

【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3年11月11日(2021.11.11)

【公表番号】特表2021-521120(P2021-521120A)

【公表日】令和3年8月26日(2021.8.26)

【年通号数】公開・登録公報2021-039

【出願番号】特願2020-555100(P2020-555100)

【国際特許分類】

C 0 7 D	487/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	33/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	33/12	(2006.01)
A 6 1 P	33/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/02	(2006.01)
A 6 1 P	33/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	33/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/20	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 27/16 (2006.01)
 A 6 1 P 17/10 (2006.01)
 A 6 1 P 7/10 (2006.01)
 A 6 1 P 11/04 (2006.01)
 A 6 1 P 31/06 (2006.01)
 A 6 1 P 31/08 (2006.01)
 A 6 1 P 31/22 (2006.01)
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)
 A 6 1 P 39/02 (2006.01)
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)
 A 6 1 P 21/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/53 (2006.01)
 A 6 1 P 7/02 (2006.01)
 A 6 1 P 19/10 (2006.01)
 A 6 1 P 17/02 (2006.01)
 A 6 1 P 27/06 (2006.01)
 C 0 7 D 519/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/538 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 1
 C 0 7 D 487/04 C S P
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 35/04
 A 6 1 P 33/14
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 33/12
 A 6 1 P 33/04
 A 6 1 P 29/02
 A 6 1 P 33/06
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 1/12
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 31/16
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 31/14
 A 6 1 P 31/20
 A 6 1 P 11/06

A 6 1 P	11/14	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	17/10	
A 6 1 P	7/10	
A 6 1 P	11/04	
A 6 1 P	31/06	
A 6 1 P	31/08	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 K	31/53	
A 6 1 P	7/02	
C 0 7 D	487/04	1 4 2
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	27/06	
C 0 7 D	519/00	3 1 1
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/538	

【手続補正書】

【提出日】 令和3年9月30日 (2021.9.30)

【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

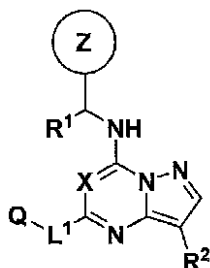
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I

【化 7 9】



式 I

を有する化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩であって、式中、

Xは、各存在において独立して、CHおよびNから選択され；

L¹は、存在しないか、または独立して、各存在において、-NH-、-NH(CH₂)-、-NH(C=O)-、-NHSO₂-、-O-、-O(CH₂)-、-(C=O)-、-(C=O)NH-、および-(C=O)(CH₂)-からなる群から選択され；

Qは、各存在において独立して、C3～C8シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、およびC1～C6アルキルからなる群から選択され、ここで、C1～C6アルキルは、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルのうちの1つまたは2つで置換されており、

C3～C8シクロアルキルは、R³およびR⁴および-(C=O)R⁵のうちの1つまたは2つで置換され得、

ヘテロシクリルは、R³およびR⁴および-(C=O)R⁵のうちの1つまたは2つで置換され得、

C1～C6アルキル、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、-(C=O)R⁵、ハロゲン、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルのうちの1つまたは2つで置換されたアリールまたはヘテロアリール；

R¹は、各存在において、水素およびメチルからなる群から独立して選択され；

R²は、各存在において、ハロゲン、C1～C6アルキル、C3～C10シクロアルキル、-CN、-(C=O)CH₃、-NR⁹R¹²、およびC1～C3ハロアルキル〔これらのいずれも必要に応じて置換される〕からなる群から独立して選択され；

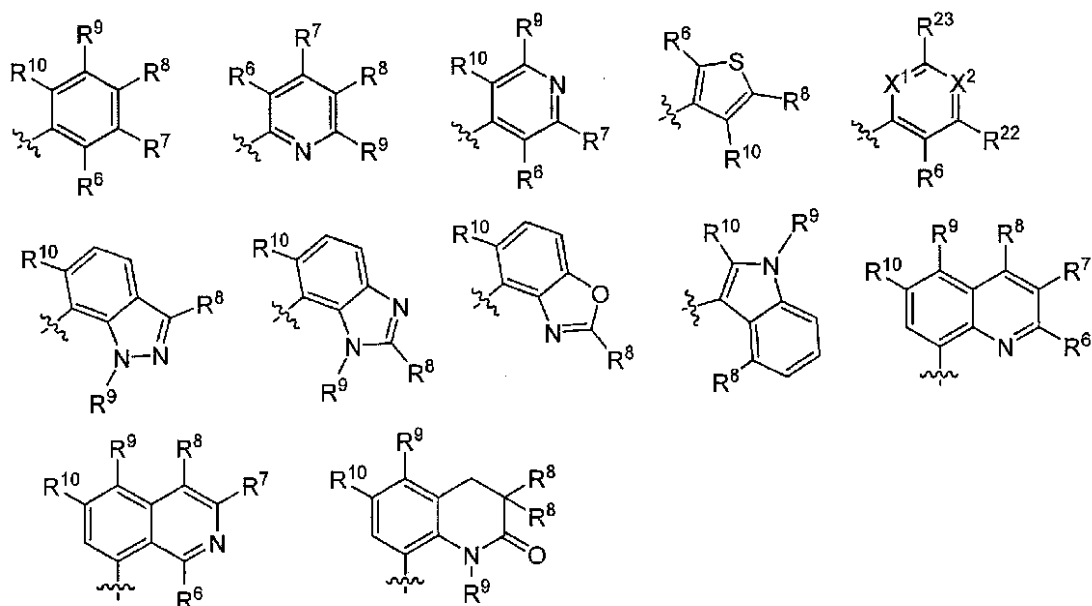
R³は独立して、各存在において、水素、-OR⁵、ハロゲン、-N(R⁵)R⁵、-NR⁹R¹²、-NH(C=O)R⁵、-(C=O)NH₂、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルからなる群から選択され；

R⁴は、独立して、各存在において、水素、ハロゲン、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、(=O)、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルからなる群から選択され；

R⁵は、各存在において、水素、C1～C6アルキル、C3～C8シクロアルキル、C1～C3ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル；ハロゲン、-OR¹¹、-N(R¹¹)R¹¹、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロアリール；ハロゲン、-OR¹¹、-N(R¹¹)R¹¹、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロシクリルからなる群から独立して選択され；

Zは、以下のA群：

【化 80】



A 群

の任意の構造であり；

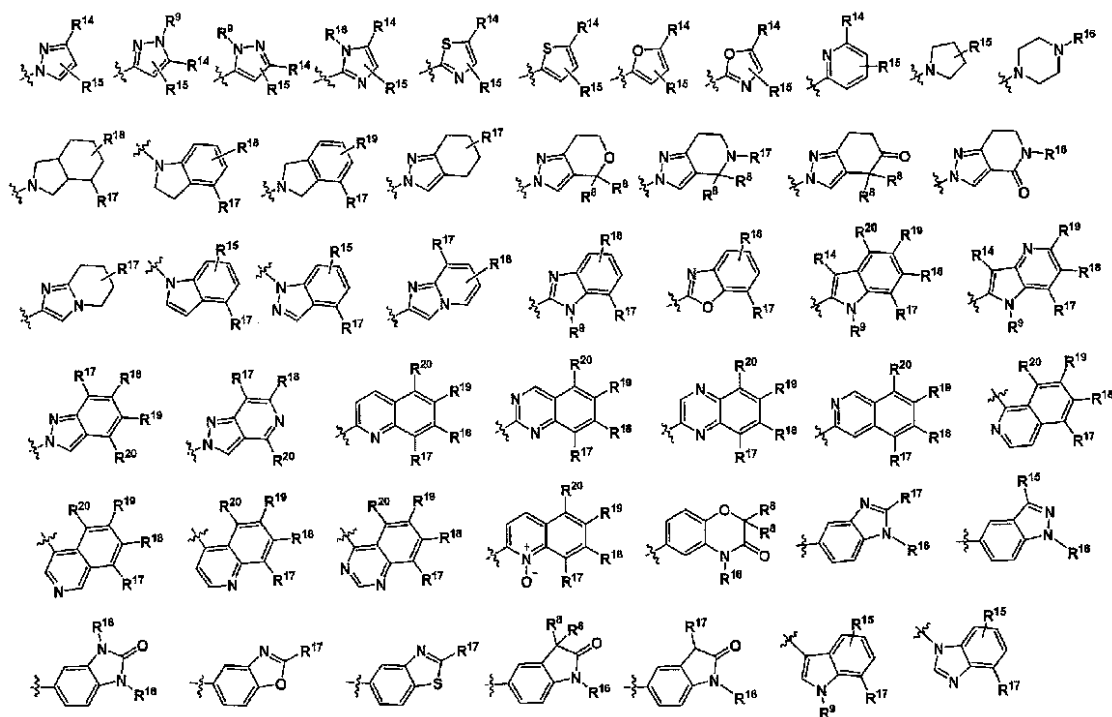
式中、

X^1 は、各存在において独立して、 $CR^{2,4}$ および N から選択され；

X^2 は、各存在において独立して、 $CR^{2,5}$ および N から選択され；

R^6 は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OH$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 $-(C=O)NHR^{1,1}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-NH(C=O)NHR^{1,1}$ 、 $-N(CH_3)(C=O)CH_3$ 、 $-NH(C=O)R^{1,2}$ 、 $-NR^9R^{1,2}$ 、 $-OR^{1,2}$ 、および以下の B 群；

【化 8 1】

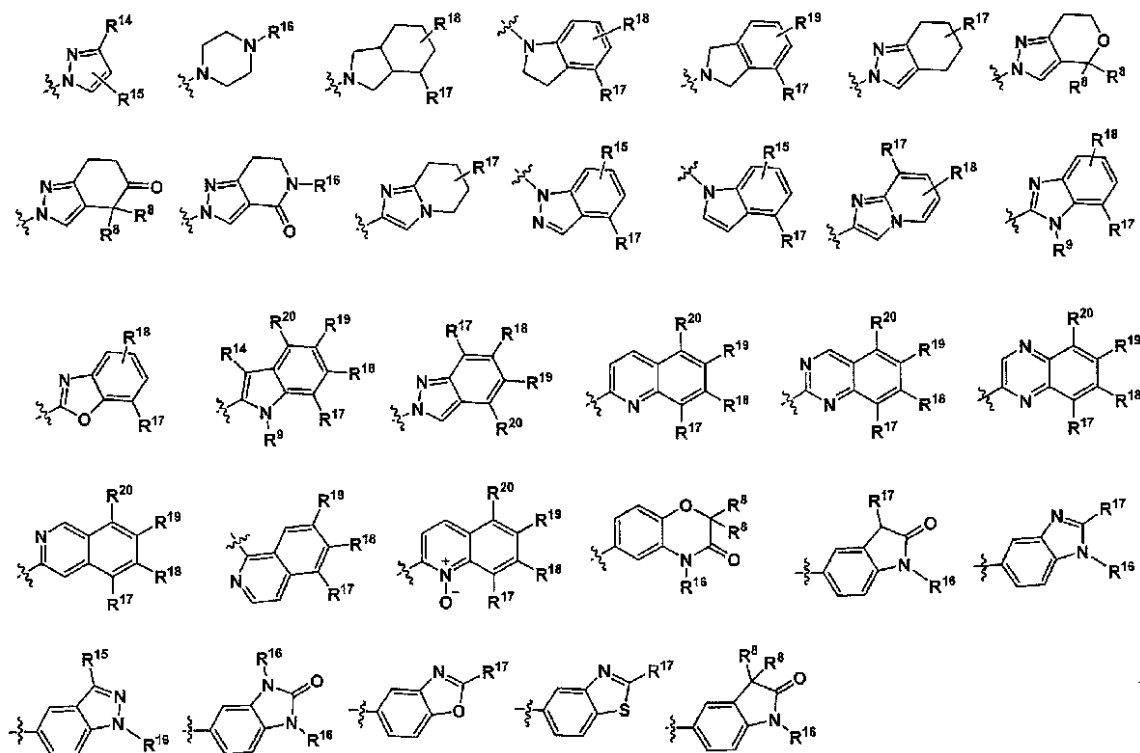


B 群

の任意の構造からなる群から独立して選択され；

R^7 は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-NH(C=O)R^{12}$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、および以下の C 群：

