

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成24年2月16日(2012.2.16)

【公表番号】特表2011-506494(P2011-506494A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-538297(P2010-538297)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04 (2006.01)

C 07 D 403/06 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

C 07 D 471/04 (2006.01)

C 07 D 403/12 (2006.01)

C 07 D 403/14 (2006.01)

C 07 D 409/14 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

A 61 K 31/4192 (2006.01)

A 61 K 31/416 (2006.01)

A 61 K 31/4184 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/437 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 K 31/4178 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04 C S P

C 07 D 403/06

C 07 D 401/14

C 07 D 471/04 1 0 4 Z

C 07 D 403/12

C 07 D 403/14

C 07 D 409/14

C 07 D 417/14

A 61 K 31/4192

A 61 K 31/416

A 61 K 31/4184

A 61 K 31/496

A 61 K 31/437

A 61 K 31/427

A 61 K 31/4709

A 61 K 31/506

A 61 K 31/497

A 61 K 31/4178

A 6 1 K 31/5377
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月19日(2011.12.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

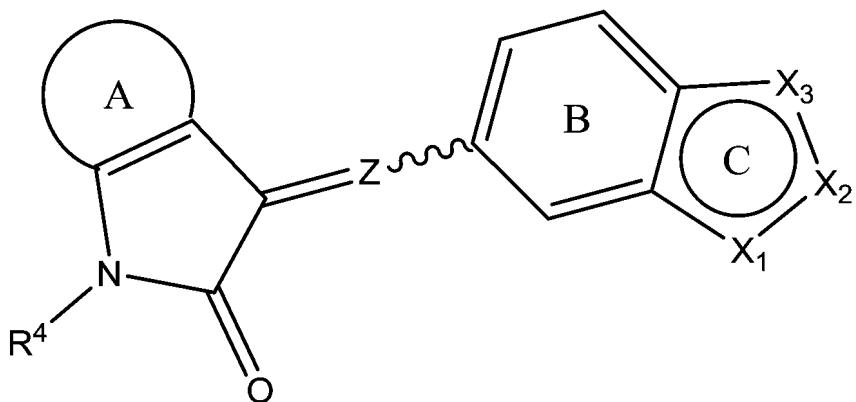
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式、

【化1】



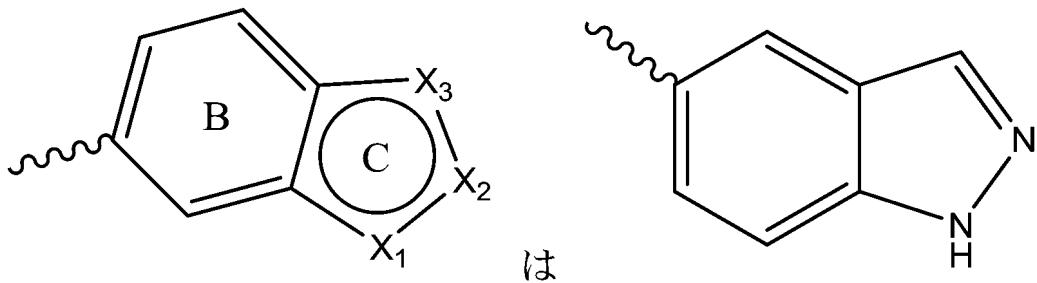
(式中、

A環は任意に置換される5または6員環芳香族環であり、

B環は任意に置換されるフェニル環であり、

C環はX1～X3の1つがNであり、X1～X3の1つがNR⁵であり、X1～X3の1つがNまたはCR⁶である、5員環複素環式芳香族環であり、Zは=N-または=CR³-であるが、ただしZが=N-であり、

【化2】



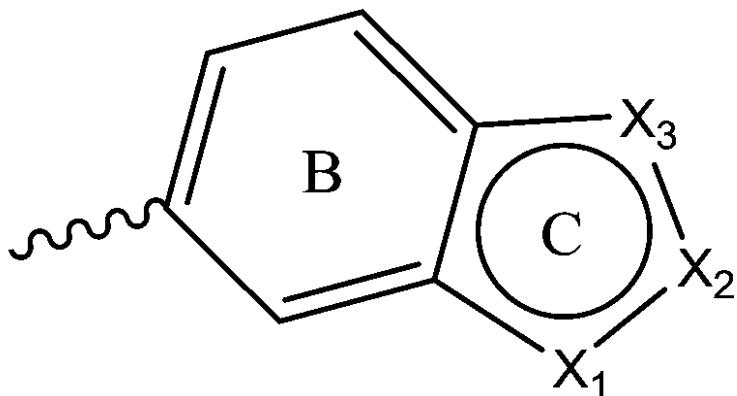
であり、

R⁴がHまたはC1～C6アルキルであれば、A環はフェニルまたは、ハロゲンまたはト

リフルオロメチルで置換されたフェニルでなく、

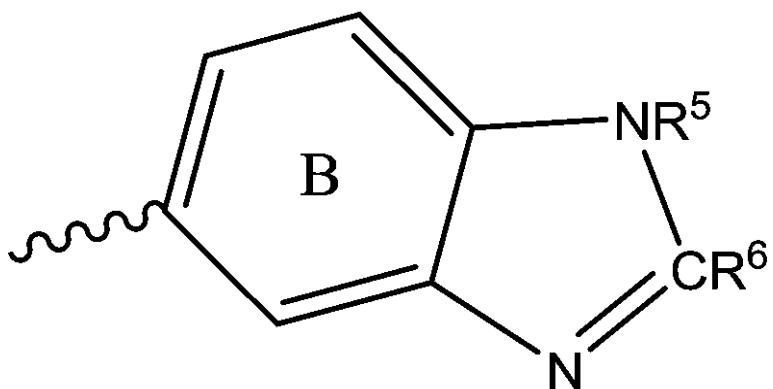
R^3 は - H、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキルまたはC 1 ~ C 6 ハロアルキルであるが、
ただし R^3 がハロゲンであれば、

【化 3】



は

【化 4】



でなく、

R^4 および R^5 のそれぞれは独立して、- H、C 1 ~ C 6 アルキル、フェニル、- C (O) (C 1 ~ C 6 アルキル)、- C (O) (フェニル)、- C (O) O (C 1 ~ C 6 アルキル)、- C (O) O (フェニル)、- S (O) 2 (C 1 ~ C 6 アルキル) または - S (O) 2 (フェニル) であり、

R^4 および R^5 によって表される基中の前記各アルキルは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、フェニル、5 ~ 6 員環ヘテロアリール、C 1 ~ C 6 アルコキシ、および C 1 ~ C 6 ハロアルコキシからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換され、

R^4 および R^5 によって表される基中の前記各フェニルは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 6 ハロアルキル、C 1 ~ C 6 アルコキシ、および C 1 ~ C 6 ハロアルコキシからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換され、

R^6 は、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、R'、- OR、- SR、- N (R) 2、- C (O) R、- C (O) OR、- OC (O) R、- C (O) N (R) 2、- OC (O) N

(R)₂、-NRC(O)R、-NRC(O)OR、-SOR'、-SO₂R'、-SO₃R'、-SO₂N(R)₂、-NRS(O)R'、-NR₂SO₂R'、-NRC(O)N(R)₂、-NRC(O)ON(R)₂、または-NR₂SO₂N(R)₂であり、

各Rは独立して、水素、C_{1~10}脂肪族、フェニルまたは5~6員環ヘテロアリールであり、前記脂肪族はハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、フェニル、5~6員環ヘテロアリール、C_{1~C6}アルコキシ、C_{1~C6}ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、Rによって表されるフェニルおよびヘテロアリール基、およびRによって表される脂肪族基の置換基中のフェニルおよびヘテロアリール基のそれぞれは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C_{1~C6}アルキル、C_{1~C6}ハロアルキル、C_{1~C6}アルコキシ、C_{1~C6}ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、または

