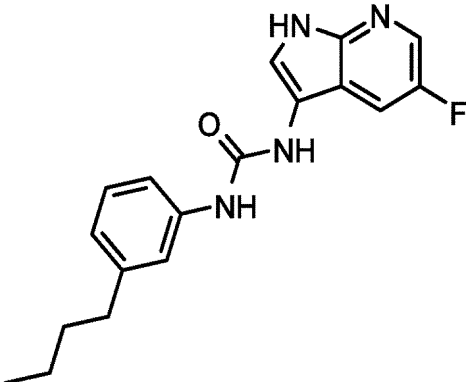
10

20

30

40

50

272	
273	
274	

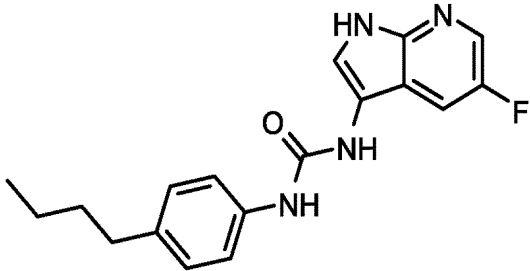
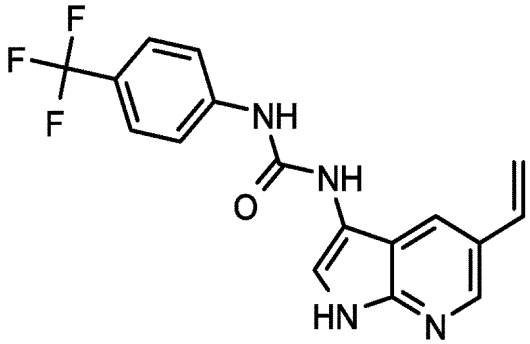
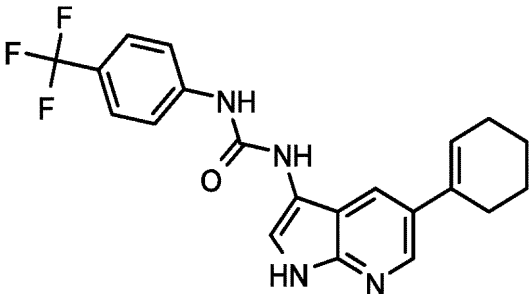
10

20

30

40

50

275	 <chem>CCCC1=CC=C(NC(=O)NC2=CNC3=CC=C(F)N3)C=C1</chem>
276	 <chem>C=Cc1cc2c(c1)c[nH]2NC(=O)NC3=CC=C(C(F)(F)F)C=C3</chem>
277	 <chem>C1=CC=C(C=C1)c2cc3c(c1)c[nH]3NC(=O)NC4=CC=C(C(F)(F)F)C=C4</chem>

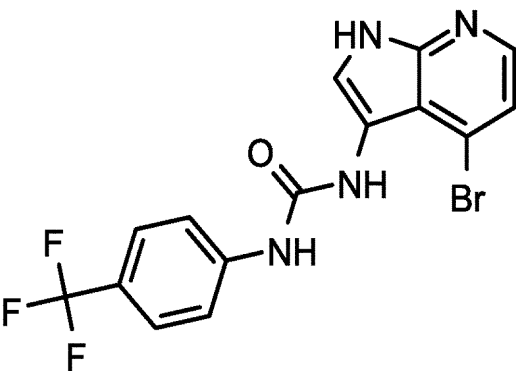
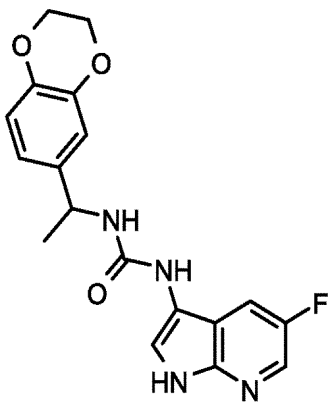
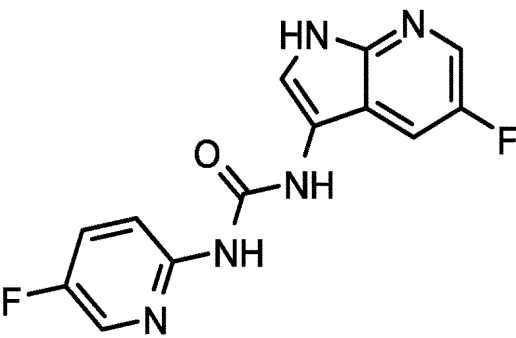
10

20

30

40

50

278	 <chem>BrC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)C(=O)NC3=CC=C(C=C3)C(F)(F)F</chem>
279	 <chem>FC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)C(=O)NC(C)C3=CC=C(C=C3)O4COCCO4</chem>
280	 <chem>Fc1ccncc1C(=O)NC2=CC=C3C(=C2)C(=CN3)C(F)=C</chem>

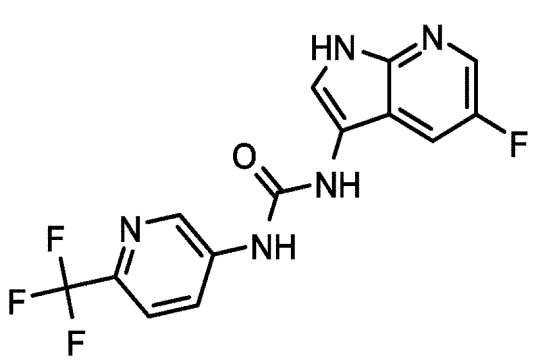
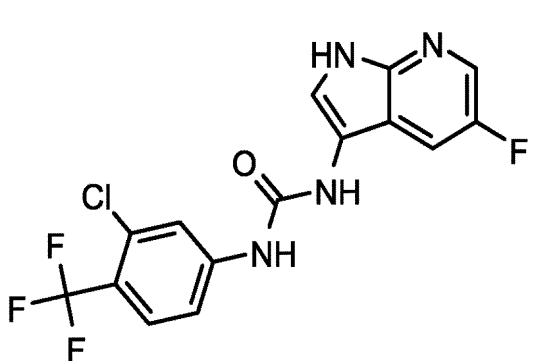
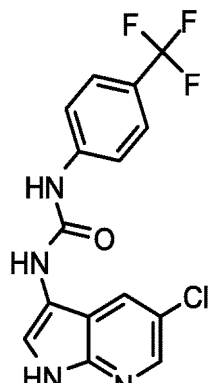
10

20

30

40

50

281	 <chem>FC1=CC=C(C=C1C2=CC=CC=C2N)NC(=O)Nc3cc(C(F)(F)F)ncn3</chem>
282	 <chem>FC1=CC=C(C=C1C2=CC=CC=C2N)NC(=O)Nc3cc(C(F)(F)F)c(Cl)c3</chem>
283	 <chem>Clc1cc2c(c1)c[nH]2NC(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>

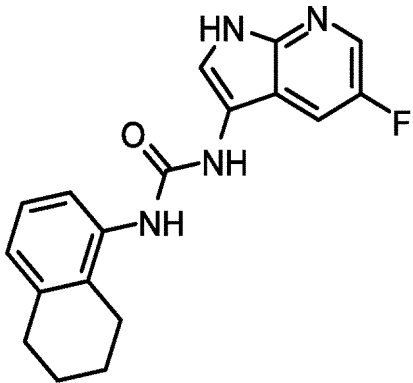
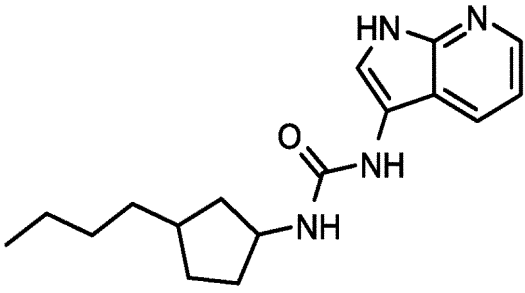
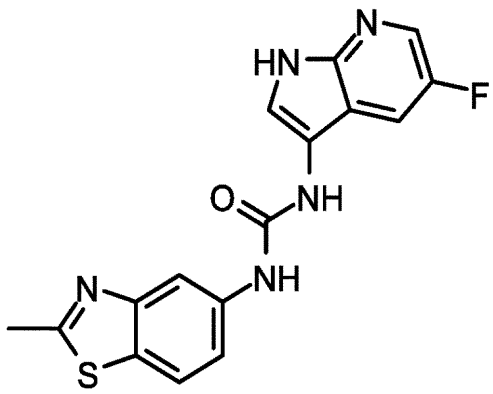
10

20

30

40

50

284	 <chem>O=C(Nc1ccc2c(c1)C3CCCCC3c2)c4c[nH]c5cc(F)nc45</chem>
285	 <chem>CCCC1CCC(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)C1</chem>
286	 <chem>O=C(Nc1ccc2c(c1)nc(C)s2)Nc3c[nH]c4cc(F)nc34</chem>

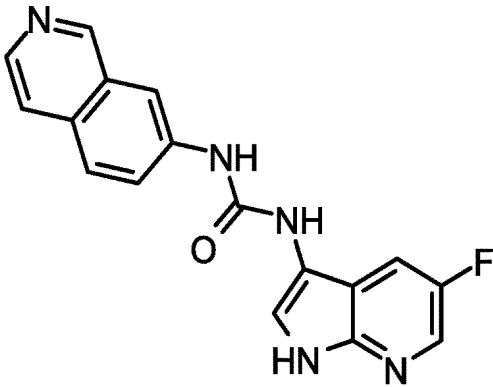
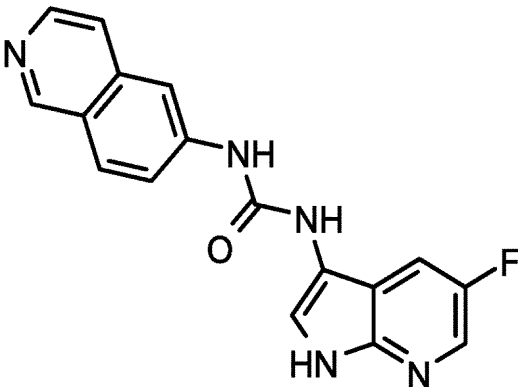
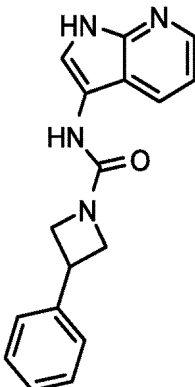
10

20

30

40

50

287	 <chem>Fc1nc2c(c[nH]2)nc(=O)nc1Nc3ccc4ccncc4c3</chem>
288	 <chem>Fc1nc2c(c[nH]2)nc(=O)nc1Nc3ccc4ccncc4c3</chem>
289	 <chem>c1ccc(cc1)C2CCN2C(=O)Nc3c[nH]c4ccncc34</chem>

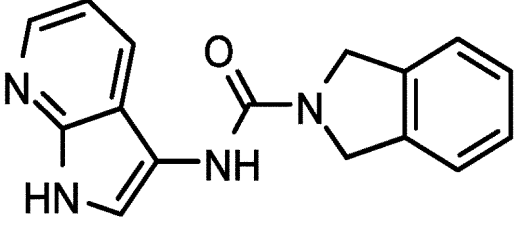
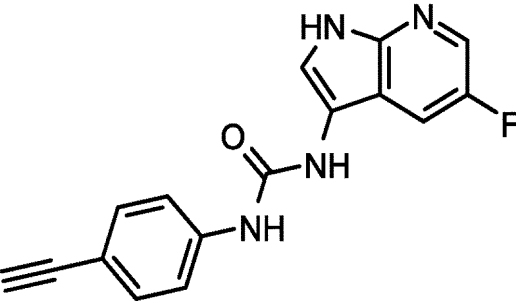
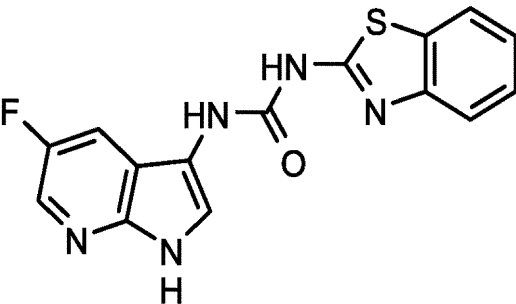
10

20

30

40

50

290	 <chem>Nc1c[nH]c2ccncc12NC(=O)N3Cc4ccccc4C3</chem>
291	 <chem>CC#Cc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)cn32)cc1</chem>
292	 <chem>Fc1c[nH]c2c(c1)ncn2NC(=O)Nc3nc4ccccc4s3</chem>

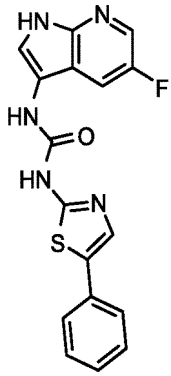
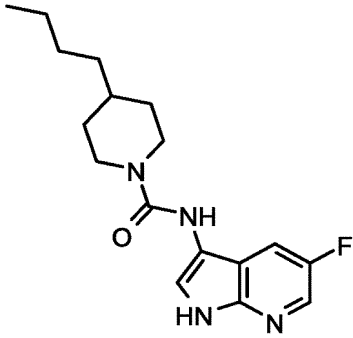
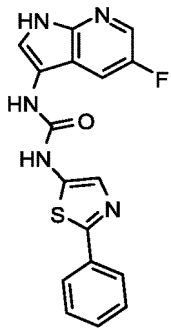
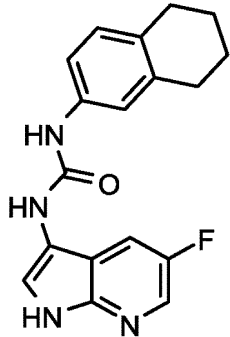
10

20

30

40

50

293	
294	
295	
296	

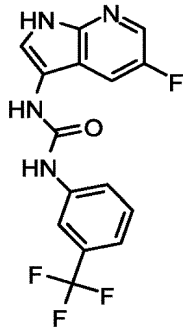
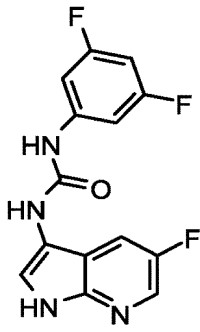
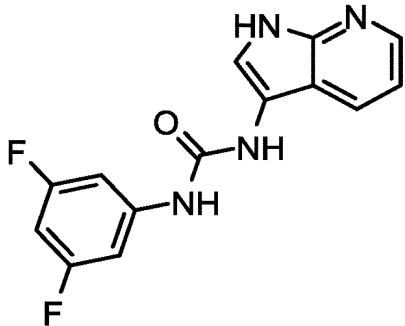
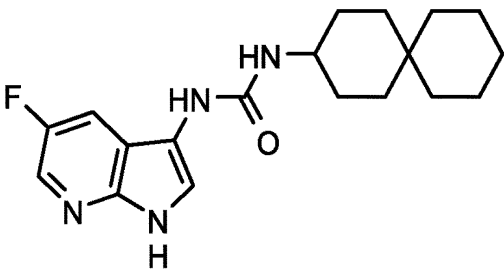
10

20

30

40

50

297	
298	
299	
300	

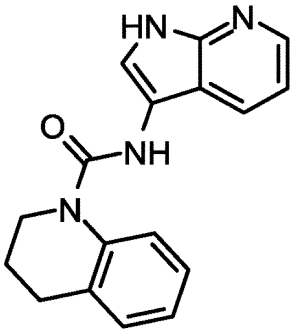
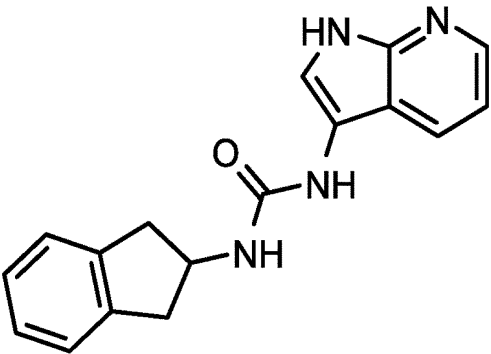
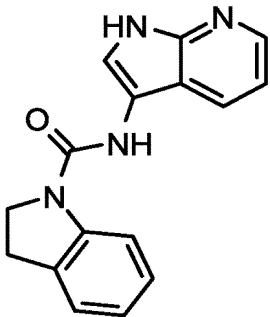
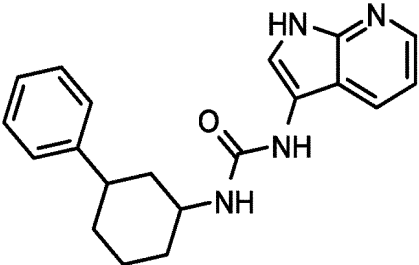
10

20

30

40

50

301	
302	
303	
304	

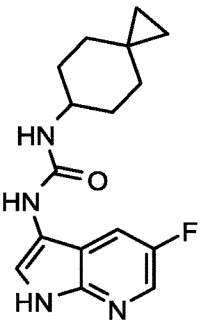
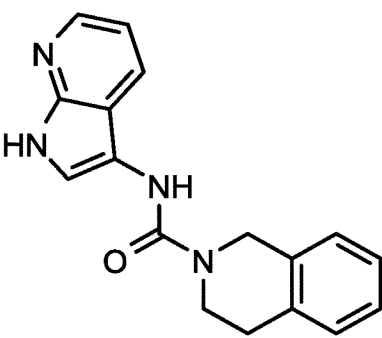
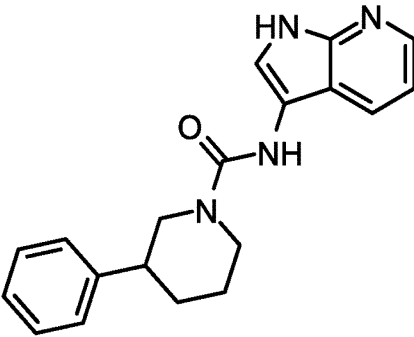
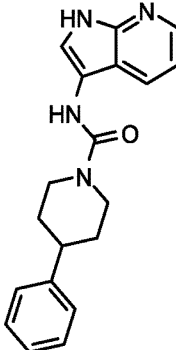
10

20

30

40

50

305	
306	
307	
308	

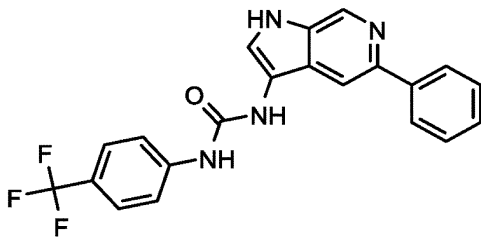
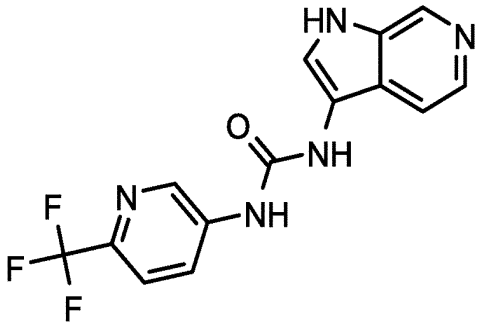
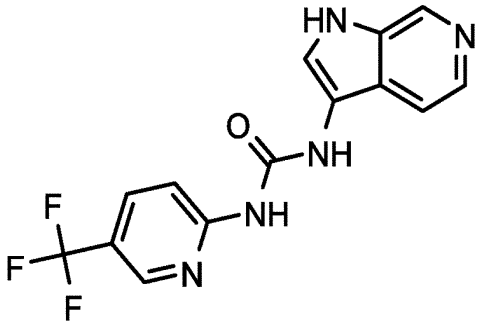
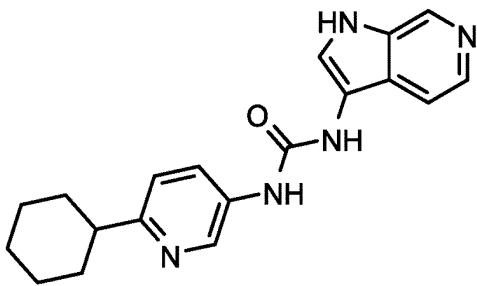
10

20

30

40

50

309	
310	
311	
312	

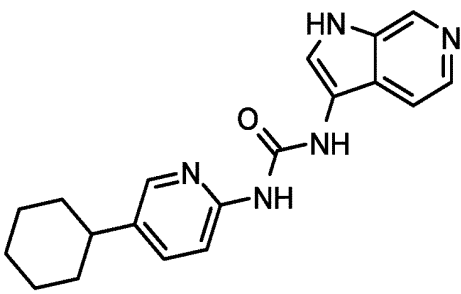
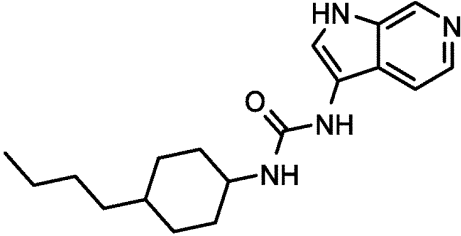
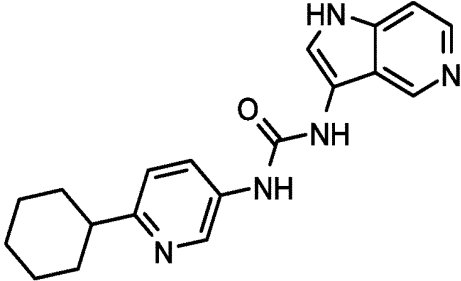
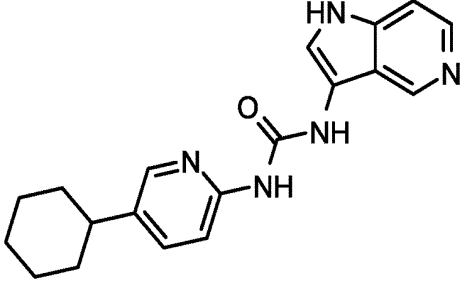
10

20

30

40

50

313	
314	
315	
316	

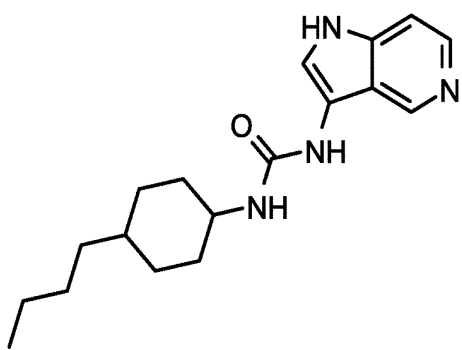
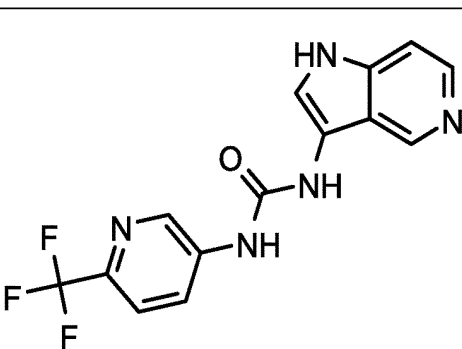
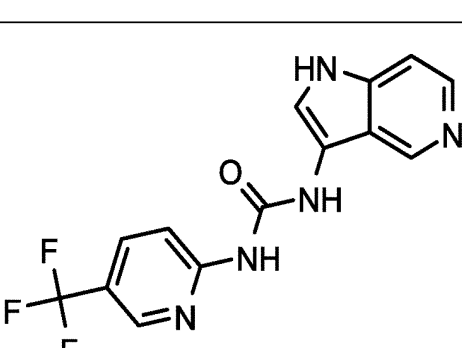
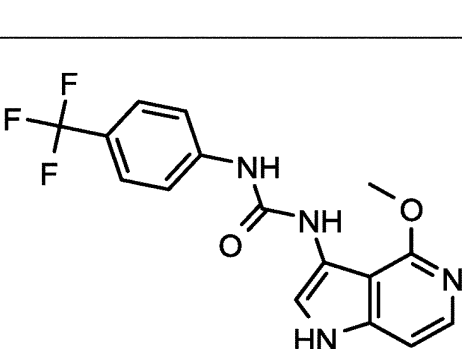
10

20

30

40

50

317	
318	
319	
320	

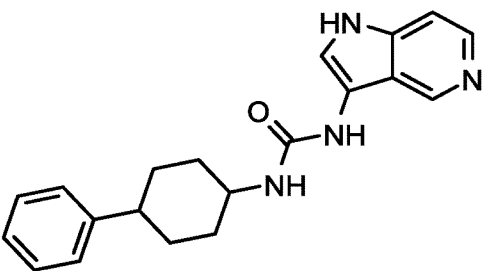
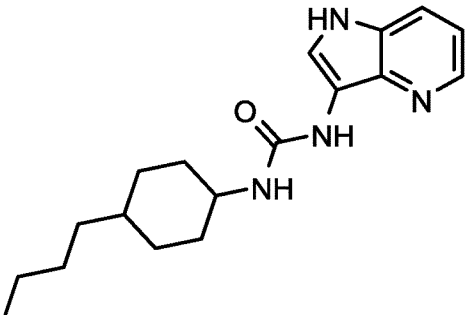
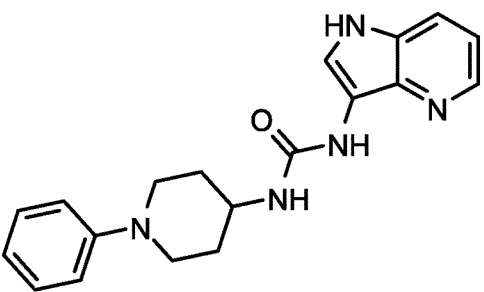
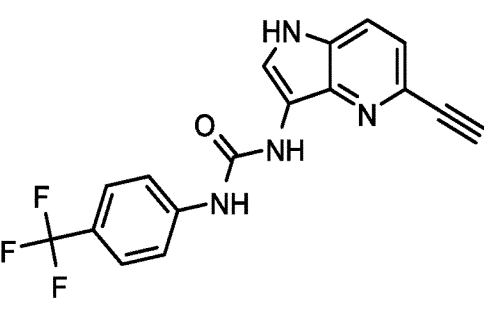
10

20

30

40

50

321	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2CCCCC2NC(=O)Nc3cc4ccc(N)cc4n3</chem>
322	 <chem>CCCCC1CCCCC1NC(=O)Nc2cc3ccc(N)cc3n2</chem>
323	 <chem>Nc1ccc(cc1)N2CCCCC2NC(=O)Nc3cc4ccc(N)cc4n3</chem>
324	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2cc3ccc(N)cc3n2)cc1</chem>

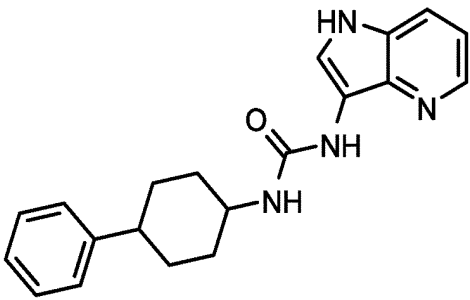
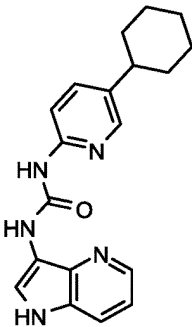
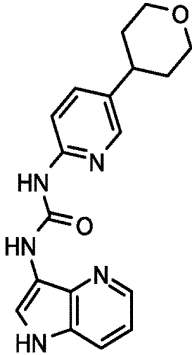
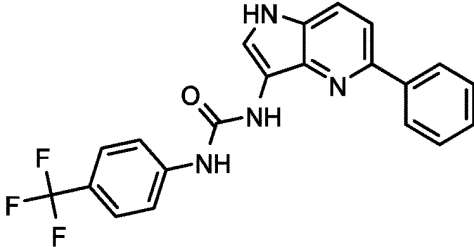
10

20

30

40

50

325	
326	
327	
328	

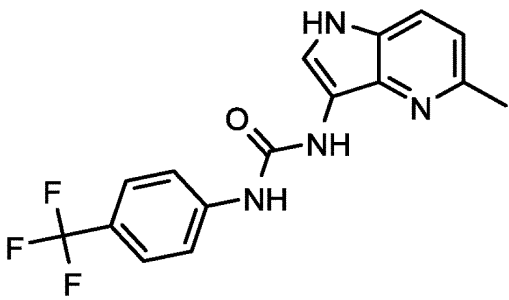
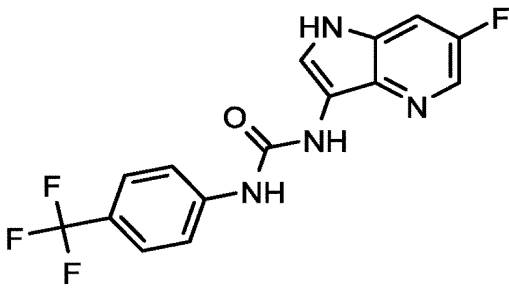
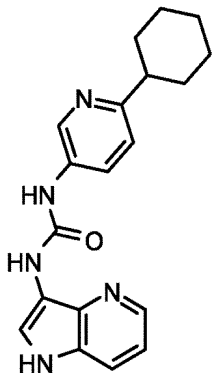
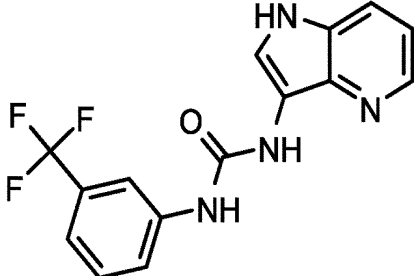
10

20

30

40

50

329	
330	
331	
332	

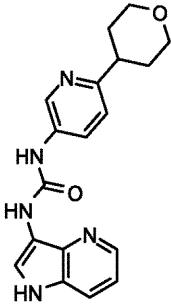
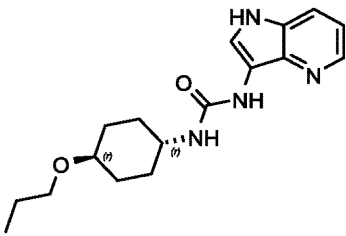
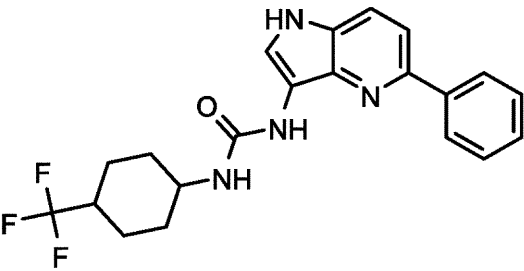
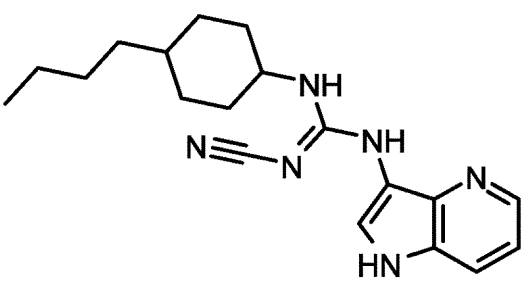
10

20

30

40

50

333	
334	
335	
336	

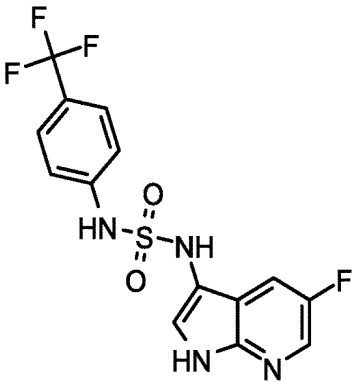
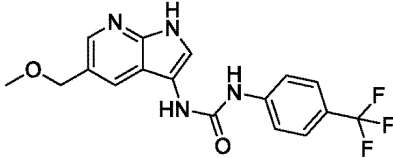
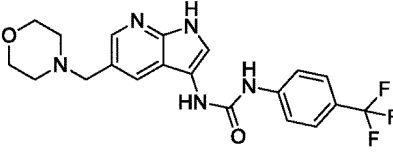
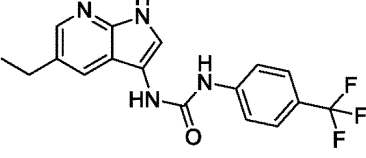
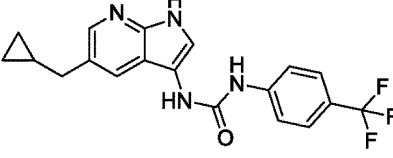
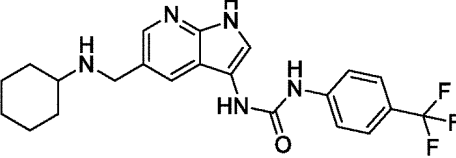
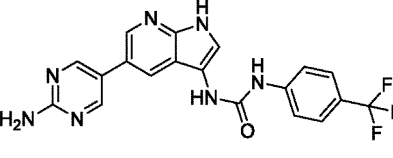
10