【化 8 2】



C 群

の任意の構造からなる群から独立して選択され；

R^8 および R^{10} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^9 は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、および $-OH$ または OR^5 で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{11} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C3 \sim C10$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

R^{12} は、各存在において、存在しないか、または独立して、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C6 \sim C10$ アリール、フェニル、ベンジル、 $C3 \sim C9$ ヘテロアリール、 $C3 \sim C6$ ヘテロシクリル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換されたベンジル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C9$ ヘテロアリール、 $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C6$ ヘテロシクリル、ならびに1～4つのハロゲンおよび／または1～4つの $-NH(C=O)R^{13}$ で置換された $C6 \sim C10$ アリールからなる群から選択され；

R^{13} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル； $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル；および $C3 \sim C10$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

R^{14} および R^{15} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OH$ または NH_2 で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-C(R^9)(R^{11})OR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{21}$ 、 $-NR^9R^{21}$ 、 $-OR^{21}$ 、 $-OC(R^9)(R^{11})(R^{21})$ 、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 R^4 で置換された $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C10$ ヘテロアリール、 $C6 \sim C10$ アリール [例えば、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、または $-S(=O)_2NHR^{21}$ で置換されたフェニルおよびアリール] からなる群から独立して選択され；

R^{16} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-(C=O)R^{13}$ 、および $-OR^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、および R^{20} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $C6 \sim C10$ アリール [例えば、フェニル]、 $-CN$ 、 $-CHCF_3NR^9R^{11}$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{21}$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHR^5$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-(C=O)NHR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{21} は、各存在において、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル； $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル；ハロゲンまたは $C1 \sim C3$ ハロアルキルで置換されたアリール、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C10$ ヘテロアリール、

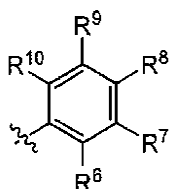
および R^4 で置換された C 3 ~ C 10 ヘテロシクリルからなる群から独立して選択され；

R^{22} および R^{23} は、各存在において、水素、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 3 ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された C 1 ~ C 6 アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{24} および R^{25} は、各存在において、水素、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 3 ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、または $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された C 1 ~ C 6 アルキルからなる群から独立して選択され；

但し、Z が

【化 8 3】



である場合、 R^6 および R^7 のうちの 1 つは H ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 が H であり、 R^5 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は 1 H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は、 CH_3 でも、Cl でも、1 H-ピラゾールでもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は、フェニルでも、 $CH(CH_3)_2$ でも、 CH_2CH_3 でも、 CH_3 でもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が Cl である場合、 R^6 は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8

がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がClである場合、 R^6 は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 がFであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、かつ R^9 がHである場合、 R^{10} はFではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がFである場合、 R^6 はFではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が1H-ピラゾールであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^3 はHではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく、

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は $CH(CH_3)_2$ ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたC3~C8シクロアルキルであり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がNHであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がNHであり、QがR

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が

N (R⁵) R⁵であり、R⁴がHであり、R⁵がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、R⁶がOR^{1 2}であり、R⁷がHであり、R⁸がHであり、R⁹がHであり、かつR^{1 0}がHである場合、R^{1 2}はCH₃ではなく；

ここで、R¹がCH₃であり、R²がCH (CH₃)₂であり、L¹がNHであり、QがR³およびR⁴で置換されたC3～C8シクロアルキルであり、R³がN (R⁵) R⁵であり、R⁴がHであり、R⁵がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、R⁶がHであり、R⁷がOR^{1 2}であり、R⁸がHであり、R⁹がHであり、かつR^{1 0}がHである場合、R^{1 2}はCH₃ではなく；

ここで、R¹がCH₃であり、R²がCH (CH₃)₂であり、L¹が— (C=O) —であり、QがR³およびR⁴で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、R³がHであり、R⁴がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、R⁶がHであり、R⁷がOR^{1 2}であり、R⁸がHであり、R⁹がHであり、かつR^{1 0}がHである場合、R^{1 2}はCH₃ではなく；

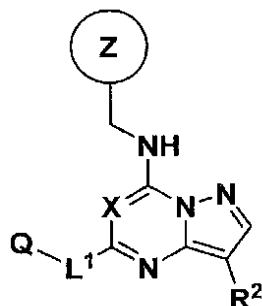
ここで、R¹がCH₃であり、R²がCH (CH₃)₂であり、L¹が— (C=O) —であり、QがR³およびR⁴で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、R³がN (R⁵) R⁵であり、R⁴がHであり、R⁵がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、R⁶がHであり、R⁷がOR^{1 2}であり、R⁸がHであり、R⁹がHであり、かつR^{1 0}がHである場合、R^{1 2}はCH₃ではない；

化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項2】

R¹は水素であり、前記化合物は、一般式 I I

【化84】



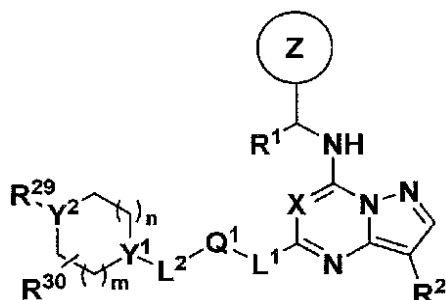
式 II

を有し、式中、X、Q、L¹、R²、およびZは、請求項1に定義の通りである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

一般式 I I I

【化85】



式 III

を有し、式中、 X 、 L^1 、 R^1 、 R^2 、および Z は、請求項1に定義の通りであり、

Q^1 は、存在しないか、または独立して、各存在において、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル； $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、およびハロゲンのうちの1つまたは2つで置換されたアリーール； $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、およびハロゲンのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロアリーール；ならびに R^{29} および R^{30} のうちの1つまたは2つで置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^{29} は、存在しないか、または独立して、各存在において、水素、 $-OR^5$ 、ハロゲン、 $-N(R^5)R^5$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

R^{30} は、独立して、各存在において、水素、ハロゲン、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、 $(=O)$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

ここで、 R^5 、 R^9 、および R^{12} は、請求項1に定義の通りであり；

L^2 は、存在しないか、または独立して、各存在において、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-(C=O)-$ 、および $-(C=O)NH-$ からなる群から選択され；

Y^1 は、各存在において独立して、 CH 、 $C(OH)$ 、および N から選択され；

Y^2 は、各存在において独立して、 CH 、 CR^{30} 、 O 、および N から選択され；

m は、各存在において独立して、 0 、 1 、および 2 から選択され；

n は、各存在において独立して、 0 および 1 から選択され；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は $1H$ -ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が CH_3 であり、 R^{30} が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は、 CH_3 でも、 Cl でも、 $1H$ -ピラゾールでもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が CH_3 であり、 R^{30} が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は、フェニルでも、 $CH(CH_3)_2$ でも、 CH_2CH_3 でも、 CH_3 でもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が CH_3 であり、 R^{30} が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が CH_3 であり、 R^{30} が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が Cl である場合、 R^6 は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 で

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 がCHであり、 Y^2 がCHであり、 m が1であり、 n が1

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 がCHであり、 Y^2 がNであり、 m が2であり、 n が

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が NH であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が CH であり、 m が1であり、

n が 1 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が N であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が H であり、 R^{30} が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、 m が 1 であり、 n が 1 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

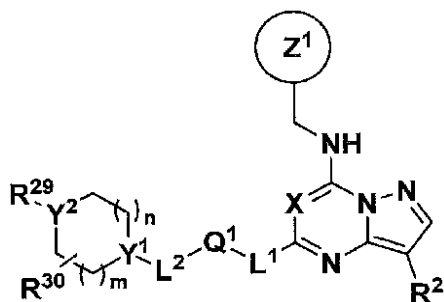
ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、 m が 2 であり、 n が 0 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではない；

請求項 1 のいずれかに記載の化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 4】

一般式 I V

【化 8 6】



式 IV

を有し、式中、 X 、 L^1 、および R^2 は、請求項 1 に定義の通りであり；

ここで、 m 、 n 、 Y^1 、 Y^2 、 L^2 、 R^{29} 、 R^{30} 、および Q^1 は、請求項 3 に定義の通りであり；

ここで、 Z^1 は、以下の D 群：

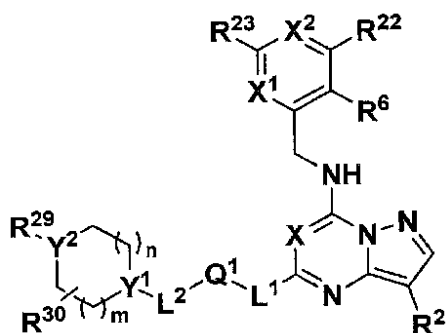
Chemical structures 1-6 are shown below:

- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted benzene.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted pyridine.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted pyridine (isomer of 2).
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted indole.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted indole (isomer of 4).
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted naphthalene.

の任意の構造であり；

【請求項 5】

【化 8 8】



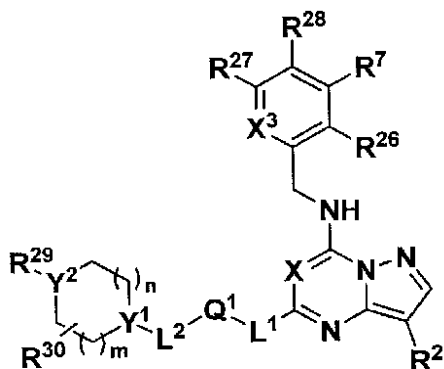
式 V

ここで、 m 、 n 、 Y^1 、 Y^2 、 L^2 、 $R^{2,9}$ 、 $R^{3,0}$ 、および Q^1 は、請求項3に定義の通りである、請求項1～4のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