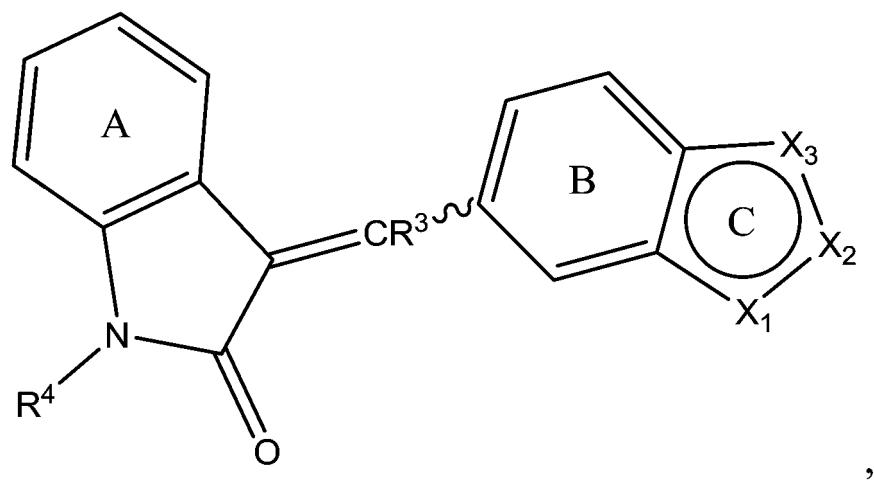
N(R)₂は、=O、=S、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1~6}アルキル、C_{1~6}ハロアルキル、C_{1~6}ヒドロキシアルキル、アミノ、C_{1~6}アルキルアミノ、C_{1~6}ジアルキルアミノ、C_{1~6}アミノアルキル、(C_{1~6}アルキルアミノ)C_{1~6}アルキル、(C_{1~6}ジアルキルアミノ)C_{1~6}アルキル、(フェニル)C_{1~6}アルキル、(5~6員環ヘテロアリール)C_{1~6}アルキル、C_{1~6}アルコキシ、C_{1~6}ハロアルコキシ、C_{1~6}アルキルカルボニルオキシ、C_{1~6}アルコキシカルボニル、C_{1~6}アルキルカルボニル、フェニル、および5~6員環ヘテロアリールからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される非芳香族複素環式基を形成し、

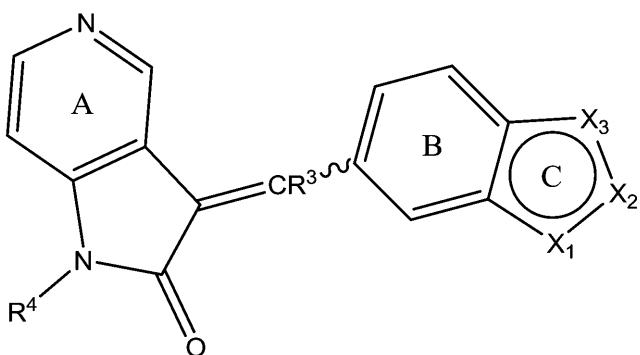
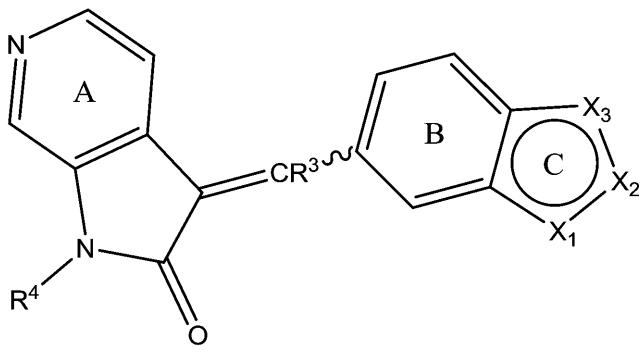
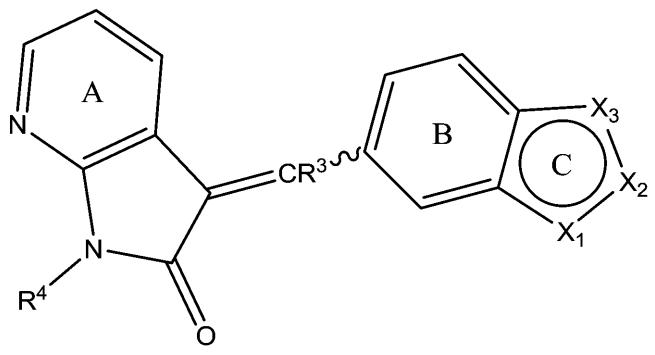
各R'は独立して、C_{1~10}脂肪族、フェニルまたは5~14員環ヘテロアリールであり、前記脂肪族は、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、フェニル、5~6員環ヘテロアリール、C_{1~C6}アルコキシ、C_{1~C6}ハロアルコキシ、C_{1~6}アルキルアミノ、C_{1~6}ジアルキルアミノ、-C(O)(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)(C_{1~C6}ハロアルキル)、-C(O)(フェニル)、-C(O)(非芳香族複素環式基)、-C(O)O(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)O(C_{1~C6}ハロアルキル)、-C(O)O(フェニル)、-OC(O)(C_{1~C6}アルキル)、-OC(O)(C_{1~C6}ハロアルキル)、-OC(O)(フェニル)、-S(O)₂(C_{1~C6}アルキル)、および-S(O)₂(フェニル)からなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、R'によって表されるフェニルおよびヘテロアリール基、およびR'によって表される脂肪族基の置換基中のフェニルおよびヘテロアリール基のそれぞれは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C_{1~C6}アルキル、C_{1~C6}ハロアルキル、C_{1~C6}アルコキシ、C_{1~C6}ハロアルコキシ、非芳香族複素環式基、C_{1~6}アルキルアミノ、C_{1~6}ジアルキルアミノ、-C(O)(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)(C_{1~C6}ハロアルキル)、-C(O)(フェニル)、-C(O)(非芳香族複素環式基)、-C(O)O(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)O(C_{1~C6}ハロアルキル)、-OC(O)(C_{1~C6}アルキル)、-OC(O)(フェニル)、-S(O)₂(C_{1~C6}アルキル)、-S(O)₂(C_{1~C6}ハロアルキル)、および-S(O)₂(フェニル)からなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される)によって表される化合物、または薬学的に許容できるその塩。

【請求項2】

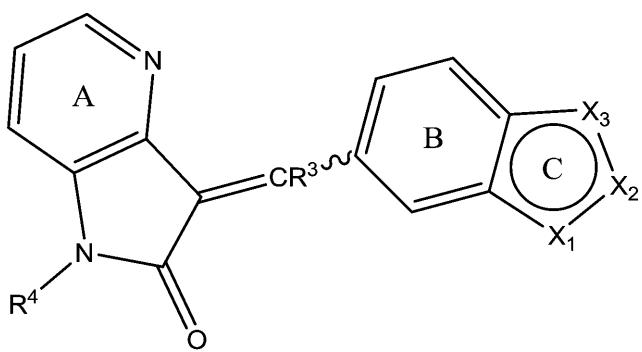
化合物が、

【化 9】





および

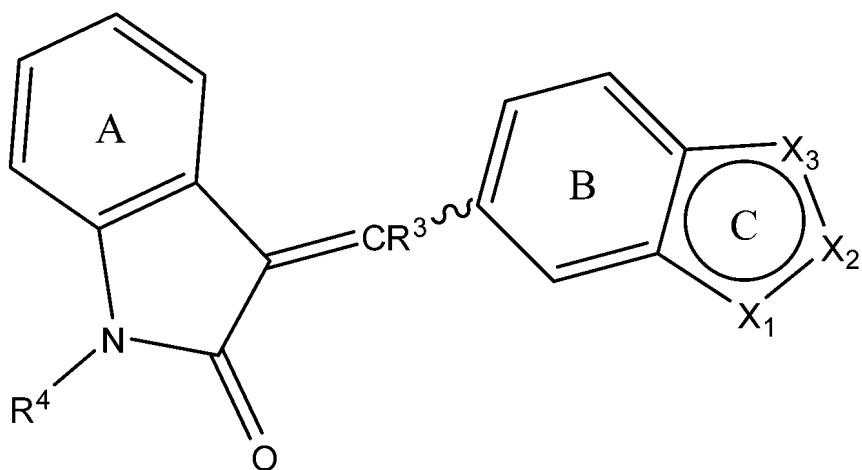


(式中、A環およびB環は任意に置換される)から選択される構造式によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