20

30

40

50

337	
338	
339	
340	
341	
342	
343	

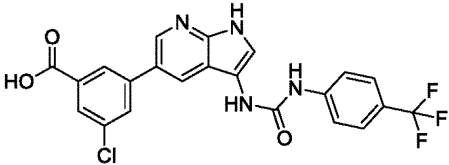
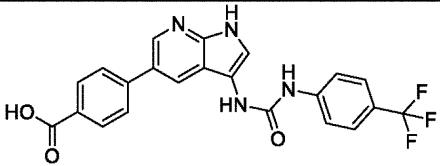
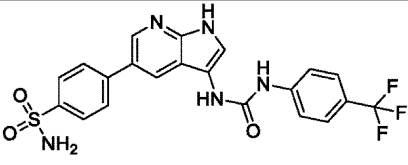
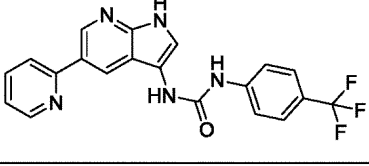
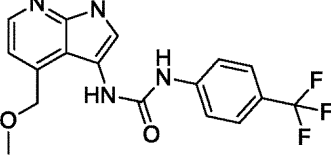
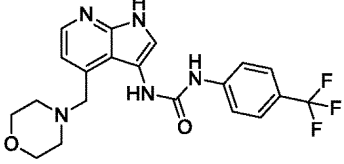
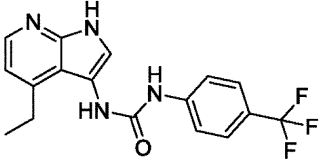
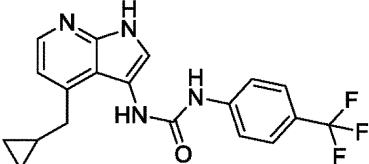
10

20

30

40

50

344	
345	
346	
347	
348	
349	
350	
351	

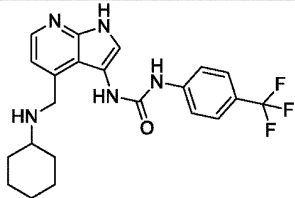
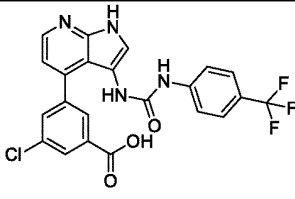
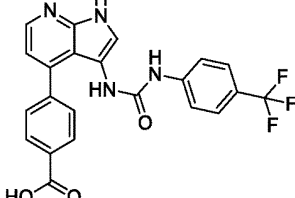
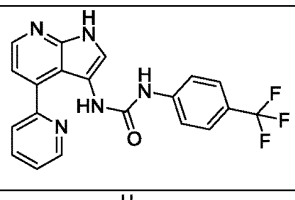
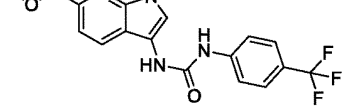
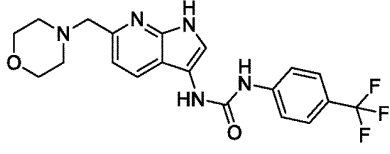
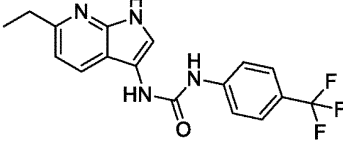
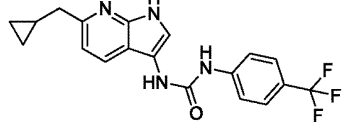
10

20

30

40

50

352	
353	
354	
355	
356	
357	
358	
359	

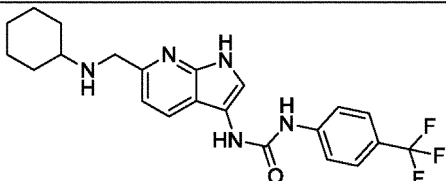
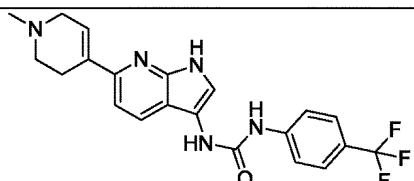
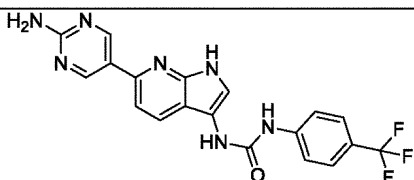
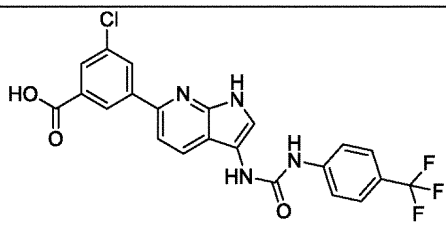
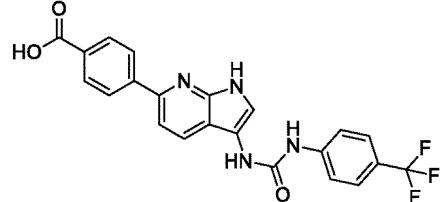
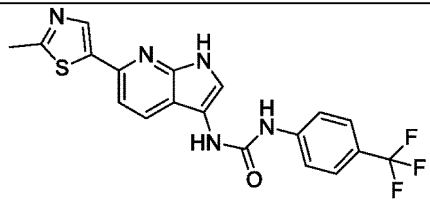
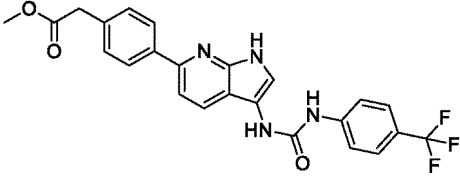
10

20

30

40

50

360	
361	
362	
363	
364	
365	
366	

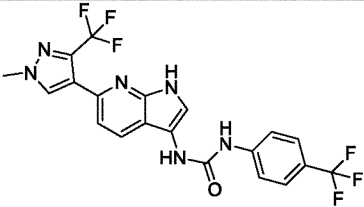
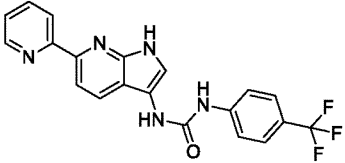
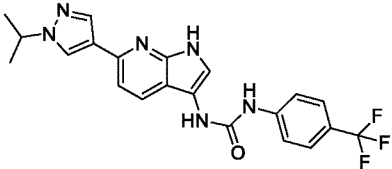
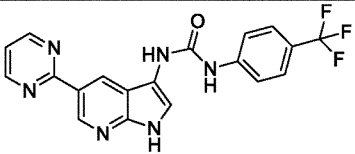
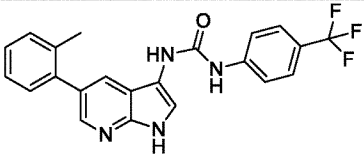
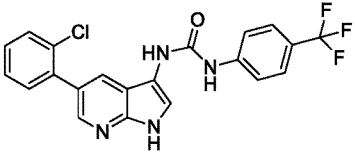
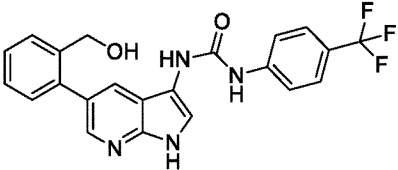
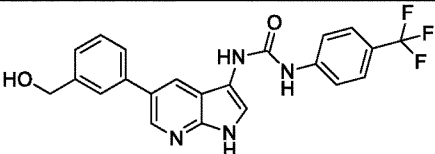
10

20

30

40

50

367	
368	
369	
370	
371	
372	
373	
374	

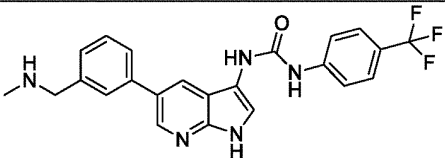
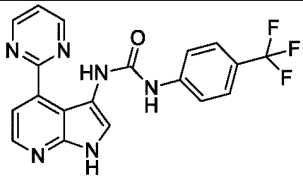
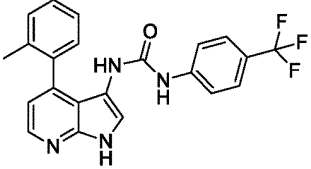
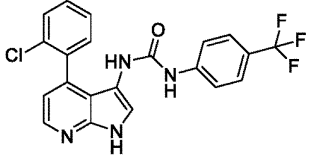
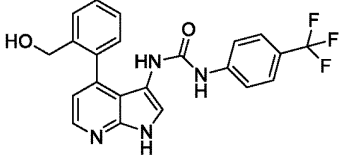
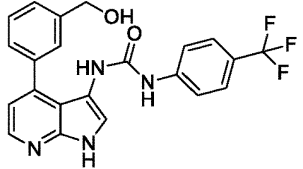
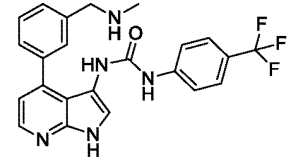
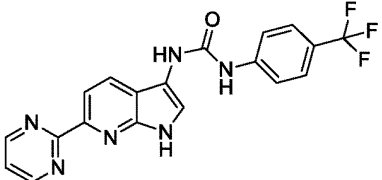
10

20

30

40

50

375	
376	
377	
378	
379	
380	
381	
382	

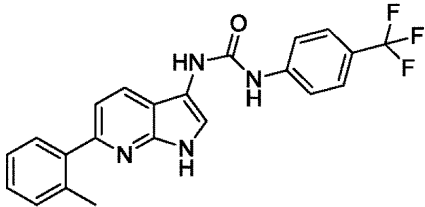
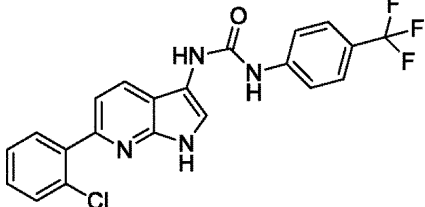
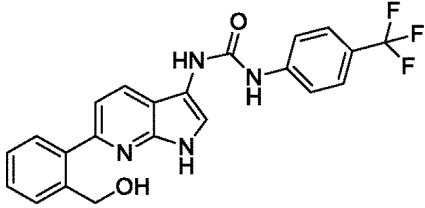
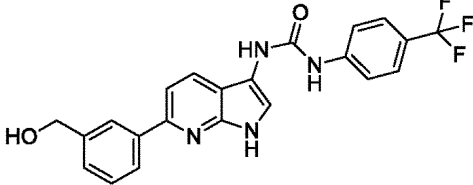
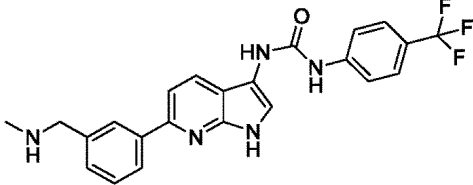
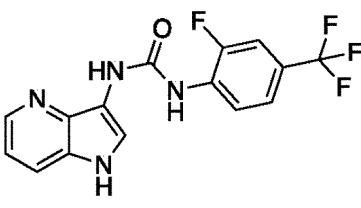
10

20

30

40

50

383	
384	
385	
386	
387	
388	

10

20

30

40

またはこれらの薬学的に許容される塩よりなる群より選択される、化合物。

【請求項 15】

請求項1記載の化合物と、1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項 16】

請求項1記載の化合物を含む、STING活性を阻害するための薬学的組成物。

【請求項 17】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象におけるがんを治療するための薬学的組成物。

50

【請求項 18】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象において免疫応答を誘導するための薬学的組成物。

【請求項 19】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象における疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を治療するための薬学的組成物。

【請求項 20】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象におけるSTINGに関連する疾患、障害、または状態を治療するための薬学的組成物。

10

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0052

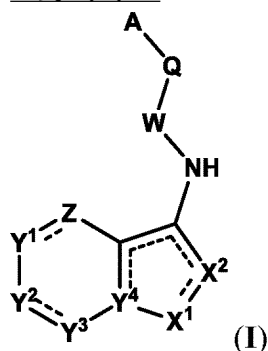
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0052】

[本発明1001]

式(I)：



20

の化合物であって、

式(I)中、

30

Zは、結合、CR¹、C(R³)₂、N、およびNR²からなる群より選択され、

Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは、O、S、CR¹、C(R³)₂、N、およびNR²からなる群より独立して選択され、

Y⁴はCまたはNであり、

X¹は、O、S、N、NR²、およびCR¹からなる群より選択され、

X²は、O、S、N、NR⁴、およびCR⁵からなる群より選択され、

各

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、およびX²を含む5員環はヘテロアリアルであり、

40

Wは、

(i) C(=O)、

(ii) C(=S)、

(iii) S(O)_{1~2}、

(iv) C(=NR^d)、

(v) C(=NH)、

(vi) C(=C-NO₂)、

(vii) S(O)N(R^d)、および

(viii) S(O)NH

50

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され：

(A)

QはNHもしくはN(C₁~6アルキル)であり、ここで、C₁~6アルキルは、1~2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよく、かつ

Aは、

(i) - (YA1)_n-YA2であって、

・ nが0もしくは1であり、

・ YA1が、1~6個のR^aで置換されていてもよいC₁~6アルキレンであり、かつ

・ YA2が、

(a) 1~4個のR^bで置換されていてもよいC₃~20シクロアルキル、

(b) 1~4個のR^cで置換されていてもよいC₆~20アリアル、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリアルであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、該ヘテロアリアル、もしくは

(d) 3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、該ヘテロシクリル

である、

該-(YA1)_n-YA2、または

(ii) -Z1-Z2-Z3であって、

・ Z1が、1~4個のR^aで置換されていてもよいC₁~3アルキレンであり、

・ Z2が、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・ Z3が、1~4個のR^aで置換されていてもよいC₂~7アルキルである、

該-Z1-Z2-Z3、または

(iii) 1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル

である、

または、

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、



はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3~16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、

R¹の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1~2個のR^aで置換されていてもよいC₁~6アルキル、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₁~4ハロアルキル、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀~3アルキレン)-、C₃~6シクロアルキル、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀

～3アルキレン) -C₆～10アリール、-(C₀～3アルキレン) -5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン) -5～10員のヘテロアリール、-(C₀～3アルキレン) -5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン) -5～10員のヘテロシクリル、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、ならびに-C(=O)N(R') (R'')からなる群より独立して選択され、

10

R²の各出現は、

- (i) 1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、
- (ii) C₃～6シクロアルキル、
- (iii) 3～10個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、該ヘテロシクリル、
- (iv) -C(O)(C₁～4アルキル)、
- (v) -C(O)O(C₁～4アルキル)、
- (vi) -CON(R') (R'')、
- (vii) -S(O)₁～2(NR'¹R'')、
- (viii) -S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、
- (ix) -OH、
- (x) C₁～4アルコキシ、ならびに
- (xi) H

20

からなる群より独立して選択され、

R³の各出現は、H、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R') (R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、シアノ、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択されるか、または同じ炭素上の2つのR³は組み合わせさせてオキソを形成し、

30

R⁴は、HおよびC₁～6アルキルからなる群より選択され、

R⁵は、H、ハロ、C₁～4アルコキシ、OH、オキソ、およびC₁～6アルキルからなる群より選択され、

R^aの各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-CON(R') (R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、シアノ、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

40

R^bの各出現は、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R') (R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、シアノ、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン) -C₆～10アリール、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン) -C₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

50

R^cの各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、

(iv) C₂～6アルケニル、

(v) C₂～6アルキニル、

(vi) C₁～4ハロアルキル、

(vii) C₁～4アルコキシ、

(viii) C₁～4ハロアルコキシ、

(ix) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、 10

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀～3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、

(xii) -NR^eR^f、

(xiii) -OH、

(xiv) -S(O)₁～2(NR'¹R'')、

(xv) -C₁～4チオアルコキシ、

(xvi) -NO₂、 20

(xvii) -C(=O)(C₁～4アルキル)、

(xviii) -C(=O)O(C₁～4アルキル)、

(xix) -C(=O)OH、

(xx) -C(=O)N(R')(R'')、

(xxi) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリのールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリのールが、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリのール 30

からなる群より独立して選択され、

R^dは、C₁～6アルキル、C₃～6シクロアルキル、-C(O)(C₁～4アルキル)、-C(O)O(C₁～4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-CN、-OH、およびC₁～4アルコキシからなる群より選択され、

R^eおよびR^fの各出現は、H、C₁～6アルキル、C₁～6ハロアルキル、C₃～6シクロアルキル、-C(O)(C₁～4アルキル)、-C(O)O(C₁～4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-OH、およびC₁～4アルコキシからなる群より独立して選択されるか、またはR^eおよびR^fは、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルからなる群より独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R^eおよびR^fに結合した窒素原子に加えて)とを含み、 40

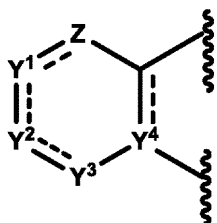
R^gの各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R')(R'')からなる群より独立して選択され、 50

かつ、

R'およびR''の各出現は、HおよびC₁～4アルキルからなる群より独立して選択されるか、またはR'およびR''は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルからなる群より独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) N (R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子 (R'およびR''に結合した窒素原子に加えて) とを含み、

但し、以下のa)、b)、およびc)のうちの1つまたは複数が該当し：

a) 以下の環：



10

におけるZ、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴のうちの1つもしくは複数は、独立して選択されるヘテロ原子である、

b) Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は部分的に不飽和である、または

c) Zは結合である、

20

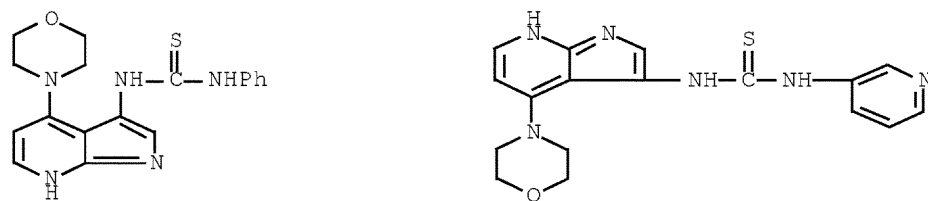
さらに、但し、Q-Aが(A)にしたがって定義され、Aが、パラ位においてn-ブチルなどのC₄アルキルで一置換されているC₆アリールであり、かつZ、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環が芳香族である場合、Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は、水素以外の1つまたは複数のR¹で置換されていなければならない、かつ

さらに、但し、該化合物は、

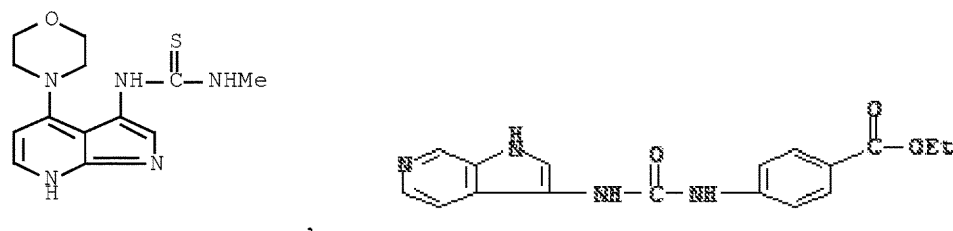
30

40

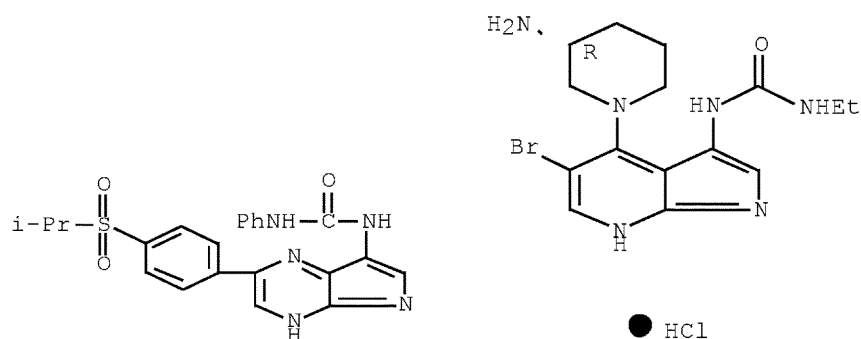
50



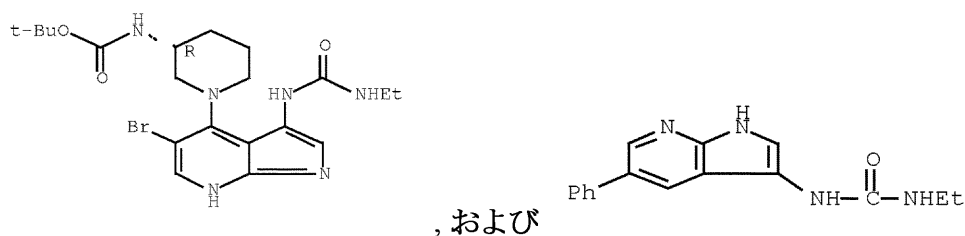
10



20



30



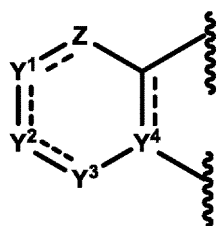
からなる群より選択されない、

該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

40

[本発明1002]

以下の環：



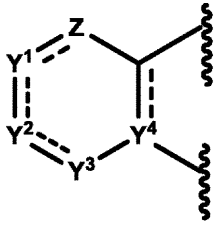
におけるZ、Y1、Y2、Y3、およびY4のうちの1つまたは複数が、独立して選択されるへ

50

テロ原子である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む環：



が芳香族である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1004]

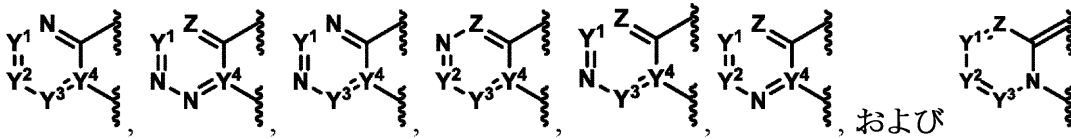
Zが結合以外である、本発明1001～1003のいずれかの化合物。

[本発明1005]

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4のうちの1～2つが独立してNである、本発明1001～1004のいずれかの化合物。

[本発明1006]

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む前記環が、



からなる群より選択され、各



が、X1およびX2を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の

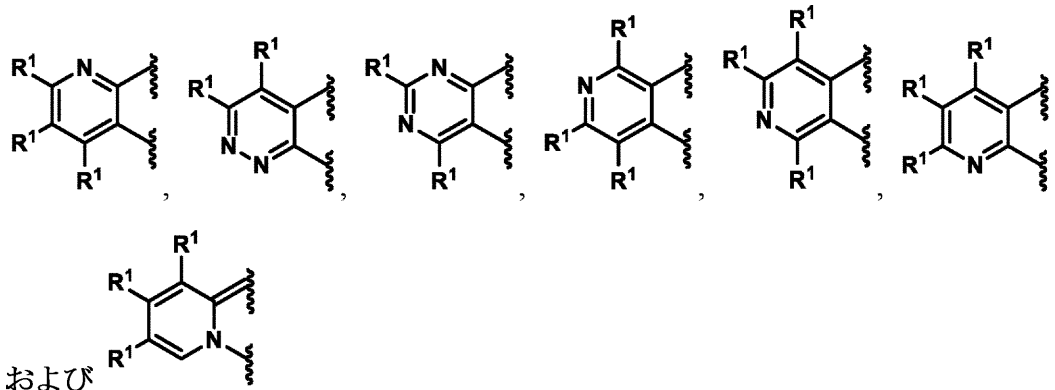


がX1への結合点を表す、

本発明1001～1005のいずれかの化合物。

[本発明1007]

Z、Y1、Y2、Y3、およびY4を含む前記環が、



からなる群より選択され、各



が、X1およびX2を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の



10

20

30

40

50

がX¹への結合点を表す、

本発明1001～1006のいずれかの化合物。

[本発明1008]

Zが結合である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1009]

Y²がCR¹である、本発明1001～1002および1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

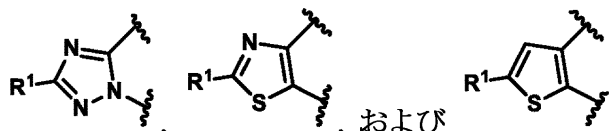
Y¹およびY³のうちの1～2つがCR¹以外である、本発明1001～1002および1008～1009のいずれかの化合物。

[本発明1011]

Y¹およびY³のうちの1～2つが、N、CR¹、およびSからなる群より独立して選択される、本発明1001～1002および1008～1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む前記環が、



からなる群より選択され、各

が、X¹およびX²を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の

がX¹への結合点を表す、

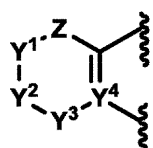
本発明1001～1002および1008～1011のいずれかの化合物。

[本発明1013]

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む前記環が部分的に不飽和である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1014]

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む前記環が、



であり、各

が、X¹およびX²を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の

がX¹への結合点を表す、

本発明1001～1002および1013のいずれかの化合物。

[本発明1015]

Zが単結合以外である、本発明1001～1002および1013～1014のいずれかの化合物。

[本発明1016]

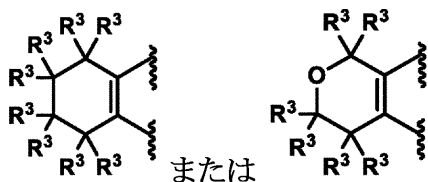
Y⁴がCである、本発明1001～1002および1013～1015のいずれかの化合物。

[本発明1017]

Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つがC(R³)₂以外である、本発明1001～1002および1013～1016のいずれかの化合物。

[本発明1018]

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む前記環が、



であり、各

が、X¹およびX²を含む前記環への結合点を表し、かつ下方の

がX¹への結合点を表す、

本発明1001～1002および1013～1016のいずれかの化合物。

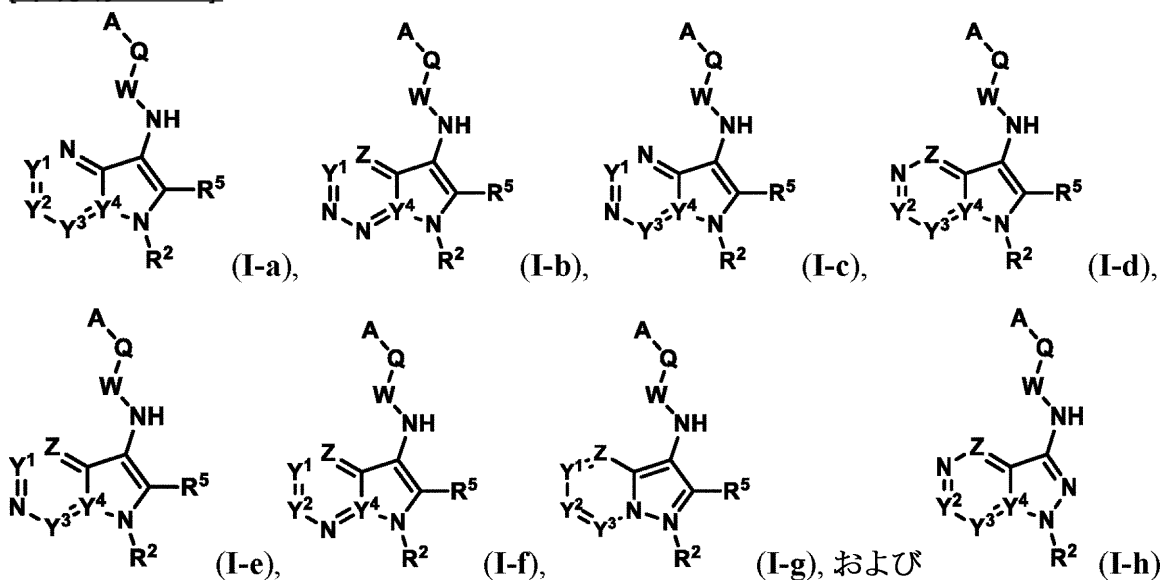
[本発明1019]

X²が、NまたはCR⁵、例えばCR⁵である、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本発明1020]

X¹が、NおよびNR²、例えばNHからなる群より選択される、本発明1001～1019のいずれかの化合物。

[本発明1021]



からなる群より選択される式を有する、本発明1001～1007および1019～1020のいずれかの化合物。

[本発明1022]

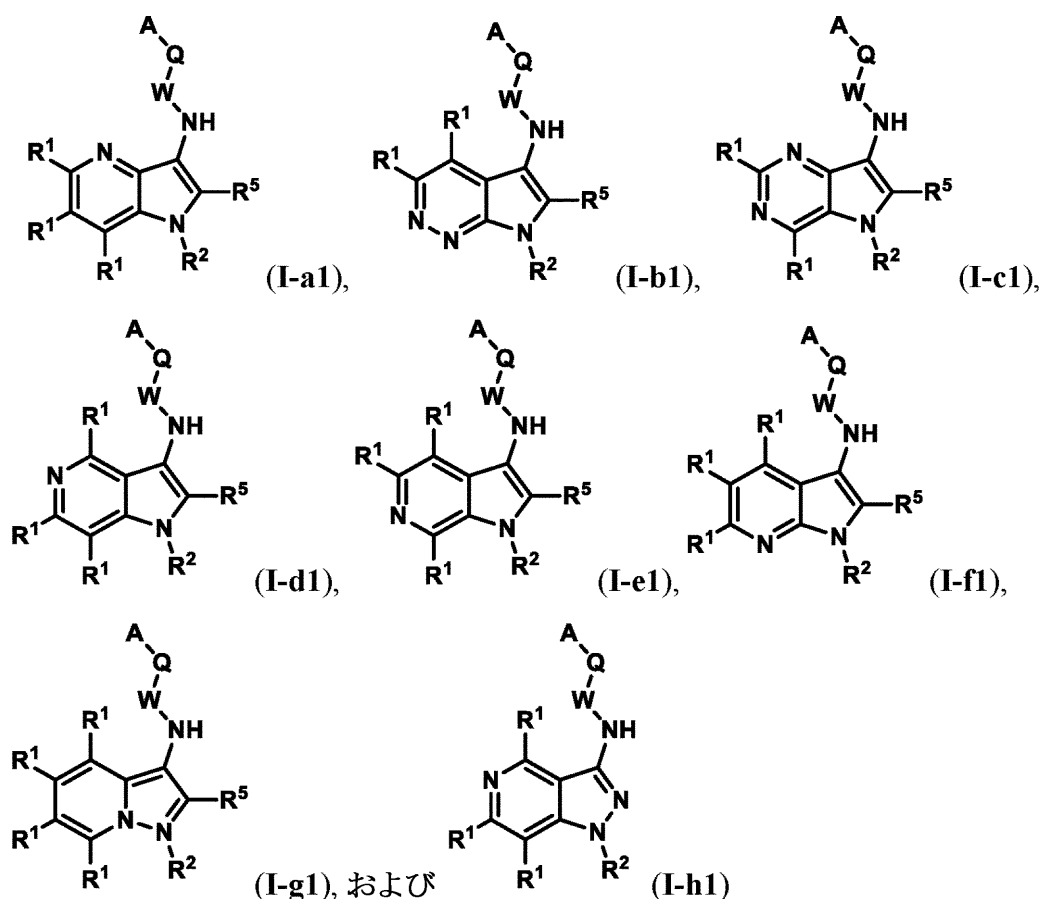
10

20

30

40

50



10

20

からなる群より選択される式を有する、本発明1001～1007および1019～1021のいずれかの化合物。

[本発明1023]

式 (I-a1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1024]

式 (I-b1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1025]

式 (I-c1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1026]

式 (I-d1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1027]

式 (I-e1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1028]

式 (I-f1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1029]

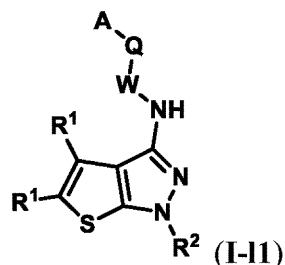
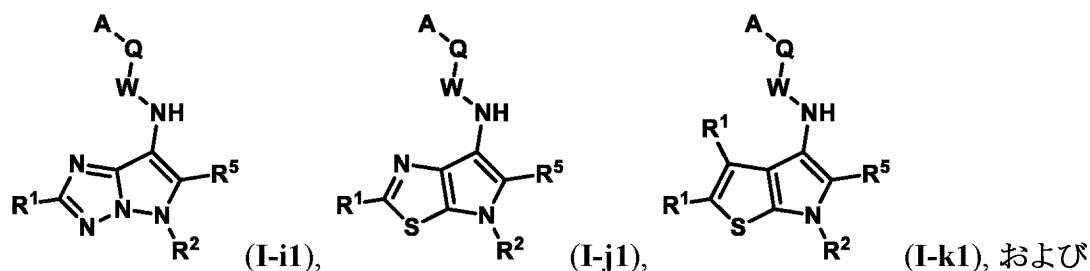
式 (I-g1) を有するか、または式 (I-h1) を有する、本発明1001～1007および1019～1022のいずれかの化合物。

[本発明1030]

30

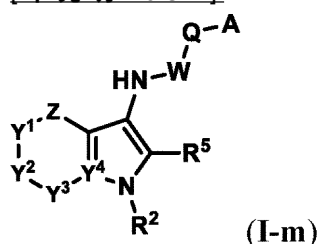
40

50

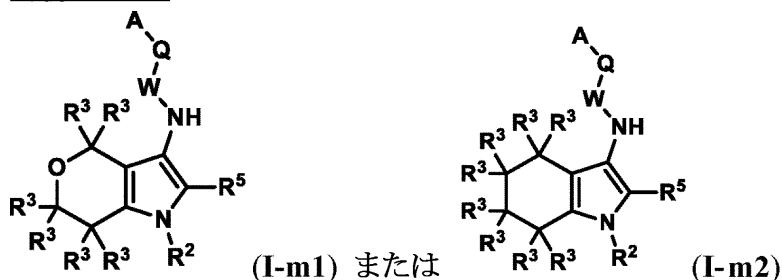


からなる群より選択される式を有する、本発明1001～1002、1008～1012、および1019～1021のいずれかの化合物。

[本発明1031]



