

【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30年12月20日(2018.12.20)

【公表番号】特表2017-533250(P2017-533250A)

【公表日】平成29年11月9日(2017.11.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-043

【出願番号】特願2017-525079(P2017-525079)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)
C 07 D 519/00 (2006.01)
A 61 K 31/437 (2006.01)
A 61 K 31/5513 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/541 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/4402 (2006.01)
A 61 K 31/444 (2006.01)
A 61 K 31/4545 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/501 (2006.01)
A 61 K 31/337 (2006.01)
A 61 K 31/517 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 K 33/24 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 19/06 (2006.01)
A 61 P 19/00 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 17/02 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 17/04 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 9/14 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 5/00 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 1/18 (2006.01)
A 61 P 7/04 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)

【F I】

| | | |
|---------|---------|---------|
| C 0 7 D | 471/04 | 1 0 4 Z |
| C 0 7 D | 471/04 | C S P |
| C 0 7 D | 519/00 | 3 0 1 |
| A 6 1 K | 31/437 | |
| A 6 1 K | 31/5513 | |
| A 6 1 K | 31/5377 | |
| A 6 1 K | 31/541 | |
| A 6 1 K | 31/496 | |
| C 0 7 D | 519/00 | 3 1 1 |
| A 6 1 K | 31/4402 | |
| A 6 1 K | 31/444 | |
| A 6 1 K | 31/4545 | |
| A 6 1 K | 31/506 | |
| A 6 1 K | 31/501 | |
| A 6 1 K | 31/337 | |
| A 6 1 K | 31/517 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 K | 33/24 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 35/02 | |
| A 6 1 P | 19/06 | |
| A 6 1 P | 19/00 | |
| A 6 1 P | 11/06 | |
| A 6 1 P | 9/10 | |
| A 6 1 P | 17/02 | |
| A 6 1 P | 11/00 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 17/04 | |
| A 6 1 P | 17/06 | |
| A 6 1 P | 9/14 | |
| A 6 1 P | 13/12 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 9/00 | |
| A 6 1 P | 29/00 | |
| A 6 1 P | 1/16 | |
| A 6 1 P | 5/00 | |
| A 6 1 P | 37/02 | |
| A 6 1 P | 19/02 | |
| A 6 1 P | 1/18 | |
| A 6 1 P | 29/00 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 7/04 | |
| A 6 1 P | 3/10 | |
| A 6 1 P | 27/02 | |

【手続補正書】**【提出日】**平成30年11月8日(2018.11.8)**【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

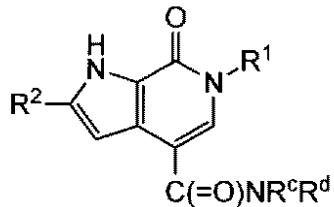
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1 6 3】



(I)

の化合物またはその塩であって、式中、

R¹ は、H、C_{1～12}アルキル、C_{2～12}アルケニル、C_{2～12}アルキニル、またはカルボシクリルであり、ここで、R¹のC_{1～12}アルキル、C_{2～12}アルケニル、C_{2～12}アルキニル、およびカルボシクリルの各々は、1つまたは複数のR^a基で任意選択的に置換され；

R² は、H、C_{1～12}アルキル、C_{2～12}アルケニル、C_{2～12}アルキニル、またはC_{3～8}シクロアルキルであり、ここで、R²のC_{1～12}アルキル、C_{2～12}アルケニル、C_{2～12}アルキニル、およびC_{3～8}シクロアルキルの各々は、1つまたは複数のR^b基で任意選択的に置換され；

各R^aは、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^v)₂、-S(O)-N(R^v)₂、-S(O)₂-N(R^v)₂、-O-R^v、-S-R^v、-O-C(O)-R^v、-O-C(O)-O-R^v、-S(O)₂-R^v、-O-C(O)-N(R^v)₂、-N(R^v)-C(O)-R^v、-N(R^v)-S(O)-R^v、-N(R^v)-S(O)₂-R^v、-N(R^v)-S(O)-N(R^v)₂、および-N(R^v)-S(O)₂-N(R^v)₂から独立して選択され、ここで、任意のC_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^v)₂、-S(O)-N(R^v)₂、-S(O)₂-N(R^v)₂、-O-R^v、-S-R^v、-O-C(O)-R^v、-C(O)-R^v、-C(O)-O-R^v、-S(O)-R^v、-S(O)₂-R^v、-C(O)-N(R^v)-C(O)-R^v、-N(R^v)-S(O)-R^v、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC_{1～6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各R^bは、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^w)₂、-CN、-C(O)-N(R^w)₂、-S(O)-N(R^w)₂、-S(O)₂-N(R^w)₂、-O-R^w、-S-R^w、-O-C(O)-R^w、-O-C(O)-O-R^w、-S(O)₂-R^w、-O-C(O)-N(R^w)₂、-N(R^w)-C(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)₂-R^w、-N(R^w)-S(O)-N(R^w)₂、および-N(R^w)-S(O)₂-N(R^w)₂から独立して選択され、

ここで、任意の $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、 $C_{1\sim 6}$ ハロアルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^w)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^w)_2$ 、 $-S(O)-N(R^w)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^w)_2$ 、 $-O-R^w$ 、 $-S-R^w$ 、 $-O-C(O)-R^w$ 、 $-C(O)-R^w$ 、 $-C(O)-O-R^w$ 、 $-S(O)-R^w$ 、 $-S(O)_2-R^w$ 、 $-C(O)-N(R^w)_2$ 、 $-N(R^w)-C(O)-R^w$ 、 $-N(R^w)-S(O)-R^w$ 、 $-N(R^w)-S(O)_2-R^w$ 、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された $C_{1\sim 6}$ アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^c および R^d は各々、水素、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^v)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-O-C(O)-O-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-O-R^h$ 、 $-S(O)-R^h$ 、 $-S(O)_2-R^h$ 、 $-O-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-OR^h$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-S(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)_2-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-S(O)_2-N(R^h)_2$ および $-N(R^h)-S(O)_2-N(R^h)_2$ から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意の $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^h)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-O-R^h$ 、 $-S(O)-R^h$ 、 $-S(O)_2-R^h$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-R^h$ 、 $N(R^h)-S(O)_2-R^h$ 、および $C_{1\sim 6}$ アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、および $C_{1\sim 6}$ アルキルは、オキソ、ハロ、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、シアノ、 $-O-R^h$ 、ヘテロシクリル、ならびにハロおよび $C_{1\sim 6}$ アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；