化合物が、構造式、

【化10】



(式中、A環およびB環は任意に置換される)によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

各R²が-HまたはC1~C6アルキルであり、

R³が-H、C1~C6アルキルまたはC1~C6ハロアルキルであり、

各R'が独立して、C_{1~10}脂肪族、フェニルまたは5~6員環ヘテロアリールであり、前記脂肪族が、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、フェニル、5~6員環ヘテロアリール、C1~C6アルコキシ、C1~C6ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、R'によって表されるフェニルおよびヘテロアリール基、およびR'によって表される脂肪族基の置換基中のフェニルおよびヘテロアリール基のそれぞれが独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C1~C6アルキル、C1~C6ハロアルキル、C1~C6アルコキシ、C1~C6ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

フェニルA環が1つ以上の置換基Q^aで任意に置換され、フェニルB環が1つ以上の置換基Q^bで任意に置換され、Q^aおよびQ^bのそれぞれが独立して、ハロゲン、-X-R¹、-NO₂、-CN、-NCS、Ak¹、Ar¹、(C_{1~10}アルキレン)-Ar¹、(C_{2~10}アルケニレン)-Ar¹、-O-[CH₂]_p-O-、-S-[CH₂]_p-S-、および-[CH₂]_q-からなる群から選択され、

Xが-C(O)O-、-C(O)-、-C(S)-、-OC(O)-、-C(O)N(R²)⁻、-C(S)N(R²)⁻、-OC(O)N(R²)⁻、-S(O)⁻、-S(O)₂-、-SO₃⁻、-SO₂NR²⁻、-O-、-S-、-NR²⁻、-NR²C(O)-、-NR²C(O)ONR²⁻、-N(R²)C(O)NR²⁻、-NR²SO₂NR²⁻または-NR²SO₂-であり、

各R¹が独立して、

i) 水素、

i i) ハロゲン、-NO₂、-CN、-NCS、Ak¹⁰、(C_{1~10}アルキレン)-Ar¹⁰、(C_{2~10}アルケニレン)-Ar¹⁰、-C(O)OR¹⁰、-C(O)R¹⁰、-C(S)R¹⁰、-OC(O)R¹⁰、-C(O)N(R¹¹)₂、-C(S)N(R¹¹)₂、-OC(O)N(R¹¹)₂、-S(O)R¹²、-S(O)₂R¹²、-SO₃R¹²、-SO₂N(R¹¹)₂、-OR¹⁰、-SR¹⁰、-N(R¹¹)₂、-NR¹¹C(O)R¹⁰、-NR¹¹S(O)R¹²、-NR¹¹C(O)OR¹²、-N(R¹¹)C(O)N(R¹¹)₂、-NR¹¹SO₂N(R¹¹)₂、および-NR¹¹SO₂R¹²からなる群から選択される1つ以上の置換基でそれぞれ任意に

独立して置換される $C_{6\sim14}$ アリール基または 5~14 員環ヘテロアリール基、または $i_1 i_2 i_3$ ハロゲン、-NO₂、-CN、-NCS、Ar^{1~0}、-C(O)OR^{1~0}、-C(O)R^{1~0}、-C(S)R^{1~0}、-OC(O)R^{1~0}、-C(O)N(R^{1~1})₂、-C(S)N(R^{1~1})₂、-OC(O)N(R^{1~1})₂、-S(O)R^{1~2}、-S(O)₂R^{1~2}、-SO₃R^{1~2}、-SO₂N(R^{1~1})₂、-OR^{1~0}、-SR^{1~0}、-N(R^{1~1})₂、-NR^{1~1}C(O)R^{1~0}、-NR^{1~1}S(O)R^{1~2}、-NR^{1~1}C(O)OR^{1~2}、-N(R^{1~1})C(O)N(R^{1~1})₂、-NR^{1~1}SO₂N(R^{1~1})₂、および-NR^{1~1}SO₂R^{1~2}からなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換される $C_{1\sim10}$ 脂肪族基であるが、

ただし X が -S(O)-、-S(O)₂-、-SO₃-、-NR²S(O)- または -NR²SO₂- であれば、R¹ は水素以外であり、

各 R² が独立して、R¹、-CO₂R¹、-SO₂R¹ または -C(O)R¹ であり、または NR¹ と一緒に合わせると、=O、=S、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1~6} アルキル、C_{1~6} ハロアルキル、C_{1~6} ヒドロキシアルキル、アミノ、C_{1~6} アルキルアミノ、C_{1~6} ジアルキルアミノ、C_{1~6} アミノアルキル、(C_{1~6} アルキルアミノ)C_{1~6} アルキル、(C_{1~6} ジアルキルアミノ)C_{1~6} アルキル、(フェニル)C_{1~6} アルキル、(5~6 員環ヘテロアリール)C_{1~6} アルキル、C_{1~6} アルコキシ、C_{1~6} ハロアルコキシ、C_{1~6} アルキルカルボニルオキシ、C_{1~6} アルコキシカルボニル、C_{1~6} アルキルカルボニル、フェニル、および 5~6 員環ヘテロアリールからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換される非芳香族複素環式基を形成し、

各 R^{1~0} が独立して、

i) 水素、

i i) ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1~10} アルキル、C_{1~10} ハロアルキル、(C_{1~10} ハロアルコキシ)C_{1~10} アルキル、(C_{1~10} アルコキシ)C_{1~10} アルキル、C_{1~10} ヒドロキシアルキル、C_{1~10} アミノアルキル、(C_{1~10} アルキルアミノ)C_{1~10} アルキル、(C_{1~10} ジアルキルアミノ)C_{1~10} アルキル、(フェニル)C_{1~10} アルキル、(5~6 員環ヘテロアリール)C_{1~10} アルキル、C_{1~10} アルコキシ、C_{1~10} ハロアルコキシ、C_{1~10} アルキルカルボニルオキシ、C_{1~10} アルコキシカルボニル、および C_{1~10} アルキルカルボニルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基でそれぞれ任意に独立して置換される C_{6~14} アリール基または 5~14 員環ヘテロアリール基、または

i ii i) ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1~10} ハロアルキル、C_{1~10} アルコキシ、C_{1~10} ハロアルコキシ、アミノ、C_{1~10} アルキルアミノ、C_{1~10} ジアルキルアミノ、C_{1~10} アルキルカルボニルオキシ、C_{1~10} アルコキシカルボニル、C_{1~10} アルキルカルボニル、およびフェニルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換される C_{1~10} アルキル基であり、前記フェニルがハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C_{1~C3} アルキル、C_{1~C3} ハロアルキル、C_{1~C3} アルコキシ、および C_{1~C3} ハロアルコキシからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換され、

各 R^{1~1} が独立して、R^{1~0}、-CO₂R^{1~0}、-SO₂R^{1~0} または -C(O)R^{1~0} であり、または

一緒に合わせた -N(R^{1~1})₂ が、=O、=S、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1~6} アルキル、C_{1~6} ハロアルキル、C_{1~6} ヒドロキシアルキル、アミノ、C_{1~6} アルキルアミノ、C_{1~6} ジアルキルアミノ、C_{1~6} アミノアルキル、(C_{1~6} アルキルアミノ)C_{1~6} アルキル、(C_{1~6} ジアルキルアミノ)C_{1~6} アルキル、C_{1~6} アルコキシ、C_{1~6} ハロアルコキシ、C_{1~6} アルキルカルボニルオキシ、C_{1~6} アルコキシカルボニル、および C_{1~6} アルキルカルボニルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換される非芳香族複素環式基であり、