(例えば、



) からなる群より選択される式を有する、本発明1001～1002、1013～1018、および1019～1020のいずれかの化合物。

[本発明1032]

各R¹が、H、ハロ、シアノ、1～2個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、OH、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-S(O)_{1～2}(NR¹R^{1'})、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R¹)(R^{1'})からなる群より独立して選択される、本発明1001～1031のいずれかの化合物。

[本発明1033]

R¹の1つまたは複数の出現が独立してHである、本発明1001～1032のいずれかの化合物。

[本発明1034]

R¹の残りの出現のそれぞれが、ハロ、シアノ、1～2個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、OH、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R')(R'')からなる群より独立して選択される、本発明1033の化合物。

[本発明1035]

R¹の残りの出現のそれぞれが、メチル、C(O)NHMe、CF₃、ヒドロキシ-C₁～6アルキル（例えば、1-ヒドロキシ-エタ-1-イル）、およびメトキシより選択される、本発明1034の化合物。

[本発明1036]

各R²が、

(i) 1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、

(ii) C₃～6シクロアルキル、

(iii) 3～10個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、該ヘテロシクリル、ならびに

(xi) H

からなる群より独立して選択される、本発明1001～1035のいずれかの化合物。

[本発明1037]

各R²が、

(i) 1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、および

(xi) H（例えば、各R²が独立してHである）

からなる群より独立して選択される、本発明1001～1036のいずれかの化合物。

[本発明1038]

各R³が、H、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、-F、-Cl、-Br、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、およびシアノからなる群より独立して選択されるか、または同じ炭素上の2つのR³が組み合わさってオキソを形成する、本発明1001～1037のいずれかの化合物。

[本発明1039]

各R³が、H、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、およびC₁～4ハロアルキルからなる群より独立して選択されるか、または同じ炭素上の2つのR³が組み合わさってオキソを形成する、本発明1001～1038のいずれかの化合物。

[本発明1040]

各R³が、H、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、およびC₁～4ハロアルキルからなる群より独立して選択される、本発明1001～1039のいずれかの化合物。

[本発明1041]

各R³がHである、本発明1040の化合物。

[本発明1042]

各R⁵が、H、オキソ、およびヒドロキシからなる群より独立して選択される、本発明1001～1041のいずれかの化合物。

[本発明1043]

各R⁵がHまたはC₁～3アルキル、例えば、Hである、本発明1001～1041のいずれかの化合物。

[本発明1044]

Wが、

- (i) C (=O)、
- (ii) C (=S)、
- (iii) S (O) 1~2、
- (iv) C (=NR^d)、
- (v) C (=NH)、および
- (vi) C (=C-NO₂)

からなる群より選択される、本発明1001~1043のいずれかの化合物。

[本発明1045]

WがC (=O) である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1046]

QおよびAが(A) にしたがって定義される、本発明1001~1045のいずれかの化合物。

[本発明1047]

Aが-(YA1)_n-YA2である、本発明1001~1046のいずれかの化合物。

[本発明1048]

nが0である、本発明1001~1047のいずれかの化合物。

[本発明1049]

nが1である、本発明1001~1047のいずれかの化合物。

[本発明1050]

YA1が、C₁~3アルキレン、例えばCH₂またはCH₂CH₂である、本発明1001~1047および1049のいずれかの化合物。

[本発明1051]

YA2が、1~4個のR^cで置換されていてもよいC₆~20アリールである、本発明1001~1050のいずれかの化合物。

[本発明1052]

YA2が、1~3個のR^cで置換されていてもよいC₆~10アリールである、本発明1001~1051のいずれかの化合物。

[本発明1053]

YA2が、1~3個のR^cで置換されていてもよいフェニルである、本発明1001~1052のいずれかの化合物。

[本発明1054]

YA2が、1~2個のR^cで置換されたフェニルである、本発明1001~1053のいずれかの化合物。

[本発明1055]

YA2が、パラ位においてR^cで置換されたフェニルである、本発明1054の化合物。

[本発明1056]

YA2が、5~20個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1001~1050のいずれかの化合物。

[本発明1057]

YA2が、5~10個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~3個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1001~1050および1056のいずれかの化合物。

[本発明1058]

YA2が、5~10個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R^d) からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~3個の独

10

20

30

40

50

立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1001～1050および1056～1057のいずれかの化合物。

[本発明1059]

YA²が、5～10個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R^d)からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1001～1050および1056～1058のいずれかの化合物。

[本発明1060]

YA²が、6～10個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～2個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R^d)からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1001～1050および1056～1059のいずれかの化合物。

[本発明1061]

YA²が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよいクニオリニルまたはテトラヒドロキノリル、例えば、非置換のクニオリニルまたはテトラヒドロキノリルである、本発明1001～1050および1056～1060のいずれかの化合物。

[本発明1062]

R^cの各出現が、

(iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、
(ix) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、ならびに

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀～3アルキレン)-ヘテロシクリル
からなる群より独立して選択される、本発明1051～1061のいずれかの化合物。

[本発明1063]

R^cの各出現が独立して、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキルである、本発明1051～1062のいずれかの化合物。

[本発明1064]

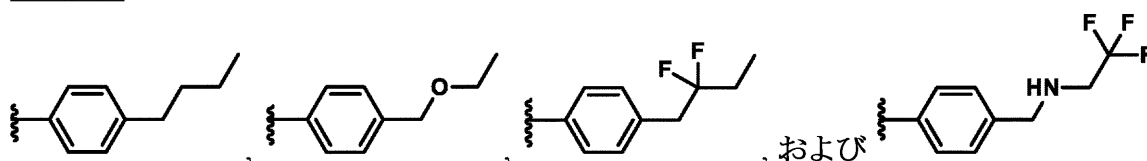
R^cが、ハロ（例えば、F）で置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4アルコキシ、および/またはNR^eR^fからなる群より独立して選択される、本発明1051～1063のいずれかの化合物。

[本発明1065]

R^cが独立して、非置換のC₁～6アルキル（例えば、n-ブチル）、エトキシメチル、CH₂NHCH₂CF₃、およびCH₂CF₂CH₂CH₃である、本発明1064の化合物。

[本発明1066]

Aが、



からなる群より選択される、本発明1001～1048および1051～1065のいずれかの化合物。

[本発明1067]

R^cの各出現が、

(ix) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、ならびに

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀～3アルキレン)-ヘテロシクリルからなる群より独立して選択される、本発明1051～1062のいずれかの化合物。

[本発明1068]

R^cの各出現が、

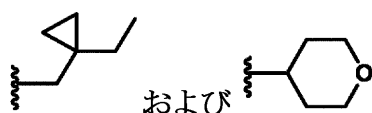
(ix) 1個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₁アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、ならびに

(x) ヘテロシクリルが6個の環原子を含み、1個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-ヘテロシクリル

からなる群より独立して選択される、本発明1051～1062および1067のいずれかの化合物。

[本発明1069]

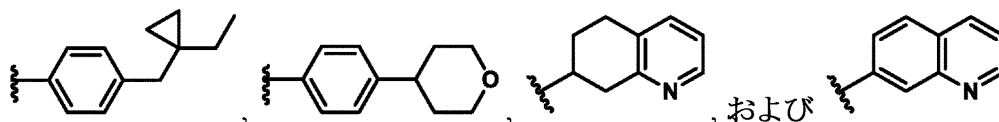
R^cの各出現が、



からなる群より独立して選択される、本発明1068の化合物。

[本発明1070]

Aが、



からなる群より選択される、本発明1001～1048、1051～1061、および1067～1069のいずれかの化合物。

[本発明1071]

YA₂が、1～4個のR^bで置換されていてもよいC₃～20シクロアルキルである、本発明1001～1050のいずれかの化合物。

[本発明1072]

YA₂が、3～12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、本発明1001～1050のいずれかの化合物。

[本発明1073]

R^bの各出現が、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキルからなる群より選択される、本発明1071または1072の化合物。

[本発明1074]

R^bの各出現が、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、およびC₁～4ハロアルキルからなる群より選択される、本発明1071～1073のいずれかの化合物。

[本発明1075]

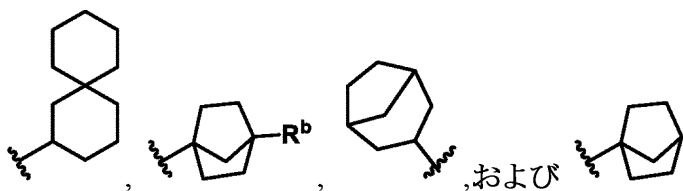
R^bの各出現が、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキルからなる群より選択される、本発明1071～1074のいずれかの化合物。

[本発明1076]

R^b の各出現が、非置換のC₁~6アルキル（例えば、n-ブチルなどのブチル）からなる群より選択される、本発明1071~1075のいずれかの化合物。

[本発明1077]

Aが、

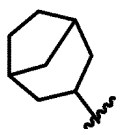


10

からなる群より選択される、本発明1001~1048、1071、および1073~1076のいずれかの化合物。

[本発明1078]

Aが、

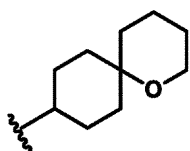


20

である、本発明1001~1048、1071、および1073~1077のいずれかの化合物。

[本発明1079]

Aが、



である、本発明1001~1048および1072~1076のいずれかの化合物。

[本発明1080]

QおよびAが(B)にしたがって定義される、本発明1001~1045のいずれかの化合物。

30

[本発明1081]

Eが、3~12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~2個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、本発明1001~1045および1080のいずれかの化合物。

[本発明1082]

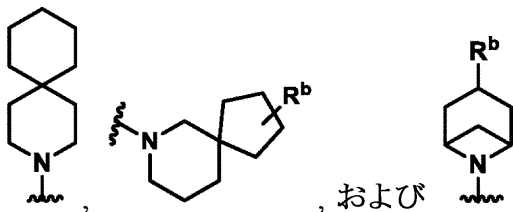
Eが、6~12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~2個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、本発明1001~1045および1080~1081のいずれかの化合物。

40

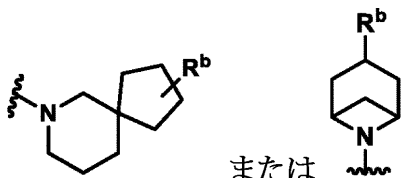
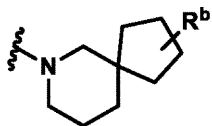
[本発明1083]

Eが、6~12個の環原子を含むヘテロシクリル（例えば、スピロ環式ヘテロシクリル）であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~2個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、本発明1001~1045および1080~1081のいずれかの化合物。

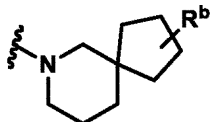
50

[本発明1084]Eが、(例えば、R^bが、n-ブチルおよびエチルなどの非置換のC₁~6アルキルである、

10

) からなる群より選択される、本発明1001~1045および1080~1082のいずれかの化合物。[本発明1085]Eが、

20

(例えば、R^bがエチルなどの非置換のC₁~6アルキルである、

30

) である、本発明1001~1045および1080~1083のいずれかの化合物。[本発明1086]QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051~1055および1062~1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。[本発明1087]QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051~1055および1067~1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

40

[本発明1088]QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056~1061および1062~1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。[本発明1089]QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056~1061および1067~1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。[本発明1090]QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1

50

071および1073～1078のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1091]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1072、1073～1076、および1079のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1092]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1093]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1094]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1095]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1096]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1071および1073～1078のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1097]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1072、1073～1076、および1079のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1098]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc)))であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1099]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc)))であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1100]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc)))であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1101]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc)))であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1102]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc)))であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1071および1073～1078のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

10

20

30

40

50

[本発明1103]

QがNHであり、WがC(=NR^d) (例えば、C(=N(Boc))) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1072、1073～1076、および1079のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1104]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1105]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

10

[本発明1106]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1062～1065のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1107]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1067～1070のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

20

[本発明1108]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1071および1073～1078のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1109]

QがNHであり、WがC(=NH) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1072、1073～1076、および1079のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1110]

WがC(=O) であり、かつQ-Aが、本発明1080～1085のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

30

[本発明1111]

WがC(=S) であり、かつQ-Aが、本発明1080～1085のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1112]

Wが C(=NR^d) (例えば、C(=NBoc)) であり、かつQ-Aが、本発明1080～1085のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1113]

WがC(=NH) であり、かつQ-Aが、本発明1080～1085のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1001の化合物。

40

[本発明1114]

式(I-a1)を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1115]

式(I-b1)を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1116]

式(I-c1)を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1117]

式(I-d1)を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1118]

式(I-e1)を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

50

[本発明1119]

式 (I-f1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1120]

式 (I-g1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1121]

式 (I-h1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1122]

式 (I-i1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1123]

式 (I-j1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1124]

式 (I-k1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1125]

式 (I-l1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1126]

式 (I-m1) を有する、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

[本発明1127]

R¹が、本発明1032～1036のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1086～1126のいずれかの化合物。

[本発明1128]

R²が、本発明1037において定義される通りである、本発明1086～1127のいずれかの化合物。

[本発明1129]

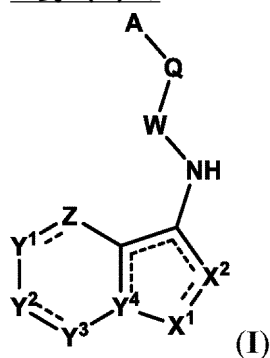
R³が、本発明1038～1041のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1086～1128のいずれかの化合物。

[本発明1130]

R⁵が、本発明1043において定義される通りである（例えば、R⁵=H）、本発明1086～1129のいずれかの化合物。

[本発明1131]

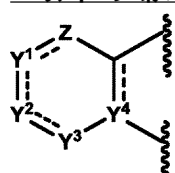
式 (I) :



の化合物であって、

式 (I) 中、

以下の環：



10

20

30

40

50

におけるZ、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるヘテロ原子であり、

Zは、CR¹およびNからなる群より選択され、

Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは、CR¹およびNからなる群より独立して選択され、

但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるCR¹であり、

Y⁴はCであり、

X¹はNHであり、

X²はCHであり、

各

10

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、およびX²を含む5員環はヘテロアリールであり、かつ

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は芳香族であり、

Wは、

(i) C (=O)、

(ii) C (=S)、

(iv) C (=NR^d)、および

(v) C (=NH)

20

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され：

(A)

QはNHもしくはN(C₁~6アルキル)であり、ここで、C₁~6アルキルは、1~2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよく、かつ

Aは、

(i) - (YA¹)_n-YA²であって、

・ nが0もしくは1であり、

・ YA¹が、1~6個のR^aで置換されていてもよいC₁~6アルキレンであり、かつ

・ YA²が、

30

(a) 1~4個のR^bで置換されていてもよいC₃~20シクロアルキル、

(b) 1~4個のR^cで置換されていてもよいC₆~20アリール、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくは

(d) 3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、該ヘテロシクリル

40

である、

該- (YA¹)_n-YA²、または

(ii) -Z¹-Z²-Z³であって、

・ Z¹が、1~4個のR^aで置換されていてもよいC₁~3アルキレンであり、

・ Z²が、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・ Z³が、1~4個のR^aで置換されていてもよいC₂~7アルキルである、

該-Z¹-Z²-Z³、または

(iii) 1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル

である、

または

50

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、

10

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3～16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、

R¹の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1～2個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₂～6アルケニル、C₂～6アルキニル、C₁～4ハロアルキル、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリル、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、ならびに-C(=O)N(R')(R'')

20

30

からなる群より独立して選択され、

R^aの各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-CON(R')(R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、シアノ、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^bの各出現は、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)₁～2(NR'¹R'')、-S(O)₁～2(C₁～4アルキル)、シアノ、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

40

R^cの各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、(iv) C₂～6アルケニル、

50

- (v) $C_2 \sim 6$ アルキニル、
 (vi) $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、
 (vii) $C_1 \sim 4$ アルコキシ、
 (viii) $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、
 (ix) 1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、
 (x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)-ヘテロシクリル、
 (xi) -S(O) 1～2 ($C_1 \sim 4$ アルキル)、
 (xii) -NR^eR^f、
 (xiii) -OH、
 (xiv) -S(O) 1～2 (NR'R'')、
 (xv) - $C_1 \sim 4$ チオアルコキシ、
 (xvi) -NO₂、
 (xvii) -C(=O) ($C_1 \sim 4$ アルキル)、
 (xviii) -C(=O) O ($C_1 \sim 4$ アルキル)、
 (xix) -C(=O) OH、
 (xx) -C(=O) N(R') (R'')、ならびに
 (xxi) 1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_6 \sim 10$ アリール、ならびに
 (xxii) ヘテロアリのルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリのルが、1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい、- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリのルからなる群より独立して選択され、
 R^d は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、-C(O) ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-C(O) O ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-CON(R') (R'')、-S(O) 1～2 (NR'R'')、-S(O) 1～2 ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-OH、-CN、および $C_1 \sim 4$ アルコキシからなる群より選択され、
 R^e および R^f の各出現は、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、-C(O) ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-C(O) O ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-CON(R') (R'')、-S(O) 1～2 (NR'R'')、-S(O) 1～2 ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-OH、および $C_1 \sim 4$ アルコキシからなる群より独立して選択されるか、または R^e および R^f は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $C_1 \sim 3$ アルキルより独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R^e および R^f に結合した窒素原子に加えて)とを含み、
 R^g の各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、S(O) 1～2 ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O) 1～2 (NR'R'')、- $C_1 \sim 4$ チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O) ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-C(=O) O ($C_1 \sim 4$ アルキル)、-C(=O) OH、および-C(=O) N(R') (R'') からなる群より独立して選択され、
 かつ、
 R' および R'' の各出現は、Hおよび $C_1 \sim 4$ アルキルからなる群より独立して選択されるか、または R' および R'' は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $C_1 \sim 3$ アルキルより独立して選択される、1～2個の置換基でそれぞれが置換されている1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、および

10

20

30

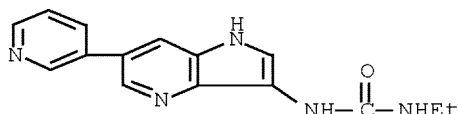
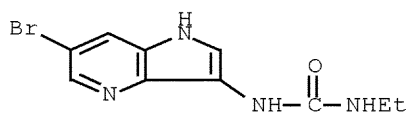
40

50

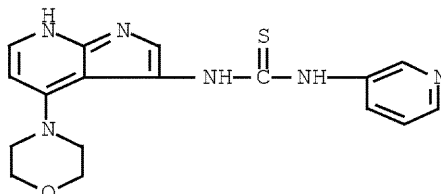
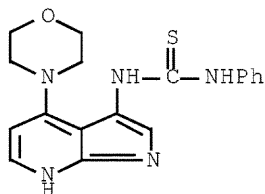
Sからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子（R'およびR''に結合した窒素原子に加えて）とを含み、

但し、Q-Aが（A）にしたがって定義され、Aが、パラ位においてn-ブチルなどのC₄アルキルで置換されているC₆アリールである場合、Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は、水素以外の1つまたは複数のR¹で置換されていなければならない、かつ

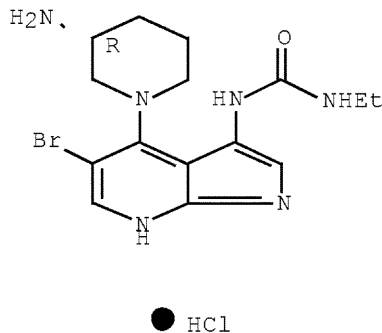
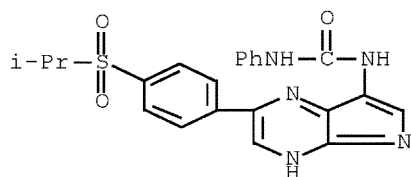
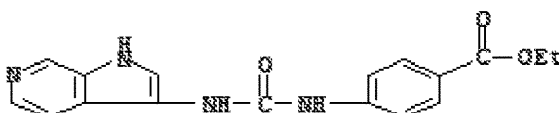
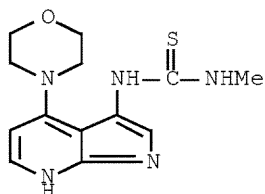
さらに、但し、該化合物は、



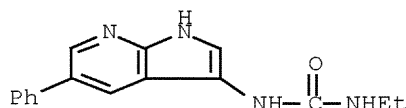
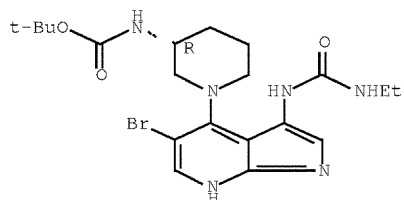
10



20



30



40

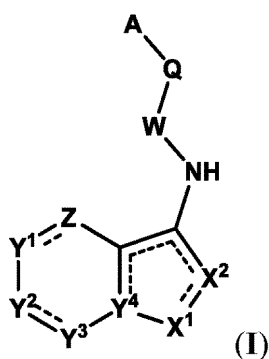
, および

のうちの1つ以外または複数以外である、

該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

[本発明1132]

式 (I) :

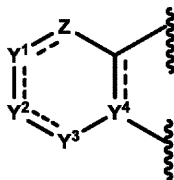


10

の化合物であって、

式 (I) 中、

以下の環：



20

における Z、Y¹、Y²、Y³、および Y⁴ のうちの 1 つまたは複数は、独立して選択されるヘテロ原子であり、

Z は、CR¹ および N からなる群より選択され、

Y¹、Y²、および Y³ のそれぞれは、CR¹ および N からなる群より独立して選択され、

但し、Z、Y¹、Y²、および Y³ のうちの 1 つまたは複数は、独立して選択される CR¹ であり、

Y⁴ は C であり、

X¹ は NH であり、

X² は CH であり、

各

30

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、および X² を含む 5 員環はヘテロアリアルであり、かつ

Z、Y¹、Y²、Y³、および Y⁴ を含む該環は芳香族であり、

W は、

(i) C (=O)、

(ii) C (=S)、

(iv) C (=NR^d)、および

(v) C (=NH)

からなる群より選択され、

Q-A は、以下の (A) または (B) にしたがって定義され：

(A)

Q は NH もしくは N (C₁~6 アルキル) であり、ここで、C₁~6 アルキルは、1~2 個の独立して選択される R^a で置換されているとしてもよく、かつ

A は、

(i) - (YA¹)_n-YA² であって、

・ n は 0 もしくは 1 であり、

・ YA¹ は、1~6 個の R^a で置換されているとしてもよい C₁~6 アルキレンであり、かつ

・ YA² は、

50

(a) 1～4個の R^b で置換されていてもよい $C_3 \sim 20$ シクロアルキル、

(b) 1～4個の R^c で置換されていてもよい $C_6 \sim 20$ アリール、

(c) 5～20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択される R^c で置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくは

(d) 3～16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、該ヘテロシクリルである、

10

該-(YA1)_n-YA2、または

(ii) -Z1-Z2-Z3であって、

・Z1は、1～4個の R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 3$ アルキレンであり、

・Z2は、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・Z3は、1～4個の R^a で置換されていてもよい $C_2 \sim 7$ アルキルである、

該-Z1-Z2-Z3、または

(iii) 1～6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 10$ アルキルである、

20

または

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、

30

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3～16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1～4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、

R^1 の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1～2個の R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい-($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい-($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_6 \sim 10$ アリール、-($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該-($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、-($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該-($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロシクリル、-S(O)_{1~2}($C_1 \sim 4$ アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)_{1~2}(NR^hRⁱ)、-C_{1~4}チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)($C_1 \sim 4$ アルキル)、-C(=O)O

40

50

(C₁~4アルキル)、-C(=O)OH、ならびに-C(=O)N(R')(R'')

からなる群より独立して選択され、

R^aの各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、-C(=O)O(C₁~4アルキル)、-C(=O)(C₁~4アルキル)、-C(=O)OH、-CON(R')(R'')、-S(O)_{1~2}(NR'R'')、-S(O)_{1~2}(C₁~4アルキル)、シアノ、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよいC₃~6シクロアルキル

からなる群より独立して選択され、

R^bの各出現は、1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル、C₁~4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁~4アルコキシ、C₁~4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁~4アルキル)、-C(=O)O(C₁~4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)_{1~2}(NR'R'')、-S(O)_{1~2}(C₁~4アルキル)、シアノ、1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい(C₀~3アルキレン)-C₆~10アリール、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい(C₀~3アルキレン)-C₃~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^cの各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10アルキル、

(iv) C₂~6アルケニル、

(v) C₂~6アルキニル、

(vi) C₁~4ハロアルキル、

(vii) C₁~4アルコキシ、

(viii) C₁~4ハロアルコキシ、

(ix) 1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい-(C₀~3アルキレン)-C₃~6シクロアルキル、

(x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀~3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)_{1~2}(C₁~4アルキル)、

(xii) -NR^eR^f、

(xiii) -OH、

(xiv) -S(O)_{1~2}(NR'R'')、

(xv) -C₁~4チオアルコキシ、

(xvi) -NO₂、

(xvii) -C(=O)(C₁~4アルキル)、

(xviii) -C(=O)O(C₁~4アルキル)、

(xix) -C(=O)OH、

(xx) -C(=O)N(R')(R'')、

(xxi) 1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい-(C₀~3アルキレン)-C₆~10アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリールの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい、-(C₀~3アルキレン)-5~10員のヘテロアリール

からなる群より独立して選択され、

R^dは、C₁~6アルキル、C₃~6シクロアルキル、-C(O)(C₁~4アルキル)、-C(O)O(C₁~4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)_{1~2}(NR'R'')、-S(O)_{1~2}(C₁~4アルキル)、-OH、-CN、およびC₁~4アルコキシからなる群より選択され

10

20

30

40

50

R^e および R^f の各出現は、H、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、 $-C(O)(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-C(O)O(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-\text{CON}(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-\text{OH}$ 、および $C_1\sim 4$ アルコキシからなる群より独立して選択されるか、または R^e および R^f は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $C_1\sim 3$ アルキルより独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) $N(R^d)$ 、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R^e および R^f に結合した窒素原子に加えて)とを含み、

10

R^g の各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 4$ ハロアルキル、1～2個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_1\sim 4$ ハロアルコキシ、 $S(O)_{1\sim 2}(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-\text{NR}^e\text{R}^f$ 、 $-\text{OH}$ 、オキソ、 $-S(O)_{1\sim 2}(NR'R'')$ 、 $-C_1\sim 4$ チオアルコキシ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-C(=O)(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)O(C_1\sim 4\text{アルキル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、および $-C(=O)N(R')(R'')$ からなる群より独立して選択され、

かつ、

R' および R'' の各出現は、Hおよび $C_1\sim 4$ アルキルからなる群より独立して選択されるか、または R' および R'' は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) Hおよび $C_1\sim 3$ アルキルより独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) $N(R^d)$ 、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R' および R'' に結合した窒素原子に加えて)とを含み、

20

但し、

(1) Wが $C(=O)$ である場合、Aは、非置換のエチル以外または非置換のフェニル以外であり、

(2) Wが $C(=S)$ である場合、 R^1 はモルホリン-4-イル以外であり、かつ

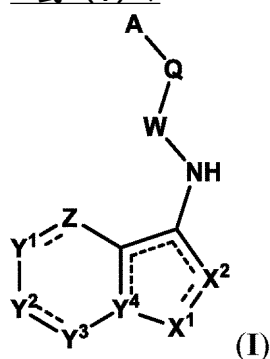
(3) Y^2 がNであり、かつZ、 Y^1 、および Y^3 のそれぞれがCHである場合、Aは、パラ位において $C(O)_2(C_1\sim 3\text{アルキル})$ (例えば、 $C(O)_2\text{Et}$)で一置換されている C_6 アリール以外であり、

30

但し、Q-Aが(A)にしたがって定義され、Aが、パラ位においてn-ブチルなどの C_4 アルキルで一置換されている C_6 アリールである場合、Z、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、および Y^4 を含む該環は、水素以外の1つまたは複数の R^1 で置換されていなければならない、該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

[本発明1133]

式(I)：



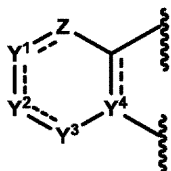
40

の化合物であって、

式(I)中、

以下の環：

50



におけるZ、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるヘテロ原子であり、

Zは、CR¹およびNからなる群より選択され、

Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは、CR¹およびNからなる群より独立して選択され、

但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数は、独立して選択されるCR¹であり、

Y⁴はCであり、

X¹はNHであり、

X²はCHであり、

各

は独立して単結合または二重結合であり、但し、Y⁴、X¹、およびX²を含む5員環はヘテロアリールであり、かつ

Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は芳香族であり、

Wは、

(i) C(=O)、

(ii) C(=S)、

(iv) C(=NR^d)、および

(v) C(=NH)

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され：

(A)

QはNHもしくはN(C₁~6アルキル)であり、ここで、C₁~6アルキルは、1~2個の独立して選択されるR^aで置換されているとしてもよく、かつ

Aは、

(i) -(YA¹)_n-YA²であって、

・nが0もしくは1であり、

・YA¹が、1~6個のR^aで置換されているともよいC₁~6アルキレンであり、かつ

・YA²が、

(a) 1~4個のR^bで置換されているともよいC₃~20シクロアルキル、

(b) 1~4個の独立したR^cで置換されているC₆アリールであって、R^cの1つの出現がR^{c'}である、該C₆アリール、

(c) 1~4個のR^cで置換されているともよいC₇~20アリール、

(d) 5~6個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されている、該ヘテロアリール、

(e) 7~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR^cで置換されているともよい、該ヘテロアリール、もしくは

(f) 3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^b)、N(R^d)、およびOからな

10

20

30

40

50

る群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、該ヘテロシクリルである、

該- (YA1) $_n$ -YA2、または

(ii) -Z1-Z2-Z3であって、

・Z1が、1~4個の R^a で置換されていてもよいC1~3アルキレンであり、

・Z2が、-N(H)-、-N(R^d)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・Z3が、1~4個の R^a で置換されていてもよいC2~7アルキルである、

該-Z1-Z2-Z3、または

(iii) 1~6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよいC3~10アルキル (例えば、C5~10、C6~10、またはC7~10アルキル) である、

または、

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3~16個の環原子を含む環であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択される R^b で置換されていてもよい、

R^1 の各出現は、

H、ハロ、シアノ、1~2個の R^a で置換されていてもよいC1~6アルキル、C2~6アルケニル、C2~6アルキニル、C1~4ハロアルキル、C1~4アルコキシ、C1~4ハロアルコキシ、1~4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい-(C0~3アルキレン)-C3~6シクロアルキル、1~4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい-(C0~3アルキレン)-C6~10アリール、-(C0~3アルキレン)-5~10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該-(C0~3アルキレン)-5~10員のヘテロアリール、-(C0~3アルキレン)-5~10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1~4個の独立して選択される R^g で置換されていてもよい、該-(C0~3アルキレン)-5~10員のヘテロシクリル、-S(O)_{1~2}(C1~4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)_{1~2}(NR'¹), -C1~4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C1~4アルキル)、-C(=O)O(C1~4アルキル)、-C(=O)OH、ならびに-C(=O)N(R') (R'')からなる群より独立して選択され、

R^a の各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C1~4アルコキシ、C1~4ハロアルコキシ、-C(=O)O(C1~4アルキル)、-C(=O)(C1~4アルキル)、-C(=O)OH、-CON(R') (R'')、-S(O)_{1~2}(NR'R'')、-S(O)_{1~2}(C1~4アルキル)、シアノ、および1~4個の独立して選択されるC1~4アルキルで置換されていてもよいC3~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^bの各出現は、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、C₁～4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR^eR^f、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)_{1~2}(NR'R'')、-S(O)_{1~2}(C₁～4アルキル)、シアノ、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、および1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R^cの各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、

(iv) C₂～6アルケニル、

(v) C₂～6アルキニル、

(vi) C₁～4ハロアルキル、

(vii) C₁～4アルコキシ、

(viii) C₁～4ハロアルコキシ、

(ix) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀～3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)_{1~2}(C₁～4アルキル)、

(xii) -NR^eR^f、

(xiii) -OH、

(xiv) -S(O)_{1~2}(NR'R'')、

(xv) -C₁～4チオアルコキシ、

(xvi) -NO₂、

(xvii) -C(=O)(C₁～4アルキル)、

(xviii) -C(=O)O(C₁～4アルキル)、

(xix) -C(=O)OH、

(xx) -C(=O)N(R')(R'')、

(xxi) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール

からなる群より独立して選択され、

R^{c'}は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～10アルキル、

(iv) C₂～6アルケニル、

(v) C₂～6アルキニル、

(vi) C₁～4ハロアルキル、

(vii) C₁～4アルコキシ、

(viii) C₁～4ハロアルコキシ、

(ix) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、

10

20

30

40

50

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C₀～3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、