または、 R^c および R^d が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^v)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-O-C(O)-O-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-O-R^h$ 、 $-S(O)-R^h$ 、 $-S(O)_2-R^h$ 、 $-O-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-OR^h$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)_2-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-N(R^h)_2$ 、および $-N(R^h)-S(O)_2-N(R^h)_2$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し、ここで、任意の $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^h)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)-N(R^h)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^h)_2$ 、 $-O-R^h$ 、 $-S-R^h$ 、 $-O-C(O)-R^h$ 、 $-O-C(O)-O-R^h$ 、 $-C(O)-R^h$ 、 $-C(O)-O-R^h$ 、 $-S(O)-R^h$ 、 $-S(O)_2-R^h$ 、 $-O-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$ 、 $-N(R^h)-C(O)-OR^h$ 、 $-N(R^h)-C(O)-N(R^h)_2$

R^h は、 $-\text{N}(\text{R}^h)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^h$ 、 $-\text{N}(\text{R}^h)-\text{S}(\text{O})-\text{R}^h$ 、 $-\text{N}(\text{R}^h)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^h$ 、 $-\text{N}(\text{R}^h)-\text{S}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^h)_2$ 、および $-\text{N}(\text{R}^h)-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^h)_2$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロおよび C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各 R^h は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^h が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各 R^v は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または2つの R^v が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各 R^w は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または2つの R^w が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、化合物またはその塩。

【請求項2】

R^1 は C_{1-12} アルキルまたは C_{2-12} アルケニルであり、ここで、 C_{1-12} アルキルおよび C_{2-12} アルケニルは各々、1つまたは複数の R^a 基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 は C_{1-6} アルキルまたは C_{2-6} アルケニルであり、ここで、 C_{1-6} アルキルおよび C_{2-6} アルケニルは各々、1つまたは複数の R^a 基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 は C_{1-6} アルキルまたは C_{2-6} アルケニルであり、ここで、 C_{1-6} アルキルおよび C_{2-6} アルケニルは各々、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^v)_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^v)_2$ 、 $-\text{O}-\text{R}^v$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{R}^v$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^v$ 、および $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^v$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^1 は C_{1-6} アルキルまたは C_{2-6} アルケニルであり、ここで、 C_{1-6} アルキルお

および $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、カルボシクリル、-F、-C1、-O-R^v、-O-C(O)-R^v、-C(O)-R^v、および-C(O)-O-R^v から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R^1 は $C_{1\sim6}$ アルキルまたは $C_{2\sim6}$ アルケニルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよび $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、 $C_{3\sim6}$ シクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 は、メチル、ブチル、2-プロペニル、2-ブテン-1-イル、3-ブテン-1-イル、または2-シクロプロビルエチルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

R^2 は H または $C_{1\sim12}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim12}$ アルキルは、1つまたは複数の R^b 基で任意選択的に置換される、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R^2 は H または $C_{1\sim6}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim6}$ アルキルは、1つまたは複数の R^b 基で任意選択的に置換される、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

R^2 は H または $C_{1\sim6}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim12}$ アルキルは、1つまたは複数のカルボシクリル、-F、-C1、-O-R^w、-O-C(O)-R^w、-C(O)-R^w、-C(O)-O-R^w で任意選択的に置換される、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

R^2 は、H またはメチルである、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

R^2 は H である、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

R^c は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、またはカルボシクリルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよびカルボシクリルは各々、オキソ、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-C1、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-O-R^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂ から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、および $C_{1\sim6}$ アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該カルボシクリルおよび $C_{1\sim6}$ アルキルは、オキソ、ハロ、 $C_{1\sim6}$ アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよび $C_{1\sim6}$ アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R^c は、水素、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、または $C_{3 \sim 8}$ シクロアルキルであり、ここで、 $C_{1 \sim 6}$ アルキルおよび $C_{3 \sim 8}$ シクロアルキルは各々、 $-O-R^h$ から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で任意選択的に置換される、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項15】

R^c は、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、または 2-メトキシエチルである、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項16】

R^c は水素である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】

R^c は、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、または 2-メトキシエチルである、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

R^d は、C_{1～6}アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、ここで、C_{1～6}アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意のC_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、およびC_{1～6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC_{1～6}アルキルは、オキソ、ハロ、C_{1～6}アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC_{1～6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 19】

R^d は、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で任意選択的に置換された C_{1～6}アルキルであり、ここで、該置換基の任意の C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-

C N、 - C (O) - N (R ^h) ₂、 - S (O) - N (R ^h) ₂、 - S (O) ₂ - N (R ^h) ₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - R ^h、 - C (O) - R ^h、 - C (O) - O - R ^h、 - S (O) - R ^h、 - S (O) ₂ - R ^h、 - C (O) - N (R ^h) ₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 N (R ^h) - S (O) ₂ - R ^h、 および C _{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、および C _{1 ~ 6} アルキルは、オキソ、ハロ、 C _{1 ~ 6} アルキル、シアノ、 - O - R ^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよび C _{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 20】

R^d は、オキソ、C₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換されたカルボシクリルであり、ここで、該置換基の任意のC₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)₂-R^h、およびC₁～₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC₁～₆アルキルは、オキソ、ハロ、C₁～₆アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC₁～₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 21】

^h、およびC₁～₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC₁～₆アルキルは、オキソ、ハロ、C₁～₆アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC₁～₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

R^cおよびR^dが、それらが結合する窒素とともに、オキソ、C₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-C1、-Br、-I、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^v)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し、ここで、任意のC₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、C₁～₆アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-C1、-Br、-I、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該C₁～₆アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロおよびC₁～₆アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