各 R^{1-2} が独立して、

i) ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、(C_{1-10} ハロアルコキシ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} アルコキシ) C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ヒドロキシアルキル、 C_{1-10} アミノアルキル、(C_{1-10} アルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} ジアルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、アミノ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} ハロアルコキシ、 C_{1-10} アルキルカルボニルオキシ、 C_{1-10} アルコキシカルボニル、および C_{1-10} アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基でそれぞれ任意に独立して置換される C_{6-14} アリール基または5~14員環ヘテロアリール基、または

ii) ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_{1-10} ハロアルキル、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} ハロアルコキシ、アミノ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} ジアルキルアミノ、 C_{1-10} アルキルカルボニルオキシ、 C_{1-10} アルコキシカルボニル、 C_{1-10} アルキルカルボニル、およびフェニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される C_{1-10} アルキル基であり、前記フェニルがハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 C_{1-C_3} アルキル、 C_{1-C_3} ハロアルキル、 C_{1-C_3} アルコキシ、および C_{1-C_3} ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

各 Ak^1 が独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-N(R^{2-1})₂、-C(O)N(R^{2-1})₂、-C(O)N(R^{2-1})₂、-NR²⁻¹C(O)R²⁻¹、-SO₂R²⁻²、-SO₂N(R^{2-1})₂、-NR²⁻¹SO₂R²⁻²、-NR²⁻¹C(O)OR²⁻¹、-O(C)N(R^{2-1})₂、-NR²⁻¹C(O)N(R^{2-1})₂、-NRC(O)ON(R)₂、-NR²⁻¹SO₂N(R^{2-1})₂、-OR²⁻¹、-SR²⁻¹、 C_{1-10} ハロアルコキシ、-C(O)R²⁻¹、-C(O)OR²⁻¹、および-O(C)R²⁻¹からなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される C_{1-10} 脂肪族基であり、

各 Ak^1 が独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C₁₋₆ アルキル)、-S(C₁₋₆ アルキル)、 C_{1-6} ハロアルコキシ、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} ジアルキルアミノ、 C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、および C_{1-6} アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される C_{1-10} アルキル基であり、

各 Ar^1 が、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、(C_{1-10} ハロアルコキシ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} アルコキシ) C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ヒドロキシアルキル、 C_{1-10} アミノアルキル、(C_{1-10} アルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} ジアルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、-N(R^{2-1})₂、-C(O)N(R^{2-1})₂、-C(O)N(R^{2-1})₂、-NR²⁻¹C(O)R²⁻¹、-SO₂R²⁻²、-SO₂N(R^{2-1})₂、-NR²⁻¹SO₂R²⁻²、-NR²⁻¹C(O)N(R^{2-1})₂、-NRC(O)ON(R)₂、-NR²⁻¹SO₂N(R^{2-1})₂、-OR²⁻¹、-SR²⁻¹、 C_{1-10} ハロアルコキシ、-C(O)R²⁻¹、-C(O)OR²⁻¹、-OC(O)R²⁻¹、フェニル、および5~6員環ヘテロアリールからなる群から選択される1つ以上の置換基でそれぞれ任意に独立して置換される C_{6-14} アリール基または5~14員環ヘテロアリール基であり、前記フェニルおよび前記5~6員環ヘテロアリールが、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 C_{1-C_3} アルキル、 C_{1-C_3} ハロアルキル、 C_{1-C_3} アルコキシ、および C_{1-C_3} ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基でそれぞれ独立して任意に置換され、

各 Ar^1 が独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C₁₋₁₀ アルキル)、-S(C₁₋₁₀ アルキル)、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、(C_{1-10} ハロアルコキシ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} アルコキシ) C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ヒドロキシアルキル、(C_{1-10} アミノアルキル、(C_{1-10} アルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} ジアルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、(C_{1-10} ジアルキルアミノ) C_{1-10} アルキル、

$C_1 \sim C_{10}$ アルキル、(フェニル) $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、(5 ~ 6員環ヘテロアリール) $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_{10}$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシカルボニル、および $C_1 \sim C_{10}$ アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基でそれぞれ独立して任意に置換される $C_6 \sim C_{14}$ アリール基または5 ~ 14員環ヘテロアリール基であり、

各 $R^{2,1}$ が独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニルまたは5 ~ 6員環ヘテロアリールであり、 $R^{2,1}$ によって表されるフェニルおよびヘテロアリール基のそれぞれが独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、 $R^{2,1}$ によって表されるアルキル基が、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、または

$N(R^{2,1})_2$ がハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、=O、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、およびアミノからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される非芳香族複素環式基を形成し、

各 $R^{2,2}$ が独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニルまたは5 ~ 6員環ヘテロアリールであり、 $R^{2,2}$ によって表されるフェニルおよびヘテロアリール基のそれぞれが独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、 $R^{2,2}$ によって表されるアルキル基が、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、および $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

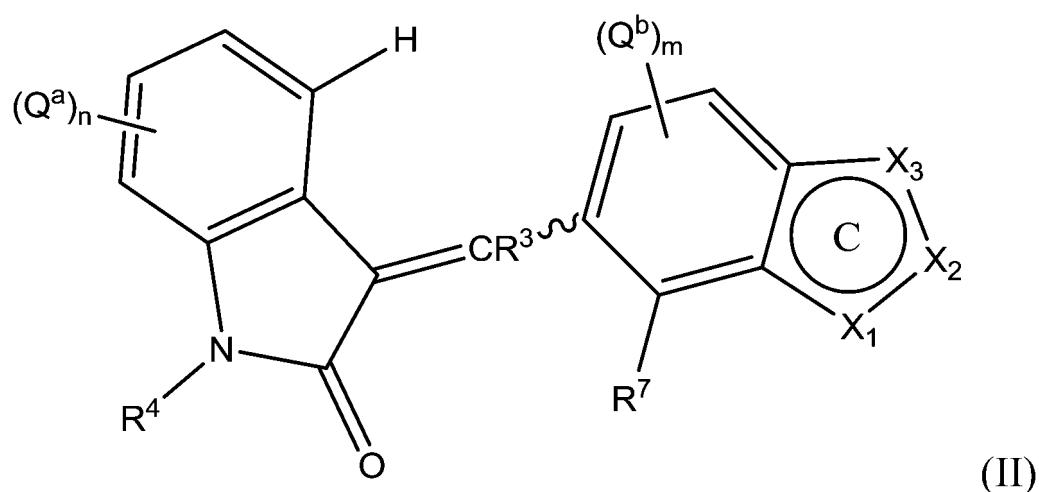
各 p が1、2または3であり、

各 q が2、3、4または5である、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

化合物が、構造式、

【化11】



(式中、

n および m のそれぞれは独立して、0、1 または 2 であり、

R^4 および R^5 のそれぞれは独立して、-H、C₁~C₆アルキル、フェニル、-C(O)(C₁~C₆アルキル)、-C(O)(フェニル)、-C(O)O(C₁~C₆アルキル)、-C(O)O(フェニル)、-S(O)₂(C₁~C₆アルキル)または-S(O)₂(フェニル)であり、 R^4 および R^5 によって表される基中の各前記フェニルは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、およびC₁~C₆ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、 R^4 および R^5 によって表される基中の各前記アルキルは独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、およびフェニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