一般式 V I

【化 8 9】



式 VI

を有し、式中、X、 L^1 、および R^2 は、請求項1に定義の通りであり；

ここで、m、n、 Y^1 、 Y^2 、 L^2 、 R^{29} 、 R^{30} 、および Q^1 は、請求項3に定義の通りであり；

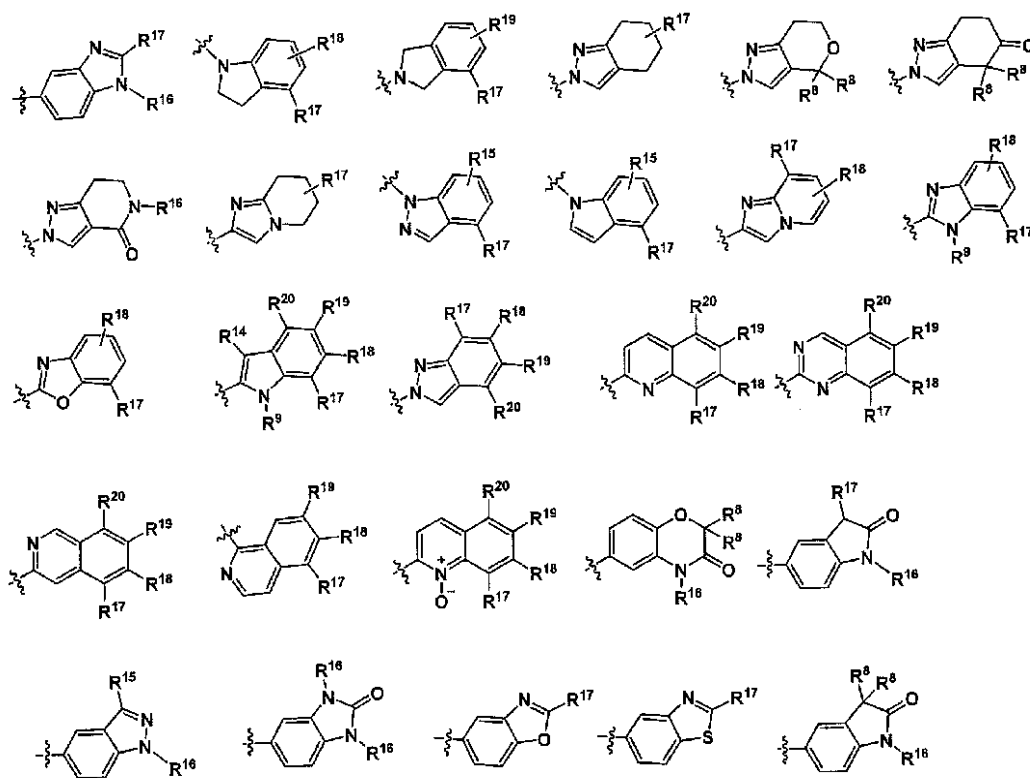
X^3 は、各存在において独立して、 CR^{10} およびNから選択され；

R^{26} 、 R^{27} 、および R^{28} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1\sim C6$ アルキル、 $C1\sim C3$ ハロアルキル、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された $C1\sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^5 、 R^9 、および R^{10} は、請求項1に定義の通りであり；

R^7 は、以下のE群：

【化 9 0】

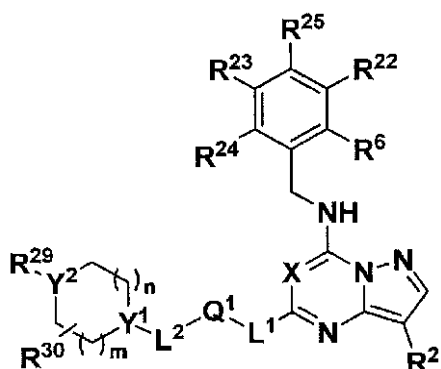


E 群

の任意の構造であり；

式中、 R^8 および $R^{14}\sim R^{20}$ は、請求項1に定義の通りである、請求項1～4のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】
 一般式 V I I
 【化 9 1】

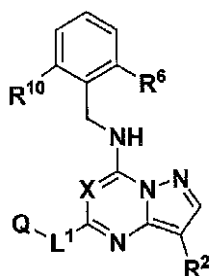


式 VII

を有し、式中、X、L¹、R²、R⁶、R²²、R²³、R²⁴、およびR²⁵は、請求項 1 に定義の通りであり；

m、n、Y¹、Y²、L²、R²⁹、R³⁰、およびQ¹は、請求項 3 に定義の通りである、請求項 1～5 のいずれかに記載の化合物。

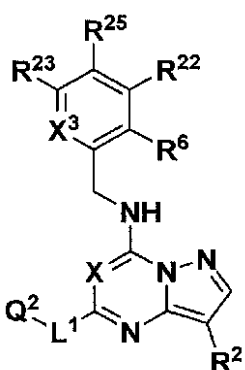
【請求項 8】
 一般式 V I I I
 【化 9 2】



式 VIII

を有し、式中、X、L¹、R²、R⁶、およびR¹⁰は、請求項 1 に定義の通りである、請求項 1 および 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】
 一般式 I X
 【化 9 3】

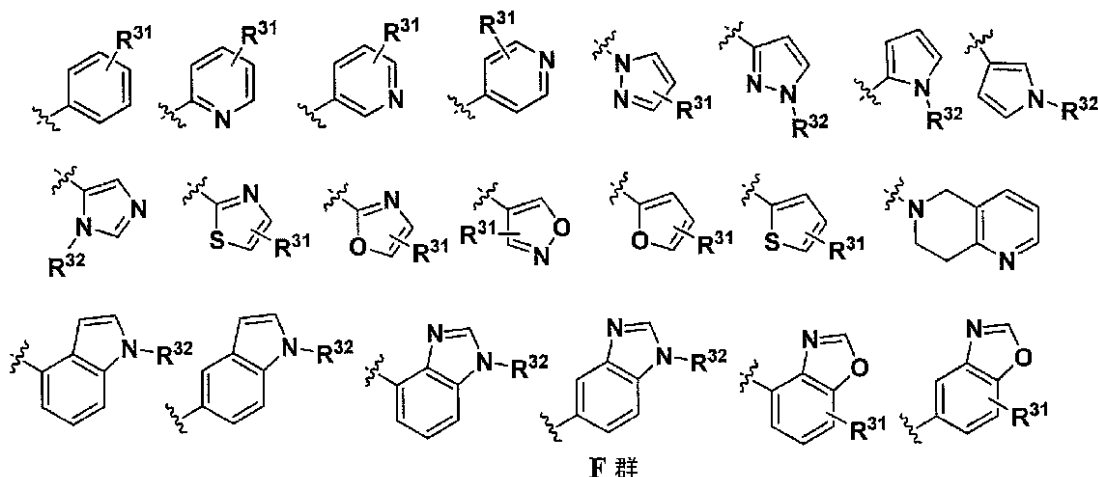


式 IX

を有し、式中、 L^1 、 R^2 、 R^6 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、および R^{25} は、請求項1に定義の通りであり、 X^3 は、請求項6に定義の通りであり；

ここで、 Q^2 は、以下のF群：

【化94】



の任意の構造であり；

R^{31} および R^{32} は、存在しないか、または独立して、各存在において、水素、 $-OR^5$ 、ハロゲン、 $-N(R^5)R^5$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C1\sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1\sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

ここで、 R^5 、 R^9 、および R^{12} は、請求項1に定義の通りである、請求項1～5のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】

表11中に定義の構造1～279から選択される構造を有する、前記請求項のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

活性成分としての請求項1～10のいずれかに記載の化合物を、少なくとも1つの薬学的に許容され得るキャリア、賦形剤、および／または希釈剤と共に含む薬学的組成物。

【請求項12】

薬学的に活性な剤が、好ましくは、サイクリン依存性キナーゼ7 (CDK7) に対する阻害活性を有する、薬学的に活性な剤としての使用のための、請求項1～10のいずれかに記載の化合物を含む組成物。

【請求項13】

1種または数種のサイクリン依存性キナーゼ (CDK)、特に、サイクリン依存性キナーゼ7 (CDK7) の異所の活性および／または過剰発現によるアポトーシスの阻害、異常な転写活性、および／または細胞周期停止に関連する疾患であって、前記疾患が、増殖性疾患、日和見疾患が含まれる感染性疾患、免疫学的疾患、自己免疫疾患、および炎症性疾患から選択される、疾患を予防および／または処置する方法における使用のための、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物を含む組成物。

【請求項14】

前記増殖性疾患が、がん、好ましくは、腺癌、脈絡膜黒色腫、急性白血病、聴神経鞘腫、膨大部癌、肛門癌、星状細胞腫、基底細胞癌、膵臓がん、デスモイド腫瘍、膀胱がん、気管支癌、エストロゲン依存性および非依存性の乳がん、パーキットリンパ腫、体がん、原発不明癌腫 (CUP症候群)、結腸直腸がん、小腸がん、小腸腫瘍、卵巣がん、子宮内膜癌、上衣腫、上皮がん型、ユーイング腫瘍、消化管腫瘍、胃のがん (gastric cancer)、胆嚢がん、胆嚢癌、子宮がん、子宮頸がん、頸部、膠芽細胞腫、婦人科

腫瘍、耳鼻咽喉科腫瘍、血液学的腫瘍、毛様細胞白血病、尿道がん、皮膚がん、皮膚精巣がん、脳腫瘍（神経膠腫）、脳転移、睾丸がん、下垂体腫瘍、カルチノイド、カボジ肉腫、喉頭がん、胚細胞腫瘍、骨がん、結腸直腸癌、頭頸部腫瘍（耳、鼻、および咽頭領域の腫瘍）、結腸癌、頭蓋咽頭腫、口腔がん（oral cancer）（口腔内および唇上のがん）、中枢神経系のがん、肝臓がん、肝転移、白血病、眼瞼腫瘍、肺がん、リンパ腫、胃がん（stomach cancer）、悪性黒色腫、悪性新形成、消化管の悪性腫瘍、乳癌、直腸がん、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、ホジキン／非ホジキンリンパ腫、菌状息肉腫、鼻腔がん、神経鞘腫、神経芽細胞腫、腎臓がん、腎細胞癌、乏突起膠腫、食道癌、溶骨性癌および骨形成性癌、骨肉腫、卵巣癌、膀胱癌、陰茎がん、プラズマ細胞腫、前立腺がん、咽頭がん、直腸癌、網膜芽細胞腫、膣がん、甲状腺癌、食道がん、T細胞リンパ腫、胸腺腫、管癌、眼腫瘍、尿道がん、泌尿器腫瘍、尿路上皮癌、外陰がん、疣贅出現、軟部組織腫瘍、軟部組織肉腫、腎芽腫、子宮頸癌、舌がん、浸潤性腺管癌腫、浸潤性小葉癌、腺管上皮内癌、上皮内小葉癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、気管支腺腫、胸膜肺芽腫、中皮腫、脳幹部神経膠腫、視床下部神経膠腫、小脳星状細胞腫、大脳星状細胞腫、神経外胚葉性腫瘍、松果体部腫瘍、子宮の肉腫、唾液腺がん、肛門腺腺癌、肥満細胞腫瘍、骨盤腫瘍、尿管腫瘍、遺伝性乳頭状腎がん、散発性乳頭状腎がん、眼内黒色腫、肝細胞癌、胆管癌、混合型肝細胞胆管癌、扁平上皮癌、悪性黒色腫、メルケル細胞皮膚がん、非黒色腫皮膚がん、下咽頭がん、上咽頭がん、中咽頭がん、口腔のがん（oral cavity cancer）、扁平上皮がん、口腔黒色腫、AIDS関連リンパ腫、皮膚T細胞リンパ腫、中枢神経系のリンパ腫、悪性線維性組織球腫、リンパ肉腫、横紋筋肉腫、悪性組織球増殖症、線維芽細胞性肉腫、血管肉腫、血管周囲細胞腫、平滑筋肉腫（LMS）、イヌ乳房癌腫、およびネコ乳房癌腫を含むか、これらからなる群から選択されるがんである、請求項13に記載の使用のための組成物。