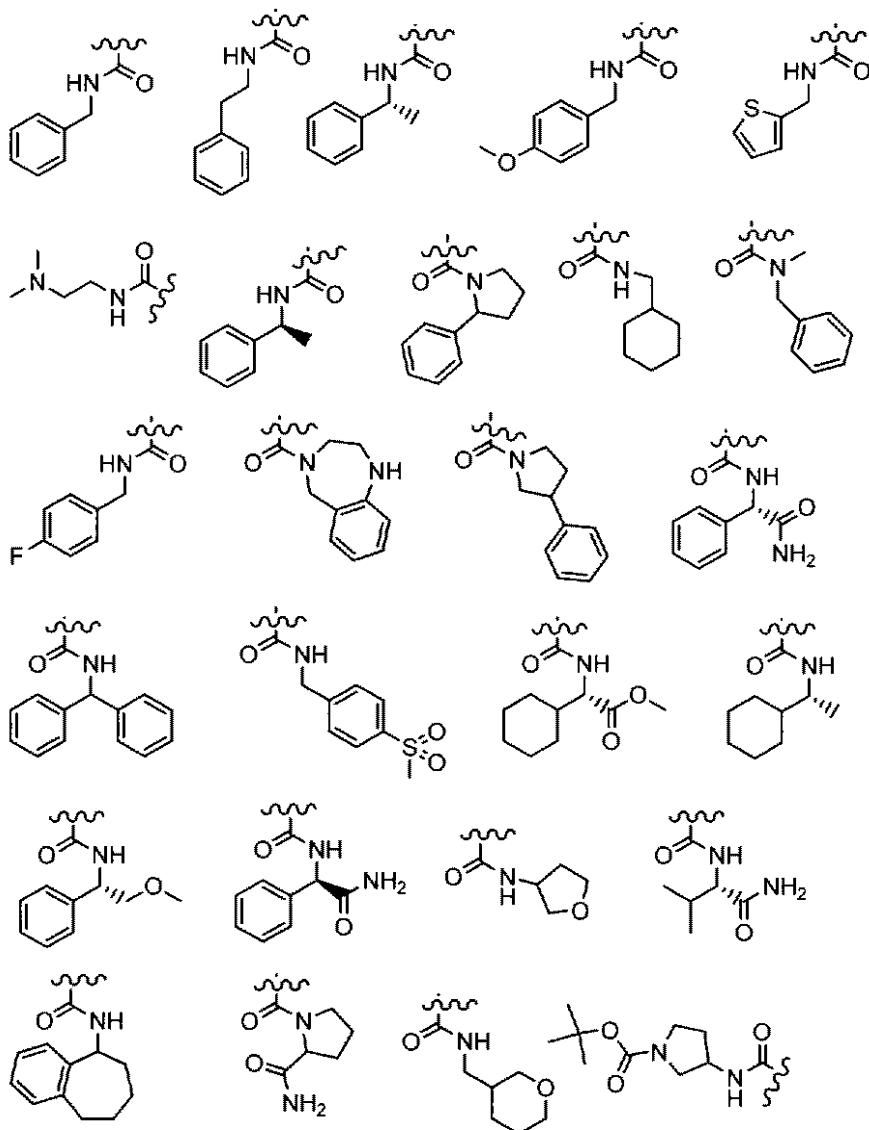
R^cおよびR^dが、それらが結合する窒素とともに、5～6員の单環式ヘテロシクリルまたは8～12員の二環式ヘテロシクリルを形成し、ここで、該单環式または二環式のヘテロシクリルは、オキソ、C₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-C1、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、ここで、任意のC₁～₆アルキル、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、C₁～₆アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-C1、-Br、-I、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

(R^h) $-S(O)_2-R^h$ 、 $-N(R^h)-S(O)-N(R^h)_2$ 、および $-N(R^h)-S(O)_2-N(R^h)_2$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロおよび C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