R^7 は-H、F、C₁ または メチルであり、

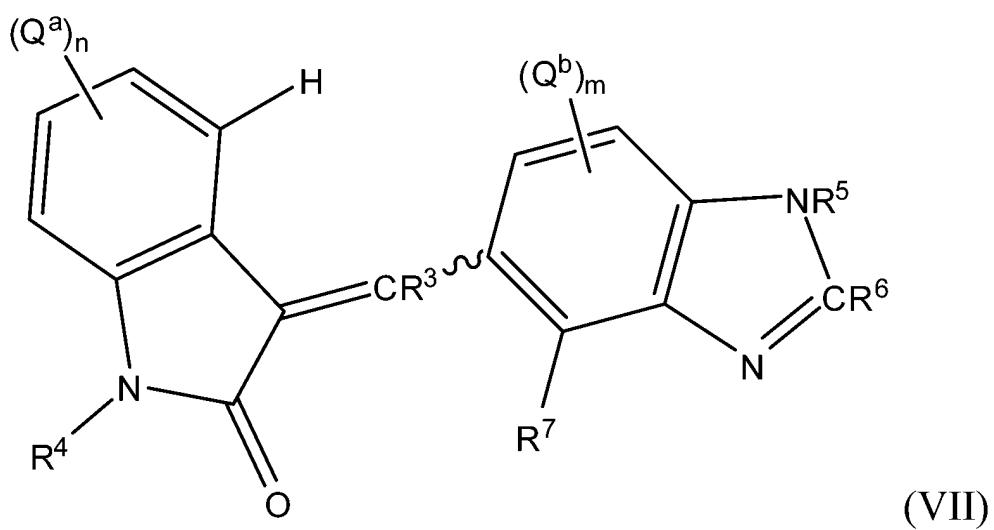
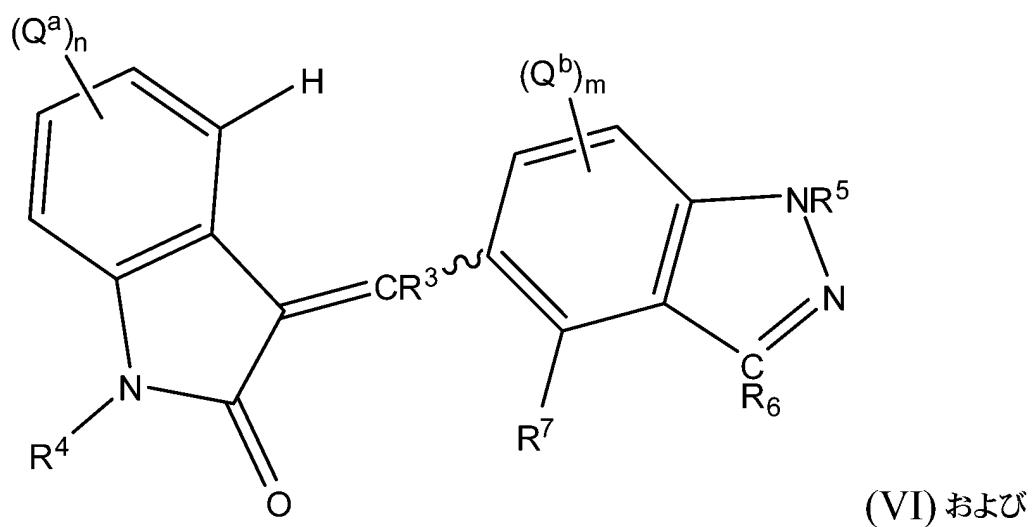
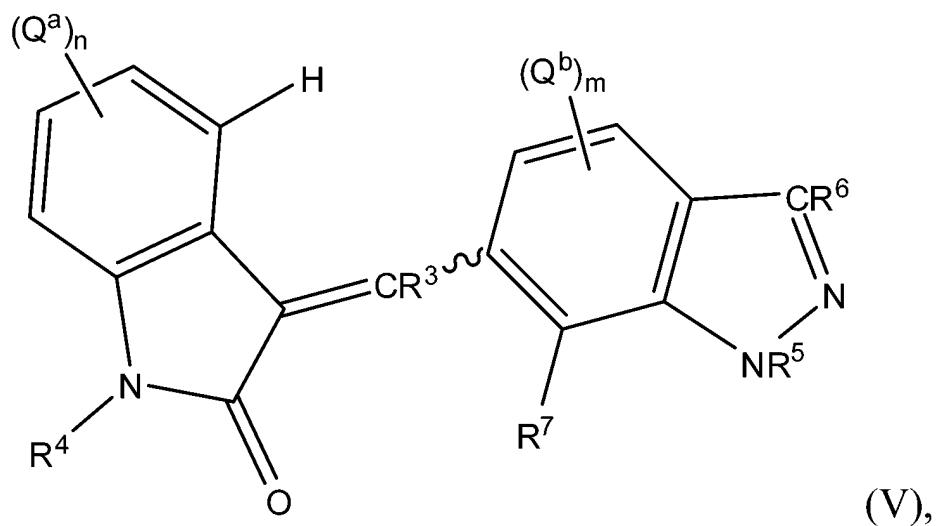
R および R' のそれぞれによって表される任意に置換される5~6員環ヘテロアリール基は、独立して、任意に置換されるフラニル基、任意に置換されるイミダゾリル基、任意に置換されるイソオキサゾリル基、任意に置換されるオキサジアゾリル基、任意に置換されるオキサゾリル基、任意に置換されるピラゾリル基、任意に置換されるピロリル基、任意に置換されるピリジル基、任意に置換されるピリミジニル基、任意に置換されるピリダジニル基、任意に置換されるチアゾリル基、任意に置換されるトリアゾリル基、任意に置換されるテトラゾリル基または任意に置換されるチエニル基であり、

R および R' のそれぞれによって表される基の置換基中の5~6員環ヘテロアリール基は独立して、フラニル基、イミダゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、オキサゾリル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、チアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基またはチエニル基である)によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

化合物が、

【化17】



(式中、

Q^a および Q^b の片方は、ハロゲン、-NO₂、-CN、Ak¹、Ar¹、(C_{1~10}アルキレン)-Ar¹、(C_{1~10}アルケニレン)-Ar¹または-X-R¹であり、 Q^a および Q^b の他方はハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、メチル、メトキシ、ハロメチルまたはハロメトキシであり、

各R⁶が独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、R'、-OR、-SRまたは-N(R)₂であり、

各Rが独立して、水素、任意に置換されるC_{1~6}アルキル、任意に置換されるC_{2~6}アルケニル、任意に置換されるフェニルまたは任意に置換される5~6員環ヘテロアリールであり、または

一緒に合わせたN(R)₂が、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、=O、C_{1~C3}アルキル、C_{1~C3}ハロアルキル、C_{1~C3}アルコキシ、C_{1~C3}ハロアルコキシ、およびアミノからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される非芳香族複素環式基であり、

各R'が独立して、任意に置換されるC_{1~6}アルキル、任意に置換されるC_{2~6}アルケニル、任意に置換されるフェニルまたは任意に置換される5~6員環ヘテロアリールである)から選択される構造式によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

R'が-CH₂- (任意に置換されるフェニル)、-CH₂ (任意に置換される5~6員環ヘテロアリール)、-CH₂-CH₂- (任意に置換されるフェニル)、-CH₂-CH₂- (任意に置換される5~6員環ヘテロアリール)、CH=CH- (任意に置換されるフェニル)または-CH=CH- (任意に置換される5~6員環ヘテロアリール)である、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

R'が-CH₂- (任意に置換されるフェニル)、-CH₂- (任意に置換されるピリジル)、-CH₂-CH₂- (任意に置換されるフェニル)、-CH₂-CH₂- (任意に置換されるピリジル)、CH=CH- (任意に置換されるフェニル)または-CH=CH- (任意に置換されるピリジル)であり、