(xii) -NR^eR^f、

(xiii) -OH、

(xiv) -S(O)_{1～2}(NR'R'')、

(xv) -C₁～4チオアルコキシ、

(xvi) -NO₂、

(xvii) -C(=O)(C₁～4アルキル)、

(xviii) -C(=O)OMeまたは-C(=O)O(C₃～4アルキル)、

(xix) -C(=O)OH、

(xx) -C(=O)N(R')(R'')、

(xxi) 1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリのルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリのルが、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリのル

からなる群より独立して選択され、

R^dは、C₁～6アルキル、C₃～6シクロアルキル、-C(O)(C₁～4アルキル)、-C(O)O(C₁～4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-OH、-CN、およびC₁～4アルコキシからなる群より選択され、

R^eおよびR^fの各出現は、H、C₁～6アルキル、C₁～6ハロアルキル、C₃～6シクロアルキル、-C(O)(C₁～4アルキル)、-C(O)O(C₁～4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-OH、およびC₁～4アルコキシからなる群より独立して選択されるか、またはR^eおよびR^fは、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルより独立して選択される1～2個の置換基でそれぞれが置換されている、1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R^eおよびR^fに結合した窒素原子に加えて)とを含み、

R^gの各出現は、ハロ、シアノ、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、1～2個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～6アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-NR^eR^f、-OH、オキソ、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R')(R'')からなる群より独立して選択され、

かつ、

R'およびR''の各出現は、HおよびC₁～4アルキルからなる群より独立して選択されるか、またはR'およびR''は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC₁～3アルキルより独立して選択される、1～2個の置換基でそれぞれが置換されている1～7個の環炭素原子と、(b) N(R^d)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0～3個の環ヘテロ原子(R'およびR''に結合した窒素原子に加えて)とを含み、

但し、Q-Aが(A)にしたがって定義され、Aが、パラ位においてn-ブチルなどのC₄アルキルで一置換されているC₆アリールである場合、Z、Y¹、Y²、Y³、およびY⁴を含む該環は、水素以外の1つまたは複数のR¹で置換されていなければならない、該化合物、またはその薬学的に許容される塩、またはそのN-オキシド。

10

20

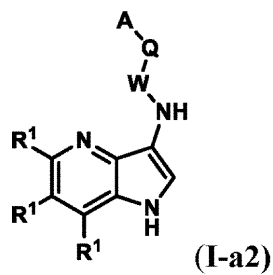
30

40

50

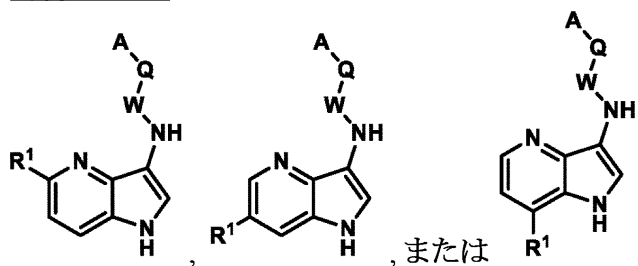
[本発明1134]

式 (I-a2) :



10

(例えば、

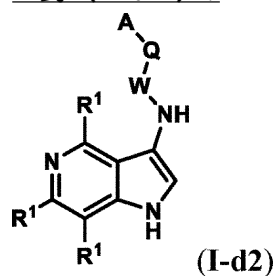


) を有する、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

20

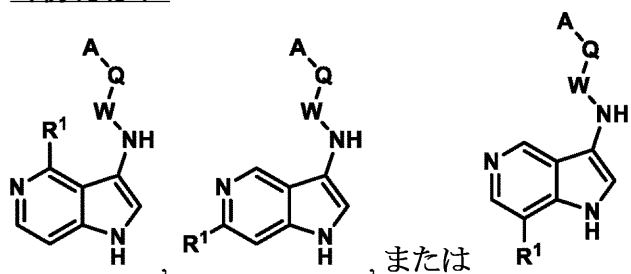
[本発明1135]

式 (I-d2) :



30

(例えば、

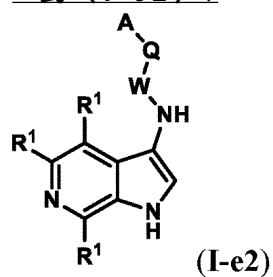


) を有する、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

40

[本発明1136]

式 (I-e2) :



50

(例えば、

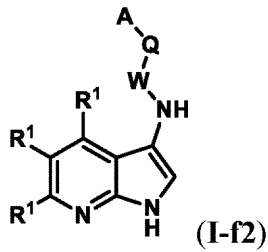


) を有する、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

10

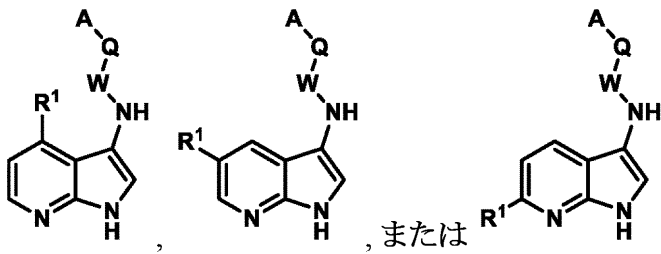
[本発明1137]

式 (I-f2) :

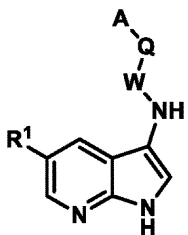


20

(例えば、



(例えば、



30

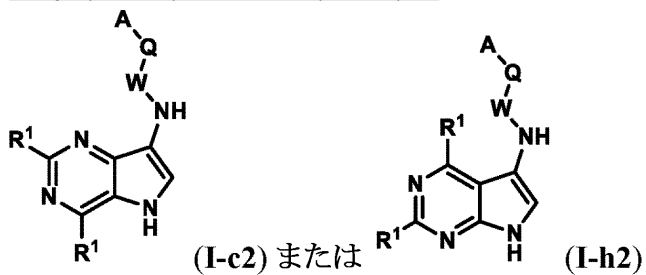
))

を有する、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

40

[本発明1138]

式 (I-c2) または (I-i2) :



を有する、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

50

[本発明1139]各R¹が、

H、ハロ、シアノ、1～2個のR^aで置換されていてもよいC₁～6アルキル、C₁～4ハロアルキル、C₂～6アルケニル（例えば、ビニル）、C₂～6アルキニル（例えば、アセチレニル）、C₁～4アルコキシ、C₁～4ハロアルコキシ、OH、-S(O)_{1～2}(C₁～4アルキル)、-S(O)_{1～2}(NR'R'')、-C₁～4チオアルコキシ、-NO₂、-C(=O)(C₁～4アルキル)、-C(=O)O(C₁～4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、ならびに-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリルであって、ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリル

10

からなる群より独立して選択される、本発明1131～1138のいずれかの化合物。

[本発明1140]

20

R¹の1～2（例えば、1）つの出現がH以外である、本発明1131～1139のいずれかの化合物。

[本発明1141]

R¹の1～2（例えば、1）つの出現が、ハロ（例えば、F）、シアノ、C₁～3アルキル（例えば、メチル）、C₁～3ハロアルキル、-C(=O)N(R')(R'')、ヒドロキシ-C₁～6アルキル（例えば、1-ヒドロキシ-エタ-1-イル）、およびメトキシからなる群より独立して選択される（例えば、R¹の1つの出現が独立してハロである）、本発明1140の化合物。

[本発明1142]

R¹の1～2（例えば、1）つの出現が独立してハロ（例えば、F）である、本発明1140の化合物。

30

[本発明1143]R¹の1つの出現が、

- ・ 1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキル、
- ・ 1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよいC₆～10アリール（例えば、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよいフェニル）、
- ・ 5～10員のヘテロアリール（例えば、5または6員のヘテロアリール）であって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい、該5～10員のヘテロアリール（例えば、1～3個の独立して選択されるR_gでそれぞれ置換されていてもよい、ピリミジル、ピリジル、ピラゾリル、およびチエニル（例えば、ピラゾリル））、ならびに
- ・ ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい、5～10員のヘテロシクリル（例えば、1～4個の独立して選択されるR_gでそれぞれ置換されていてもよい、テトラヒドロピリジルまたはテトラヒドロピラニル）

40

からなる群より選択される、本発明1140の化合物。

[本発明1144]

R¹の1つの出現が独立して、1～4個の独立して選択されるR_gで置換されていてもよい

50

C₆~10アリールである、本発明1143の化合物。

[本発明1145]

R¹の1つの出現が独立して、1~4（例えば、1~3）個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいフェニルである、本発明1144の化合物。

[本発明1146]

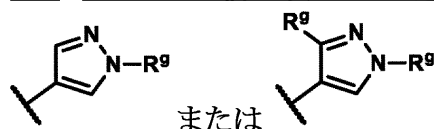
R¹の1つの出現が独立して、5~10員のヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリールの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、本発明1143の化合物。

[本発明1147]

R¹の1つの出現が独立して、5員のヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリールの1~3（例えば、1または2~3）個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、本発明1146の化合物。

[本発明1148]

R¹が、1~3個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいピラゾリル（例えば、



）である、本発明1147の化合物。

[本発明1149]

R¹の1つの出現が独立して、6員のヘテロアリールであり、ここで、ヘテロアリールの1~2個の環原子が環窒素原子であり、ヘテロアリールが、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、本発明1146の化合物。

[本発明1150]

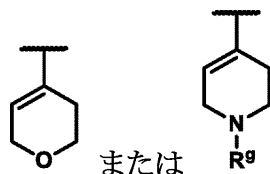
R¹の1つの出現が、1~4個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよいピリジルまたはピリミジル（例えば、3-ピリジル（例えば、



）である、本発明1149の化合物。

[本発明1151]

R¹の1つの出現が、5~10員のヘテロシクリルであり、ここで、ヘテロシクリルの1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1~4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい（例えば、1~4個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよい、テトラヒドロピリジルまたはテトラヒドロピラニル（例えば、



））、本発明1143の化合物。

[本発明1152]

各R^gが、NR^eR^f（例えば、NH₂、4-メチルピペラジン-1-イル、モルホリン-4-イル）、C₁~4アルキル（例えば、メチル、エチル、またはイソプロピル）、C₁~4ハロア

10

20

30

40

50

ルキル（例えば、 CF_3 ）、 Ra で置換されている $\text{C}_1\sim 4$ アルキル（例えば、 OH 、 NR^eR^f 、または $\text{C}(\text{O})\text{OC}_1\sim 4$ アルキルで置換されている $\text{C}_1\sim 4$ アルキル）、 Ra で置換されていてもよい $\text{C}_1\sim 4$ アルコキシ（例えば、メトキシまたは $-\text{OCH}_2$ -シクロプロピル）、 $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{NR}'\text{R}'')$ （例えば、 $\text{S}(\text{O})_2\text{NMe}_2$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NH}_2$ ）、および $-\text{S}(\text{O})_1\sim 2(\text{C}_1\sim 4$ アルキル）（例えば、 $\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$ ）からなる群より独立して選択される、本発明1142～1151のいずれかの化合物。

[本発明1153]

Wが、選択された $\text{C}(\text{=O})$ である、本発明1131～1152のいずれかの化合物。

[本発明1154]

QおよびAが(A)にしたがって定義される、本発明1131～1153のいずれかの化合物。

10

[本発明1155]

Aが $-(\text{YA1})_n\text{-YA2}$ である、本発明1131～1154のいずれかの化合物。

[本発明1156]

nが0である、本発明1131～1155のいずれかの化合物。

[本発明1157]

nが1である、本発明1131～1155のいずれかの化合物。

[本発明1158]

YA1が、 $\text{C}_1\sim 3$ アルキレン、例えば CH_2 または CH_2CH_2 である、本発明1157の化合物。

[本発明1159]

YA1が、 Ra で置換されている $\text{C}_1\sim 3$ アルキレン（例えば、 CHR^aCH_2 （例えば、 $\text{CH}(\text{C}(\text{=O})\text{NHMe})\text{CH}_2$ ））である、本発明1157の化合物。

20

[本発明1160]

YA2が、1～4個の独立した R^c で置換されている C_6 アリールである、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

[本発明1161]

YA2が、1～3個の独立した R^c で置換されている C_6 アリールであり、ここで、 R^c の1つの出現が、本発明1133において $\text{R}^{c'}$ について定義される通りである、本発明1131～1160のいずれかの化合物。

[本発明1162]

YA2が、1～3個の独立して選択される R^c で置換されているフェニル（例えば、1個の R^c で置換されているフェニル、または1個の $\text{R}^{c'}$ で置換されているフェニル）であり、ここで、 R^c の1つの出現が、パラ位に存在する $\text{R}^{c'}$ である、本発明1160または1161の化合物。

30

[本発明1163]

YA2が、1～3個の独立して選択される R^c で置換されているフェニル（例えば、1個の R^c で置換されているフェニル、または1個の $\text{R}^{c'}$ で置換されているフェニル）であり、ここで、 R^c の1つの出現が、メタ位に存在する $\text{R}^{c'}$ である、本発明1160または1161の化合物。

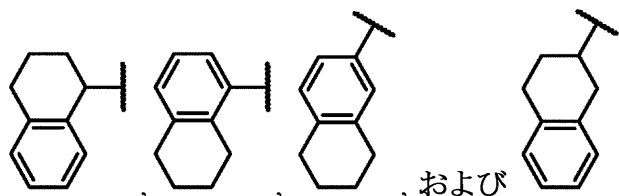
[本発明1164]

YA2が、1～4個の R^c で置換されていてもよい $\text{C}_7\sim 20$ アリールである、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

40

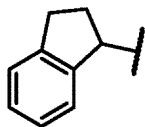
[本発明1165]

YA2が、ナフチル、テトラヒドロナフチル（例えば、



50

)、およびジヒドロインデニル (例えば、



からなる群より選択される、本発明1164の化合物。

[本発明1166]

YA2が、5～6個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～3個の独立して選択されるR^cで置換されている、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

10

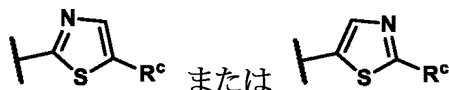
[本発明1167]

YA2が、5個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～3 (例えば、1～2) 個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されている、本発明1131～1159および1166のいずれかの化合物。

[本発明1168]

YA2が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されているチアゾリルまたはピラゾリル (例えば、チアゾリル、例えば、

20



)である、本発明1167の化合物。

[本発明1169]

YA2が、6個の環原子を含むヘテロアリール (例えば、ピリジルまたはピリミジル) であり、ここで、1～2個の環原子が環窒素原子であり、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～3個の独立して選択されるR^cで置換されている、本発明1131～1159および1166のいずれかの化合物。

30

[本発明1170]

R^cの1つの出現が、YA1への結合点に対してパラである、本発明1169の化合物。

[本発明1171]

R^cの1つの出現が、YA1への結合点に対してメタである、本発明1169の化合物。

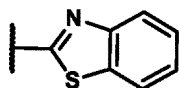
[本発明1172]

YA2が、7～12 (例えば、8～10) 個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～3個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

40

[本発明1173]

YA2が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよいイソキノリニル、キノリニル、テトラヒドロキノリニル、もしくはテトラヒドロイソキノリニル (例えば、非置換のキノリニルまたはテトラヒドロキノリル) であるか、またはYA2が、1～2個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよいベンゾチアゾリル (例えば、



50

）である、本発明1172の化合物。

[本発明1174]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が独立して、1～6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 10$ （例えば、 $C_1 \sim 2$ 、 C_3 、 C_4 、 C_5 、 C_6 、または $C_7 \sim 10$ ）アルキルである、本発明1131～1173のいずれかの化合物。

[本発明1175]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、非置換の $C_1 \sim 10$ （例えば、 $C_1 \sim 2$ 、 C_3 、 C_4 、 C_5 、 C_6 、または $C_7 \sim 10$ ）アルキル（例えば、ブチル）である、本発明1131～1174のいずれかの化合物。

[本発明1176]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が独立して、1～6個の独立して選択される R^a で置換されている $C_1 \sim 10$ （例えば C_3 、 C_4 、 C_5 、 C_6 、または $C_7 \sim 10$ ）アルキルである、本発明1131～1174のいずれかの化合物。

[本発明1177]

R^a の各出現が、ハロ（例えば、F）、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ（例えば、メトキシまたはエトキシ）、および NR^eR^f からなる群より独立して選択される、本発明1176の化合物。

[本発明1178]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、 CF_3 、エトキシメチル、 $CH_2NHCH_2CF_3$ 、および $CH_2CF_2CH_2CH_3$ からなる群より選択される、本発明1177の化合物。

[本発明1179]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、

(ix) 1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、

(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xxi) 1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)- $C_6 \sim 10$ アリール、ならびに

(xxii) ヘテロアリのルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、 NR^d 、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリのルが、1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい、- ($C_0 \sim 3$ アルキレン)-5～10員のヘテロアリのル

からなる群より独立して選択される、本発明1131～1173のいずれかの化合物。

[本発明1180]

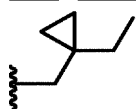
R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_1 \sim 3$ アルキレン)- $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群より独立して選択される、179の化合物。

[本発明1181]

R^C もしくは $R^{C'}$ の1つの出現がシクロヘキシルであるか、または R^C もしくは $R^{C'}$ の1つの出現がシクロブチルである、本発明1180の化合物。

[本発明1182]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、



である、本発明1180の化合物。

[本発明1183]

R^C または $R^{C'}$ の1つの出現が、

(xxi) 1～4個の独立して選択される $C_1 \sim 4$ アルキルで置換されていてもよい- ($C_0 \sim$

10

20

30

40

50

(xxii) ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるC₁～4アルキルで置換されていてもよい、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール

[本 発 明 1 1 8 4]

10

R^cまたはR^{c1}の1つの出現が、-(C₀~3アルキレン)-ヘテロシクリルであり、ここで、ヘテロシクリルが5~6個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、およびOからなる群より独立して選択される、本発明1179の化合物。

Y^{A2}が、1～4個のR^bで置換されていてもよいC₃～8単環式シクロアルキル（例えば、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシル）である、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

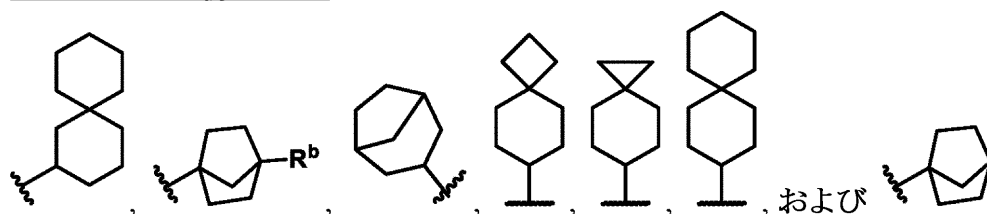
20

Y A2が、1～4個のR_bで置換されていてもよいC₆シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）である、本発明1186の化合物。

YA2が、1～3個のR^bで置換されていてもよいC₆シクロアルキル（例えば、シクロヘキシル）であり、ここで、R^bの1つの出現がパラ位に存在する、本発明1186または1187の化合物。

Y A2が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよいC₇～₁₃二環式シクロアルキル、例えば、

30



[本 発 明 1 1 9 0]

Y^{A2}が、3～12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよい、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

40

R^bの各出現が、1～6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁～₁₀アルキル、C₁～₄ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、C₁～₄アルコキシ、C₁～₄ハロアルコキシ、1～4個の独立して選択されるC₁～₄アルキルで置換されていてもよいC₆～₁₀アリール、および1～4個の独立して選択されるC₁～₄アルキルで置換されていて

50

もよいC₃~6シクロアルキルからなる群より選択される、本発明1186~1190のいずれかの化合物。

[本発明1192]

R^bの1つの出現が独立して、1~6個の独立して選択されるR^aで置換されていてもよいC₁~10（例えば、C₁~2、C₃、C₄、C₅、C₆、またはC₇~10）アルキルである、本発明1191の化合物。

[本発明1193]

R^bの1つの出現が、非置換のC₁~10（例えば、C₁~2、C₃、C₄、C₅、C₆、またはC₇~10）アルキル（例えば、ブチル）である、本発明1192の化合物。

[本発明1194]

R^bの1つの出現が独立して、1~6個の独立して選択されるR^aで置換されているC₁~10（例えば、C₃、C₄、C₅、C₆、またはC₇~10）アルキルである、本発明1192の化合物。

[本発明1195]

R^aの各出現が、ハロ（例えば、F）、C₁~4アルコキシ、およびNR^eR^fからなる群より独立して選択される、本発明1194の化合物。

[本発明1196]

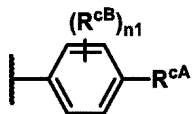
R^bの1つの出現が、CF₃、エトキシメチル、CH₂NHCH₂CF₃、およびCH₂CF₂CH₂CH₃からなる群より選択される、本発明1195の化合物。

[本発明1197]

R^bの1つの出現が、1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい（C₀~1アルキレン）-C₆~10アリール（例えば、非置換のフェニルまたは非置換のベンジル）、および1~4個の独立して選択されるC₁~4アルキルで置換されていてもよい（C₀~1アルキレン）-C₃~6シクロアルキル（例えば、非置換のシクロヘキシルまたはシクロブチル）からなる群より選択される、本発明1186~1190のいずれかの化合物。

[本発明1198]

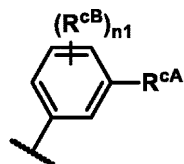
Y A₂が、



であり、n₁が、0、1、または2であり、R^{CA}が、独立して選択されるR^CまたはR^{C'}であり、かつR^{CB}が、独立して選択されるR^Cである、本発明1131~1159のいずれかの化合物。

[本発明1199]

Y A₂が、



であり、n₁が、0、1、または2であり、R^{CA}が、独立して選択されるR^CまたはR^{C'}であり、かつR^{CB}が、独立して選択されるR^Cである、本発明1131~1159のいずれかの化合物。

[本発明1200]

Y A₂が、

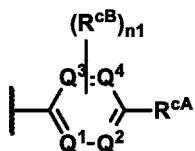
10

20

30

40

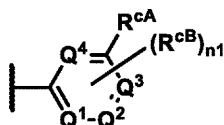
50



であり、 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、および $Q4$ のうちの1～2つがNであり、 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、および $Q4$ のうちの残りのそれぞれがCHであり、 $n1$ が、0、1、または2であり、かつ RcA および RcB のそれぞれが、独立して選択される Rc である、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

[本発明1201]

$\gamma A2$ が、



であり、 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、および $Q4$ のうちの1～2つがNであり、 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、および $Q4$ のうちの残りのそれぞれがCHであり、 $n1$ が、0、1、または2であり、かつ RcA および RcB のそれぞれが、独立して選択される Rc である、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

[本発明1202]

RcA が、本発明1174～1178のいずれかにおいて Rc または Rc' について定義される通りである、本発明1198～1201のいずれかの化合物。

[本発明1203]

RcA が、本発明1179～1185のいずれかにおいて Rc または Rc' について定義される通りである、本発明1198～1201のいずれかの化合物。

[本発明1204]

$n1$ が0である、本発明1198～1203のいずれかの化合物。

[本発明1205]

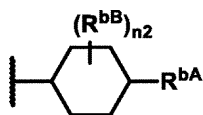
$n1$ が1または2である、本発明1198～1203のいずれかの化合物。

[本発明1206]

各 RcB が独立して、ハロ、 $C1\sim3$ アルキル、または $C1\sim3$ ハロアルキルである、本発明1198～1203および1205のいずれかの化合物。

[本発明1207]

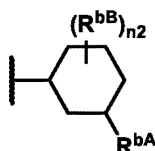
$\gamma A2$ が、



であり、 $n2$ が、0、1、または2であり、かつ RbA および RbB のそれぞれが、独立して選択される Rb である、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

[本発明1208]

$\gamma A2$ が、



であり、 $n2$ が、0、1、または2であり、かつ RbA および RbB のそれぞれが、独立して選択される Rb である、本発明1131～1159のいずれかの化合物。

[本発明1209]

R^bA が、本発明1192～1196のいずれかにおいて R^b について定義される通りである、本発明1207または1208の化合物。

[本発明1210]

R^bA が、本発明1197において R^b について定義される通りである、本発明1207または1208の化合物。

[本発明1211]

R^bA が、本発明1191において R^b について定義される通りである、本発明1207または1208の化合物。

[本発明1212]

n_2 が0であるか、または、 n_2 が1もしくは2でありかつ各 R^bB が独立してハロ、 $C_1\sim 3$ アルキル、もしくは $C_1\sim 3$ ハロアルキルである、本発明1207～1211のいずれかの化合物。

[本発明1213]

QがNHである、本発明1001～1212のいずれかの化合物。

[本発明1214]

Q-Aが(B)において定義される通りである、本発明1131～1153のいずれかの化合物。

[本発明1215]

QおよびAが、一緒になって、



を形成し、ここで、



がWへの結合点を表し、かつ

Eが、5～12個の環原子を含む環（例えば、単環式環または二環式環）であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択される R^b で置換されている、

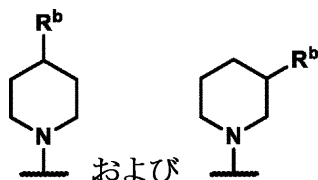
本発明1131～1153および1214のいずれかの化合物。

[本発明1216]

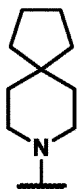
Eが、5～10（例えば、5～6）個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～1個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、および0からなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択される R^b で置換されている、本発明1131～1153および1214～1215のいずれかの化合物。

[本発明1217]

Eがピペリジニル（例えば、



) または



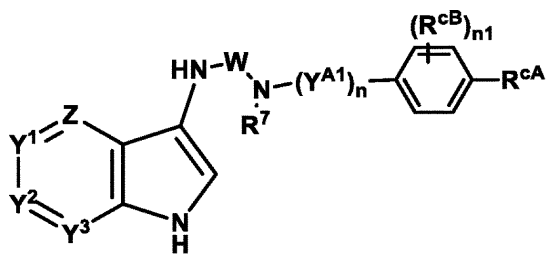
である、本発明1131～1153および1214～1216のいずれかの化合物。

[本発明1218]

R^b の1つの出現が、 $C_1\sim 4$ アルコキシ（例えば、プロポキシ）、 $C_1\sim 4$ ハロアルコキシ、1～6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1\sim 10$ アルキル（例えば、ブチル）、および $C_1\sim 4$ ハロアルキルからなる群より独立して選択される、本発明1214～1217のいずれかの化合物。

[本発明1219]

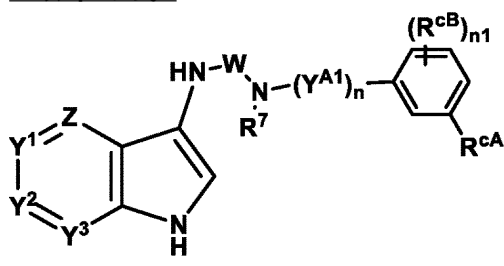
以下の式：



を有し、式中、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のそれぞれが独立してNまたは CR^1 であり、但し、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のうちの1つまたは複数がNであり、 R^7 がHまたは $C_1\sim 3$ アルキルであり、 n_1 が、0、1、または2であり、 R^{CA} が、独立して選択される R^C または $R^{C'}$ であり、かつ各 R^{CB} が、独立して選択される R^C である、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

[本発明1220]

以下の式：



を有し、式中、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のそれぞれが独立してNまたは CR^1 であり、但し、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のうちの1つまたは複数がNであり、 R^7 がHまたは $C_1\sim 3$ アルキルであり、 n_1 が、0、1、または2であり、 R^{CA} が、独立して選択される R^C または $R^{C'}$ であり、かつ各 R^{CB} が、独立して選択される R^C である、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

[本発明1221]

以下の式：

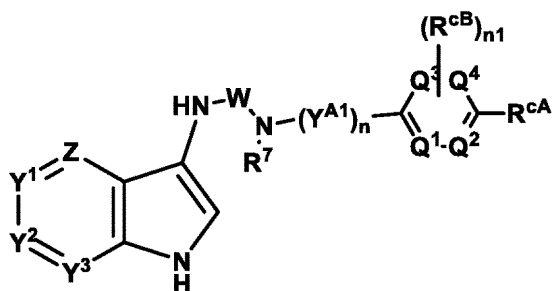
10

20

30

40

50



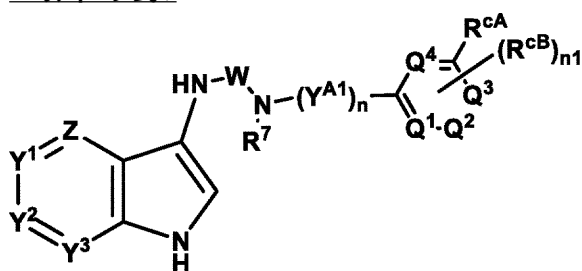
(IV)

を有し、式中、Z、Y¹、Y²、およびY³のそれぞれが独立してNまたはCR¹であり、但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数がNであり、R⁷がHまたはC₁～3アルキルであり、Q¹、Q²、Q³、およびQ⁴のうちの1～2つがNであり、Q¹、Q²、Q³、およびQ⁴のうちの残りのそれぞれがCHであり、n₁が、0、1、または2であり、かつR^{cA}およびR^{cB}のそれぞれが、独立して選択されるR^cである、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

10

[本発明1222]

以下の式：



(V)

20

を有し、式中、Z、Y¹、Y²、およびY³のそれぞれが独立してNまたはCR¹であり、但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数がNであり、R⁷がHまたはC₁～3アルキルであり、Q¹、Q²、Q³、およびQ⁴のうちの1～2つがNであり、Q¹、Q²、Q³、およびQ⁴のうちの残りのそれぞれがCHであり、n₁が、0、1、または2であり、かつR^{cA}およびR^{cB}のそれぞれが、独立して選択されるR^cである、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

30

[本発明1223]

R^{cA}が、本発明1174～1178のいずれかにおいてR^cまたはR^{c'}について定義される通りである、本発明1219～1222のいずれかの化合物。

[本発明1224]

R^{cA}が、本発明1179～1185のいずれかにおいてR^cまたはR^{c'}について定義される通りである、本発明1219～1222のいずれかの化合物。

[本発明1225]

n₁が0である、本発明1219～1224のいずれかの化合物。

40

[本発明1226]

n₁が1または2である、本発明1219～1224のいずれかの化合物。

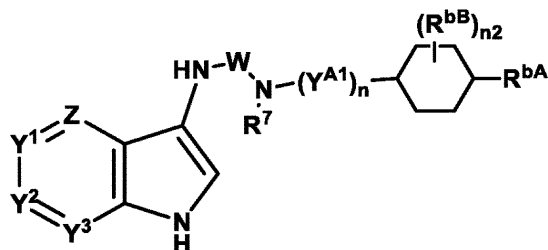
[本発明1227]

各R^{cB}が、ハロ、C₁～3アルキル、またはC₁～3ハロアルキルである、本発明1226の化合物。

[本発明1228]

以下の式：

50



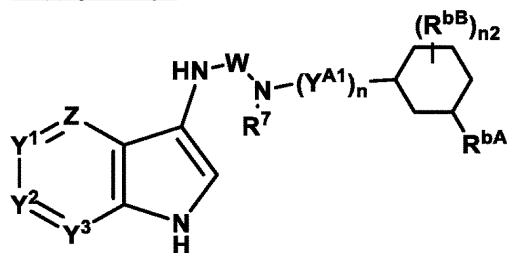
(VI)

を有し、式中、Z、Y¹、Y²、およびY³のそれぞれが独立してNまたはCR¹であり、但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数がNであり、R⁷がHまたはC₁～3アルキルであり、n₂が、0、1、または2であり、かつR^{bA}およびR^{bB}のそれぞれが、独立して選択されるR^bである、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

10

[本発明1229]

以下の式：



(VII)

20

を有し、式中、Z、Y¹、Y²、およびY³のそれぞれが独立してNまたはCR¹であり、但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数がNであり、R⁷がHまたはC₁～3アルキルであり、n₂が、0、1、または2であり、かつR^{bA}およびR^{bB}のそれぞれが、独立して選択されるR^bである、本発明1131～1133のいずれかの化合物。

[本発明1230]

R^{bA}が、本発明1192～1196のいずれかにおいてR^bについて定義される通りである、本発明1228または1229の化合物。

[本発明1231]

R^{bA}が、本発明1197においてR^bについて定義される通りである、本発明1228または1229の化合物。

30

[本発明1232]

n₂が0であるか、またはn₂が1もしくは2でありかつ各R^{bB}が独立してハロ、C₁～3アルキル、もしくはC₁～3ハロアルキルである、本発明1228～1231のいずれかの化合物。

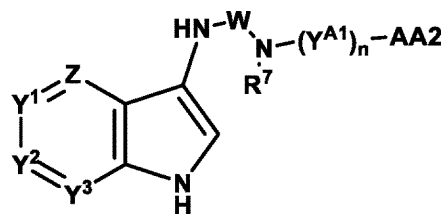
。

[本発明1233]

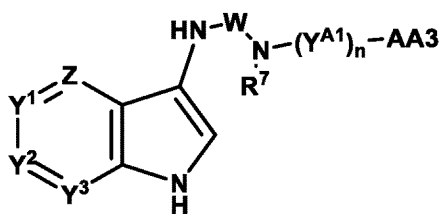
式(VIII)、(IX)、または(X)：

40

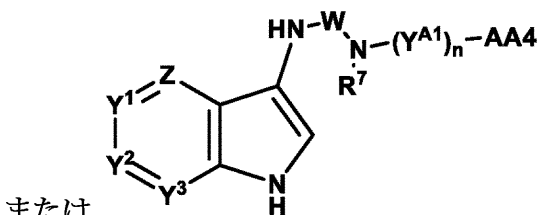
50



(VIII);