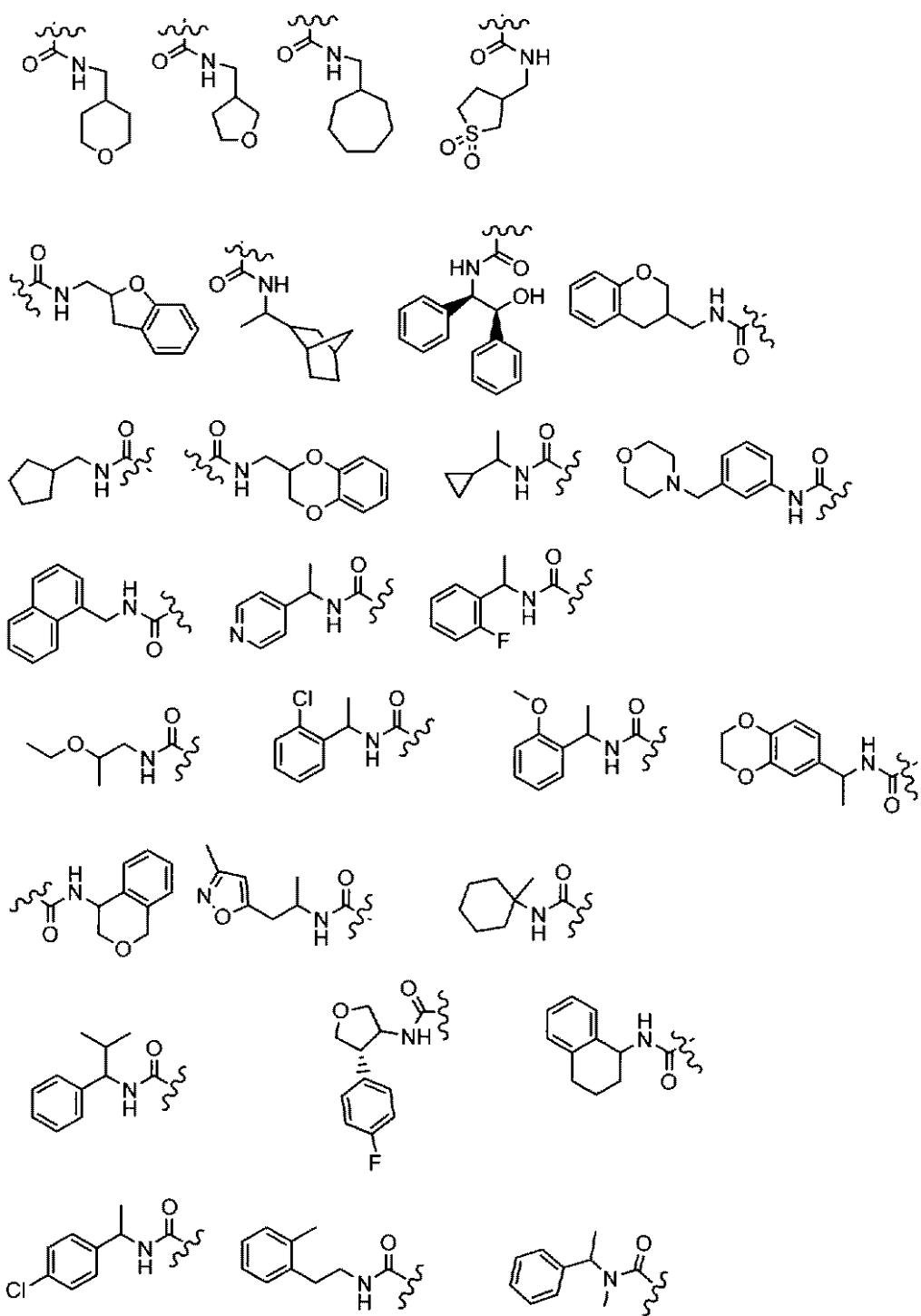
【請求項24】

$-C(=O)NR^cR^d$ が、

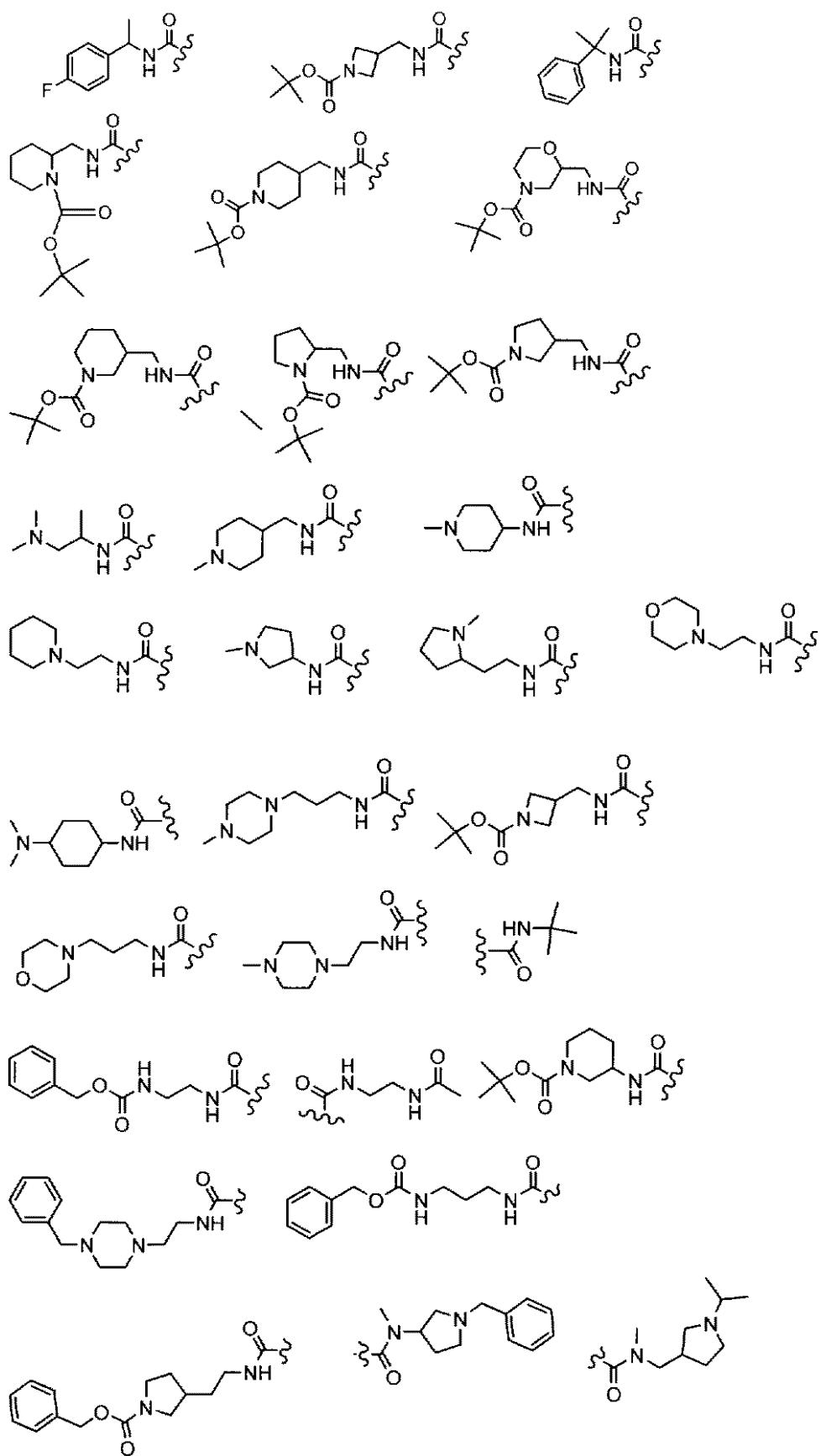