R⁴およびR⁵のそれぞれが-H、C_{1~C6}アルキル、フェニル、-C(O)(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)(フェニル)、-C(O)O(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)O(フェニル)、-S(O)₂(C_{1~C6}アルキル)または-S(O)₂(フェニル)である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R⁶が任意に置換されるフェニル基、任意に置換されるピリジル基、任意に置換されるピロリル基、任意に置換されるピラゾリル基、任意に置換されるチアゾリル基、任意に置換されるピリミジニル基、または任意に置換されるチエニル基であり、

R⁶によって表される基が、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C_{1~C6}アルキル、C_{1~C6}ハロアルキル、C_{1~C6}アルコキシ、およびC_{1~C6}ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で独立して任意に置換される、請求項6に記載の化合物。

【請求項10】

各構造式(V)~(VII)のQ^aおよびQ^bの片方が独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、C_{1~C6}アルキル、C_{1~C6}ハロアルキル、-C(O)(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)NH₂、-C(O)NH(C_{1~C6}アルキル)、-C(O)N(C_{1~C6}アルキル)₂、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C_{1~C6}アルキル)、-SO₂N(C_{1~C6}アルキル)₂、-OH、-O(C_{1~C6}アルキル)、-O(C_{1~C6}ハロアルキル)、-SH、-S(C_{1~C6}アルキル)、-S(C_{1~C6}ハロアルキル)、-NH₂、-NH(C_{1~C6}アルキル)、-N(C_{1~C6}アルキル)₂、-NHC(O)(C_{1~C6}アルキル)、-NHC(O)O(C_{1~C6}アルキル)

)、-NHC(O)NH₂、-NHC(O)NH(C1～C6アルキル)、-NHC(O)N(C1～C6アルキル)₂、-NHC(O)ONH₂、-NHC(O)ONH(C1～C6アルキル)、-NHC(O)ON(C1～C6アルキル)₂、-NHSO₂NH₂、-NHSO₂NH(C1～C6アルキル)、-NHSO₂N(C1～C6アルキル)₂または-NHSO₂(C1～C6アルキル)であり、各構造式(V)～(VII)のQ^aおよびQ^bの他方が独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、メチル、メトキシ、ハロメチルまたはハロメトキシである、請求項6に記載の化合物。

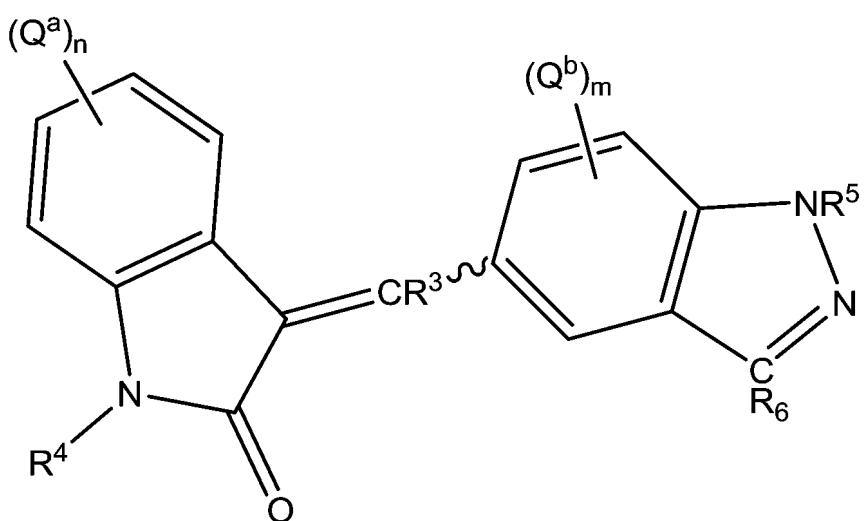
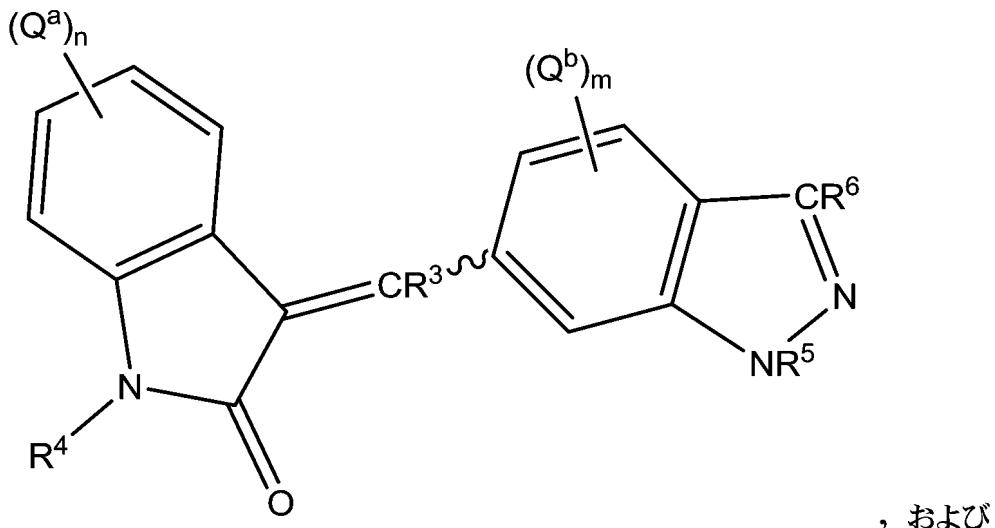
【請求項11】

各構造式(V)～(VII)のQ^aおよびQ^bの片方が独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、Ph、-CH₂Ph、-C(O)Ph、-C(O)NH(Ph)、-C(O)N(C1～C6アルキル)(Ph)、-SO₂NH(Ph)、-SO₂N(C1～C6アルキル)(Ph)、-O(Ph)、-S(Ph)、-NH(Ph)、-N(C1～C6アルキル)(Ph)、-NHC(O)(Ph)、-NHC(O)O(Ph)、-NHC(O)NH(Ph)、-NHC(O)N(C1～C6アルキル)(Ph)、-NHCO(NH)(Ph)、-NHC(O)ON(C1～C6アルキル)(Ph)、-NHSO₂NH(Ph)、-NHSO₂N(C1～C6アルキル)(Ph)または-NHSO₂(Ph)であり、各Phが、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C1～C3アルキル、C1～C3ハロアルキル、C1～C3アルコキシ、およびC1～C3ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で独立して任意に置換されるフェニル基であり、および各構造式(V)～(VII)のQ^aおよびQ^bの他方が独立して、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、メチル、メトキシ、ハロメチルまたはハロメトキシである、請求項6に記載の化合物。