【請求項15】

前記日和見疾患が含まれる感染性疾患が、AIDS、アデノウイルス感染、多包虫症（AHD）、アメーバ症、広東住血線虫症、アニサキス症、炭疽、バベシア症、バランチジウム症、バイリスアスカリス感染、ビルハルツ（住血吸虫症）、ブラストシスチスホミニス（*Blastocystis hominis*）感染、ライムボレリア症、ポツリヌス中毒、ブレーナード下痢、ブルセラ症、ウシ海綿状脳症（BSE）、カンジダ症、毛頭虫症、慢性疲労症候群（CFS）、シャーガス病、水疱、クラミジアニューモニエ（*Chlamydia pneumoniae*）感染、コレラ、慢性疲労症候群、クロイツフェルト・ヤコブ病（CJD）、肝吸虫症、皮膚幼虫移行症（CLM）、コクシジオイデス症、結膜炎、コクサッキーウイルスA16（Coxsackievirus A16）、クリプトコッカス疾患、クリプトスポリジウム症、ウエストナイル熱、サイクロスポラ症、神経囊虫症、サイトメガロウイルス感染、デング熱、瓜実条虫（*Dipylidium caninum*）感染、エボラ出血熱（EHF）、多包性エキノコックス症（AE）、脳炎、大腸アメーバ（*Entamoeba coli*）感染、エントアメーバ・ディスパー（*Entamoeba dispar*）感染、ハルトマンアメーバ（*Entamoeba hartmanni*）感染、エントアメーバポレッキ（*Entamoeba polecki*）感染、蟯虫感染、エンテロウイルス感染（ポリオ／非ポリオ）、エプスタイン・バーウイルス感染、大腸菌感染、食物媒介感染、口蹄疫、真菌性皮膚炎、真菌感染、胃腸炎、A群レンサ球菌疾患、B群レンサ球菌疾患、ハンセン病（癩病）、ハンタウイルス肺症候群、アタマジラミ外寄生（シラミ寄生症）、ヘリコバクターピロリ感染、血液疾患、ヘンドラウイルス感染、肝炎（HCV、HBV）、带状疱疹（带状疱疹ヘルペス）、HIV感染、ヒトエールリヒア症、ヒトパラインフルエンザウイルス感染、インフルエンザ、イソスポーラ症、ラッサ熱、リーシュマニア症、内蔵リーシュマニア症（VL）、マラリア、マールブルグ出血熱、麻疹、髄膜炎、マイコバクテリウム・アビウム複合体（MAC）感染、ネグレリア感染、院内感染、非病原性腸アメーバ感染、オンコセルカ症、オピストルキス症、パピローマウイルス感染、パルボウイルス感染、ペスト、ニューモシスチス肺炎（PCP）、ポリオーマウイルス感染、Q熱、狂犬病、呼吸器合胞体ウイルス（RSV）感染、リウマチ熱、リフトバ

レー熱、ロタウイルス感染、回虫感染、サルモネラ症、疥癬、細菌性赤痢、帯状ヘルペス、眠り病、天然痘、レンサ球菌感染、条虫感染、破傷風、中毒性ショック症候群、結核、十二指腸、腸炎ビブリオ (*Vibrio parahaemolyticus*) 感染、ビブリオ敗血、ウイルス性出血熱、疣贅、水系感染性疾患、水痘帯状疱疹ウイルス感染、百日咳、および黄熱病を含むか、これらからなる群から選択される、請求項 13 に記載の使用のための組成物。

【請求項 16】

前記免疫学的疾患および／または自己免疫疾患が、喘息、糖尿病、リウマチ性疾患、AIDS、移植した臓器および組織の拒絶、鼻炎、慢性閉塞性肺疾患、骨粗鬆症、潰瘍性大腸炎、副鼻腔炎、エリテマトーデス、反復性感染、アトピー性皮膚炎／湿疹および職業性アレルギー、食物アレルギー、薬物アレルギー、重症アナフィラキシー反応、アナフィラキシー、アレルギー疾患の発現、原発性免疫不全、抗体欠損状態、細胞媒介免疫不全、重症複合型免疫不全、ディジョージ症候群、高IgE症候群(HIES)、ヴィスコット・オールドリッチ症候群(WAS)、毛細管拡張性失調症、免疫介在性のがん、白血球欠損、自己免疫疾患、全身性エリテマトーデス(SLE)、関節リウマチ(RA)、多発性硬化症(MS)、免疫介在性または1型の真性糖尿病、免疫介在性糸球体腎炎、強皮症、悪性貧血、脱毛症、天疱瘡、尋常性天疱瘡、重症筋無力症、炎症性腸疾患、クローン病、乾癬、自己免疫性甲状腺疾患、橋本病、皮膚筋炎、グッドパスチャー症候群(GPS)、重症筋無力症(MG)、交感性眼炎、水晶体起因性ブドウ膜炎(Phakogene Uveitis)、慢性侵襲性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性溶血性貧血、およびヴェルホーフ病を含むか、これらからなる群から選択される、請求項 13 に記載の使用のための組成物。

【請求項 17】

前記炎症性疾患が、細菌、ウイルス、プリオン、寄生虫、真菌に起因し、誘導され、開始され、そして／または増強され、そして／または刺激因子、外傷性因子、代謝性因子、アレルギー性因子、自己免疫因子、または特発性因子に原因する、請求項 13 に記載の使用のための組成物。

【請求項 18】

前記炎症性疾患が、中枢神経系(CNS)の炎症性疾患、炎症性リウマチ性疾患、血管の炎症性疾患、中耳の炎症性疾患、炎症性腸疾患、皮膚の炎症性疾患、炎症性ブドウ膜炎、および喉頭の炎症性疾患を含むか、これらからなる群から選択される、請求項 13 または 17 に記載の使用のための組成物。

【請求項 19】

前記炎症性疾患が、中枢神経系(CNS)の炎症性疾患、炎症性リウマチ性疾患、血管の炎症性疾患、中耳の炎症性疾患、炎症性腸疾患、皮膚の炎症性疾患、炎症性ブドウ膜炎、喉頭の炎症性疾患から選択され、好ましくは、前記炎症性疾患が、膿瘍形成、アカントアメーバ感染、尋常性ざ瘡、放線菌症、急性炎症性皮膚疾患、急性成人喉頭感染、急性多発性斑状色素上皮症、急性(熱)傷、急性網膜壊死、急性化膿性中耳炎、藻類ウイルス障害(algal disorder)、アレルギー性接触皮膚炎、アミロイド症血管浮腫、強直性脊椎炎、アスペルギルス症、アトピー性皮膚炎、偽性狂犬病、脈管炎内の自己抗体、細菌性障害、細菌性喉頭炎、細菌性髄膜炎、ベーチェット病(BD)、バードショット脈絡膜症、ギルクリスト病、ボルナ病、ブルセラ症、水疱性鼓膜炎、滑液包炎、カンジダ症、イヌジステンパー脳脊髄炎、幼若動物のイヌジステンパー脳脊髄炎、イヌ出血熱、イヌヘルペスウイルス脳脊髄炎、コレステリン腫、慢性肉芽腫性疾患(CGD)、慢性炎症性皮膚疾患、慢性再発性脳脊髄炎、慢性化膿性中耳炎、眼瘢痕性類天疱瘡(OCPE)、よく見られる上気道感染、肉芽腫、クローン病、クリプトコッカス疾患、皮膚筋炎、ジフテリア、円板状エリテマトーデス(DLE)、薬物性脈管炎、薬物反応または過敏反応、エンセファリトゾーン症、好酸球性髄膜脳炎、多形性紅斑(EM)、ネコ白血病ウイルス、ネコ免疫不全ウイルス、ネコ伝染性腹膜炎、ネコ灰白脳炎、ネコ海綿状脳症、線維筋痛、フックス虹彩異色性ブドウ膜炎、胃食道(喉頭咽頭)逆流性疾患、巨細胞動脈炎、鼻疽

、緑内障毛様体炎発症、淋菌性肉芽性鼓膜炎（gonorrhea granular myringitis）、肉芽腫性髄膜炎（GME）、単純ヘルペス、ヒストプラズマ症、特発性疾患、特発性炎症性障害、免疫障害および特発性障害、免疫不全宿主の感染、イヌ伝染性肝炎、吸入喉頭炎、間質性腎炎、刺激性接触皮膚炎、若年性関節リウマチ、川崎病、ラクトスウイルス脳炎、喉頭膿瘍、喉頭気管支炎、リーシュマニア症、水晶体原性ブドウ膜炎、癩病、レプトスピラ症、白血病、扁平苔癬、狼瘡、リンパ腫、髄膜炎、グレイハウンドの髄膜炎、種々の髄膜炎／髄膜炎、顕微鏡的多発血管炎、多病巣性脈絡膜炎、成熟動物における多病巣性ジステンパー脳脊髄炎、多発性硬化症、筋緊張性発声障害（MTD）、真菌症（真菌性疾患）、CNSの真菌症、壊死性脳炎、ネオスポラ症、老犬脳炎、オンコセルカ症、寄生虫脳脊髄炎、寄生虫感染、毛様体扁平部炎、パルボウイルス脳炎、小児喉頭炎、汚染および吸入剤のアレルギー、多発性筋炎、ワクチン後イヌジステンパー脳炎、プリオンタンパク質誘発性疾患、プロトテコーシス、原生動物脳炎－脳脊髄炎、乾癬、乾癬性関節炎、パグ脳炎、放射線傷害、放射線喉頭炎、放射線壊死、再発性多発性軟骨炎、ライター症候群、網膜色素変性、網膜芽細胞腫、関節リウマチ、リケッチア障害、ロッキー山紅斑熱、サケ中毒性疾患（SPD）、肉胞子虫症、サルコイドーシス、住血吸虫症、強皮症、鼻硬化症、地図状脈絡膜炎、シェーカードッグ病、シェーグレン症候群、瘰癧性クループ、スピロヘータ（梅毒）病、海綿状皮膚炎、スポロトリウム症、ステロイド反応性髄膜炎－動脈炎、スティーブンス・ジョンソン症候群（SJS、多形紅斑重症型）、喉頭蓋炎、交感性眼炎、シンガムス症、梅毒、サルコイドーシスにおける全身性血管炎、高安動脈炎、腱炎（tendinitis）（腱炎（tendonitis））、閉塞性血栓脈管炎（バーガー病）、イヌにおけるダニ媒介性脳炎、中毒性表皮壊死症（TEN）、トキシカラ症、トキシプラズマ症、外傷、外傷性喉頭炎、旋毛虫症、トリパノソーマ症、結核、野兎病、潰瘍性大腸炎、蕁麻疹（じんま疹）、脈管炎、脈管炎と悪性疾患の合併症、脈管炎と関節リウマチの合併症、特発性炎症性筋疾患における脈管炎、中枢神経系の脈管炎、細菌、真菌、および寄生虫の感染に続発する脈管炎、ウイルス性障害、ウイルス性喉頭炎、白斑、声帯乱用、声帯出血、フォークト・小柳・原田症候群（VKH）、ウェゲナー肉芽腫症、およびホイップル病を含む群から選択される、請求項13、17、または18のいずれかに記載の使用のための組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0066

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0066】

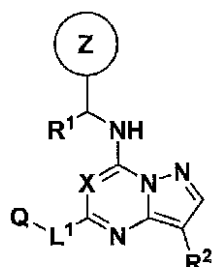
表11は、化合物1～279を、それらの構造および対応する特徴に関してまとめている。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