(IX);



(X)

または

を有し、

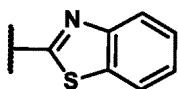
式中、

Z、Y¹、Y²、およびY³のそれぞれは独立してNまたはCR¹であり、但し、Z、Y¹、Y²、およびY³のうちの1つまたは複数はNであり、

R⁷はHまたはC₁~3アルキルであり、

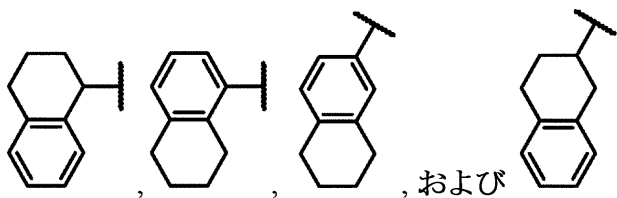
AA₂は、

(a) 9~10個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され(例えば、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、およびベンゾチアゾリル(例えば、



))、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~3個の独立して選択されるR^cで置換されていてもよい、該ヘテロアリール、ならびに

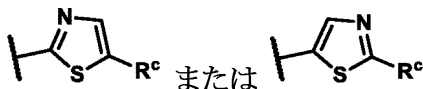
(b) 1~4個のR^cで置換されていてもよいC₇~11アリール(例えば、ナフチル、テトラヒドロナフチル(例えば、



))

からなる群より選択され、

AA₃が、5個の環原子を含むヘテロアリールであり、ここで、1~3(例えば、1~2)個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R^d)、O、およびSからなる群より独立して選択され(例えば、チアゾリル(例えば、



))、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~2個の独立して選択されるR^cで置換されており、かつ

AA₄が、1~4個の独立して選択されるR^bで置換されていてもよいC₇~13二環式シク

10

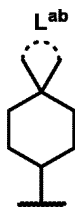
20

30

40

50

ロアルキル（例えば、 L^{ab} が結合または $C_1 \sim 3$ アルキレンである、



）である、

本発明1131～1133のいずれかの化合物。

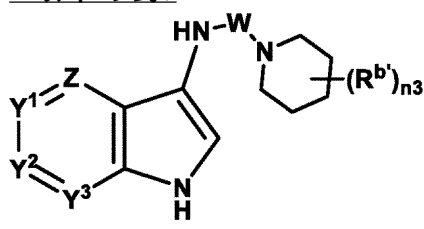
10

[本発明1234]

- $(YA1)_n$ における n が0である、本発明1219～1233のいずれかの化合物。

[本発明1235]

以下の式：



(XI)

20

を有し、式中、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のそれぞれが独立して N または CR^1 であり、但し、 Z 、 Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のうちの1つまたは複数が N であり、 n_3 が1または2であり、かつ各 $R^{b'}$ が、独立して選択される R^b であるか、または同じ炭素原子もしくは異なる炭素原子に結合した $R^{b'}$ のペアが、それぞれが結合した原子と共に、3～8個の環原子を含む環を形成する、

本発明1131～1133のいずれかの化合物。

[本発明1236]

各 n_3 が1である、本発明1235の化合物。

[本発明1237]

$R^{b'}$ が、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ（例えば、プロポキシ）、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、1～6個の独立して選択される R^a で置換されていてもよい $C_1 \sim 10$ アルキル（例えば、ブチル）、および $C_1 \sim 4$ ハロアルキルからなる群より選択される、本発明1236の化合物。

30

[本発明1238]

n_3 が2であり、かつ同じ炭素原子または異なる炭素原子に結合した $R^{b'}$ のペアが、それぞれが結合した原子と共に、3～8個の環原子を含む環（例えば、



40

）を形成する、本発明1236の化合物。

[本発明1239]

Z が N であり、かつ Y^1 、 Y^2 、および Y^3 のそれぞれが独立して CR^1 である、本発明1219～1238のいずれかの化合物。

[本発明1240]

Y^1 が N であり、かつ Z 、 Y^2 、および Y^3 のそれぞれが独立して CR^1 である、本発明1219～1238のいずれかの化合物。

[本発明1241]

Y^2 が N であり、かつ Z 、 Y^1 、および Y^3 のそれぞれが独立して CR^1 である、本発明1219～1238のいずれかの化合物。

50

[本発明1242]

Y^3 がNであり、かつZ、 Y^1 、および Y^2 のそれぞれが独立してCR¹である、本発明1219～1238のいずれかの化合物。

[本発明1243]

R¹の1つの出現が、以下からなる群より選択され、R¹の1つの出現が、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₃～6シクロアルキル、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい-(C₀～3アルキレン)-C₆～10アリール;- (C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリールであって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロアリール、ならびに

・ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、-(C₀～3アルキレン)-5～10員のヘテロシクリル

からなる群より選択される、本発明1219～1242のいずれかの化合物。

[本発明1244]

R¹の1つの出現が、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキル、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいC₆～10アリール（例えば、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいフェニル）、

・5～10員のヘテロアリール（例えば、5または6員のヘテロアリール）であって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該5～10員のヘテロアリール（例えば、1～3個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよい、ピリミジル、ピリジル、ピラゾリル、およびチエニル（例えば、ピラゾリル））、ならびに

・ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、5～10員のヘテロシクリル（例えば、1～4個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよい、テトラヒドロピリジルまたはテトラヒドロピラニル）

からなる群より選択される、本発明1243の化合物。

[本発明1245]

R¹の1つの出現が、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいC₃～6シクロアルキル、

・1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいC₆アリール（例えば、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよいフェニル）、

・5～6員のヘテロアリール（例えば、5または6員のヘテロアリール）であって、ヘテロアリールの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSより独立して選択され、ヘテロアリールが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、該5～6員のヘテロアリール（例えば、1～3個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよい、ピリミジル、ピリジル、ピラゾリル、およびチエニル（例えば、ピラゾリル））、ならびに

・ヘテロシクリルの1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、NH、NR^d、O、およびSからなる群より独立して選択され、ヘテロシクリルが、1～4個の独立して選択されるR^gで置換されていてもよい、5～6員のヘテロシクリル（例えば、1～4個の独立して選択されるR^gでそれぞれ置換されていてもよい、テトラヒドロピリジルまたはテトラヒドロピラニル）

からなる群より選択される、本発明1243または1244の化合物。

[本発明1246]

R^1 の1つの出現が、本発明1144または1145において定義される通りである、本発明1219～1245のいずれかの化合物。

[本発明1247]

R^1 の1つの出現が、本発明1146～1148のいずれかにおいて定義される通りである、本発明1219～1245のいずれかの化合物。

[本発明1248]

R^1 の1つの出現が、本発明1149または1150において定義される通りである、本発明1219～1245のいずれかの化合物。

[本発明1249]

R^1 の1つの出現が、本発明1151において定義される通りである、本発明1219～1245のいずれかの化合物。

[本発明1250]

R^1 の1つの出現が、本発明1141および1142において定義される通りである、本発明1219～1245のいずれかの化合物。

[本発明1251]

各 R^g が、 NR^eR^f （例えば、 NH_2 、4-メチルピペラジン-1-イル、モルホリン-4-イル）、 $C_1\sim 4$ アルキル（例えば、メチル、エチル、またはイソプロピル）、 $C_1\sim 4$ ハロアルキル（例えば、 CF_3 ）、 R^a で置換されている $C_1\sim 4$ アルキル（例えば、OH、 NR^eR^f 、または $C(O)OC_1\sim 4$ アルキルで置換されている $C_1\sim 4$ アルキル）、 R^a で置換されていてもよい $C_1\sim 4$ アルコキシ（例えば、メトキシまたは $-OCH_2$ -シクロプロピル）、 $-S(O)_1\sim 2(NR^eR^f)$ （例えば、 $S(O)_2NMe_2$ または $S(O)_2NH_2$ ）、および $-S(O)_1\sim 2(C_1\sim 4$ アルキル）（例えば、 $S(O)_2Me$ ）からなる群より独立して選択される、本発明1243～1249のいずれかの化合物。

[本発明1252]

R^1 の残りの出現のそれぞれがHである、本発明1243～1251のいずれかの化合物。

[本発明1253]

Wが $C(=O)$ である、本発明1219～1252のいずれかの化合物。

[本発明1254]

R^7 がHである、本発明1219～1253のいずれかの化合物。

[本発明1255]

以下の化合物:

化合物#	最終構造
100	

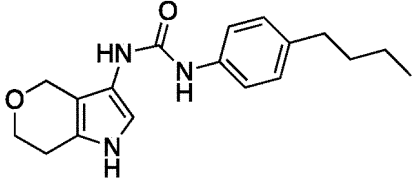
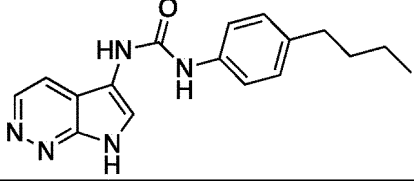
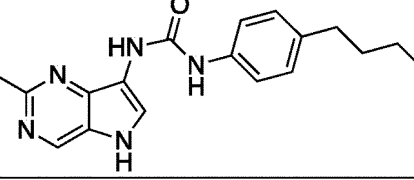
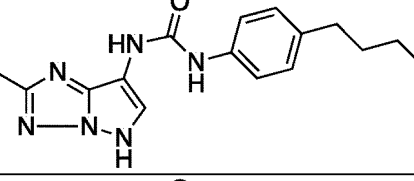
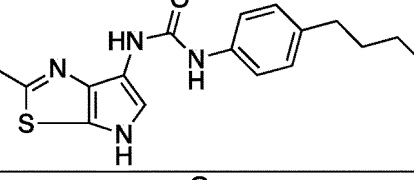
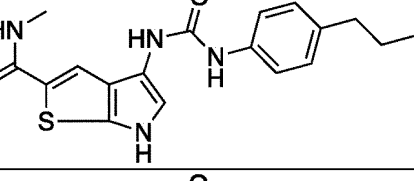
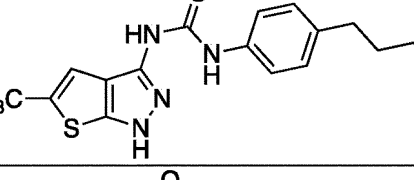
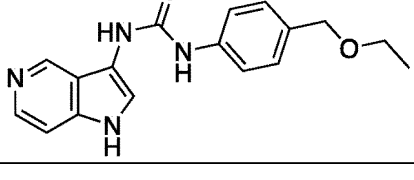
10

20

30

40

50

102	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
103	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
104	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
105	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
106	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
107	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
108	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>
109	 <chem>CCCCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23)cc1</chem>

10

20

30

40

50

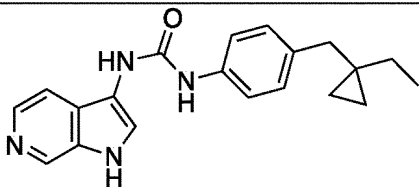
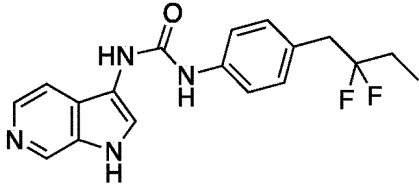
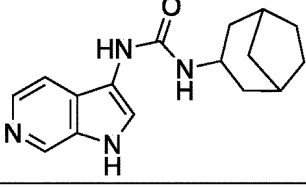
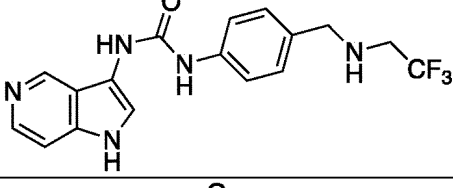
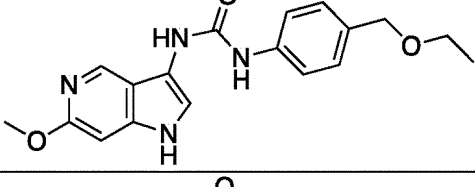
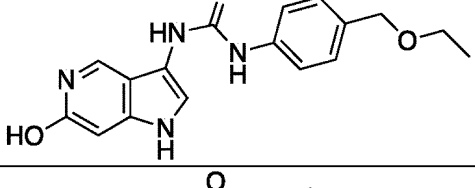
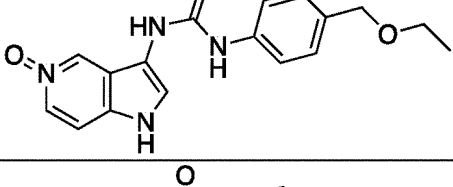
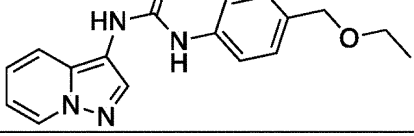
110	 A chemical structure featuring an indole ring system. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a para-substituted phenyl ring. The other end of the phenyl ring is attached to a tetrahydropyran ring.
111	 A chemical structure featuring an indole ring system. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a quinoline ring at its 6-position.
112	 A chemical structure featuring an indole ring system. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a 7,8-dihydroquinoline ring at its 2-position.
113	 A chemical structure featuring an indole ring system. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a spiro[3.3]heptane system at its 2-position.
114	 A chemical structure featuring an indole ring system. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a bicyclo[3.3.1]nonane system at its 9-position.
115	 A chemical structure featuring an indole ring system with a chlorine atom at position 5. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a para-substituted phenyl ring. The other end of the phenyl ring is attached to a propyl group.
116	 A chemical structure featuring an indole ring system with a methyl group at position 6. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a para-substituted phenyl ring. The other end of the phenyl ring is attached to a propyl group.
117	 A chemical structure featuring an indole ring system with an isopropyl group at position 5. At position 3 of the indole, there is a carboxamide group (-NH-C(=O)-NH-) linked to a para-substituted phenyl ring. The other end of the phenyl ring is attached to a propyl group.

10

20

30

40

118	
119	
120	
121	
122	
123	
124	
125	

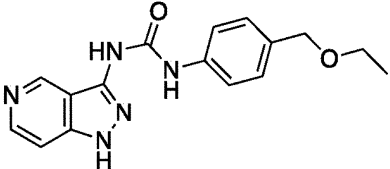
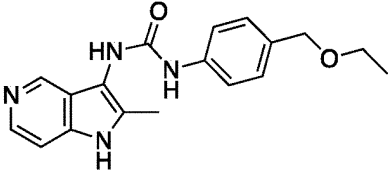
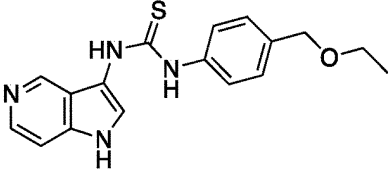
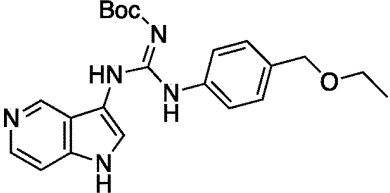
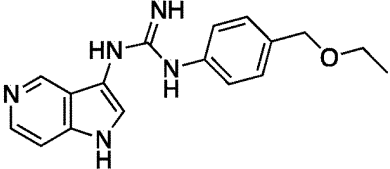
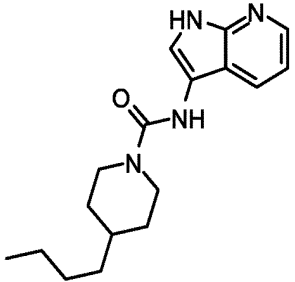
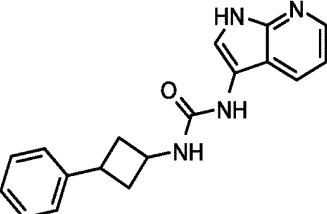
10

20

30

40

50

126	
127	
129	
130	
131	
132	
133	

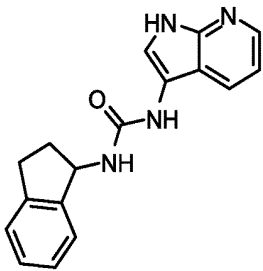
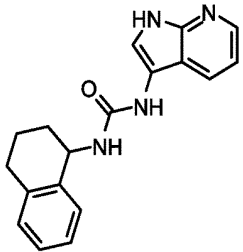
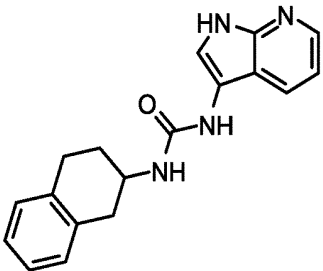
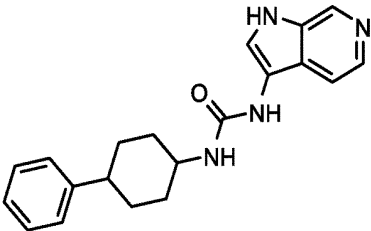
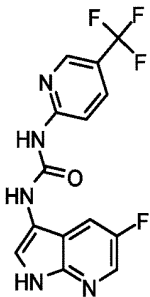
10

20

30

40

50

134	
135	
136	
137	
138	

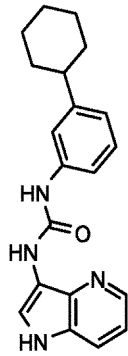
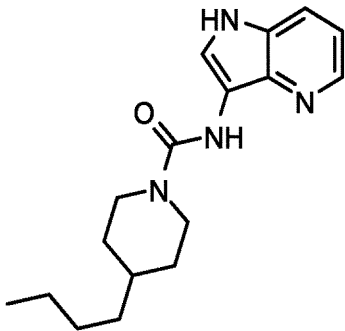
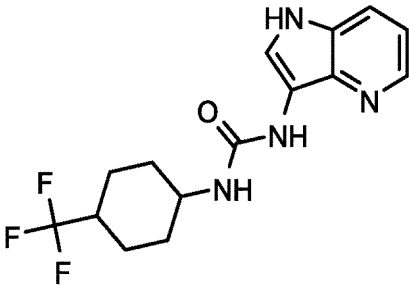
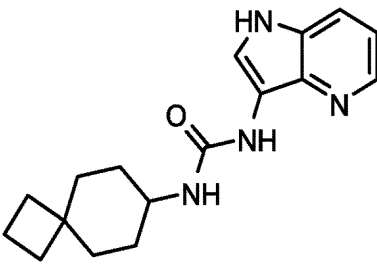
10

20

30

40

50

139	
140	
141	
142	

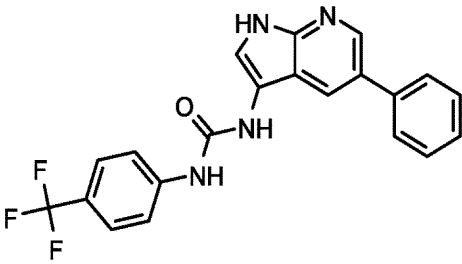
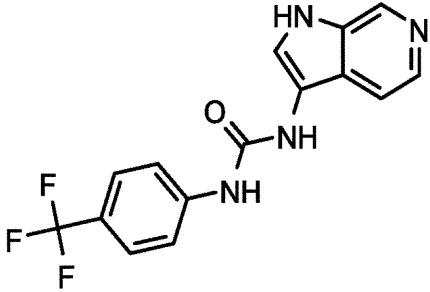
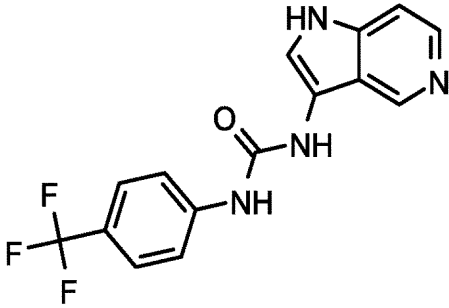
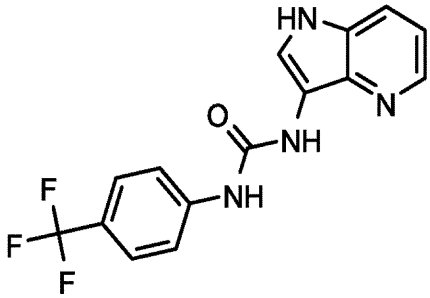
10

20

30

40

50

143	
144	
145	
146	

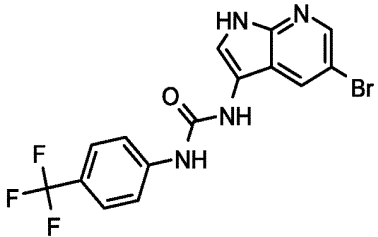
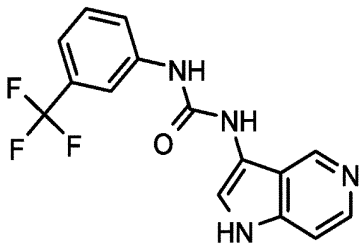
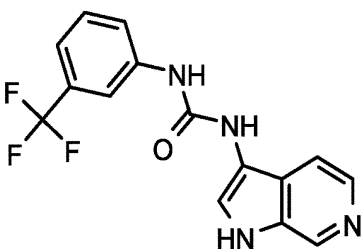
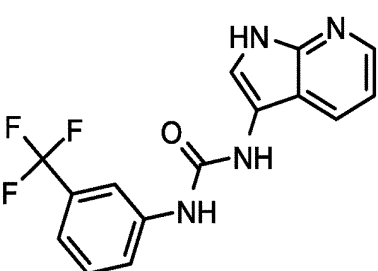
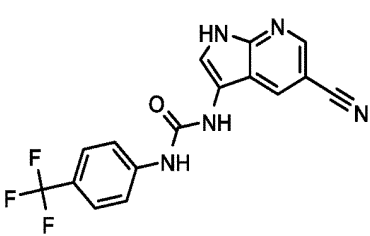
10

20

30

40

50

147	
148	
149	
150	
151	

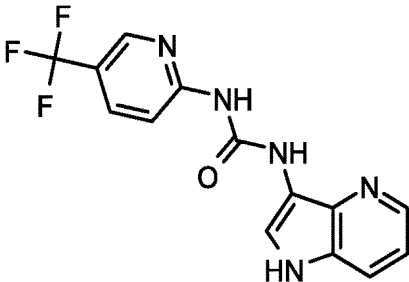
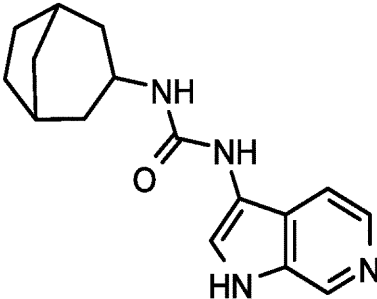
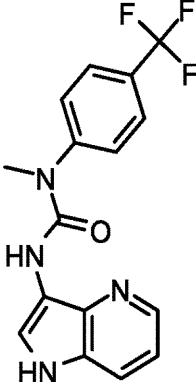
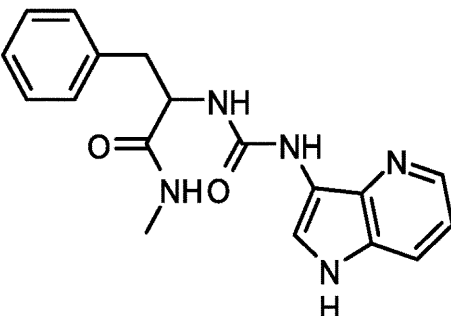
10

20

30

40

50

152	
153	
154	
155	

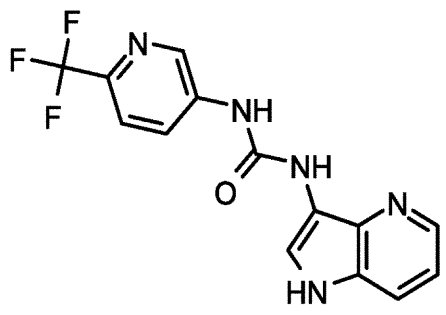
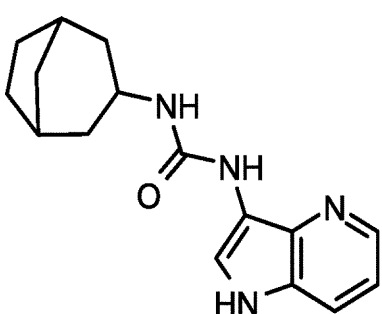
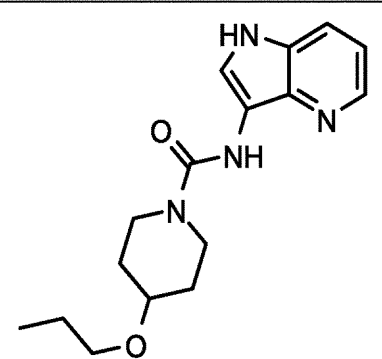
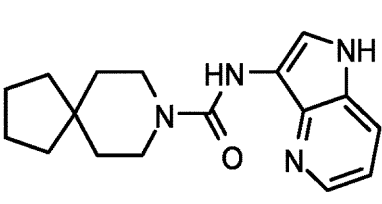
10

20

30

40

50

156	
157	
158	
159	

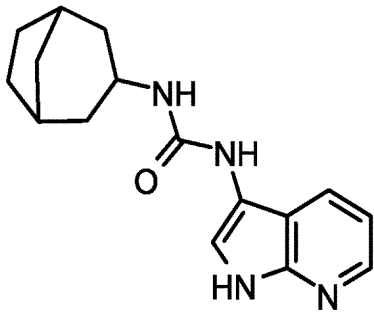
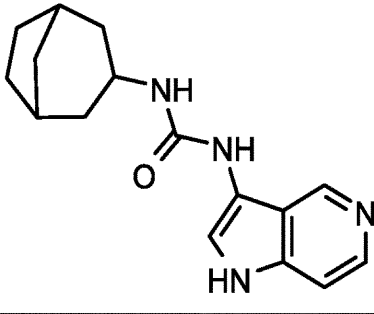
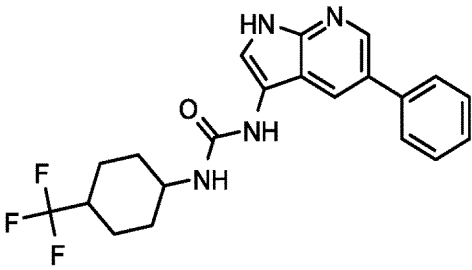
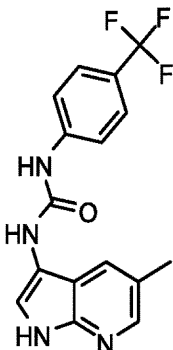
10

20

30

40

50

160	
161	
162	
163	

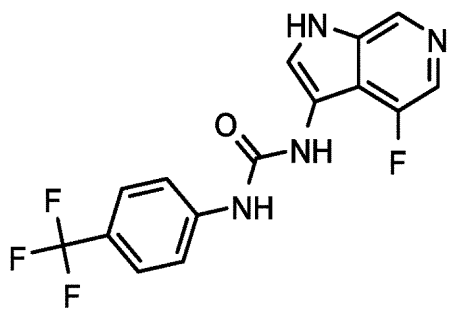
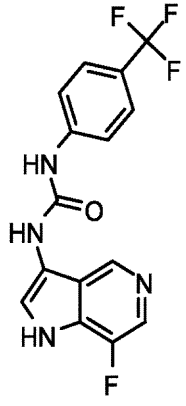
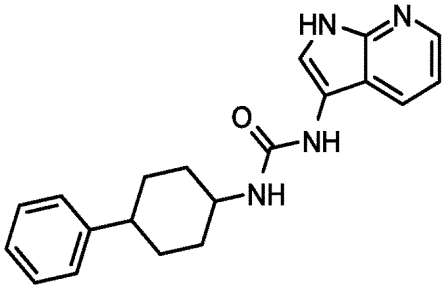
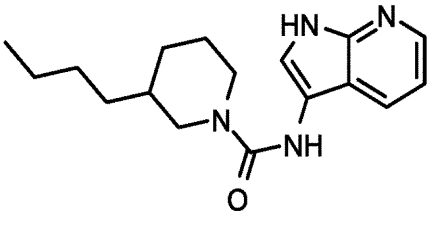
10

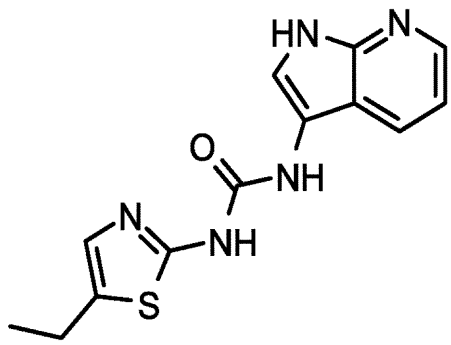
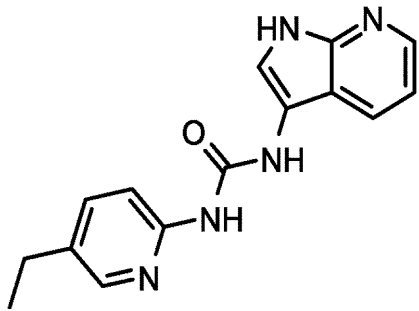
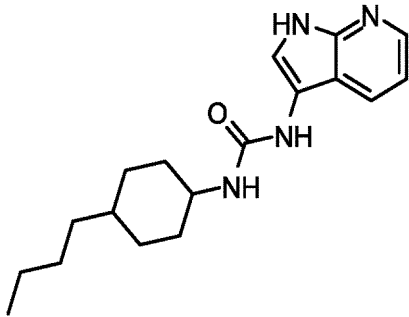
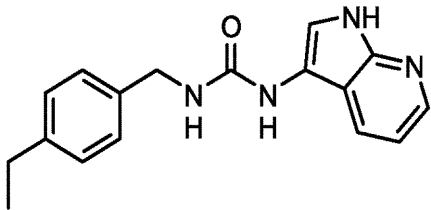
20

30

40

50

164		10
165		20
166		30
167		40

168	 <chem>CCc1cc(NC(=O)Nc2cc3c(c[nH]3)ccn2)nn1</chem>
169	 <chem>CCc1cc(NC(=O)Nc2cc3c(c[nH]3)ccn2)ccn1</chem>
170	 <chem>CCCCC1CCCCC1NC(=O)Nc2cc3c(c[nH]3)ccn2</chem>
171	 <chem>CCc1ccc(NC(=O)Nc2cc3c(c[nH]3)ccn2)cc1</chem>

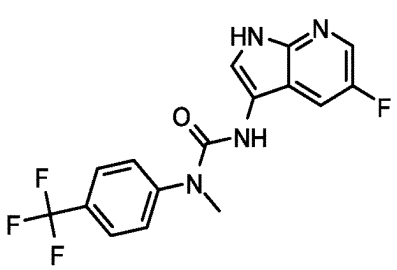
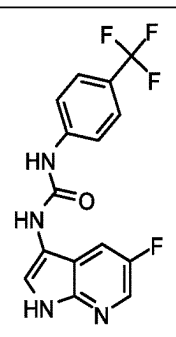
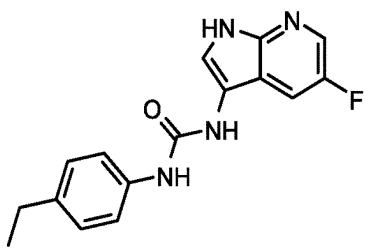
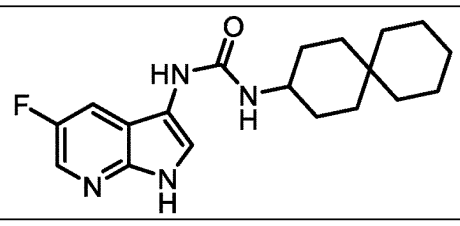
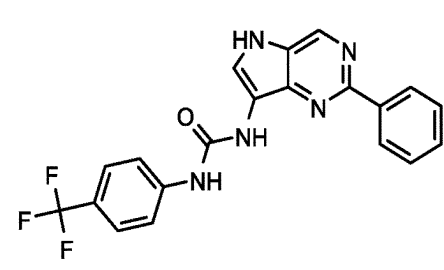
10

20

30

40

50

172	
173	
174	
179	
180	

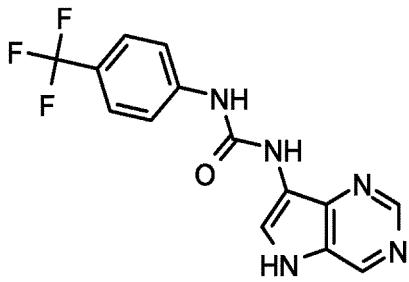
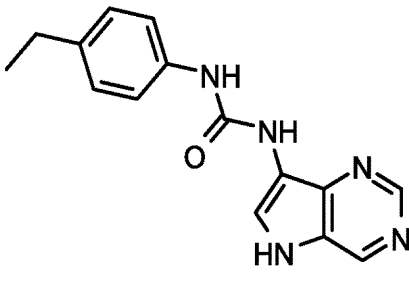
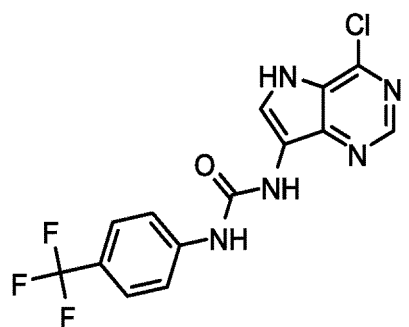
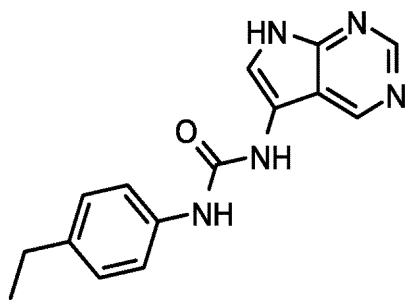
10