【化164】



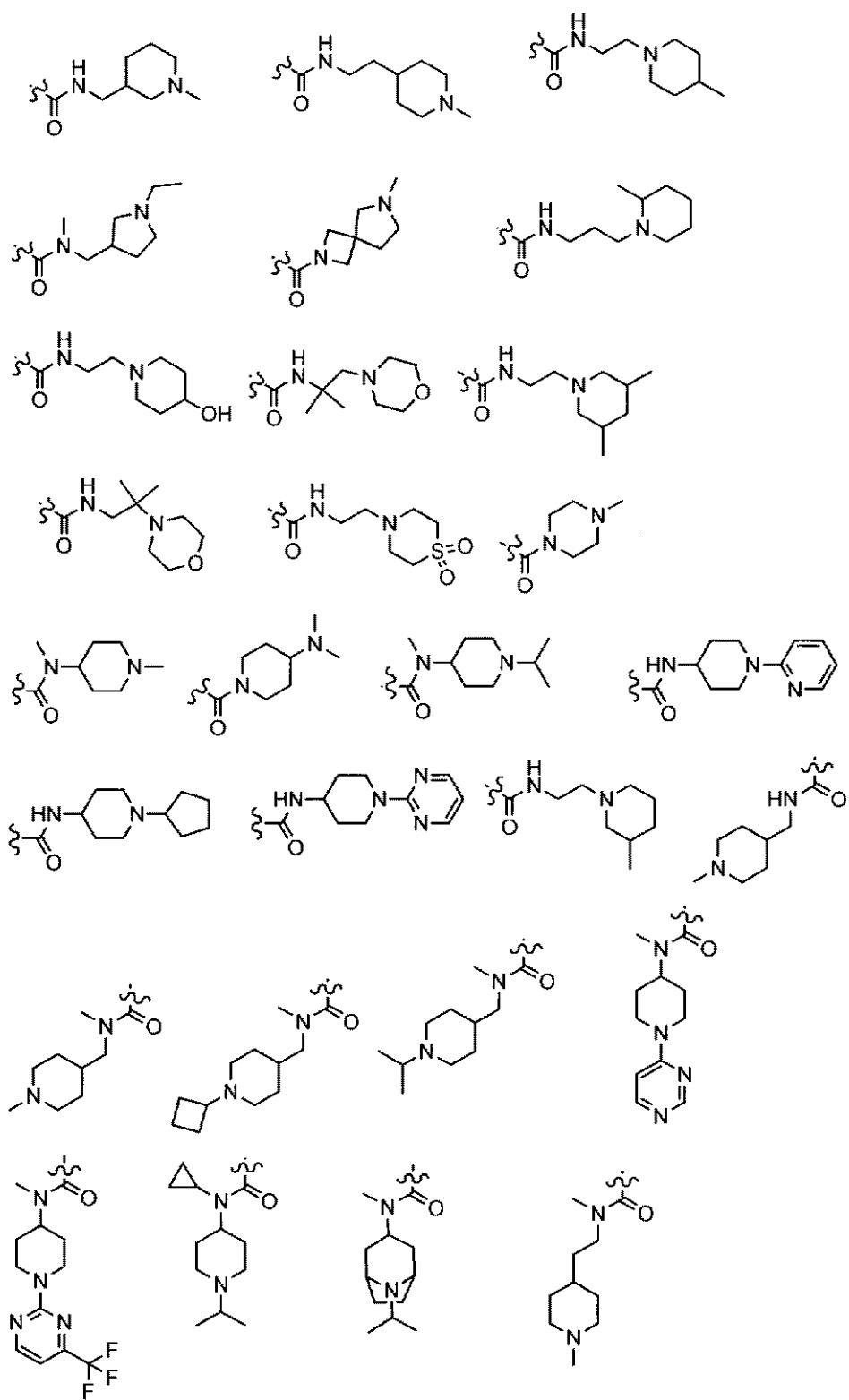
【化 1 6 5】



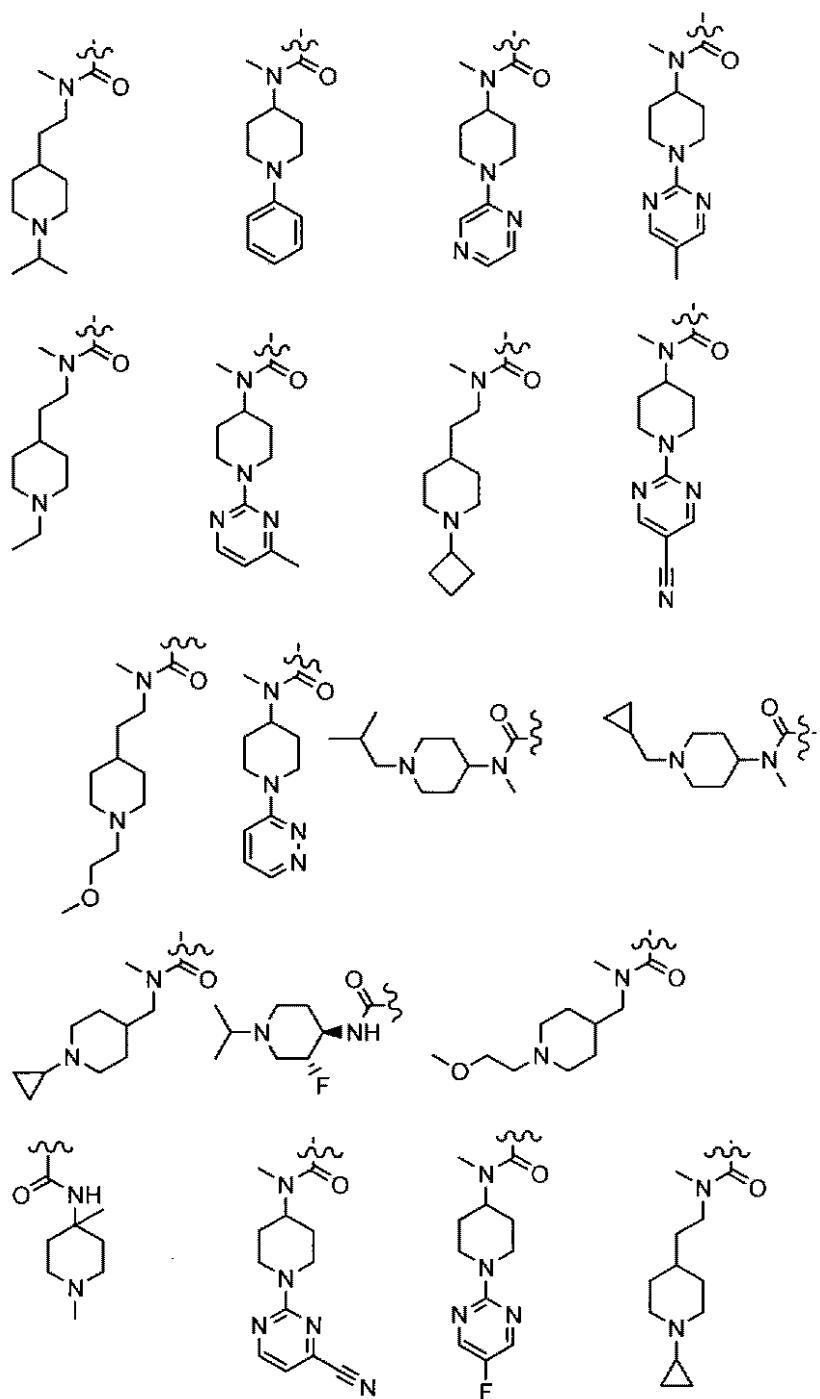