（項目1）

一般式I

【化79】



式 I

を有する化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩であって、式中、

Xは、各存在において独立して、CHおよびNから選択され；

L¹は、存在しないか、または独立して、各存在において、-NH-、-NH(CH₂)-、-NH(C=O)-、-NHSO₂-、-O-、-O(CH₂)-、-(C=O)-、-(C=O)NH-、および-(C=O)(CH₂)-からなる群から選択され；

Qは、各存在において独立して、C3～C8シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、およびC1～C6アルキルからなる群から選択され、ここで、C1～C6アルキルは、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルのうちの1つまたは2つで置換されており、

C3～C8シクロアルキルは、R³およびR⁴および-(C=O)R⁵のうちの1つまたは2つで置換され得、

ヘテロシクリルは、R³およびR⁴および-(C=O)R⁵のうちの1つまたは2つで置換され得、

C1～C6アルキル、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、-(C=O)R⁵、ハロゲン、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルのうちの1つまたは2つで置換されたアリールまたはヘテロアリール；

R¹は、各存在において、水素およびメチルからなる群から独立して選択され；

R²は、各存在において、ハロゲン、C1～C6アルキル、C3～C10シクロアルキル、-CN、-(C=O)CH₃、-NR⁹R^{1 2}、およびC1～C3ハロアルキル〔これらのいずれも必要に応じて置換される〕からなる群から独立して選択され；

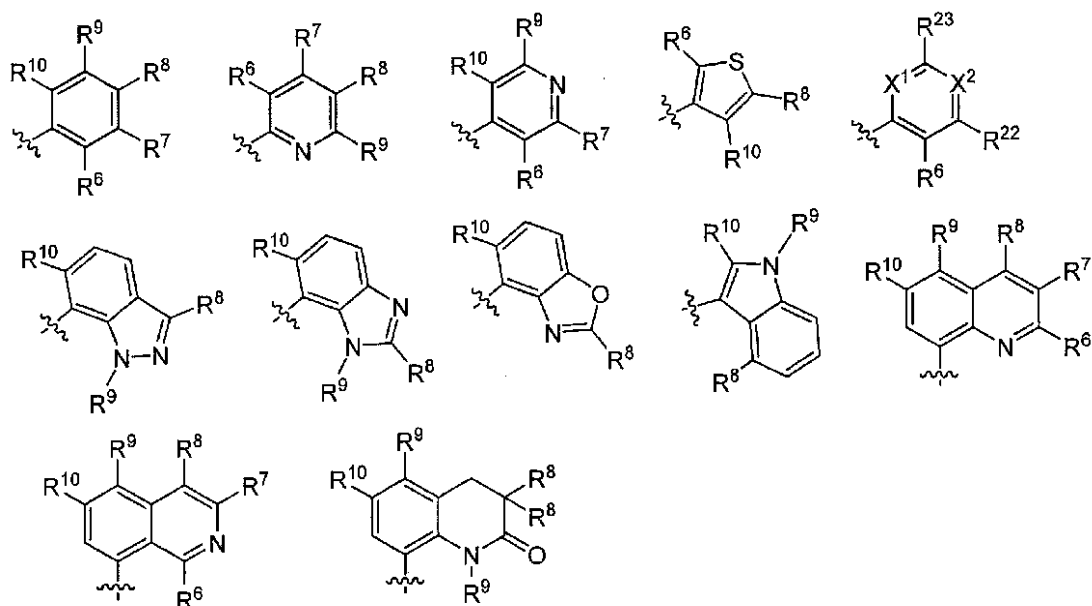
R³は独立して、各存在において、水素、-OR⁵、ハロゲン、-N(R⁵)R⁵、-NR⁹R^{1 2}、-NH(C=O)R⁵、-(C=O)NH₂、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルからなる群から選択され；

R⁴は、独立して、各存在において、水素、ハロゲン、-OR⁵、-N(R⁵)R⁵、(=O)、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルからなる群から選択され；

R⁵は、各存在において、水素、C1～C6アルキル、C3～C8シクロアルキル、C1～C3ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル；ハロゲン、-OR^{1 1}、-N(R^{1 1})R^{1 1}、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロアリール；ハロゲン、-OR^{1 1}、-N(R^{1 1})R^{1 1}、C1～C6アルキル、および-OHまたは-NH₂で置換されたC1～C6アルキルのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロシクリルからなる群から独立して選択され；

Zは、以下のA群：

【化 8 0】



A 群

の任意の構造であり；

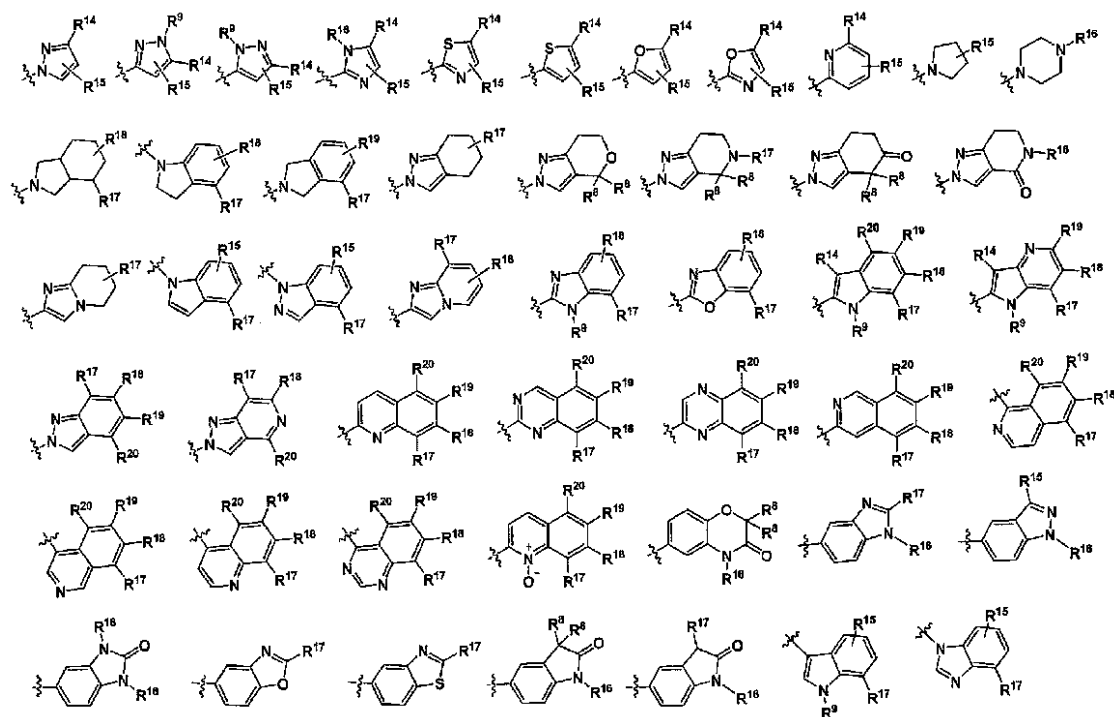
式中、

X^1 は、各存在において独立して、 CR^{24} および N から選択され；

X^2 は、各存在において独立して、 CR^{25} および N から選択され；

R^6 は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OH$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 $-(C=O)NHR^{11}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-NH(C=O)NHR^{11}$ 、 $-N(CH_3)(C=O)CH_3$ 、 $-NH(C=O)R^{12}$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、および以下の B 群；

【化 8 1】

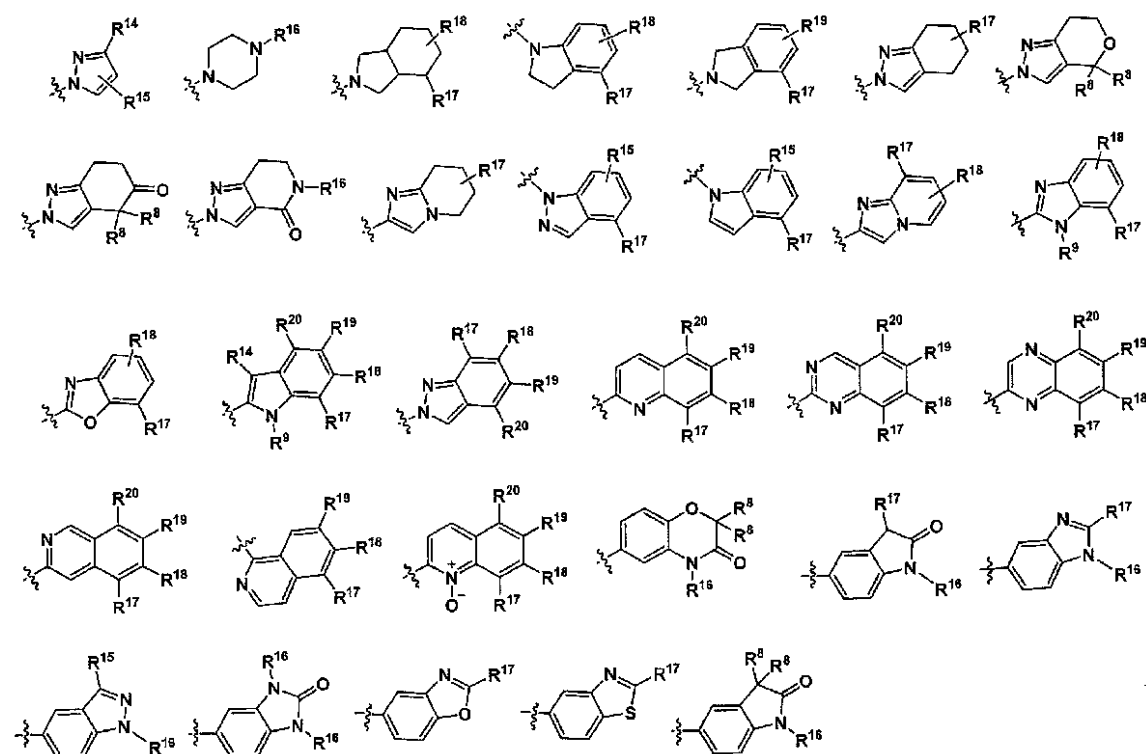


B 群

の任意の構造からなる群から独立して選択され；

R^7 は、各存在において、水素、ハロゲン、C 1～C 6 アルキル、 $-\text{NH}(\text{C}=\text{O})R^{12}$ 、 $-\text{NR}^9R^{12}$ 、 $-\text{OR}^{12}$ 、および以下の C 群；

【化 8 2】



C 群

の任意の構造からなる群から独立して選択され；

R^8 および R^{10} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^9 は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、および $-OH$ または OR^5 で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{11} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C3 \sim C10$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

R^{12} は、各存在において、存在しないか、または独立して、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C6 \sim C10$ アリール、フェニル、ベンジル、 $C3 \sim C9$ ヘテロアリール、 $C3 \sim C6$ ヘテロシクリル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換されたベンジル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C9$ ヘテロアリール、 $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C6$ ヘテロシクリル、ならびに1～4つのハロゲンおよび／または1～4つの $-NH(C=O)R^{13}$ で置換された $C6 \sim C10$ アリールからなる群から選択され；

R^{13} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル； $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル；および $C3 \sim C10$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

R^{14} および R^{15} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OH$ または NH_2 で置換された $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-C(R^9)(R^{11})OR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{21}$ 、 $-NR^9R^{21}$ 、 $-OR^{21}$ 、 $-OC(R^9)(R^{11})(R^{21})$ 、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 R^4 で置換された $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C10$ ヘテロアリール、 $C6 \sim C10$ アリール [例えば、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、または $-S(=O)_2NHR^{21}$ で置換されたフェニルおよびアリール] からなる群から独立して選択され；