20

30

40

50

181	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ncnc23)cc1</chem>
182	 <chem>CCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ncnc23)cc1</chem>
183	 <chem>Clc1nc2c[nH]c2c1NC(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
183b	 <chem>CCc1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3ncnc23)cc1</chem>

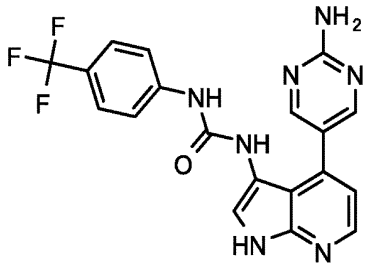
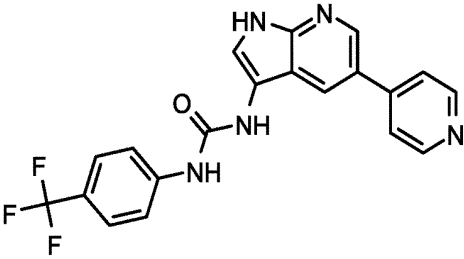
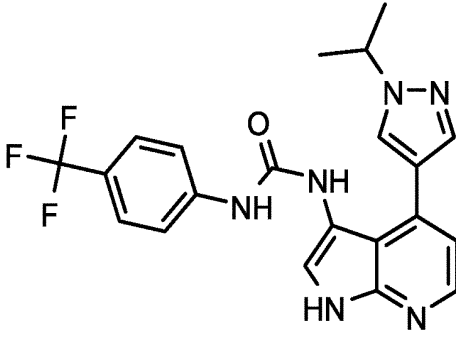
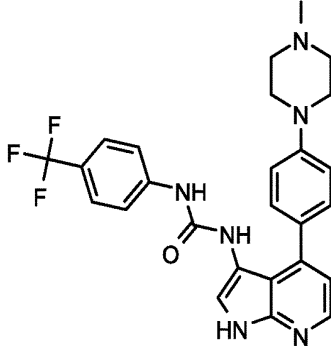
10

20

30

40

50

184	
185	
186	
187	

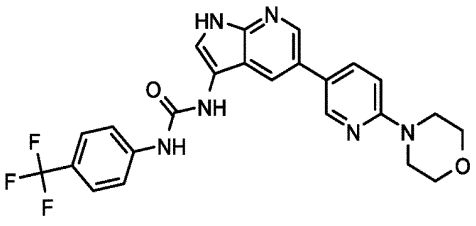
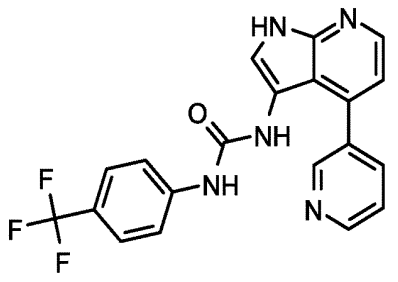
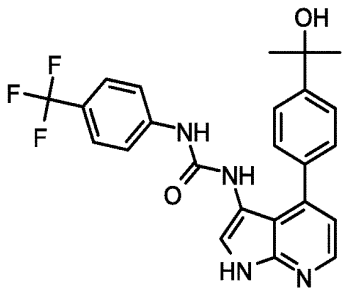
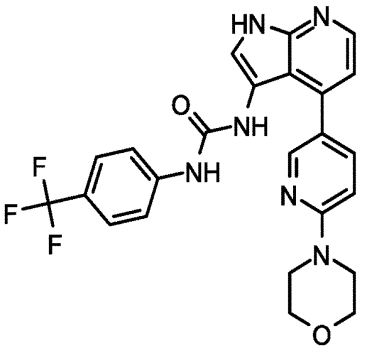
10

20

30

40

50

188	
189	
190	
191	

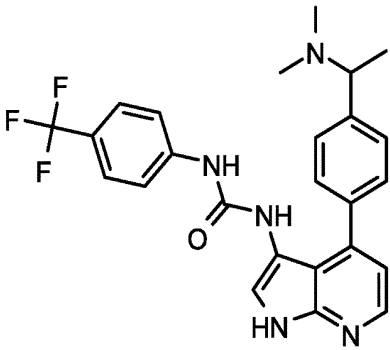
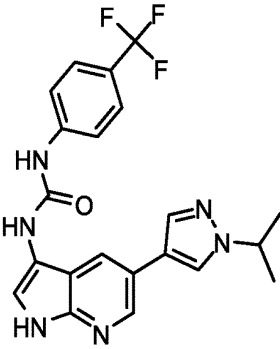
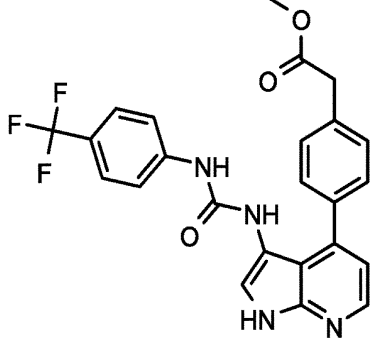
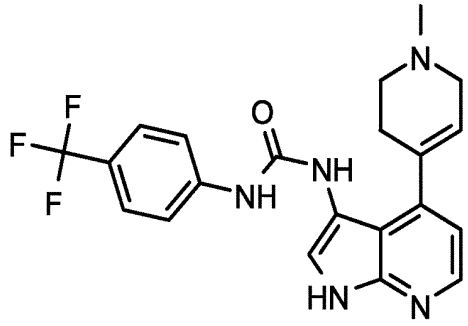
10

20

30

40

50

192	
193	
194	
195	

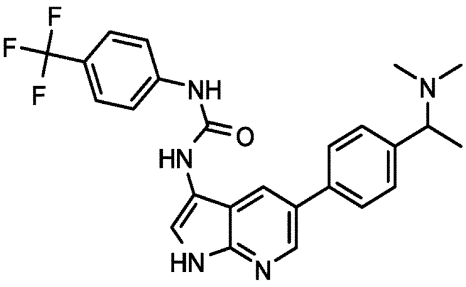
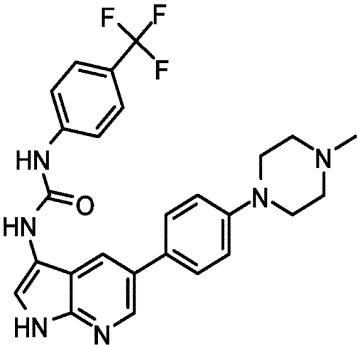
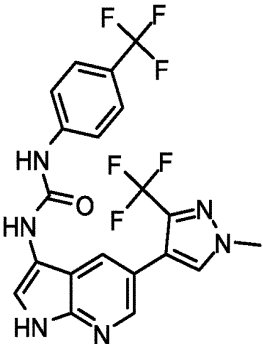
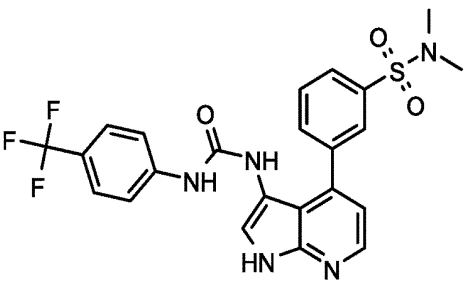
10

20

30

40

50

196	
197	
198	
199	

10

20

30

40

50

200	 <chem>Cc1ccsc1-c2cc3c(cnc2)nc4ccccc4n3C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
201	 <chem>COc1cc(F)ccc1-c2cc3c(cnc2)nc4ccccc4n3C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
202	 <chem>Ns(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cnc2)nc4ccccc4n3C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
203	 <chem>C1=CC=C(C=C1)Oc2cc3c(cnc2)nc4ccccc4n3C(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>

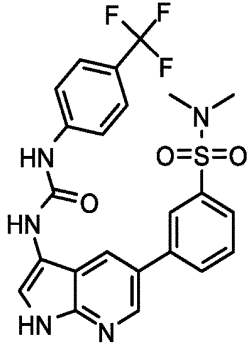
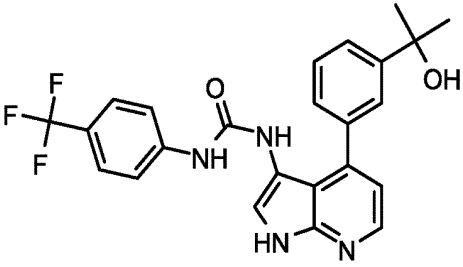
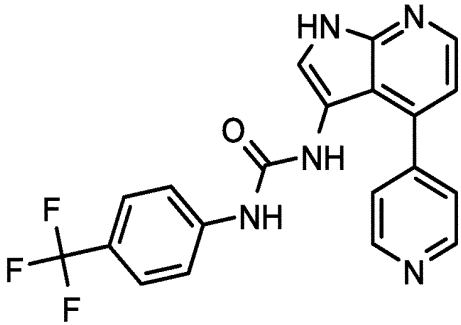
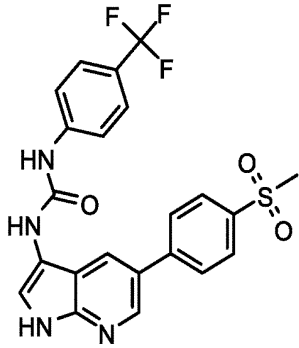
10

20

30

40

50

204	
205	
206	
207	

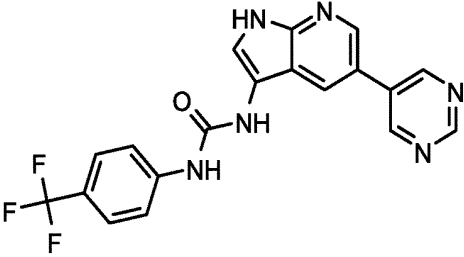
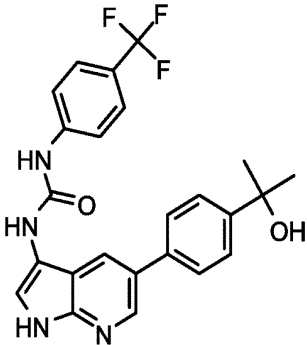
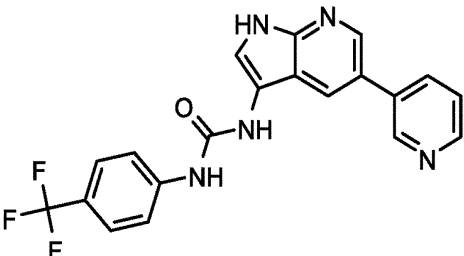
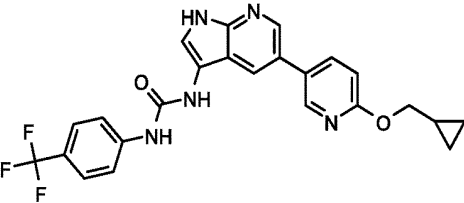
10

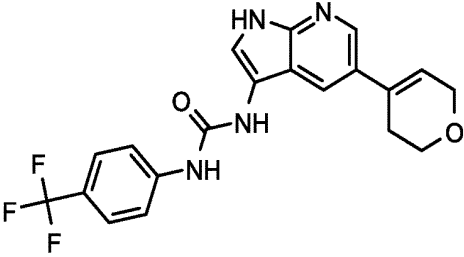
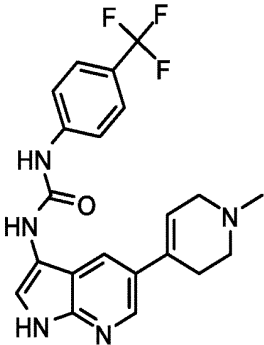
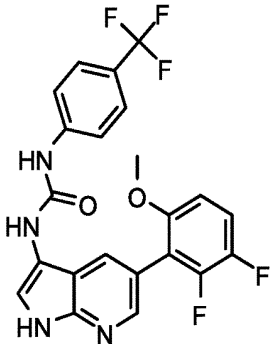
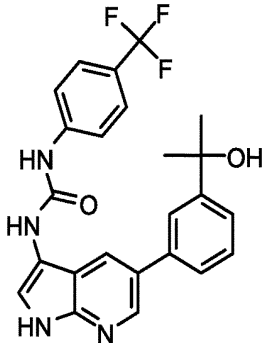
20

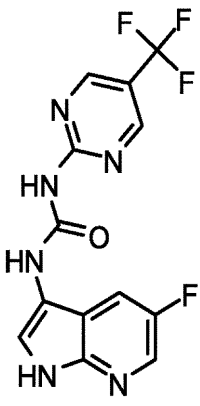
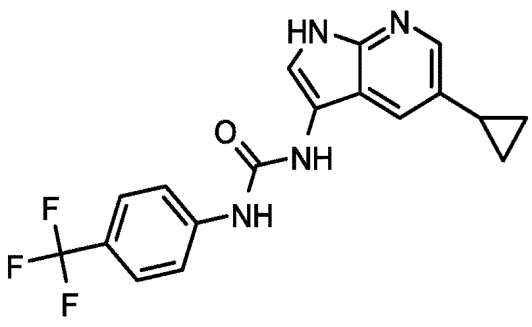
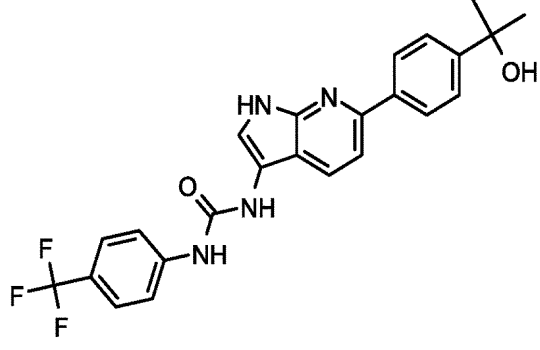
30

40

50

208	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2nc3cc(NC4=CC=CC=C4)cc3n2)cc1</chem>	10
209	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1C2=CC=CC=C2N3C(=O)Nc4cc5c(N)ncn5C3)C(=O)Nc6ccc(cc6)C(F)(F)F</chem>	20
210	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2nc3cc(NC4=CC=CC=C4)cc3n2)cc1</chem>	30
211	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2nc3cc(NC4=CC=CC=C4)cc3n2)cc1</chem>	40

212		10
213		20
214		30
215		40

216	 <chem>FC1=CC=C(C=C1N)NC(=O)Nc2cc(C(F)(F)F)nn2</chem>
217	 <chem>FC1=CC=C(C=C1N)NC(=O)Nc2cc(C3CC3)nn2</chem>
218	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)-c2cc(C3CC3)nn2NC(=O)Nc4cc(C(F)(F)F)cc4</chem>

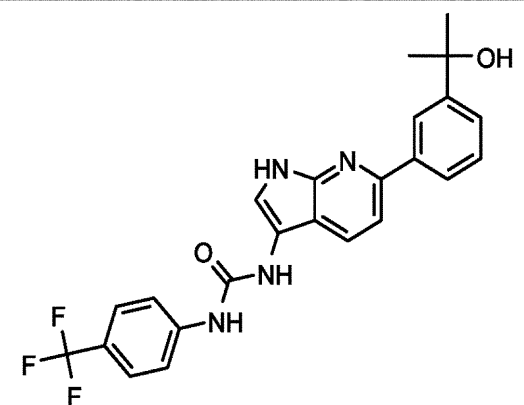
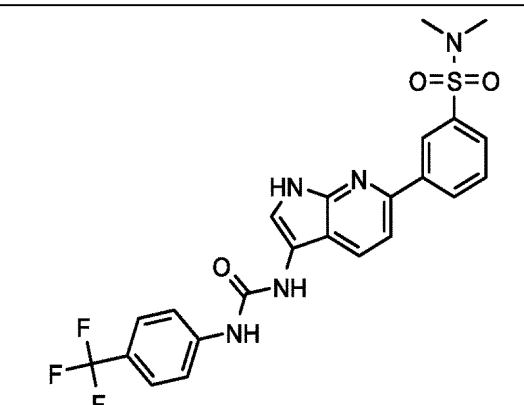
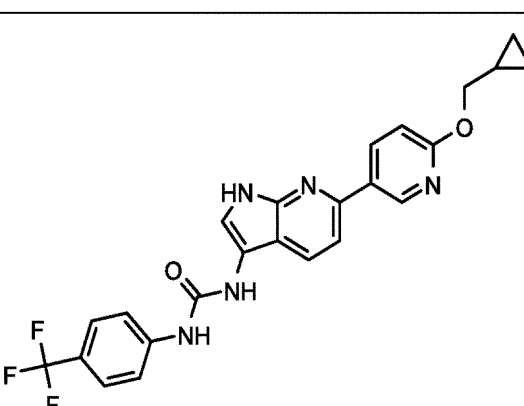
10

20

30

40

50

219	 <chem>CC(C)(C)c1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>
220	 <chem>CN(C)S(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>
221	 <chem>C1CC1COc1ccc(cc1)-c2ccn(c3cc(NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4)cn3)c2</chem>

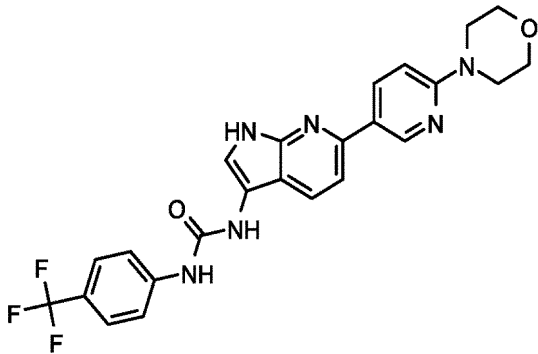
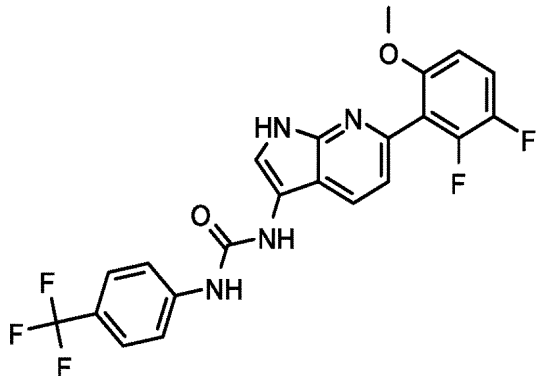
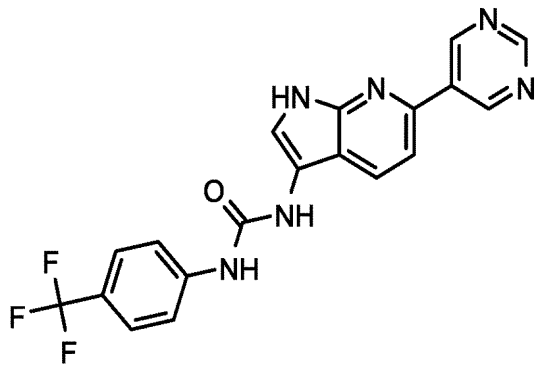
10

20

30

40

50

222	
223	
224	

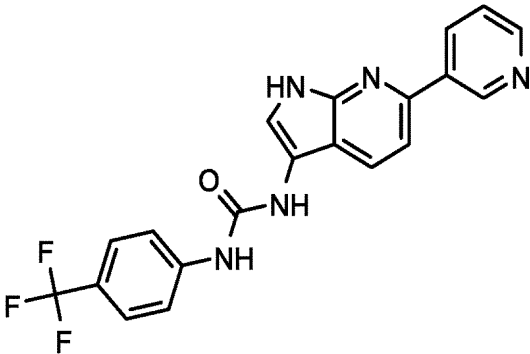
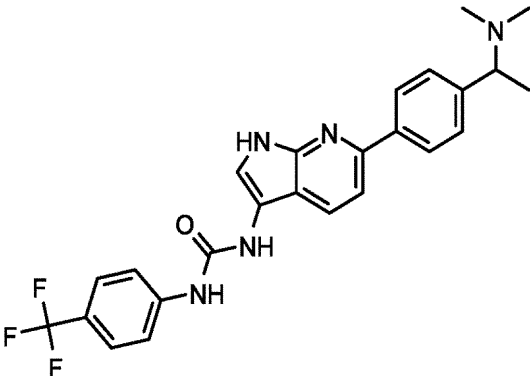
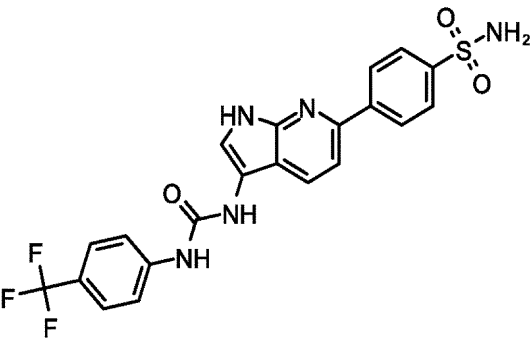
10

20

30

40

50

225	
226	
227	

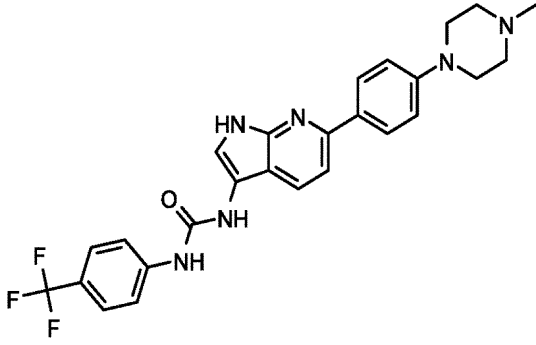
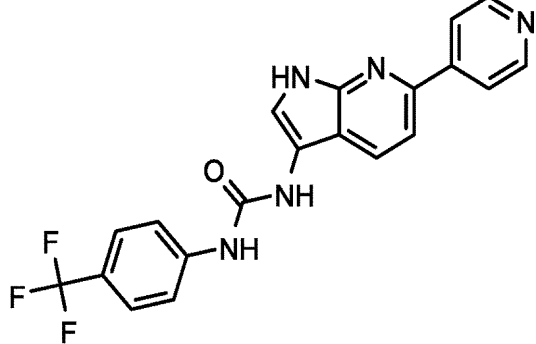
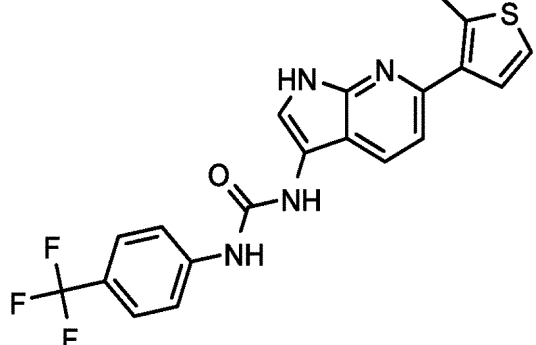
10

20

30

40

50

228	
229	
230	

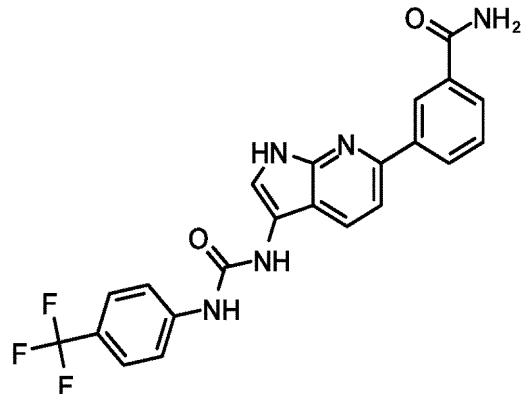
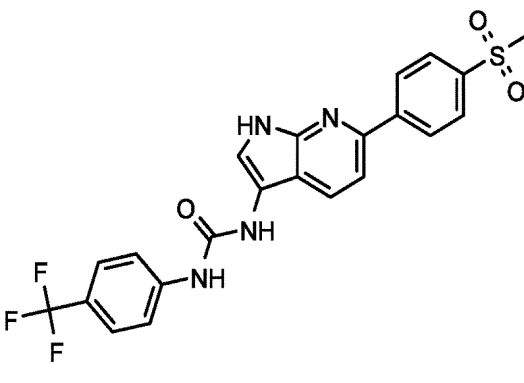
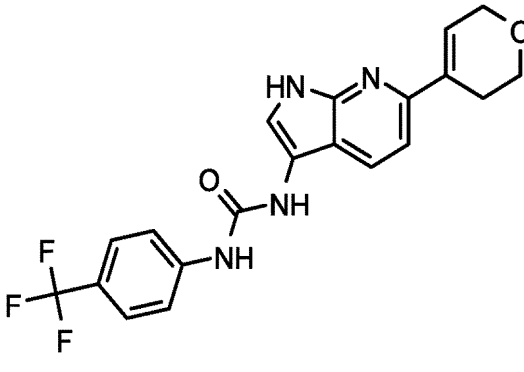
10

20

30

40

50

231	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cc2n3)C(=NNC(=O)Nc4ccc(cc4)C(F)(F)F)C5</chem>
232	 <chem>CS(=O)(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3c(cc2n3)C(=NNC(=O)Nc4ccc(cc4)C(F)(F)F)C5</chem>
233	 <chem>C1=CC=C(C=C1)-c2cc3c(cc2n3)C(=NNC(=O)Nc4ccc(cc4)C(F)(F)F)C5</chem>

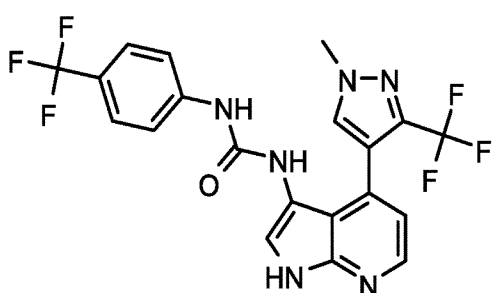
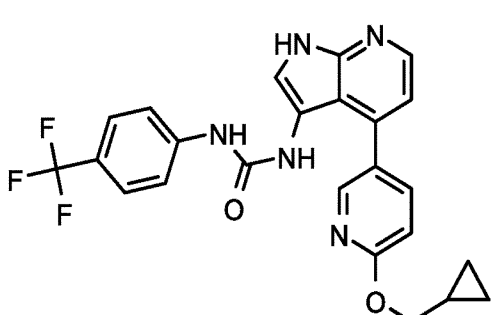
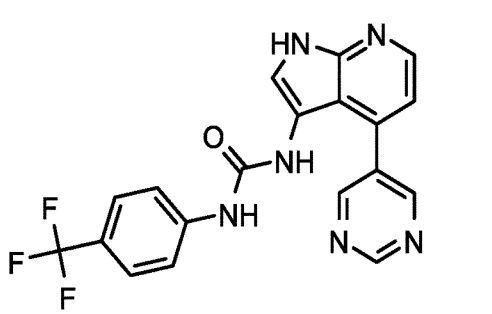
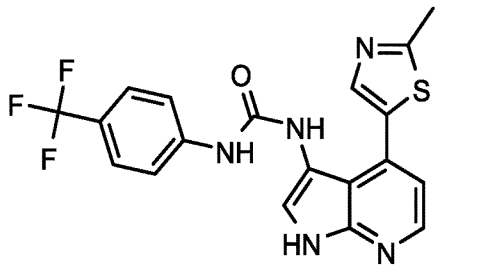
10

20

30

40

50

234	
235	
236	
237	

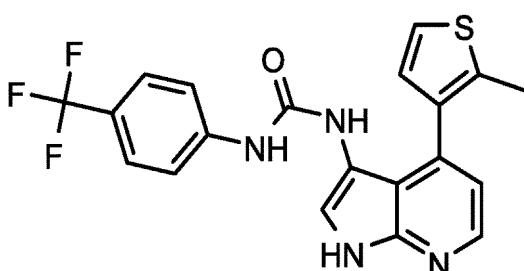
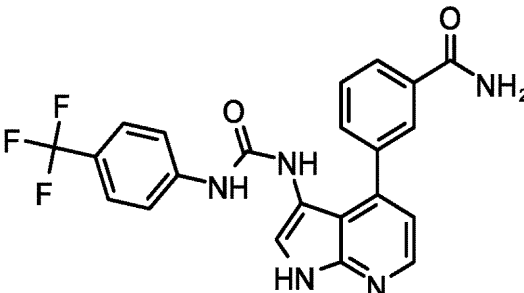
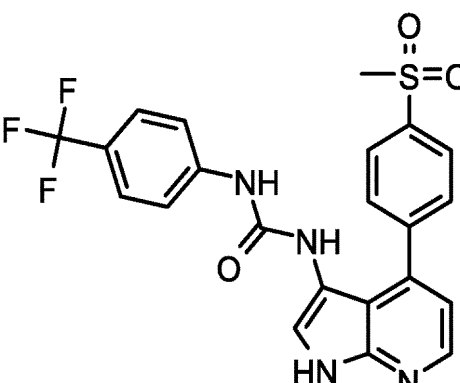
10

20

30

40

50

238	 <chem>Cc1ccsc1-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>
239	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>
240	 <chem>O=S(=O)c1ccc(cc1)-c2ccnc3c2c[nH]3NC(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cc4</chem>

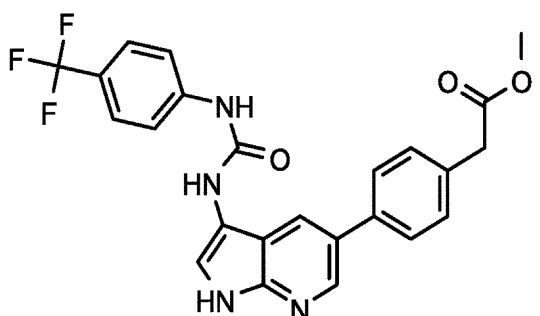
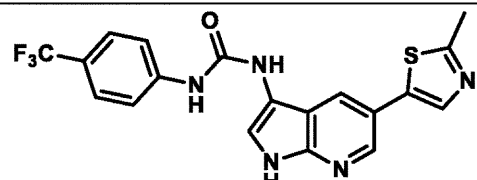
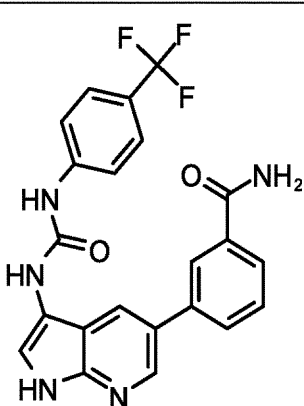
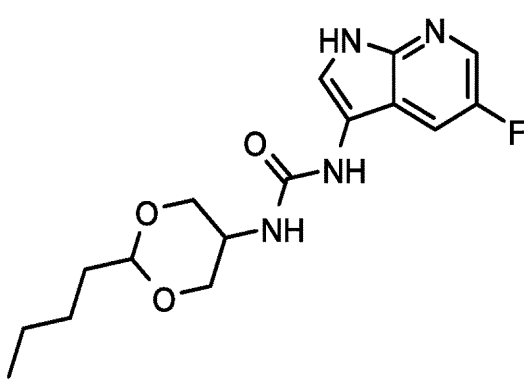
10

20

30

40

50

241	 <chem>COC(=O)Cc1ccc(cc1)-c2cc3nc4c(c3c[nH]4)nc5c2c[nH]5NC(=O)Nc6ccc(cc6)C(F)(F)F</chem>
242	 <chem>Cc1cc2nc3c(c1c[nH]3)nc4c2c[nH]4NC(=O)Nc5ccc(cc5)C(F)(F)F</chem>
243	 <chem>NC(=O)c1ccc(cc1)-c2cc3nc4c(c3c[nH]4)nc5c2c[nH]5NC(=O)Nc6ccc(cc6)C(F)(F)F</chem>
244	 <chem>CCOC1OCC(NC(=O)Nc2cc3nc4c(c3c[nH]4)nc5c2c[nH]5)CC1</chem>

10

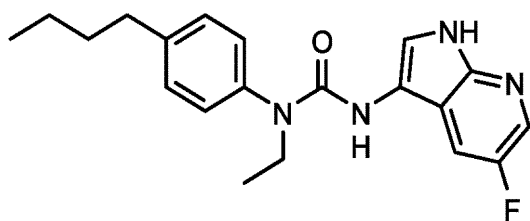
20

30

40

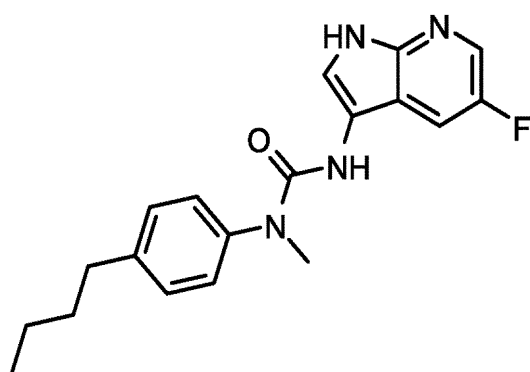
50

245



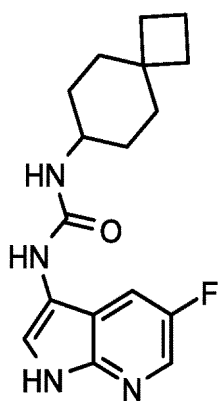
10

246



20

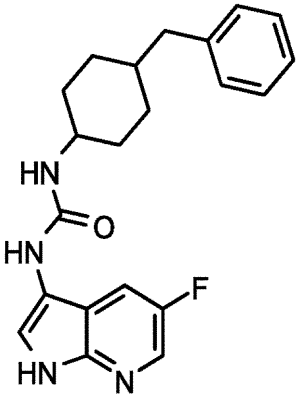
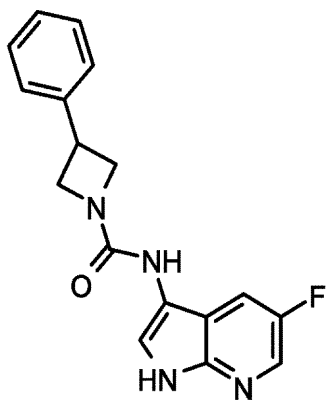
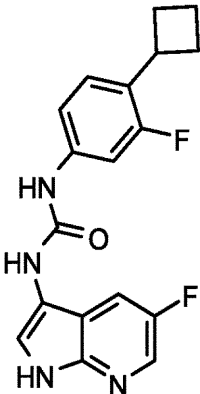
247



30

40

50

248	
249	
250	

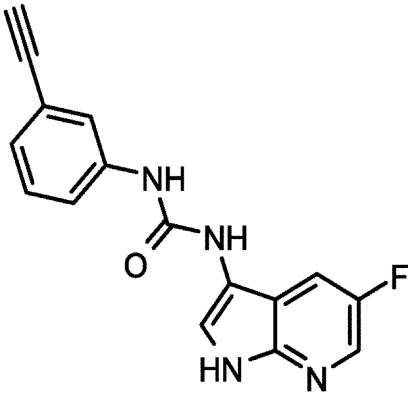
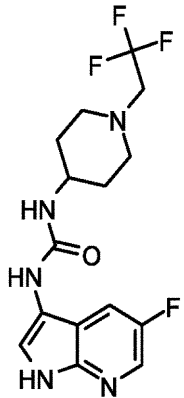
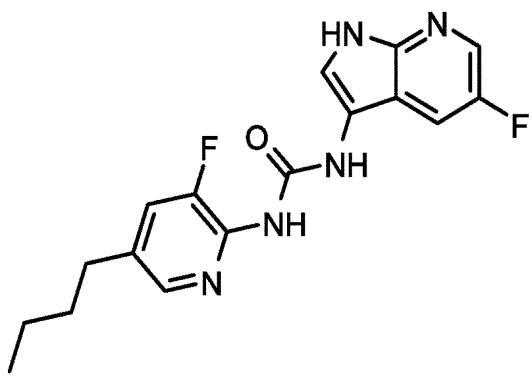
10

20

30

40

50

251	 Chemical structure 251: A fluorinated indole-pyridine system (5-fluoro-1H-indolo[2,3-b]pyridine) connected via a hydrazide linkage to a 4-ethynylphenyl group.
252	 Chemical structure 252: A fluorinated indole-pyridine system (5-fluoro-1H-indolo[2,3-b]pyridine) connected via a hydrazide linkage to a piperidine ring, which is further substituted with a difluoromethyl group.
253	 Chemical structure 253: A fluorinated indole-pyridine system (5-fluoro-1H-indolo[2,3-b]pyridine) connected via a hydrazide linkage to a 4-propyl-2-fluorophenyl group.