【請求項12】

化合物が、

【化25】



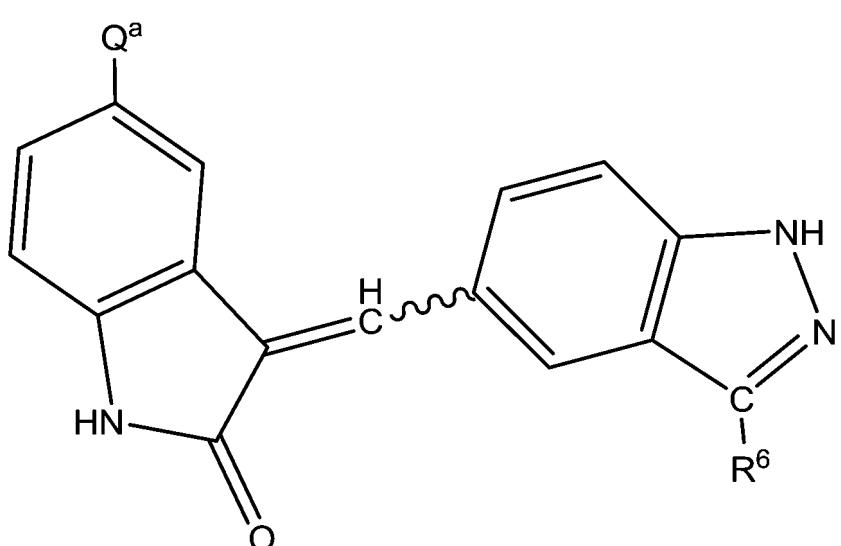
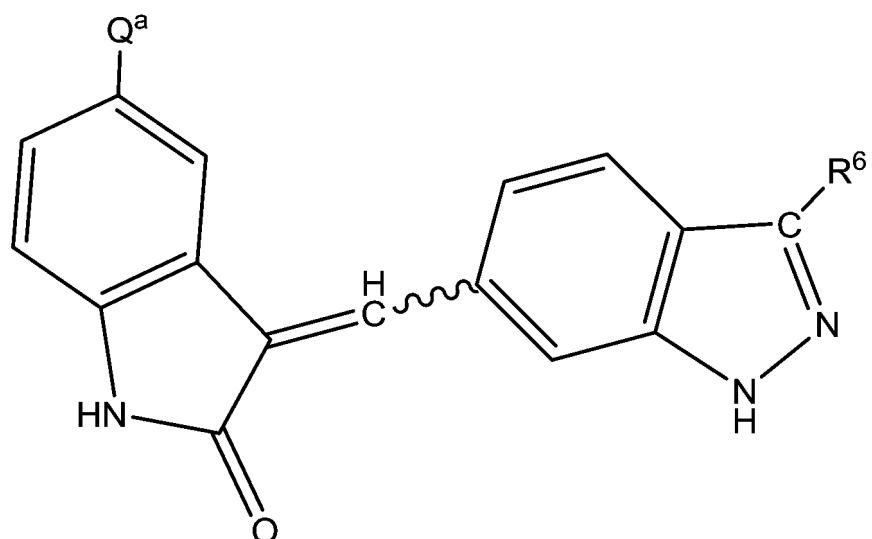
(式中、

R^6 は任意に置換されるフェニル、任意に置換される5～12員環ヘテロアリール、 $-CH_2-$ （任意に置換されるフェニル）、 $-CH_2-$ （任意に置換される5～12員環ヘテロアリール）、 $-CH_2-CH_2-$ （任意に置換されるフェニル）、 $-CH_2-CH_2-$ （任意に置換される5～12員環ヘテロアリール）、 $-CH=CH-$ （任意に置換されるフェニル）、 $-CH=CH-$ （任意に置換される5～12員環ヘテロアリール）、 $-CH=CH-C(O)O$ （任意に置換されるC_{1～6}アルキル）、または $-CH=CH-O-C(O)$ （任意に置換されるC_{1～6}アルキル）である）から選択される構造式によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

化合物が、

【化 3 0】



から選択される構造式によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項1 2に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R^6 によって表される基中の 5 ~ 12 員環ヘテロアリールが、ピリジル、チアゾリル、ピラジニル、チオフェニル、インドリル、キノリニル、ピロリル、ピラゾリル、およびピリミジニルからなる群から選択され、そのそれが任意に置換され、

Q^a および Q^b のそれが独立して、ハロゲン、シアノ、 $-NR^1R^2$ 、 $-NR^2C(O)R^1$ 、 $-C(O)OR^1$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $-C(O)NR^1R^2$ 、 $-NR^2C(O)OR^1$ 、 $-N(R^2)C(O)NR^1R^2$ 、 $-OR^1$ 、 $-SO_2NR^1R^2$ 、 $-NR^2SO_2R^1$ 、 $C_{1~6}$ アルキル、フェニルまたは 5 ~ 12 員環ヘテロアリールであり、 Q^a および Q^b によって表される $C_{1~6}$ アルキルが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-O(C_{1~6}$ アルキル)、 $-S(C_{1~6}$ アルキル)、 $C_{1~6}$ ハロアルコキシ、アミノ、 $C_{1~6}$ アルキルアミノ、 $C_{1~6}$ ジアルキルアミノ、 $C_{1~6}$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_{1~6}$ アルコキカルボニル、および $C_{1~6}$ アルキルカルボニルからなる群から選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換され、 Q^a および Q^b によ

って表されるフェニルまたは5～12員環ヘテロアリールが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C_{1～6}アルキル)、-S(C_{1～6}アルキル)、C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、(C_{1～6}ハロアルコキシ)C_{1～6}アルキル、C_{1～6}アルコキシ)C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ヒドロキシアルキル、(C_{1～6}アミノアルキル、(C_{1～6}アルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}ジアルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(フェニル)C_{1～6}アルキル、(5～6員環ヘテロアリール)C_{1～6}アルキル、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、C_{1～6}ハロアルコキシ、C_{1～6}アルキルカルボニルオキシ、C_{1～6}アルコキシカルボニル、およびC_{1～6}アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

R¹およびR²のそれぞれが独立して、-H-またはC_{1～6}アルキルであり、C_{1～6}アルキルが、ハロゲン、-OH、-SH、-O(C_{1～3}アルキル)、-S(C_{1～3}アルキル)、およびC_{1～6}ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

R⁶によって表される基中のフェニルまたは5～12員環ヘテロアリールが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C_{1～6}アルキル)、-S(C_{1～6}アルキル)、C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、(C_{1～6}ハロアルコキシ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}アルコキシ)C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ヒドロキシアルキル、C_{1～6}アミノアルキル、(C_{1～6}アルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}ジアルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(フェニル)C_{1～6}アルキル、(5～6員環ヘテロアリール)C_{1～6}アルキル、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、C_{1～6}ハロアルコキシ、C_{1～6}アルキルカルボニルオキシ、C_{1～6}アルコキシカルボニル、C_{1～6}アルキルカルボニル、-(CH₂)_{0～3}-N-ピペリジニル、-(CH₂)_{0～3}-N-モルホリニル、-(CH₂)_{0～3}-N-ピロリジニル、および-(CH₂)_{0～3}-N-(CH₂)_{0～3}-ピペラジニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

R⁶によって表される基中のC_{1～6}アルキルが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C_{1～6}アルキル)、-S(C_{1～6}アルキル)、C_{1～6}ハロアルコキシ、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、C_{1～6}アルキルカルボニルオキシ、C_{1～6}アルコキシカルボニル、およびC_{1～6}アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

R⁶によって表される基中のフェニルまたは5～12員環ヘテロアリールが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、-O(C_{1～6}アルキル)、-S(C_{1～6}アルキル)、C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、(C_{1～6}ハロアルコキシ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}アルコキシ)C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ヒドロキシアルキル、C_{1～6}アミノアルキル、(C_{1～6}アルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}ジアルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(フェニル)C_{1～6}アルキル、(5～6員環ヘテロアリール)C_{1～6}アルキル、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、C_{1～6}ハロアルコキシ、C_{1～6}アルキルカルボニルオキシ、C_{1～6}アルコキシカルボニル、およびC_{1～6}アルキルカルボニルからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

Q^aがハロゲン、シアノ、-NR¹R²、-NR²C(O)R¹、-C(O)OR¹、-OC(O)R¹、-N(R²)C(O)NR¹R²、-OR¹、C_{1～6}アルキルであり、C_{1～6}アルキルがハロゲン、-OH、-SH、-O(C_{1～6}アルキル)、-S(C_{1～6}アルキル)、およびC_{1～6}ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換され、

Q^bがハロゲン、C_{1～3}アルキル、C_{1～3}ハロアルキル、C_{1～3}アルコキシ、ま

たは C₁ ~ C₃ ハロアルコキシであり、

R⁶ によって表される基中のフェニル、5 ~ 12員環ヘテロアリール、および C₁ ~ C₆ アルキルが、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-O(C₁ ~ C₆ アルキル)、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、および C₁ ~ C₆ ハロアルコキシからなる群から選択される1つ以上の置換基で任意に置換される、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