R^{16} は、各存在において、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $-(C=O)R^{13}$ 、および $-OR^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、および R^{20} は、各存在において、水素、ハロゲン、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、 $C6 \sim C10$ アリール [例えば、フェニル]、 $-CN$ 、 $-CHCF_3NR^9R^{11}$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{21}$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHR^5$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-(C=O)NHR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から独立して選択され；

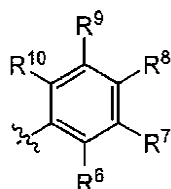
R^{21} は、各存在において、 $C1 \sim C6$ アルキル、 $C3 \sim C10$ シクロアルキル、 $C3 \sim C10$ ヘテロシクリル、 $C1 \sim C3$ ハロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル； $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^5$ 、または $-N(R^5)R^5$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキル；ハロゲンまたは $C1 \sim C3$ ハロアルキルで置換されたアリール、1～4つのハロゲンまたは $C1 \sim C3$ アルキルで置換された $C3 \sim C10$ ヘテロアリール、

および R^4 で置換された C 3 ~ C 10 ヘテロシクリルからなる群から独立して選択され；
 R^{22} および R^{23} は、各存在において、水素、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 3 ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された C 1 ~ C 6 アルキルからなる群から独立して選択され；

R^{24} および R^{25} は、各存在において、水素、ハロゲン、C 1 ~ C 6 アルキル、C 1 ~ C 3 ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN$ 、 $-(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)OR^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、 $-(C=O)NHR^{21}$ 、 $-CH_2(C=O)NHR^{21}$ 、 $-NH(C=O)R^{13}$ 、 $-NHS(=O)_2R^5$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、または $-S(=O)_2NHR^{21}$ 、および $-OH$ 、 $-OR^5$ 、または $-NHR^9$ で置換された C 1 ~ C 6 アルキルからなる群から独立して選択され；

但し、Z が

【化 8 3】



である場合、 R^6 および R^7 のうちの 1 つは H ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が N (R^5) R^5 であり、 R^4 が H であり、 R^5 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は 1 H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は、 CH_3 でも、Cl でも、1 H-ピラゾールでもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は、フェニルでも、 $CH(CH_3)_2$ でも、 CH_2CH_3 でも、 CH_3 でもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が Cl である場合、 R^6 は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル (heterocycl) であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8

がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がClである場合、 R^6 は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 がFであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、かつ R^9 がHである場合、 R^{10} はFではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がFである場合、 R^6 はFではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が CH_3 であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が1H-ピラゾールであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^3 はHではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく、

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は $CH(CH_3)_2$ ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたC3～C8シクロアルキルであり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がNHであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がNHであり、QがR

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q が R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocyclil)であり、 R^3 が

$N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 がHであり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がNHであり、Qが R^3 および R^4 で置換されたC3～C8シクロアルキルであり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 がHであり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 がHであり、 R^4 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 がHであり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

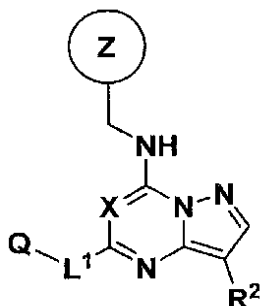
ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、Qが R^3 および R^4 で置換されたヘテロシクリル(heterocycl)であり、 R^3 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^4 がHであり、 R^5 がHであり、XがNであり、Zがフェニルであり、 R^6 がHであり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 がHであり、 R^9 がHであり、かつ R^{10} がHである場合、 R^{12} は CH_3 ではない；

化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目2)

R^1 は水素であり、前記化合物は、一般式 I I

【化84】



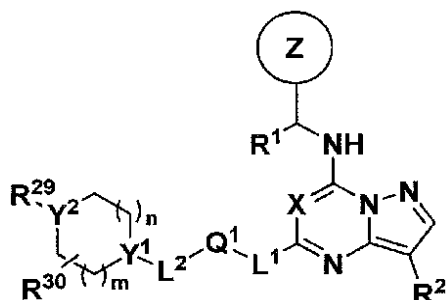
式 II

を有し、式中、X、Q、 L^1 、 R^2 、およびZは、項目1に定義の通りである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

一般式 I I I

【化85】



式 III

を有し、式中、 X 、 L^1 、 R^1 、 R^2 、および Z は、項目1に定義の通りであり、

Q^1 は、存在しないか、または独立して、各存在において、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル； $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、およびハロゲンのうちの1つまたは2つで置換されたアリーール； $C1 \sim C6$ アルキル、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、およびハロゲンのうちの1つまたは2つで置換されたヘテロアリーール；ならびに R^2R^9 および R^3R^0 のうちの1つまたは2つで置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^2R^9 は、存在しないか、または独立して、各存在において、水素、 $-OR^5$ 、ハロゲン、 $-N(R^5)R^5$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

R^3R^0 は、独立して、各存在において、水素、ハロゲン、 $-OR^5$ 、 $-N(R^5)R^5$ 、 $(=O)$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1 \sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

ここで、 R^5 、 R^9 、および R^{12} は、項目1に定義の通りであり；

L^2 は、存在しないか、または独立して、各存在において、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-(C=O)-$ 、および $-(C=O)NH-$ からなる群から選択され；

Y^1 は、各存在において独立して、 CH 、 $C(OH)$ 、および N から選択され；

Y^2 は、各存在において独立して、 CH 、 CR^{30} 、 O 、および N から選択され；

m は、各存在において独立して、0、1、および2から選択され；

n は、各存在において独立して、0および1から選択され；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、 m が1であり、 n が1であり、 R^2R^9 が $N(R^5)R^5$ であり、 R^3R^0 が H であり、 R^5 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は1H-ピラゾールではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が1であり、 n が1であり、 R^2R^9 が CH_3 であり、 R^3R^0 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^6 は CH_3 でも、 Cl でも、1H-ピラゾールでもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が1であり、 n が1であり、 R^2R^9 が CH_3 であり、 R^3R^0 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が OR^{12} であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は、フェニルでも、 $CH(CH_3)_2$ でも、 CH_2CH_3 でも、 CH_3 でもなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が1であり、 n が1であり、 R^2R^9 が CH_3 であり、 R^3R^0 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^6 が Cl であり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、かつ R^9 が H である場合、 R^{10} は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が1であり、 n が1であり、 R^2R^9 が CH_3 であり、 R^3R^0 が H であり、 X が N であり、 Z がフェニルであり、 R^7 が H であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が Cl である場合、 R^6 は Cl ではなく；

ここで、 R^1 が H であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が1であり、 n が1で

ここで、 R^1 がHであり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 がOであり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 がCHであり、 Y^2 がCHであり、mが1であり、nが1

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が O であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が N であり、 m が2であり、 n が

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が NH であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が CH であり、 Y^2 が CH であり、 m が1であり、

n が 1 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が N であり、m が 1 であり、n が 1 であり、 R^{29} が H であり、 R^{30} が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が $-(C=O)-$ であり、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、m が 1 であり、n が 1 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではなく；

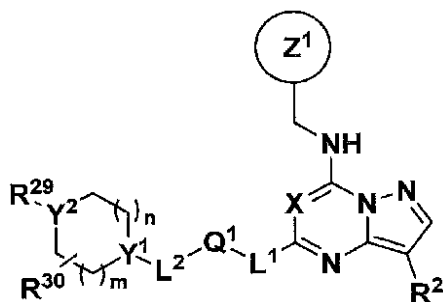
ここで、 R^1 が CH_3 であり、 R^2 が $CH(CH_3)_2$ であり、 L^1 が存在せず、 Q^1 が存在せず、 L^2 が存在せず、 Y^1 が N であり、 Y^2 が CH であり、m が 2 であり、n が 0 であり、 R^{29} が $N(R^5)R^5$ であり、 R^{30} が H であり、 R^5 が H であり、X が N であり、Z がフェニルであり、 R^6 が H であり、 R^7 が OR^{12} であり、 R^8 が H であり、 R^9 が H であり、かつ R^{10} が H である場合、 R^{12} は CH_3 ではない；

項目 1 のいずれかに記載の化合物もしくは前記化合物の鏡像異性体、立体異性体、鏡像異性体の混合物、ジアステレオマー、ジアステレオマーの混合物、ラセミ体、またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4)

一般式 I V

【化 8 6】



式 IV

を有し、式中、X、 L^1 、および R^2 は、項目 1 に定義の通りであり；

ここで、m、n、 Y^1 、 Y^2 、 L^2 、 R^{29} 、 R^{30} 、および Q^1 は、項目 3 に定義の通りであり；

ここで、 Z^1 は、以下の D 群：

Chemical structures 1-6 are shown below:

- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted benzene.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted pyridine.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted pyridine (isomer of 2).
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted indole.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted benzofuran.
- 1,2,3,4,5,6-hexa-substituted indole (isomer of 4).

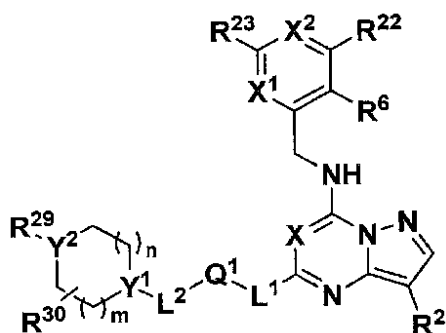
の任意の構造であり；

式中、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、および R^{10} は、項目1に定義の通りである、項目1～3のいずれかに記載の化合物。

(項目5)

一般式 V

【化 8 8】



式 V

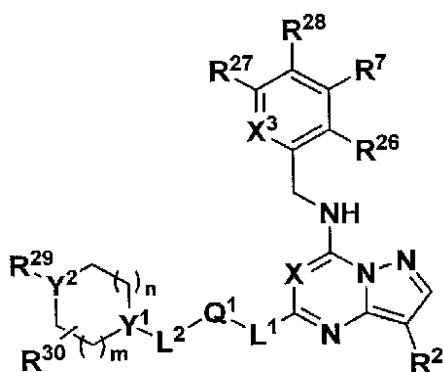
を有し、式中、 X 、 X^1 、 X^2 、 L^1 、 R^2 、 R^6 、 $R^{2\ 2}$ 、および $R^{2\ 3}$ は、項目1に定義の通りであり；

ここで、 m 、 n 、 Y^1 、 Y^2 、 L^2 、 R^{29} 、 R^{30} 、および Q^1 は、項目3に定義の通りである、項目1～4のいずれかに記載の化合物。

(項目 6)