【化 1 6 6】



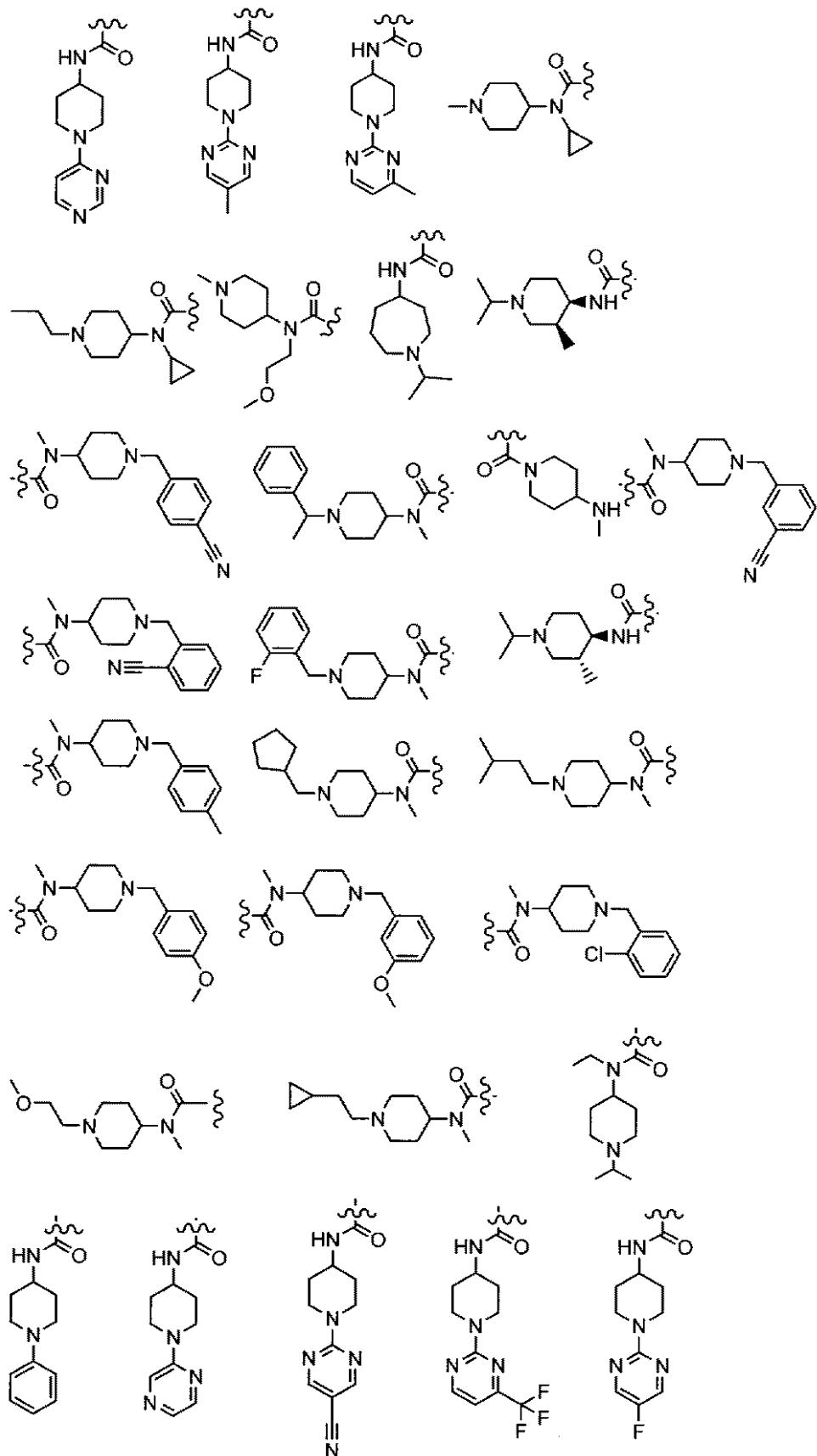
【化 1 6 7】