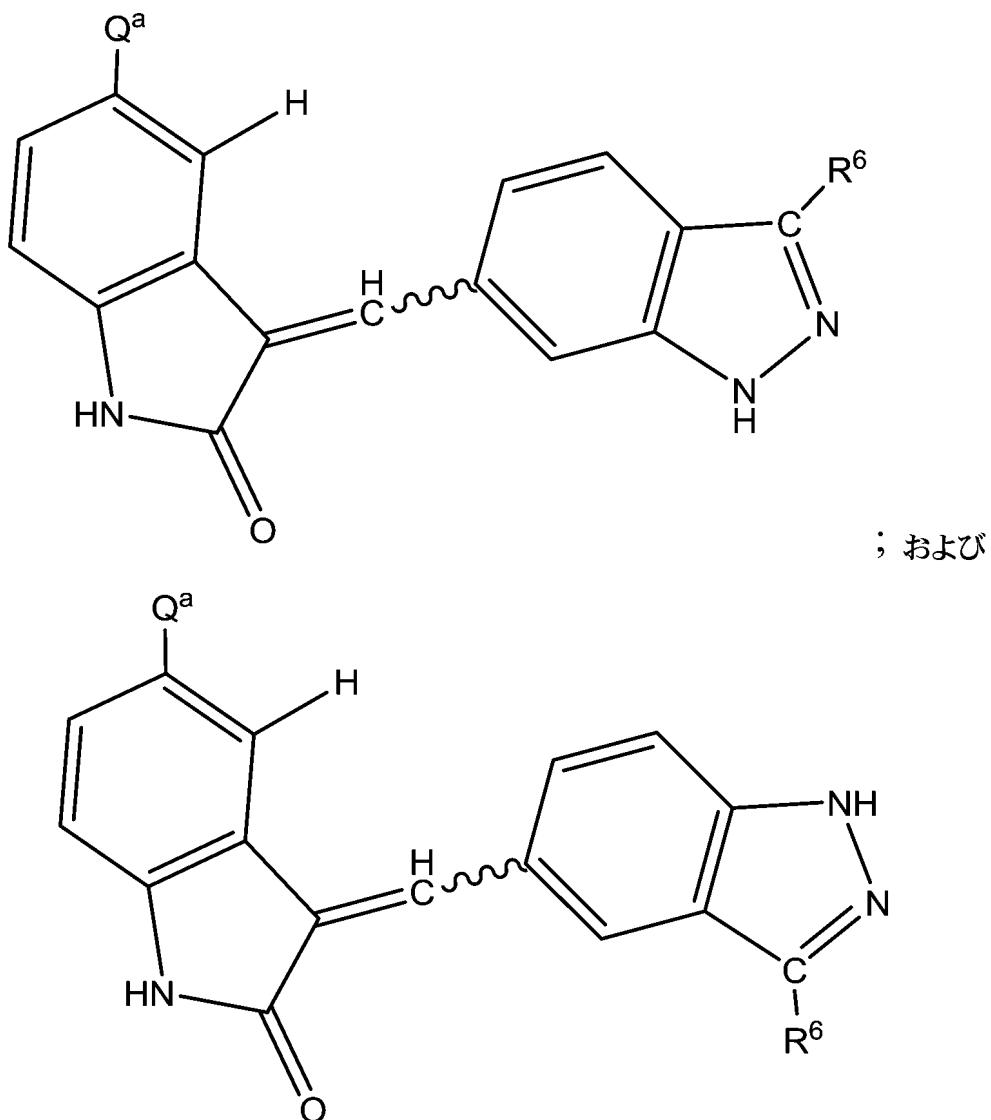
Q^a が -OH、C₁ ~ C₆ アルコキシまたは C₁ ~ C₆ ハロアルコキシであり、

R⁶ によって表される基中のフェニル、5 ~ 12員環ヘテロアリール、および C₁ ~ C₆ アルキルが、ハロゲン、メチル、メトキシ、およびトリフルオロメチルからなる群から独立して選択される1つ以上の置換基でそれぞれ任意に置換される、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

化合物が、

【化31】



(式中、

Q^a は -H、ハロゲン、-NH₂、(C₁ ~ C₆ アルキル)アミンまたは C₁ ~ C₆ アルコキシであり、

R^6 はフェニル、5～6員環ヘテロアリール、-CH=CH-（フェニル）、-CH=CH-（5～6員環ヘテロアリール）、-C-C-（フェニル）、-C-C-（5～6員環ヘテロアリール）であり、 R^6 によって表される基中の各フェニルおよびヘテロアリールは、ハロゲン、C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、C_{1～6}アミノアルキル、(C_{1～6}アルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}ジアルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(フェニル)C_{1～6}アルキル、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、-(CH₂)_{0～3}-N-ピペリジニル、-(CH₂)_{0～3}-N-モルホリニル、-(CH₂)_{0～3}-N-ピロリジニル、および-(CH₂)_{0～3}-N-ピペラジニルで任意に置換され、N-ピペラジニルはC_{1～6}アルキルまたはC_{1～6}アシルで任意にN'置換される）から選択される構造式によって表され、または薬学的に許容できるその塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

R^6 によって表される基中の各ヘテロアリールが、ピリジニル、ピリミジニルまたはピラジニルであり、それぞれがハロゲン、C_{1～6}アルキル、C_{1～6}ハロアルキル、C_{1～6}アミノアルキル、(C_{1～6}アルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(C_{1～6}ジアルキルアミノ)C_{1～6}アルキル、(フェニル)C_{1～6}アルキル、アミノ、C_{1～6}アルキルアミノ、C_{1～6}ジアルキルアミノ、N-ピペリジニル、N-モルホリニル、N-ピロリジニル、およびN-ピペラジニルで任意に置換され、N-ピペラジニルがC_{1～6}アルキルまたはC_{1～6}アシルで任意にN'で置換される、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

薬学的に許容できるキャリア、および請求項1～19のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩を含んでなる、医薬組成物。

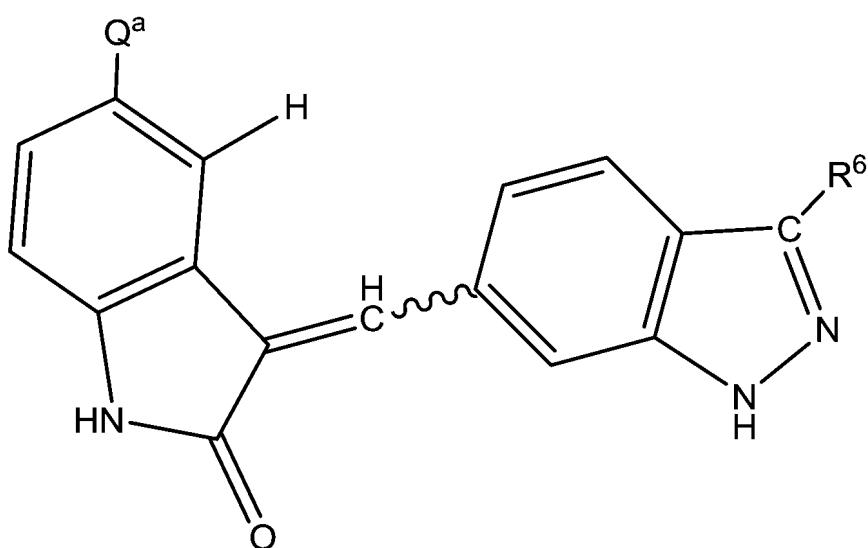
【請求項21】

E異性体である、請求項1の化合物。

【請求項22】

化合物が、構造式、

【化32】



によって表わされる、請求項18に記載の化合物。

【請求項23】

それを必要とする被験者の癌の治療のための、請求項1～19、21及び22のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項24】

癌が、肺癌、乳癌、大腸癌、脳癌、前立腺癌、メラノーマ、多形膠芽腫、卵巣癌、胚細胞腫、神経膠腫、および中皮腫からなる群から選択される、それを必要とする被験者の癌

の治療のための、請求項 1 ~ 19、21 及び 22 のいずれか一項に記載の化合物の使用。