一般式 V I

【化 8 9】



式 VI

を有し、式中、X、L¹、およびR²は、項目1に定義の通りであり；

ここで、m、n、Y¹、Y²、L²、R²⁹、R³⁰、およびQ¹は、項目3に定義の通りであり；

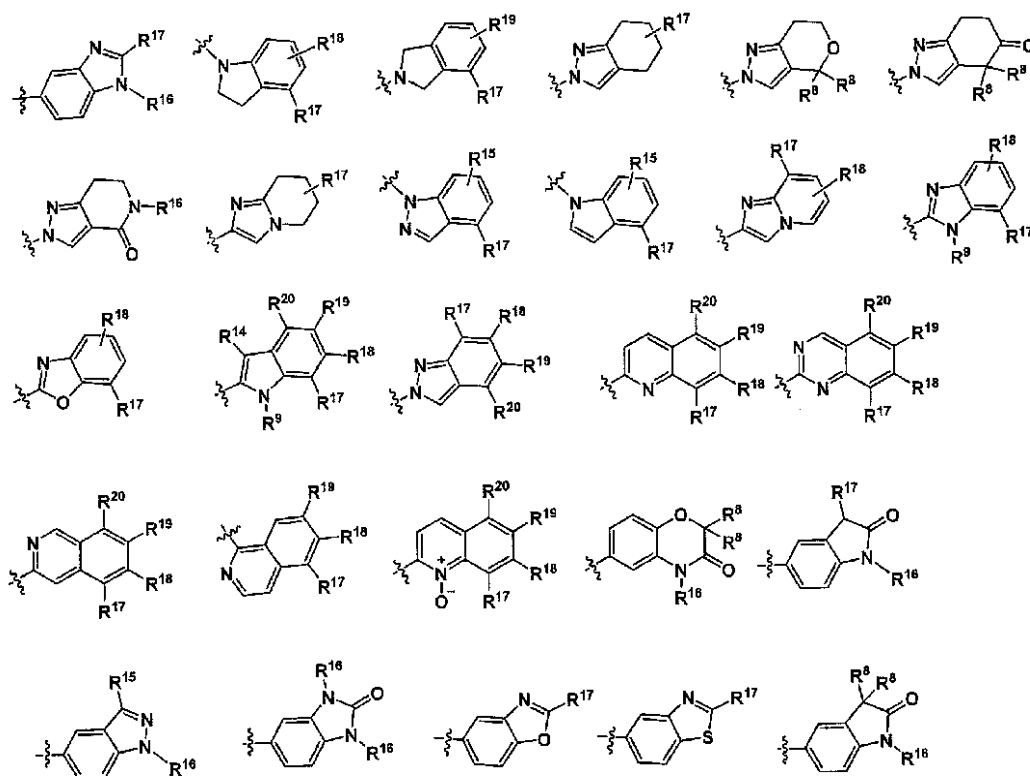
X³は、各存在において独立して、CR¹⁰およびNから選択され；

R²⁶、R²⁷、およびR²⁸は、各存在において、水素、ハロゲン、C1～C6アルキル、C1～C3ハロアルキル、—OR⁵、—CN、および—OH、—OR⁵、または—NHR⁹で置換されたC1～C6アルキルからなる群から独立して選択され；

R⁵、R⁹、およびR¹⁰は、項目1に定義の通りであり；

R⁷は、以下のE群：

【化 9 0】

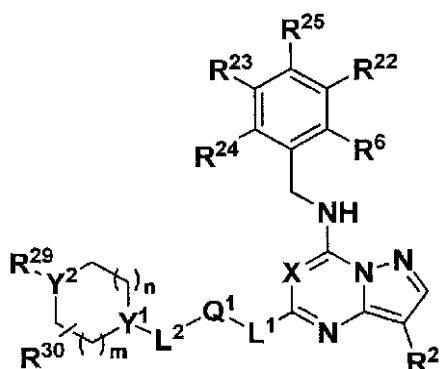


E 群

の任意の構造であり；

式中、R⁸およびR¹⁴～R²⁰は、項目1に定義の通りである、項目1～4のいずれかに記載の化合物。

(項目 7)
 一般式 V I I
 【化 9 1】

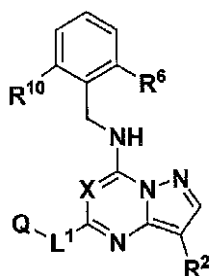


式 VII

を有し、式中、X、L¹、R²、R⁶、R²²、R²³、R²⁴、およびR²⁵は、項目 1 に定義の通りであり；

m、n、Y¹、Y²、L²、R²⁹、R³⁰、およびQ¹は、項目 3 に定義の通りである、項目 1～5 のいずれかに記載の化合物。

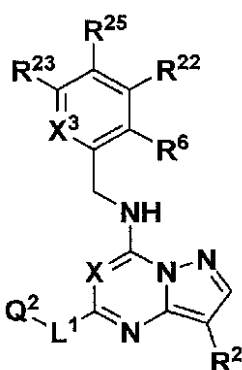
(項目 8)
 一般式 V I I I
 【化 9 2】



式 VIII

を有し、式中、X、L¹、R²、R⁶、およびR¹⁰は、項目 1 に定義の通りである、項目 1 および 2 のいずれかに記載の化合物。

(項目 9)
 一般式 I X
 【化 9 3】

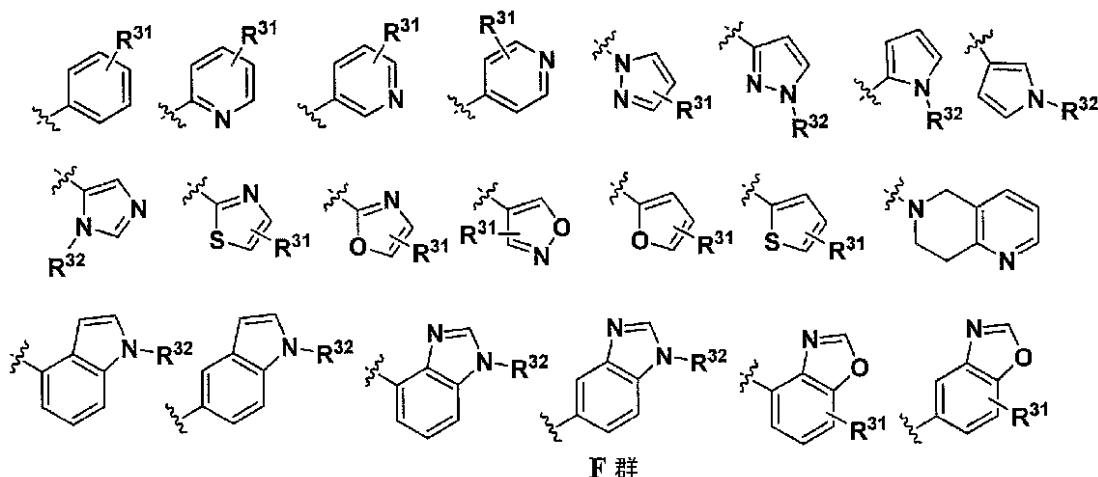


式 IX

を有し、式中、 L^1 、 R^2 、 R^6 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、および R^{25} は、項目1に定義の通りであり、 X^3 は、項目6に定義の通りであり；

ここで、 Q^2 は、以下のF群：

【化94】



の任意の構造であり；

R^{31} および R^{32} は、存在しないか、または独立して、各存在において、水素、 $-OR^5$ 、ハロゲン、 $-N(R^5)R^5$ 、 $-NR^9R^{12}$ 、 $-NH(C=O)R^5$ 、 $-(C=O)NH_2$ 、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $C1\sim C6$ アルキル、および $-OH$ または $-NH_2$ で置換された $C1\sim C6$ アルキルからなる群から選択され；

ここで、 R^5 、 R^9 、および R^{12} は、項目1に定義の通りである、項目1～5のいずれかに記載の化合物。

(項目10)

表11中に定義の構造1～279から選択される構造を有する、前記項目のいずれかに記載の化合物。

(項目11)

活性成分としての項目1～10のいずれかに記載の化合物を、少なくとも1つの薬学的に許容され得るキャリア、賦形剤、および／または希釈剤と共に含む薬学的組成物。

(項目12)

薬学的に活性な剤が、好ましくは、サイクリン依存性キナーゼ7 (CDK7) に対する阻害活性を有する、薬学的に活性な剤としての使用のための項目1～10に記載の化合物。

(項目13)

1種または数種のサイクリン依存性キナーゼ (CDK)、特に、サイクリン依存性キナーゼ7 (CDK7) の異所の活性および／または過剰発現によるアポトーシスの阻害、異常な転写活性、および／または細胞周期停止に関連する疾患であって、前記疾患が、増殖性疾患、日和見疾患が含まれる感染性疾患、免疫学的疾患、自己免疫疾患、および炎症性疾患から選択される、疾患を予防および／または処置する方法における使用のための項目1～10のいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

前記増殖性疾患が、がん、好ましくは、腺癌、脈絡膜黒色腫、急性白血病、聴神経鞘腫、膨大部癌、肛門癌、星状細胞腫、基底細胞癌、膵臓がん、デスモイド腫瘍、膀胱がん、気管支癌、エストロゲン依存性および非依存性の乳がん、パーキットリンパ腫、体がん、原発不明癌腫 (CUP症候群)、結腸直腸がん、小腸がん、小腸腫瘍、卵巣がん、子宮内膜癌、上衣腫、上皮がん型、ユーイング腫瘍、消化管腫瘍、胃のがん (gastric cancer)、胆嚢がん、胆嚢癌、子宮がん、子宮頸がん、頸部、膠芽細胞腫、婦人科

腫瘍、耳鼻咽喉科腫瘍、血液学的腫瘍、毛様細胞白血病、尿道がん、皮膚がん、皮膚精巣がん、脳腫瘍（神経膠腫）、脳転移、睾丸がん、下垂体腫瘍、カルチノイド、カボジ肉腫、喉頭がん、胚細胞腫瘍、骨がん、結腸直腸癌、頭頸部腫瘍（耳、鼻、および咽頭領域の腫瘍）、結腸癌、頭蓋咽頭腫、口腔がん（oral cancer）（口腔内および唇上のがん）、中枢神経系のがん、肝臓がん、肝転移、白血病、眼瞼腫瘍、肺がん、リンパ腫、胃がん（stomach cancer）、悪性黒色腫、悪性新形成、消化管の悪性腫瘍、乳癌、直腸がん、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、ホジキン／非ホジキンリンパ腫、菌状息肉腫、鼻腔がん、神経鞘腫、神経芽細胞腫、腎臓がん、腎細胞癌、乏突起膠腫、食道癌、溶骨性癌および骨形成性癌、骨肉腫、卵巣癌、膀胱癌、陰茎がん、プラズマ細胞腫、前立腺がん、咽頭がん、直腸癌、網膜芽細胞腫、膣がん、甲状腺癌、食道がん、T細胞リンパ腫、胸腺腫、管癌、眼腫瘍、尿道がん、泌尿器腫瘍、尿路上皮癌、外陰がん、疣贅出現、軟部組織腫瘍、軟部組織肉腫、腎芽腫、子宮頸癌、舌がん、浸潤性腺管癌腫、浸潤性小葉癌、腺管上皮内癌、上皮内小葉癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、気管支腺腫、胸膜肺芽腫、中皮腫、脳幹部神経膠腫、視床下部神経膠腫、小脳星状細胞腫、大脳星状細胞腫、神経外胚葉性腫瘍、松果体部腫瘍、子宮の肉腫、唾液腺がん、肛門腺腺癌、肥満細胞腫瘍、骨盤腫瘍、尿管腫瘍、遺伝性乳頭状腎がん、散発性乳頭状腎がん、眼内黒色腫、肝細胞癌、胆管癌、混合型肝細胞胆管癌、扁平上皮癌、悪性黒色腫、メルケル細胞皮膚がん、非黒色腫皮膚がん、下咽頭がん、上咽頭がん、中咽頭がん、口腔のがん（oral cavity cancer）、扁平上皮がん、口腔黒色腫、AIDS関連リンパ腫、皮膚T細胞リンパ腫、中枢神経系のリンパ腫、悪性線維性組織球腫、リンパ肉腫、横紋筋肉腫、悪性組織球増殖症、線維芽細胞性肉腫、血管肉腫、血管周囲細胞腫、平滑筋肉腫（LMS）、イヌ乳房癌腫、およびネコ乳房癌腫を含むか、これらからなる群から選択されるがんである、項目13に記載の使用のための化合物。