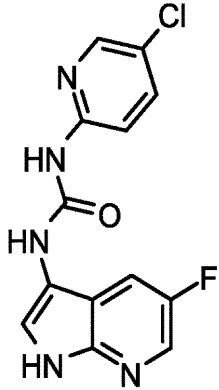
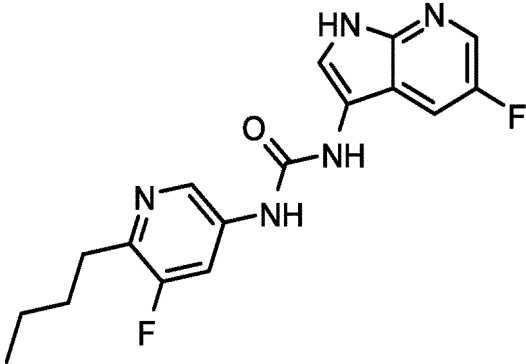
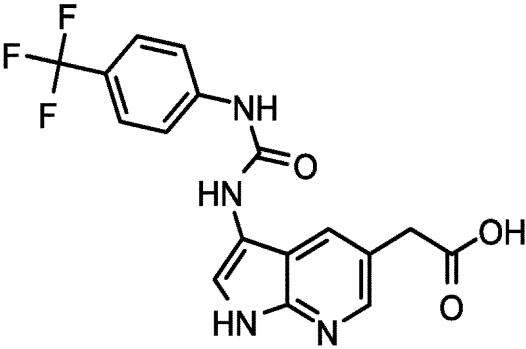
10

20

30

40

50

254	
255	
256	

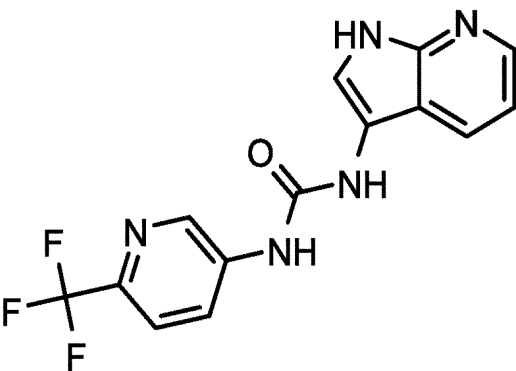
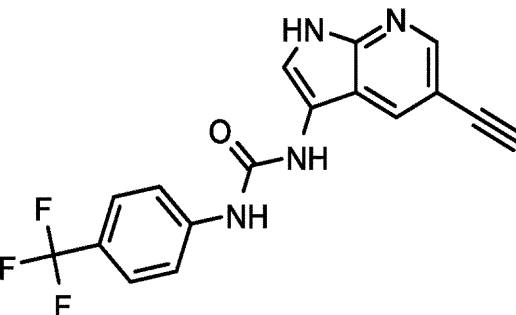
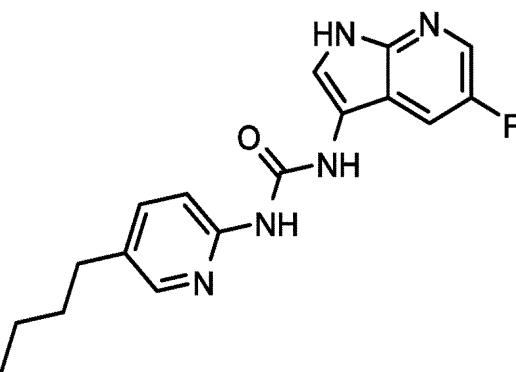
10

20

30

40

50

257	 <chem>FC(F)(F)c1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23</chem>
258	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(C#C)cc32)cc1</chem>
259	 <chem>CCCCc1ccncc1NC(=O)Nc2c[nH]c3cc(F)cc32</chem>

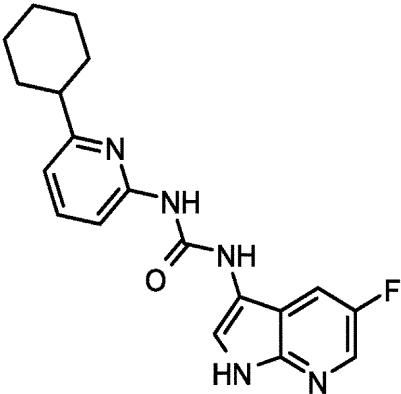
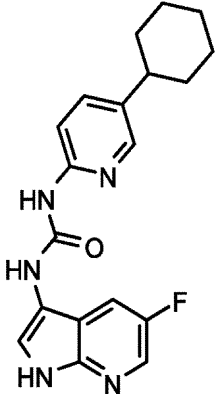
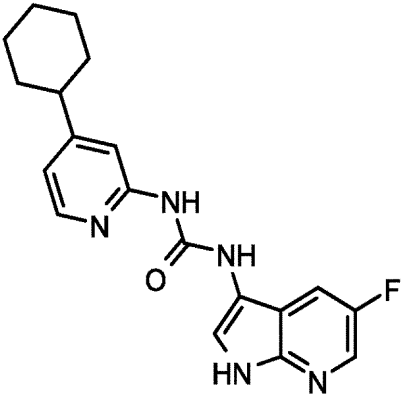
10

20

30

40

50

260	
261	
262	

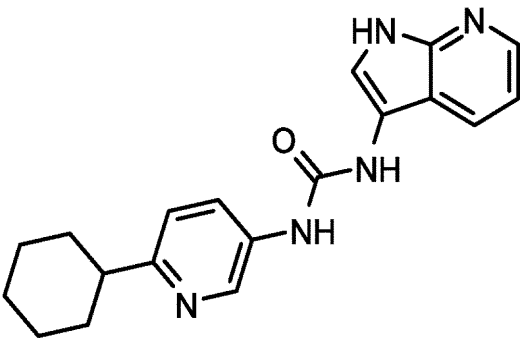
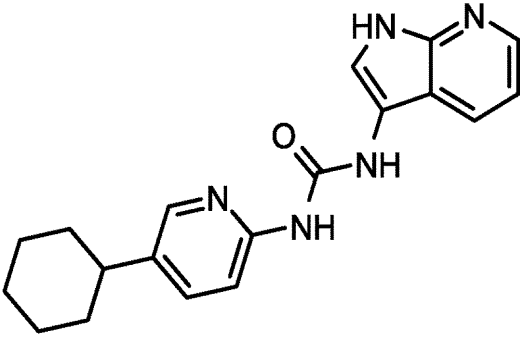
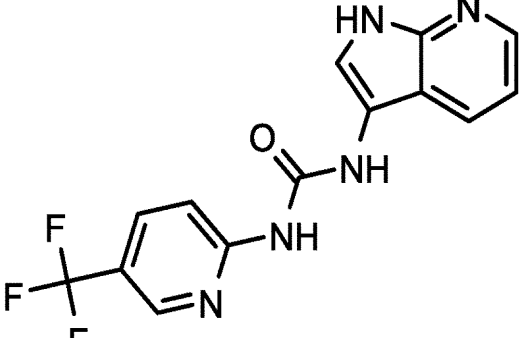
10

20

30

40

50

263	
264	
265	

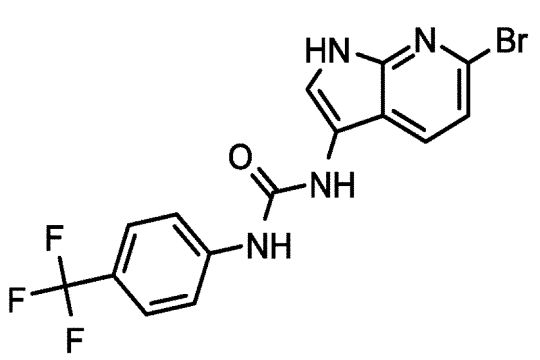
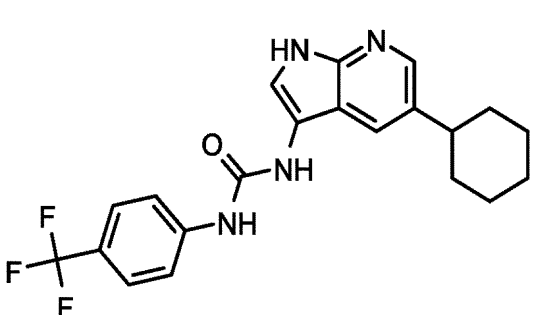
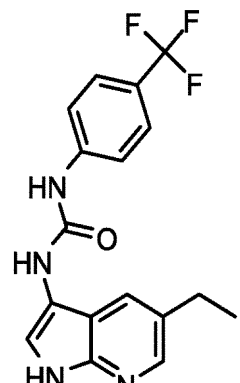
10

20

30

40

50

266	 <chem>Brc1ccc2c(c1)c(c[nH]2)C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
267	 <chem>C1CCCCC1c1ccc2c(c1)c(c[nH]2)C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
268	 <chem>CCc1ccc2c(c1)c(c[nH]2)C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>

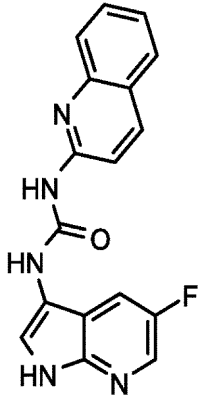
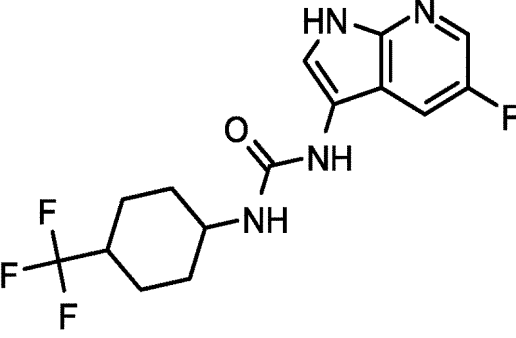
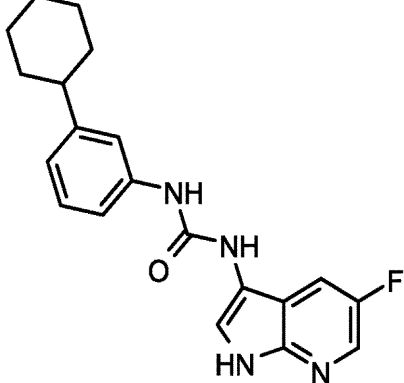
10

20

30

40

50

269	 <chem>O=C(Nc1ccc2c(c1)nc3ccccc32)c4c[nH]c5cc(F)nc45</chem>
270	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2cc(F)nc12)Nc3ccccc3C(F)(F)F</chem>
271	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2cc(F)nc12)Nc3ccccc3C4CCCCC4</chem>

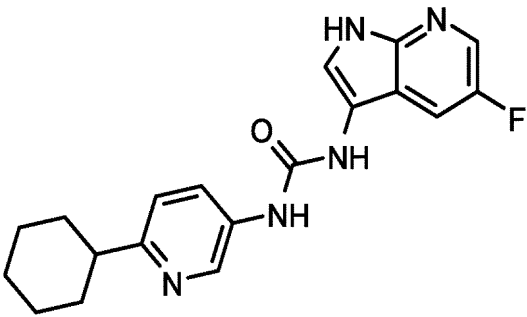
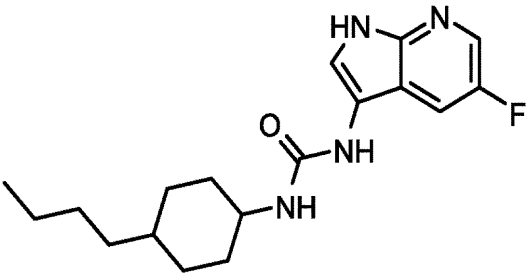
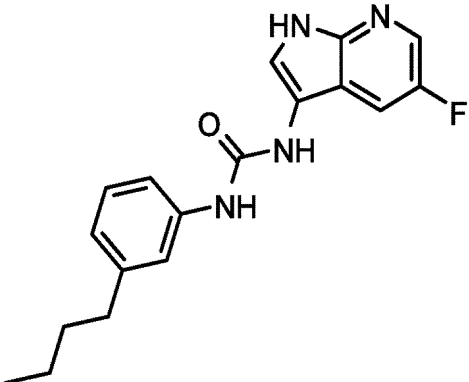
10

20

30

40

50

272	
273	
274	

10

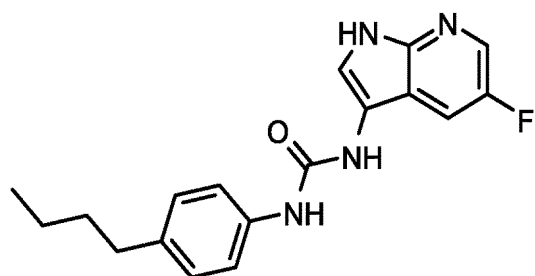
20

30

40

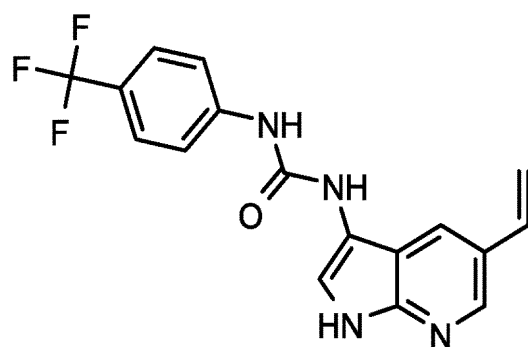
50

275



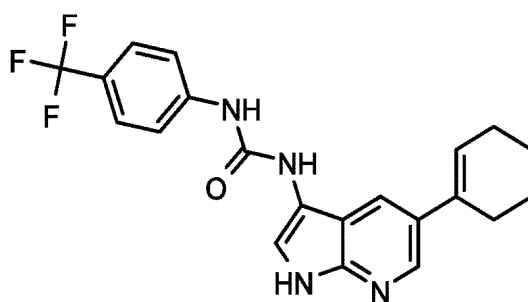
10

276



20

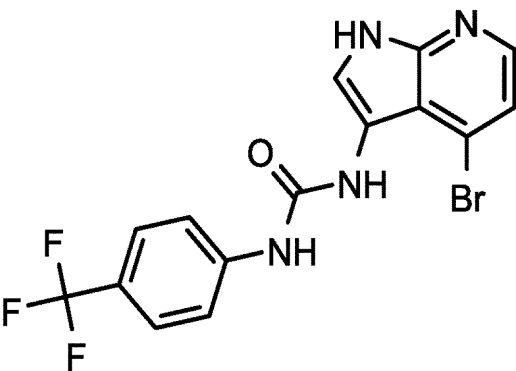
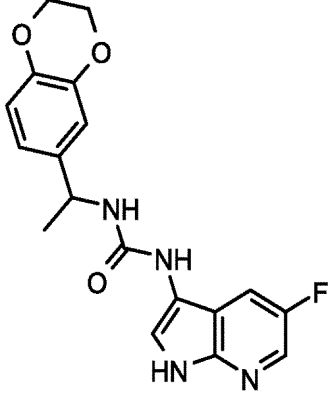
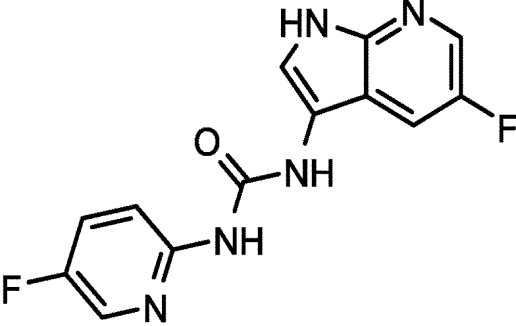
277



30

40

50

278	 <chem>BrC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)C(=O)NC3=CC=C(C=C3)C(F)(F)F</chem>
279	 <chem>FC1=CC=C2C(=C1)C(=CN2)C(=O)NC(C)C3=CC=C(C=C3)O4COCCO4</chem>
280	 <chem>Fc1ccncc1C(=O)NC2=CC=C3C(=C2)C(=CN3)C(F)=C</chem>

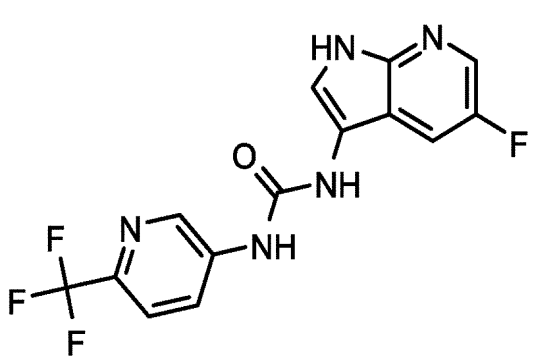
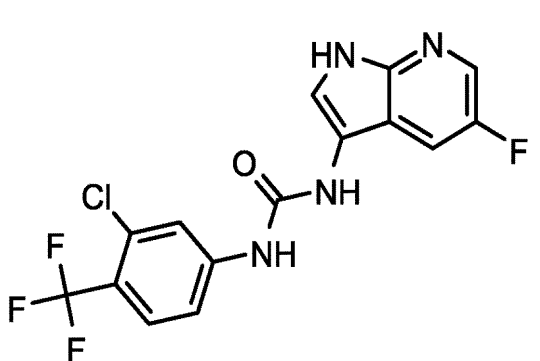
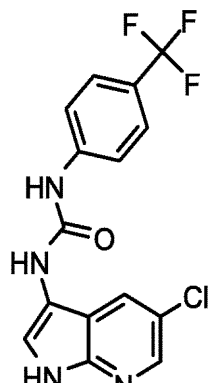
10

20

30

40

50

281	 <chem>FC1=CC=C(C=C1N)NC(=O)Nc2cc(C(F)(F)F)ncn2</chem>
282	 <chem>FC1=CC=C(C=C1N)NC(=O)Nc2ccc(C(F)(F)F)c(Cl)c2</chem>
283	 <chem>Clc1cc2c(c1)[nH]cnc2NC(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>

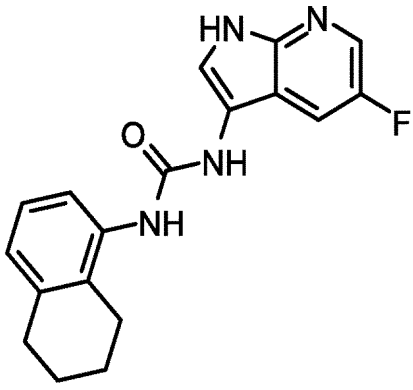
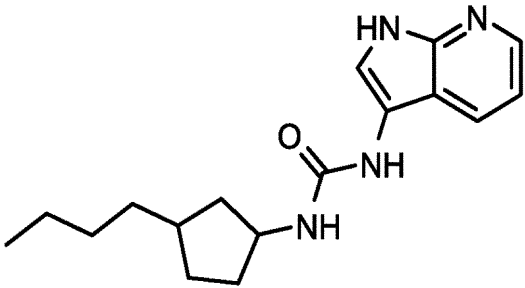
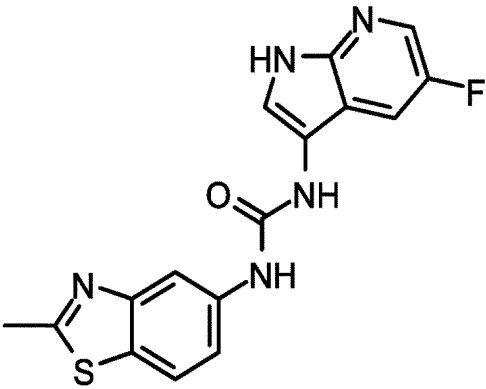
10

20

30

40

50

284	 <chem>Fc1cc2c(c1)c[nH]2NC(=O)Nc3ccc4c(c3)CCCC4</chem>
285	 <chem>CCN(CCCC1CCCC1)C(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23</chem>
286	 <chem>Fc1cc2c(c1)c[nH]2NC(=O)Nc3ccc(SC)c3</chem>

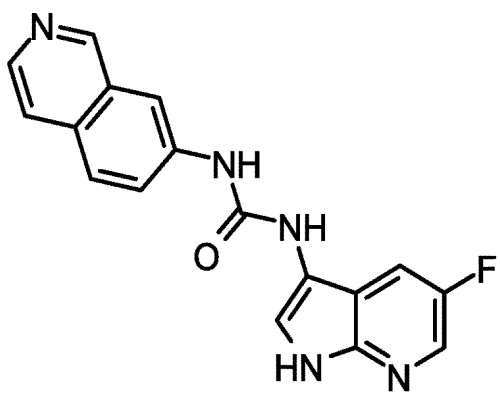
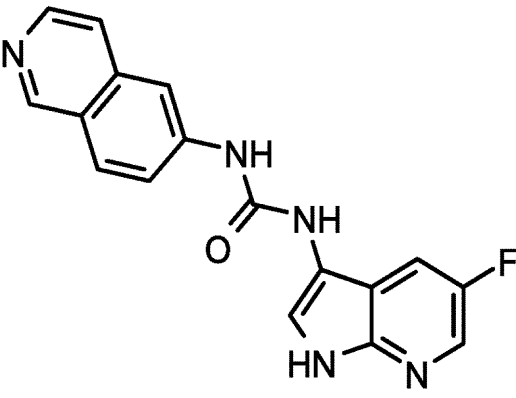
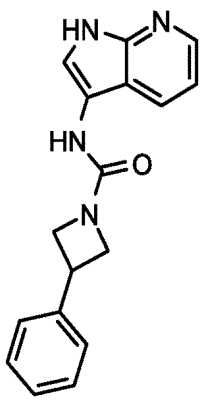
10

20

30

40

50

287	 <chem>Fc1ccc2nc[nH]c2c1NC(=O)Nc3ccc4ccncc34</chem>
288	 <chem>Fc1ccc2nc[nH]c2c1NC(=O)Nc3ccc4ccncc34</chem>
289	 <chem>c1ccc(cc1)C2CCN2C(=O)Nc3cc[nH]c3</chem>

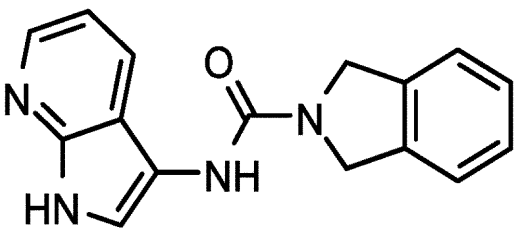
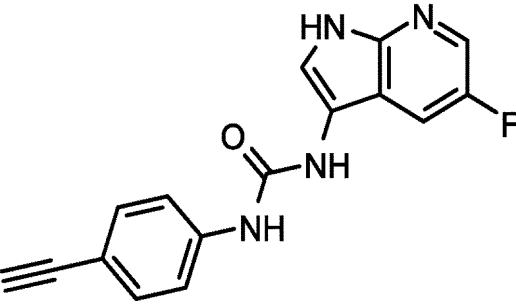
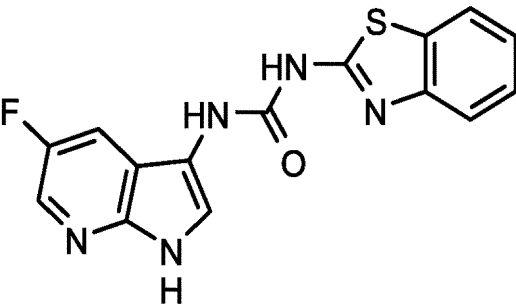
10

20

30

40

50

290	 <chem>Nc1c[nH]c2ccncc12C(=O)Nc3ccc4ccccc34</chem>
291	 <chem>C#Cc1ccc(NC(=O)Nc2cc3ncc[nH]3cc2F)cc1</chem>
292	 <chem>Fc1c[nH]c2c[nH]cnc12C(=O)Nc3c[nH]c4ccccc34</chem>

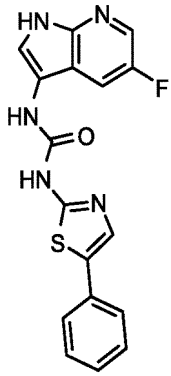
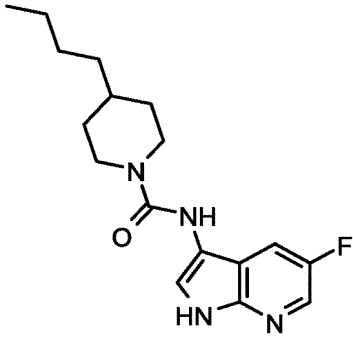
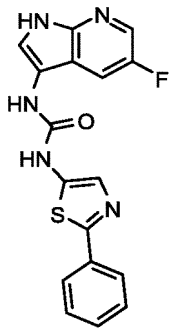
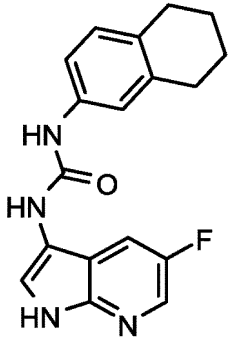
10

20

30

40

50

293	
294	
295	
296	

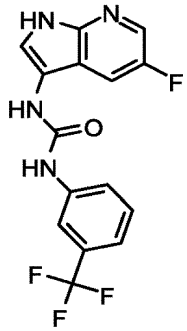
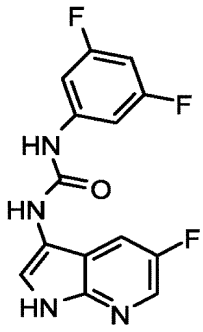
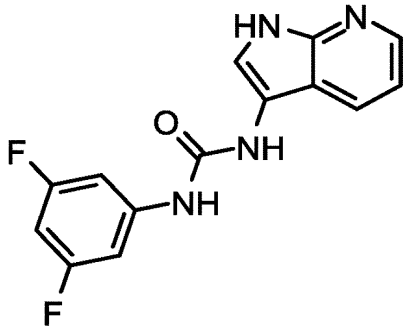
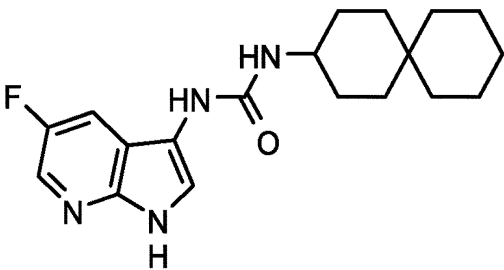
10

20

30

40

50

297	
298	
299	
300	

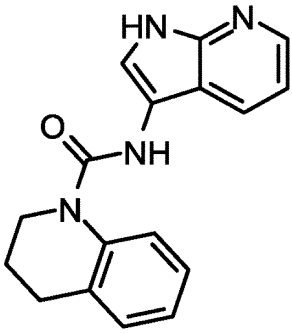
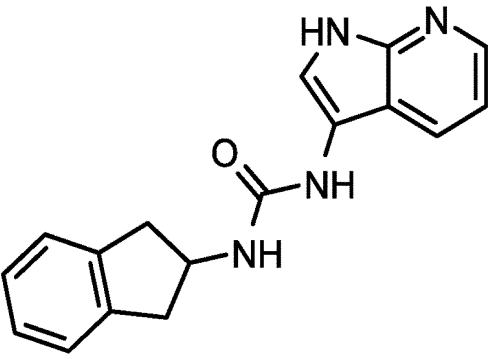
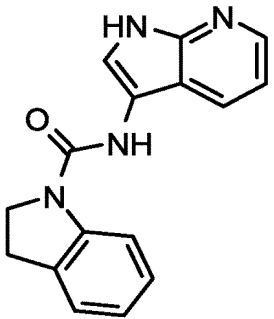
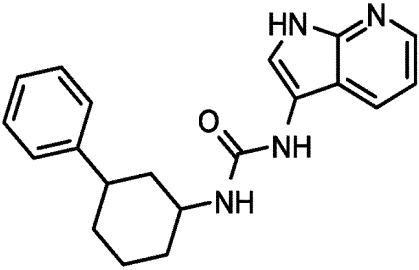
10

20

30

40

50

301	
302	
303	
304	

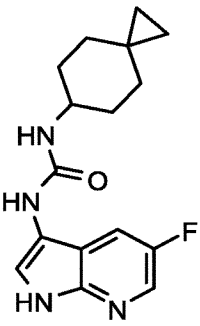
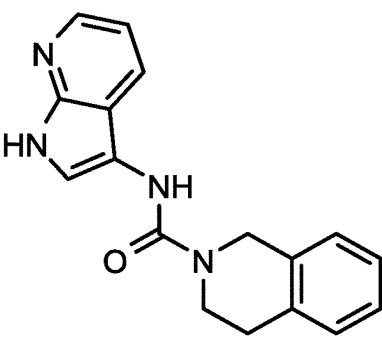
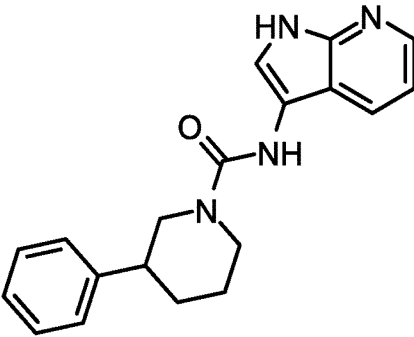
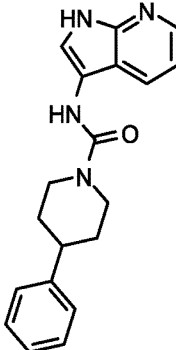
10