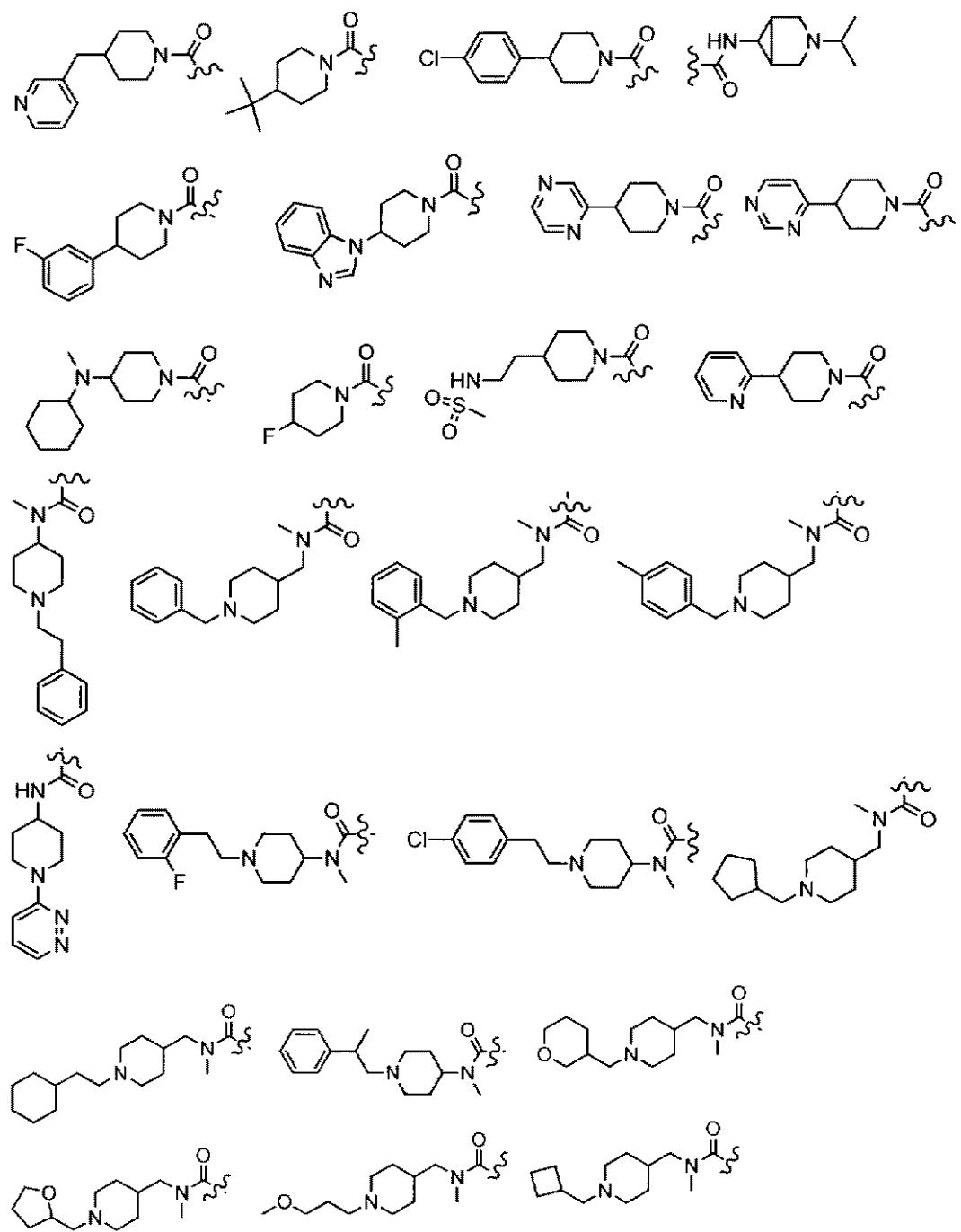
【化 1 6 8】



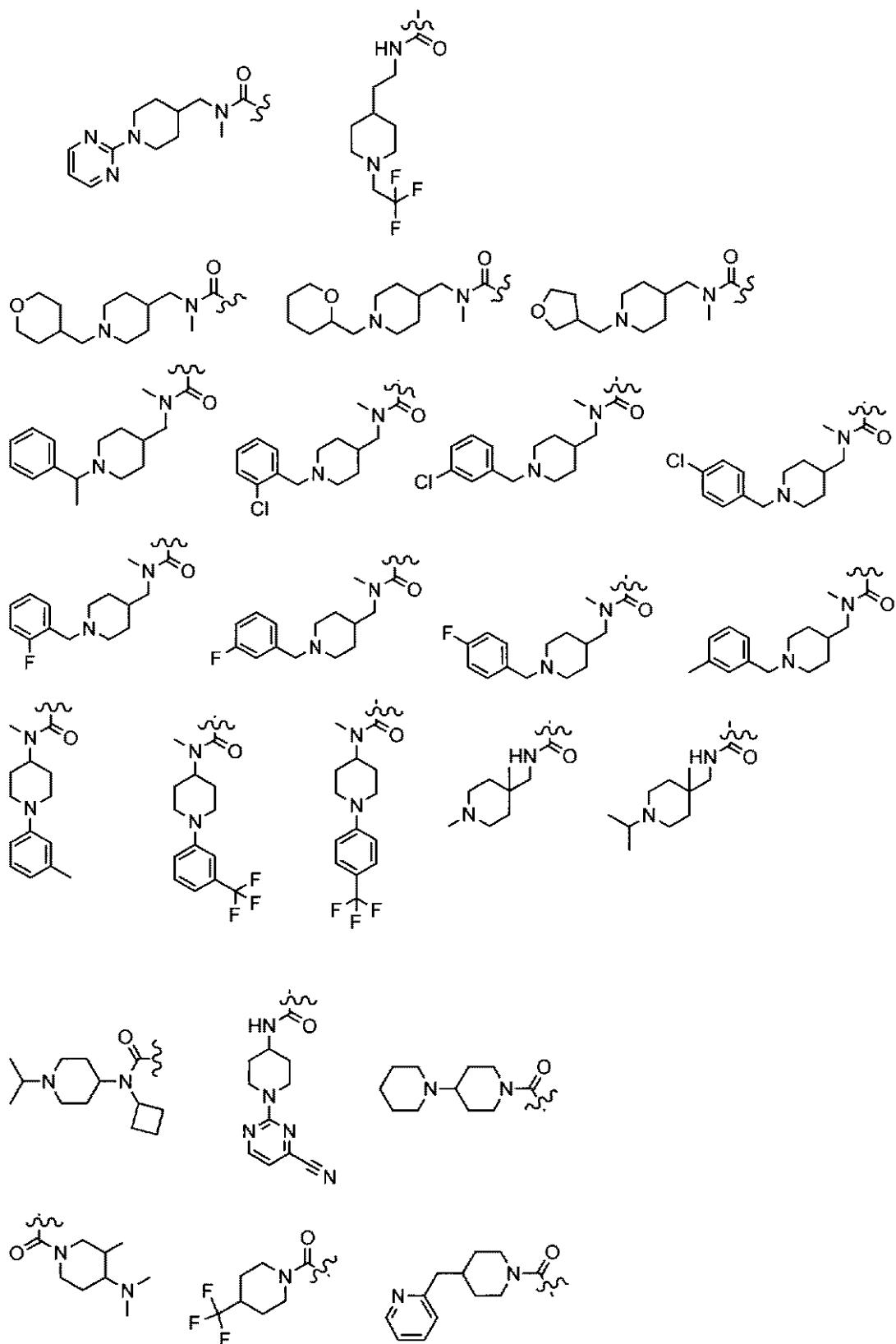
【化 169】