（項目15）

前記日和見疾患が含まれる感染性疾患が、AIDS、アデノウイルス感染、多包虫症（AHD）、アメーバ症、広東住血線虫症、アニサキス症、炭疽、バベシア症、バランチジウム症、バイリスアスカリス感染、ビルハルツ（住血吸虫症）、ブラストシスチスホミニス（Blastocystis hominis）感染、ライムボレリア症、ポツリヌス中毒、ブレーナード下痢、ブルセラ症、ウシ海綿状脳症（BSE）、カンジダ症、毛頭虫症、慢性疲労症候群（CFS）、シャーガス病、水疱、クラミジアニューモニエ（Chlamydia pneumoniae）感染、コレラ、慢性疲労症候群、クロイツフェルト・ヤコブ病（CJD）、肝吸虫症、皮膚幼虫移行症（CLM）、コクシジオイデス症、結膜炎、コクサッキーウイルスA16（Coxsackievirus A16）、クリプトコッカス疾患、クリプトスポリジウム症、ウエストナイル熱、サイクロスポラ症、神経囊虫症、サイトメガロウイルス感染、デング熱、瓜実条虫（Dipylidium caninum）感染、エボラ出血熱（EHF）、多包性エキノコックス症（AE）、脳炎、大腸アメーバ（Entamoeba coli）感染、エントアメーバ・ディスパー（Entamoeba dispar）感染、ハルトマンアメーバ（Entamoeba hartmanni）感染、エントアメーバポレッキ（Entamoeba polecki）感染、蟯虫感染、エンテロウイルス感染（ポリオ／非ポリオ）、エプスタイン・バーウイルス感染、大腸菌感染、食物媒介感染、口蹄疫、真菌性皮膚炎、真菌感染、胃腸炎、A群レンサ球菌疾患、B群レンサ球菌疾患、ハンセン病（癩病）、ハンタウイルス肺症候群、アタマジラミ外寄生（シラミ寄生症）、ヘリコバクターピロリ感染、血液疾患、ヘンドラウイルス感染、肝炎（HCV、HBV）、帯状疱疹（帯状ヘルペス）、HIV感染、ヒトエールリヒア症、ヒトパラインフルエンザウイルス感染、インフルエンザ、イソスポーラ症、ラッサ熱、リーシュマニア症、内蔵リーシュマニア症（VL）、マラリア、マールブルグ出血熱、麻疹、髄膜炎、マイコバクテリウム・アビウム複合体（MAC）感染、ネグレリア感染、院内感染、非病原性腸アメーバ感染、オンコセルカ症、オピストルキス症、パピローマウイルス感染、パルボウイルス感染、ペスト、ニューモシスチス肺炎（PCP）、ポリオーマウイルス感染、Q熱、狂犬病、呼吸器合胞体ウイルス（RSV）感染、リウマチ熱、リフトバ

レー熱、ロタウイルス感染、回虫感染、サルモネラ症、疥癬、細菌性赤痢、帯状ヘルペス、眠り病、天然痘、レンサ球菌感染、条虫感染、破傷風、中毒性ショック症候群、結核、十二指腸、腸炎ビブリオ (*Vibrio parahaemolyticus*) 感染、ビブリオ敗血、ウイルス性出血熱、疣贅、水系感染性疾患、水痘帯状疱疹ウイルス感染、百日咳、および黄熱病を含むか、これらからなる群から選択される、項目 13 に記載の使用のための化合物。

(項目 16)

前記免疫学的疾患および／または自己免疫疾患が、喘息、糖尿病、リウマチ性疾患、AIDS、移植した臓器および組織の拒絶、鼻炎、慢性閉塞性肺疾患、骨粗鬆症、潰瘍性大腸炎、副鼻腔炎、エリテマトーデス、反復性感染、アトピー性皮膚炎／湿疹および職業性アレルギー、食物アレルギー、薬物アレルギー、重症アナフィラキシー反応、アナフィラキシー、アレルギー疾患の発現、原発性免疫不全、抗体欠損状態、細胞媒介免疫不全、重症複合型免疫不全、ディジョージ症候群、高IgE症候群 (HIES)、ヴィスコット・オールドリッチ症候群 (WAS)、毛細管拡張性失調症、免疫介在性のがん、白血球欠損、自己免疫疾患、全身性エリテマトーデス (SLE)、関節リウマチ (RA)、多発性硬化症 (MS)、免疫介在性または1型の真性糖尿病、免疫介在性糸球体腎炎、強皮症、悪性貧血、脱毛症、天疱瘡、尋常性天疱瘡、重症筋無力症、炎症性腸疾患、クローン病、乾癬、自己免疫性甲状腺疾患、橋本病、皮膚筋炎、グッドパスチャー症候群 (GPS)、重症筋無力症 (MG)、交感性眼炎、水晶体起因性ブドウ膜炎 (Phakogene Uveitis)、慢性侵襲性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性溶血性貧血、およびヴェルホーフ病を含むか、これらからなる群から選択される、項目 13 に記載の使用のための化合物。

(項目 17)

前記炎症性疾患が、細菌、ウイルス、プリオン、寄生虫、真菌に起因し、誘導され、開始され、そして／または増強され、そして／または刺激因子、外傷性因子、代謝性因子、アレルギー性因子、自己免疫因子、または特発性因子に原因する、項目 13 に記載の使用のための化合物。

(項目 18)

前記炎症性疾患が、中枢神経系 (CNS) の炎症性疾患、炎症性リウマチ性疾患、血管の炎症性疾患、中耳の炎症性疾患、炎症性腸疾患、皮膚の炎症性疾患、炎症性ブドウ膜炎、および喉頭の炎症性疾患を含むか、これらからなる群から選択される、項目 13 または 17 に記載の使用のための化合物。

(項目 19)

前記炎症性疾患が、中枢神経系 (CNS) の炎症性疾患、炎症性リウマチ性疾患、血管の炎症性疾患、中耳の炎症性疾患、炎症性腸疾患、皮膚の炎症性疾患、炎症性ブドウ膜炎、喉頭の炎症性疾患から選択され、好ましくは、前記炎症性疾患が、膿瘍形成、アカントアメーバ感染、尋常性ざ瘡、放線菌症、急性炎症性皮膚疾患、急性成人喉頭感染、急性多発性斑状色素上皮症、急性 (熱) 傷、急性網膜壊死、急性化膿性中耳炎、藻類ウイルス障害 (algal disorder)、アレルギー性接触皮膚炎、アミロイド症血管浮腫、強直性脊椎炎、アスペルギルス症、アトピー性皮膚炎、偽性狂犬病、脈管炎内の自己抗体、細菌性障害、細菌性喉頭炎、細菌性髄膜炎、ベーチェット病 (BD)、バードショット脈絡膜症、ギルクリスト病、ボルナ病、ブルセラ症、水疱性鼓膜炎、滑液包炎、カンジダ症、イヌジステンパー脳脊髄炎、幼若動物のイヌジステンパー脳脊髄炎、イヌ出血熱、イヌヘルペスウイルス脳脊髄炎、コレステリン腫、慢性肉芽腫性疾患 (CGD)、慢性炎症性皮膚疾患、慢性再発性脳脊髄炎、慢性化膿性中耳炎、眼癬痕性類天疱瘡 (OCP)、よく見られる上気道感染、肉芽腫、クローン病、クリプトコッカス疾患、皮膚筋炎、ジフテリア、円板状エリテマトーデス (DLE)、薬物性脈管炎、薬物反応または過敏反応、エンセファリトゾーン症、好酸球性髄膜脳炎、多形性紅斑 (EM)、ネコ白血病ウイルス、ネコ免疫不全ウイルス、ネコ伝染性腹膜炎、ネコ灰白脳炎、ネコ海綿状脳症、線維筋痛、フックス虹彩異色性ブドウ膜炎、胃食道 (喉頭咽頭) 逆流性疾患、巨細胞動脈炎、鼻疽

、緑内障毛様体炎発症、淋菌性肉芽性鼓膜炎（gonorrhea granular myringitis）、肉芽腫性髄膜脳炎（GME）、単純ヘルペス、ヒストプラズマ症、特発性疾患、特発性炎症性障害、免疫障害および特発性障害、免疫不全宿主の感染、イヌ伝染性肝炎、吸入喉頭炎、間質性腎炎、刺激性接触皮膚炎、若年性関節リウマチ、川崎病、ラクトスウイルス脳炎、喉頭膿瘍、喉頭気管気管支炎、リーシュマニア症、水晶体原性ブドウ膜炎、癩病、レプトスピラ症、白血病、扁平苔癬、狼瘡、リンパ腫、髄膜炎、グレイハウンドの髄膜脳炎、種々の髄膜炎／髄膜脳炎、顕微鏡的多発血管炎、多病巣性脈絡膜炎、成熟動物における多病巣性ジステンパー脳脊髄炎、多発性硬化症、筋緊張性発声障害（MTD）、真菌症（真菌性疾患）、CNSの真菌症、壊死性脳炎、ネオスポラ症、老犬脳炎、オンコセルカ症、寄生虫脳脊髄炎、寄生虫感染、毛様体扁平部炎、パルボウイルス脳炎、小児喉頭炎、汚染および吸入剤のアレルギー、多発性筋炎、ワクチン後イヌジステンパー脳炎、プリオンタンパク質誘発性疾患、プロトテコーシス、原生動物脳炎－脳脊髄炎、乾癬、乾癬性関節炎、パグ脳炎、放射線傷害、放射線喉頭炎、放射線壊死、再発性多発性軟骨炎、ライター症候群、網膜色素変性、網膜芽細胞腫、関節リウマチ、リケッチア障害、ロッキー山紅斑熱、サケ中毒性疾患（SPD）、肉胞子虫症、サルコイドーシス、住血吸虫症、強皮症、鼻硬化症、地図状脈絡膜炎、シェーカードッグ病、シェーグレン症候群、瘰癧性クループ、スピロヘータ（梅毒）病、海綿状皮膚炎、スポロトリウム症、ステロイド反応性髄膜炎－動脈炎、スティープンス・ジョンソン症候群（SJS、多形紅斑重症型）、喉頭蓋炎、交感性眼炎、シンガムス症、梅毒、サルコイドーシスにおける全身性血管炎、高安動脈炎、腱炎（tendinitis）（腱炎（tendonitis））、閉塞性血栓脈管炎（バーガー病）、イヌにおけるダニ媒介性脳炎、中毒性表皮壊死症（TEN）、トキシカラ症、トキシプラズマ症、外傷、外傷性喉頭炎、旋毛虫症、トリパノソーマ症、結核、野兎病、潰瘍性大腸炎、蕁麻疹（じんま疹）、脈管炎、脈管炎と悪性疾患の合併症、脈管炎と関節リウマチの合併症、特発性炎症性筋疾患における脈管炎、中枢神経系の脈管炎、細菌、真菌、および寄生虫の感染に続発する脈管炎、ウイルス性障害、ウイルス性喉頭炎、白斑、声帯乱用、声帯出血、フォークト・小柳・原田症候群（VKH）、ウェゲナー肉芽腫症、およびホイップル病を含む群から選択される、項目13、17、または18のいずれかに記載の使用のための化合物。