20

30

40

50

305	
306	
307	
308	

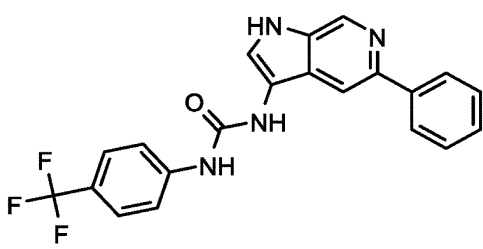
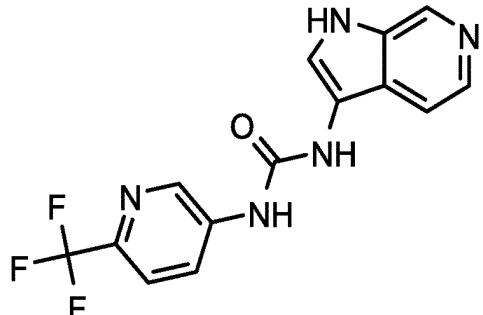
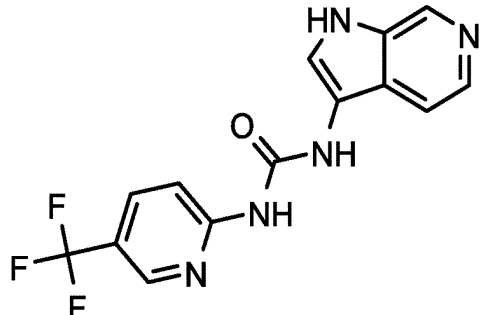
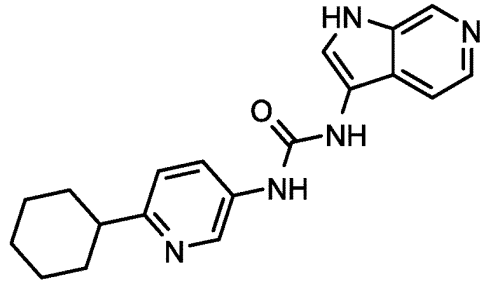
10

20

30

40

50

309	
310	
311	
312	

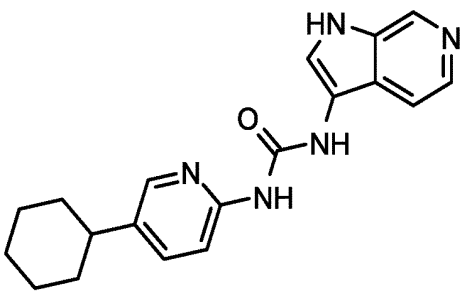
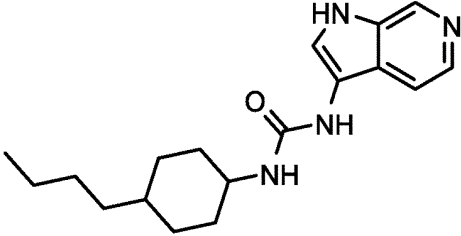
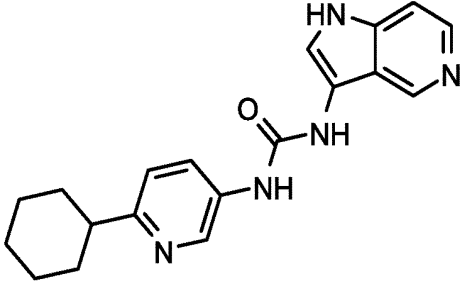
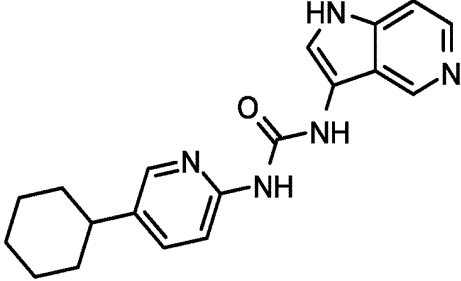
10

20

30

40

50

313	
314	
315	
316	

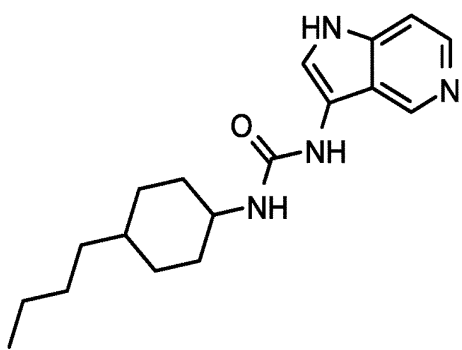
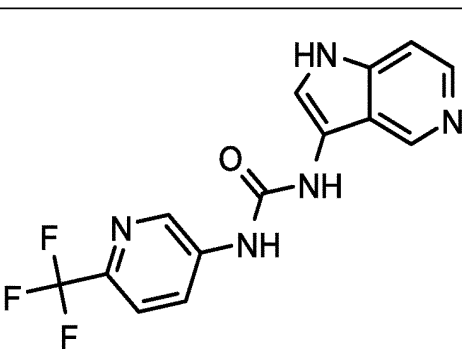
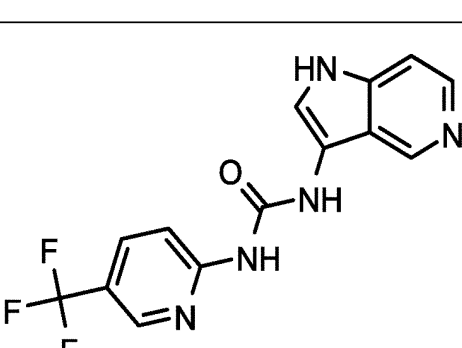
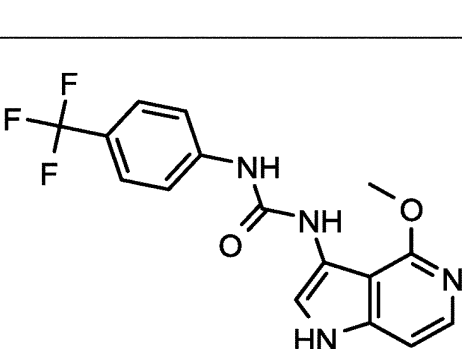
10

20

30

40

50

317	
318	
319	
320	

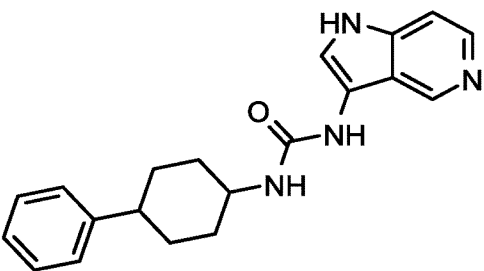
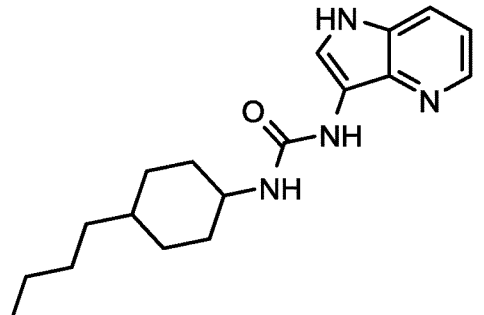
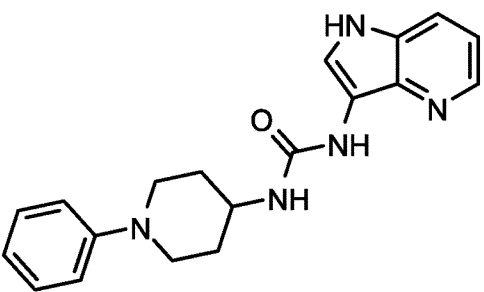
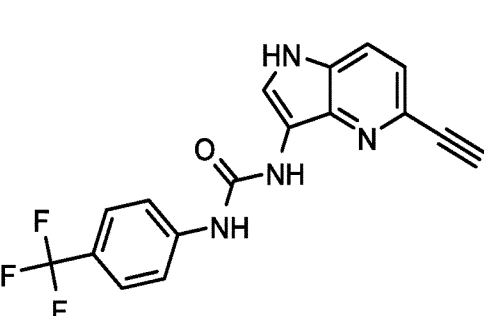
10

20

30

40

50

321	
322	
323	
324	

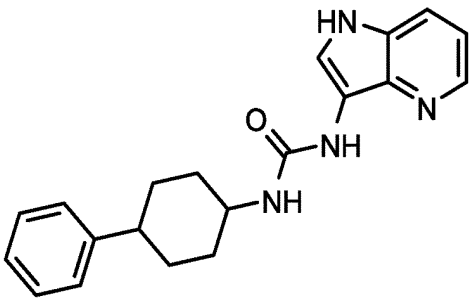
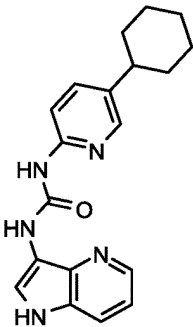
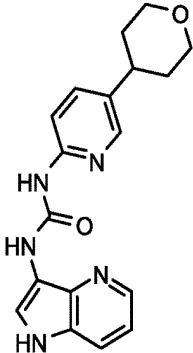
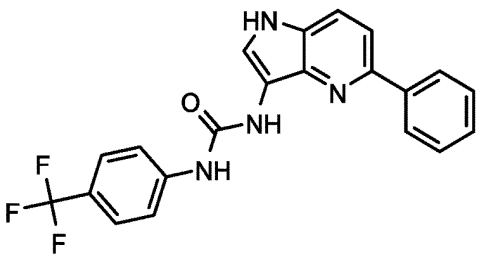
10

20

30

40

50

325	
326	
327	
328	

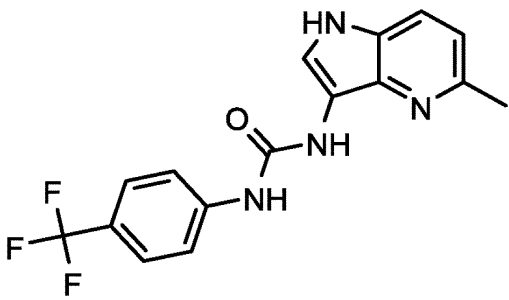
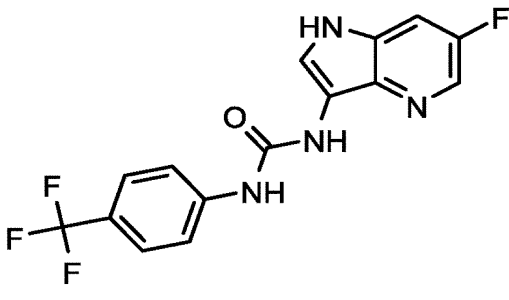
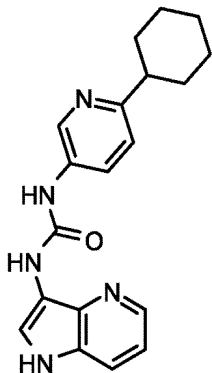
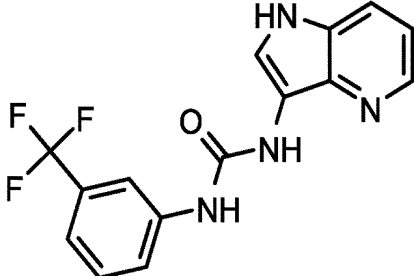
10

20

30

40

50

329	
330	
331	
332	

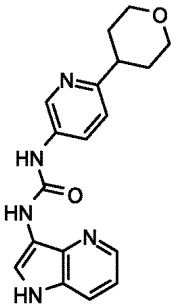
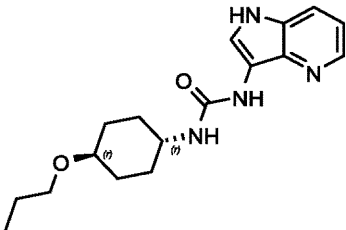
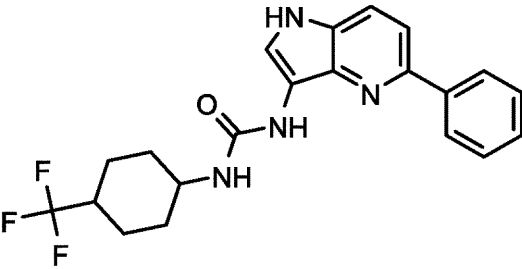
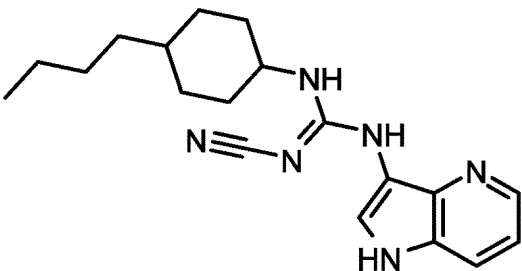
10

20

30

40

50

333	
334	
335	
336	

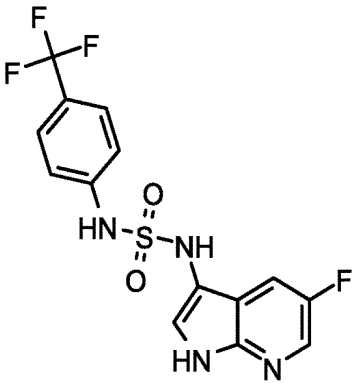
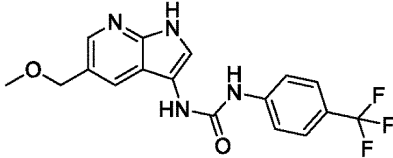
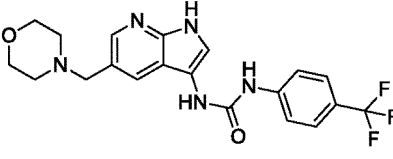
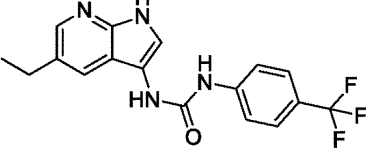
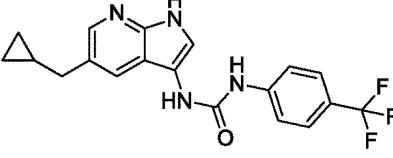
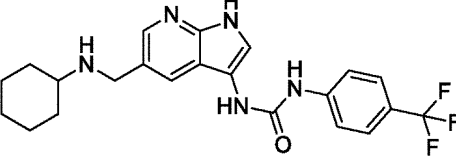
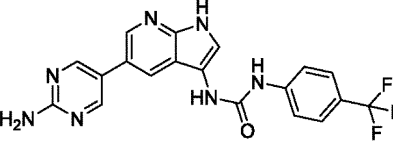
10

20

30

40

50

337	
338	
339	
340	
341	
342	
343	

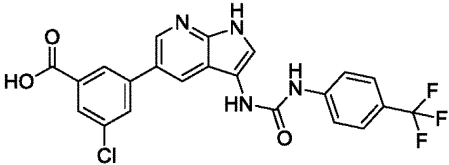
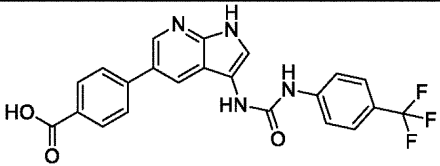
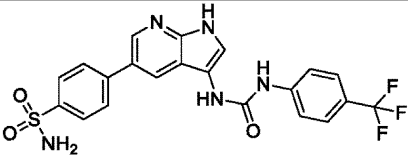
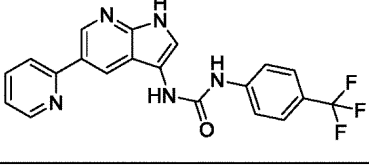
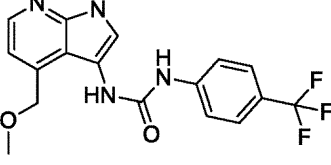
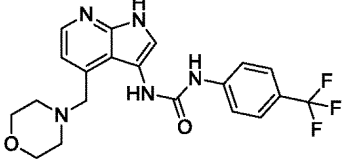
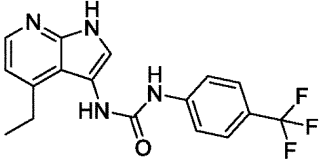
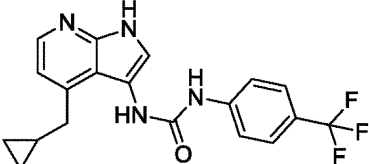
10

20

30

40

50

344	
345	
346	
347	
348	
349	
350	
351	

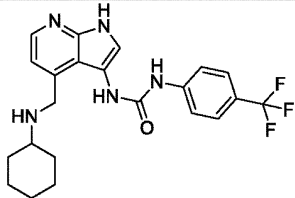
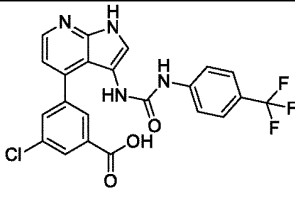
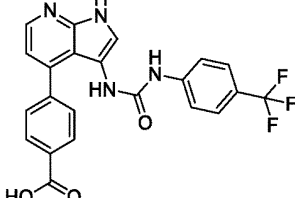
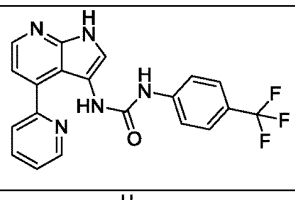
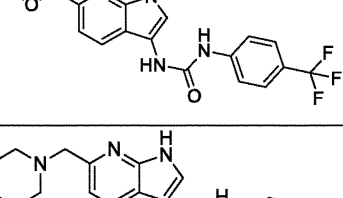
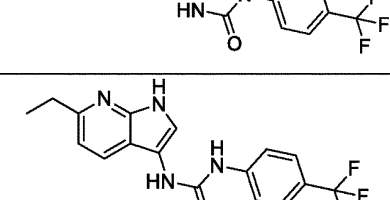
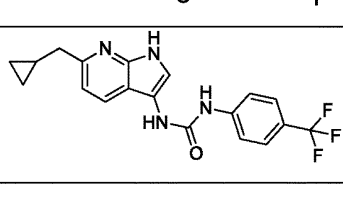
10

20

30

40

50

352	
353	
354	
355	
356	
357	
358	
359	

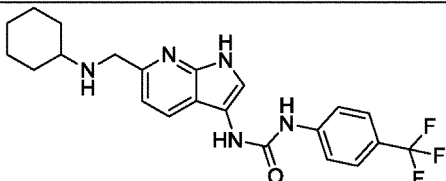
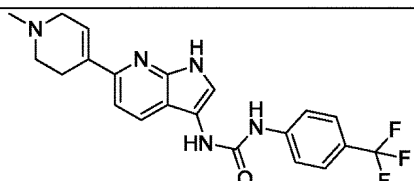
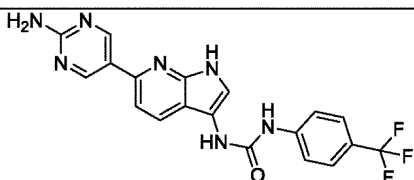
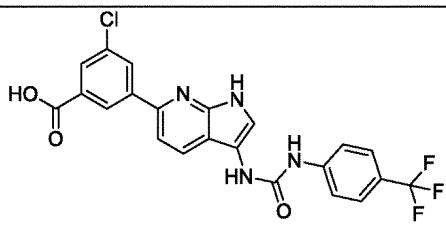
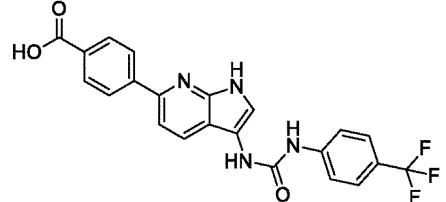
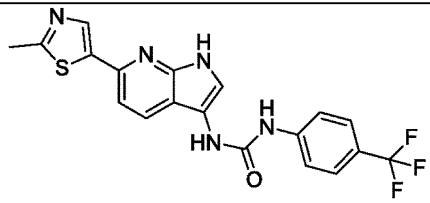
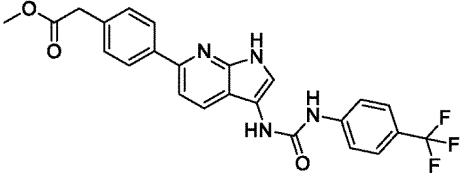
10

20

30

40

50

360	
361	
362	
363	
364	
365	
366	

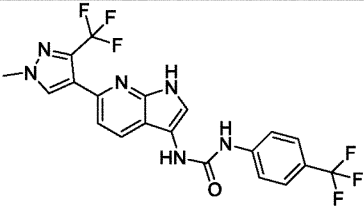
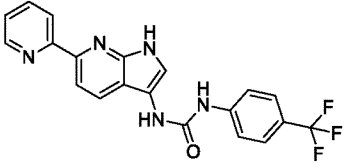
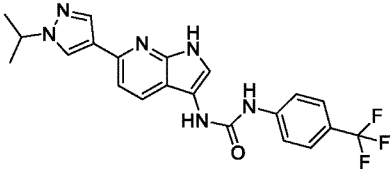
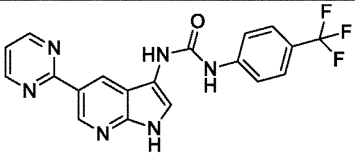
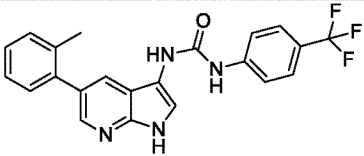
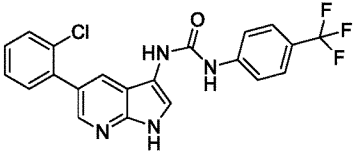
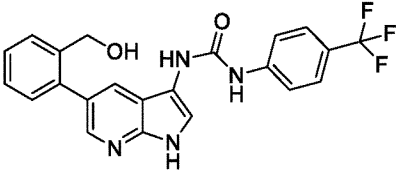
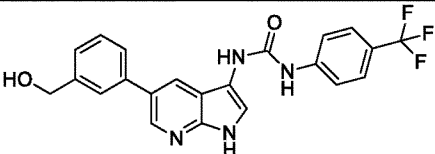
10

20

30

40

50

367	
368	
369	
370	
371	
372	
373	
374	

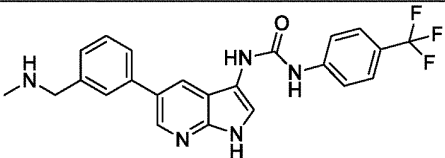
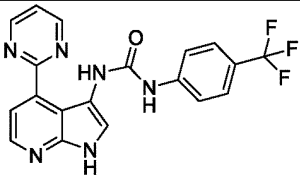
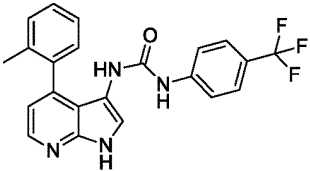
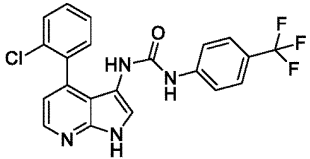
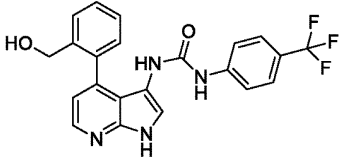
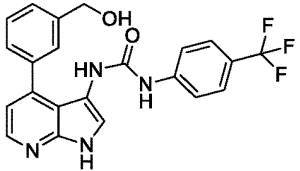
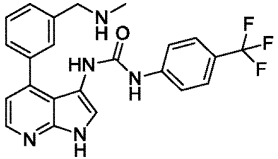
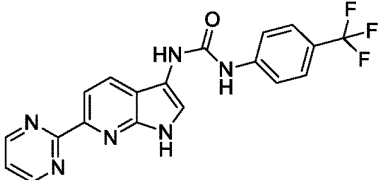
10

20

30

40

50

375	
376	
377	
378	
379	
380	
381	
382	

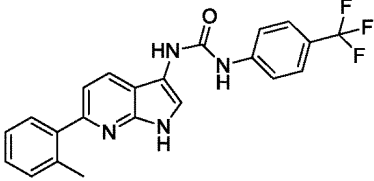
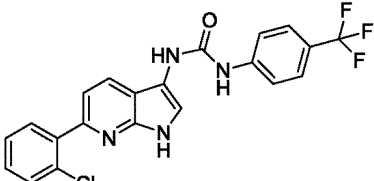
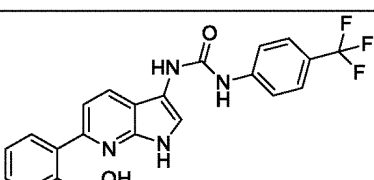
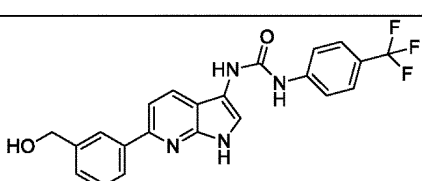
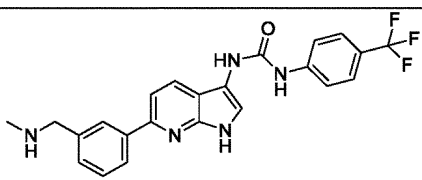
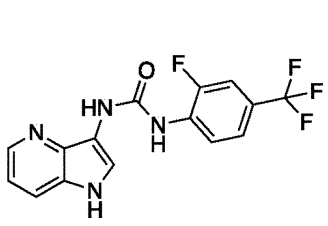
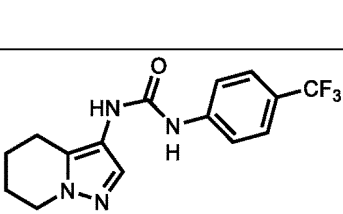
10

20

30

40

50

383	
384	
385	
386	
387	
388	
389	

10

20

30

40

またはこれらの薬学的に許容される塩よりなる群より選択される、化合物。

[本発明1256]

本発明1001～1255のいずれかの化合物と、1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明1257]

STINGを本発明1001～1255のいずれかの化合物と接触させる工程を含む、STING活性を阻害するための方法。

[本発明1258]

阻害することがSTINGをアンタゴナイズすることを含む、本発明1257の方法。

50

[本発明1259]

インビトロで実行される、本発明1257または1258の方法。

[本発明1260]

STINGを含む1つまたは複数の細胞を含む試料を、前記化合物と接触させる工程を含む、本発明1259の方法。

[本発明1261]

前記1つまたは複数の細胞が1つまたは複数のがん細胞である、本発明1259または1260の方法。

[本発明1262]

前記試料が、1つまたは複数のがん細胞をさらに含む（例えば、がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん（hepatocellular cancer）、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がん（hepatocellular carcinoma）からなる群より選択される）、本発明1260または1261の方法。

[本発明1263]

インビボで実行される、本発明1257の方法。

[本発明1264]

疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を有する対象に、前記化合物を投与する工程を含む、本発明1263の方法。

[本発明1265]

前記対象がヒトである、本発明1264の方法。

[本発明1266]

前記疾患ががんである、本発明1264の方法。

[本発明1267]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1266の方法。

[本発明1268]

前記がんが難治性がんである、本発明1266または1267の方法。

[本発明1269]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明1264の方法。

[本発明1270]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1269の方法。

[本発明1271]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1270の方法。

[本発明1272]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ビンカアルカロイドおよび/またはタ

10

20

30

40

50

キサン、例えば、ビソクリスチン、ビンブラスチン、ビノレルビン、および/またはビン
デシン タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル)、トポイソメラー
ゼ(例えば、I型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノ
テカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エ
トポシドホスフェート、および/またはテニポシド)、細胞障害性抗生物質(例えば、ア
クチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルビシン、ダウノルビシン、バルルビシン
、イダルビシン、エピルビシン、ブレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイ
トマイシン)、ホルモン(例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、
ロイプロリジン(leuprolidine)、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ビカ
ルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド)、抗体(例えば、アブシキシマブ、
アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリスマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズ
マブ、プレツキシマブベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブペゴル、
ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ
、ゴリムマブ、イブリツモマブチウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモ
ナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムア
ブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラス
ツズマブ)、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならび
に、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択さ
れ、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-
1-PD-L2、インターロイキン-2(IL-2)、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ(I
DO)、IL-10、トランスフォーミング増殖因子- β (TGF β)、T細胞免疫グロブリンお
よびムチン3(TIM3またはHAVCR2)、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-T
IM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質(LAG3)、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-
1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-
CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-L
IGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA
-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244
、ICOS、ICOS-ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMI
GD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミ
リーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD
244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン
-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセ
リン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD1
55(例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1)からなる群より選択される、本発明1
271の方法。

10

20

30

40

50

[本発明1273]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1264~1272のいずれかの方法。

[本発明1274]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001~1255のいずれかの化合
物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含む、がんを治療する方法。

[本発明1275]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上
皮がん、膀胱がん、非小細胞肺癌、小細胞肺癌、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質
腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血
病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞
新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1274の
方法。

[本発明1276]

前記がんが難治性がんである、本発明1274または1275の方法。

[本発明1277]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明1274の方法。

[本発明1278]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1277の方法。

[本発明1279]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1278の方法。

[本発明1280]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ビンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビンORELビン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル）、トポイソメラーゼ（例えば、I型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド）、細胞障害性抗生物質（例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルビシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エピルビシン、ブレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン）、ホルモン（例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド）、抗体（例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリズマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、ブレツキシマブベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブチウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムアブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ）、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2（IL-2）、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ（IDO）、IL-10、トランスフォーミング増殖因子-β（TGFβ）、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3（TIM3またはHAVCR2）、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質（LAG3）、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I、ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HHLA2-TMIGD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155（例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1）からなる群より選択される、本発明1279の方法。

[本発明1281]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1274～1280のいずれかの方法。

10

20

30

40

50

[本発明1282]

それを必要とする対象に、有効量の本発明1001~1255のいずれかの化合物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含む、該対象において免疫応答を誘導する方法。

[本発明1283]

前記対象ががんを有する、本発明1282の方法。

[本発明1284]

前記対象が、1つまたは複数のがん療法を受けたかつ/または受けているかつ/または受ける対象である、本発明1282の方法。

[本発明1285]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1283の方法。

[本発明1286]

前記がんが難治性がんである、本発明1285の方法。

[本発明1287]

前記免疫応答が自然免疫応答である、本発明1282の方法。

[本発明1288]

前記少なくとも1つまたは複数のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1284の方法。

[本発明1289]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1288の方法。

[本発明1290]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ビンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビノレルビン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル）、トポイソメラーゼ（例えば、I型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド）、細胞障害性抗生物質（例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルビシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エビルビシン、ブレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン）、ホルモン（例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ビカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド）、抗体（例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリズマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、プレツキシマブベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブチウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オフアツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムアブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ）、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェック

10

20

30

40

50

ポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2（IL-2）、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ（IDO）、IL-10、トランスフォーミング増殖因子- β （TGF β ）、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3（TIM3またはHAVCR2）、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質（LAG3）、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I、ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMIGD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155（例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1）からなる群より選択される、本発明1289の方法。

10

[本発明1291]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001～1255のいずれかの化合物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含む、疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患の治療の方法。

20

[本発明1292]

疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を有する対象に、有効量の本発明1001～1255のいずれかの化合物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含む、治療の方法。

[本発明1293]

対象に本発明1001～1255のいずれかの化合物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含み、該化合物または組成物が、疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を治療するのに有効な量で投与され、それにより、該疾患が治療される、治療の方法。

30

[本発明1294]

前記疾患ががんである、本発明1291～1293のいずれかの方法。

[本発明1295]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1294の方法。

[本発明1296]

前記がんが難治性がんである、本発明1294または1295の方法。

40

[本発明1297]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明1294～1296のいずれかの方法。

[本発明1298]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1297の方法。

[本発明1299]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1298

50

の方法。

[本発明1300]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ビンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビノレルビン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル）、トポイソメラーゼ（例えば、I型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド）、細胞障害性抗生物質（例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルビシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エピルビシン、ブレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン）、ホルモン（例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ビカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド）、抗体（例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリズマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、ブレッキシマブ、ベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブ、ペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブ、チウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムアブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ）、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2（IL-2）、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ（IDO）、IL-10、トランスフォーミング増殖因子- β （TGF β ）、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3（TIM3またはHAVCR2）、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質（LAG3）、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I、ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMIGD2、BTN2L2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155（例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1）からなる群より選択される、本発明1299の方法。

[本発明1301]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1291～1300のいずれかの方法。

[本発明1302]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001～1255のいずれかの化合物または本発明1256の薬学的組成物を投与する工程を含む、STINGに関連する疾患、障害、または状態の治療の方法。

[本発明1303]

前記疾患、障害、または状態が、I型インターフェロン症、エカルディ-グティエール症候群（AGS）、遺伝型のループス、炎症関連障害、および関節リウマチより選択される、本発明1302の方法。

10

20

30

40

50

[本発明1304]

前記疾患、障害、または状態がI型インターフェロン症（例えば、乳児発症性STING関連血管炎（SAVI））である、本発明1303の方法。

[本発明1305]

前記I型インターフェロン症が乳児発症性STING関連血管炎（SAVI）である、本発明1304の方法。

[本発明1306]

前記疾患、障害、または状態がエカルディ-グティエール症候群（AGS）である、本発明1303の方法。

[本発明1307]

前記疾患、障害、または状態が遺伝型のループスである、本発明1303の方法。

[本発明1308]

前記疾患、障害、または状態が炎症関連障害である、本発明1303の方法。

[本発明1309]

前記炎症関連障害が全身性エリテマトーデスである、本発明1308の方法。

[本発明1310]

前記対象を同定する工程をさらに含む、本発明1257～1309のいずれかの方法。

本発明の1つまたは複数の態様の詳細は、添付の図面および以下の説明に示される。本発明の他の特徴および利点は、説明および図面から、ならびに請求項から明らかであろう。

10

20

30

40

50