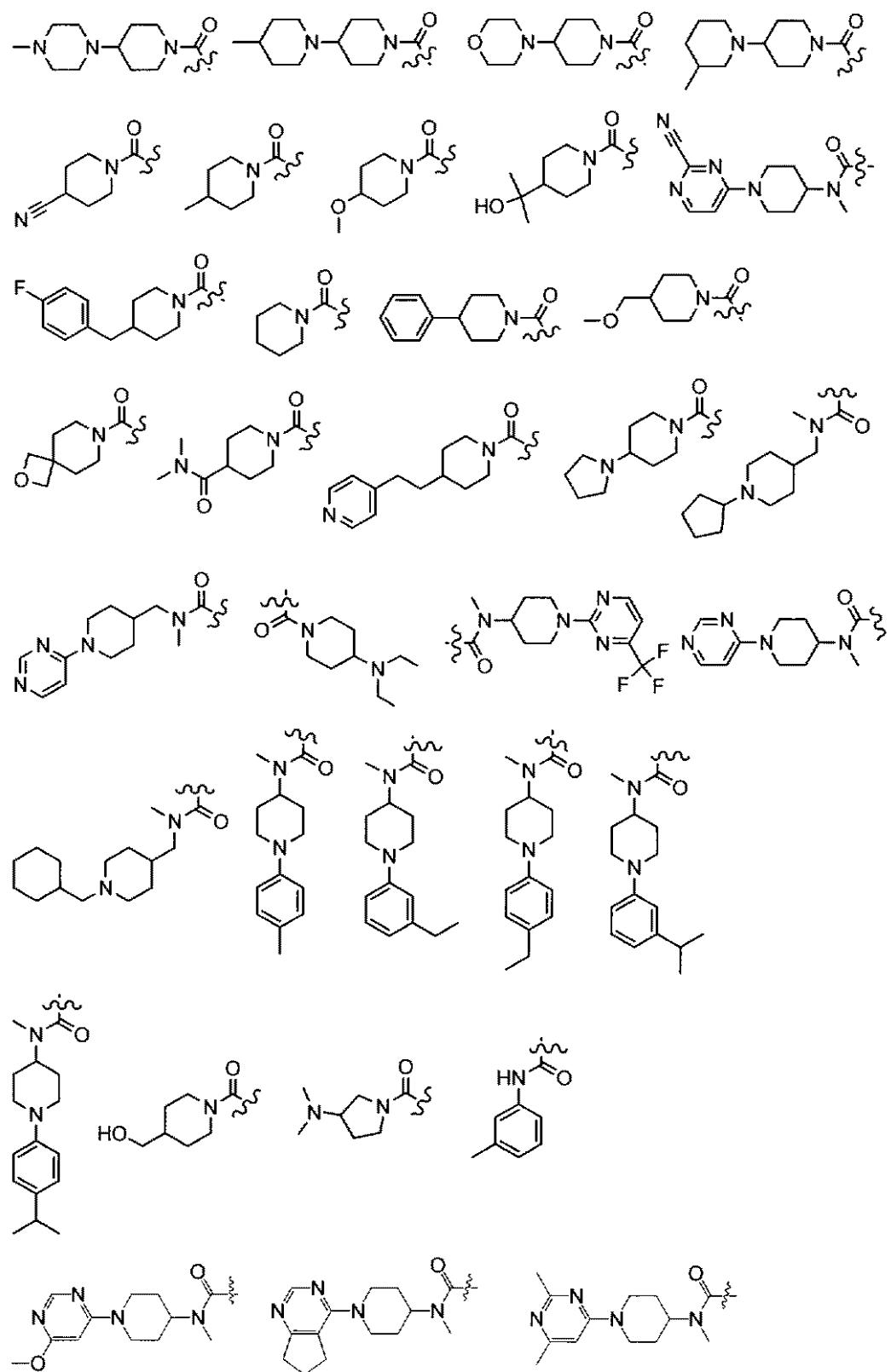
【化 1 7 0 】



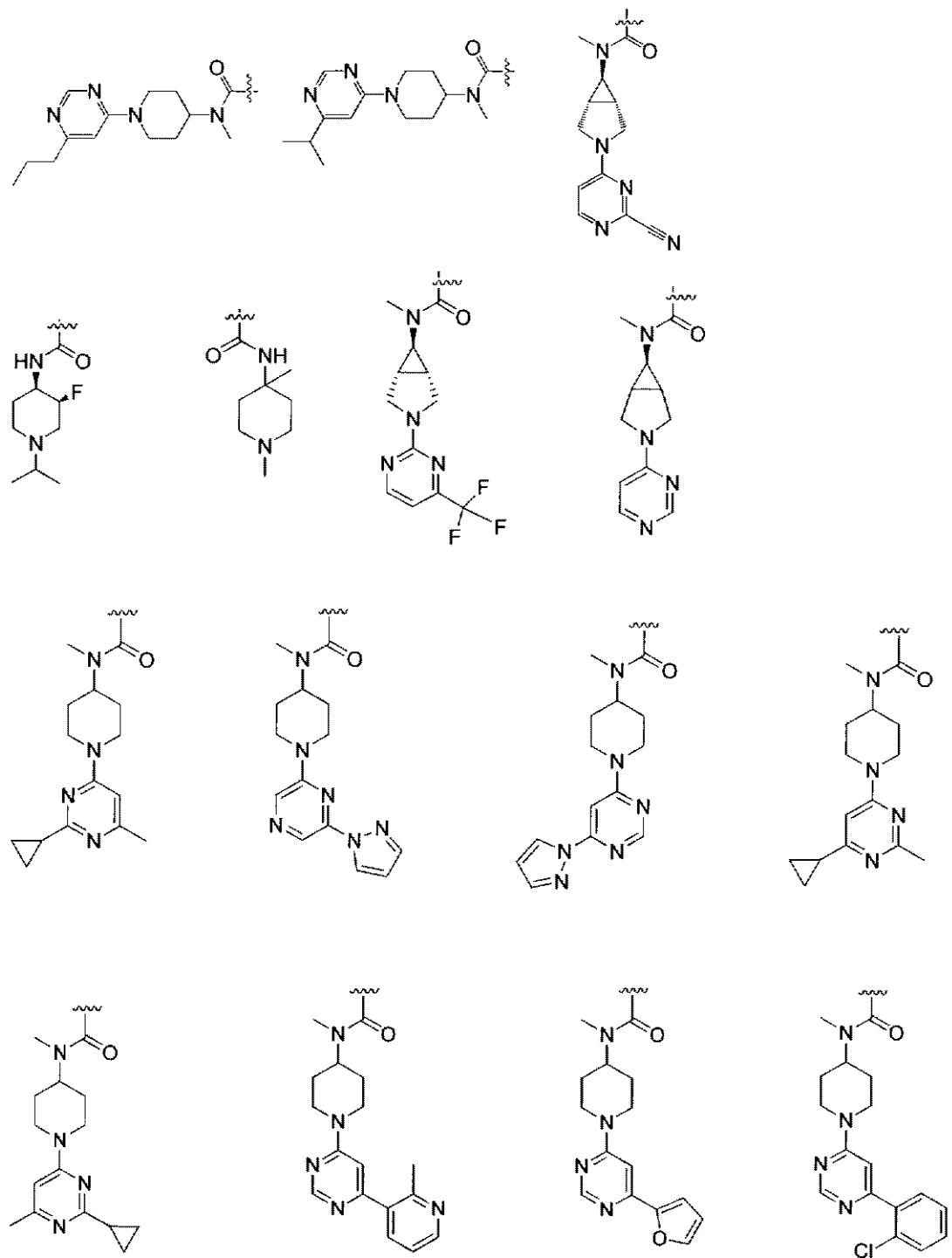
【化 171】



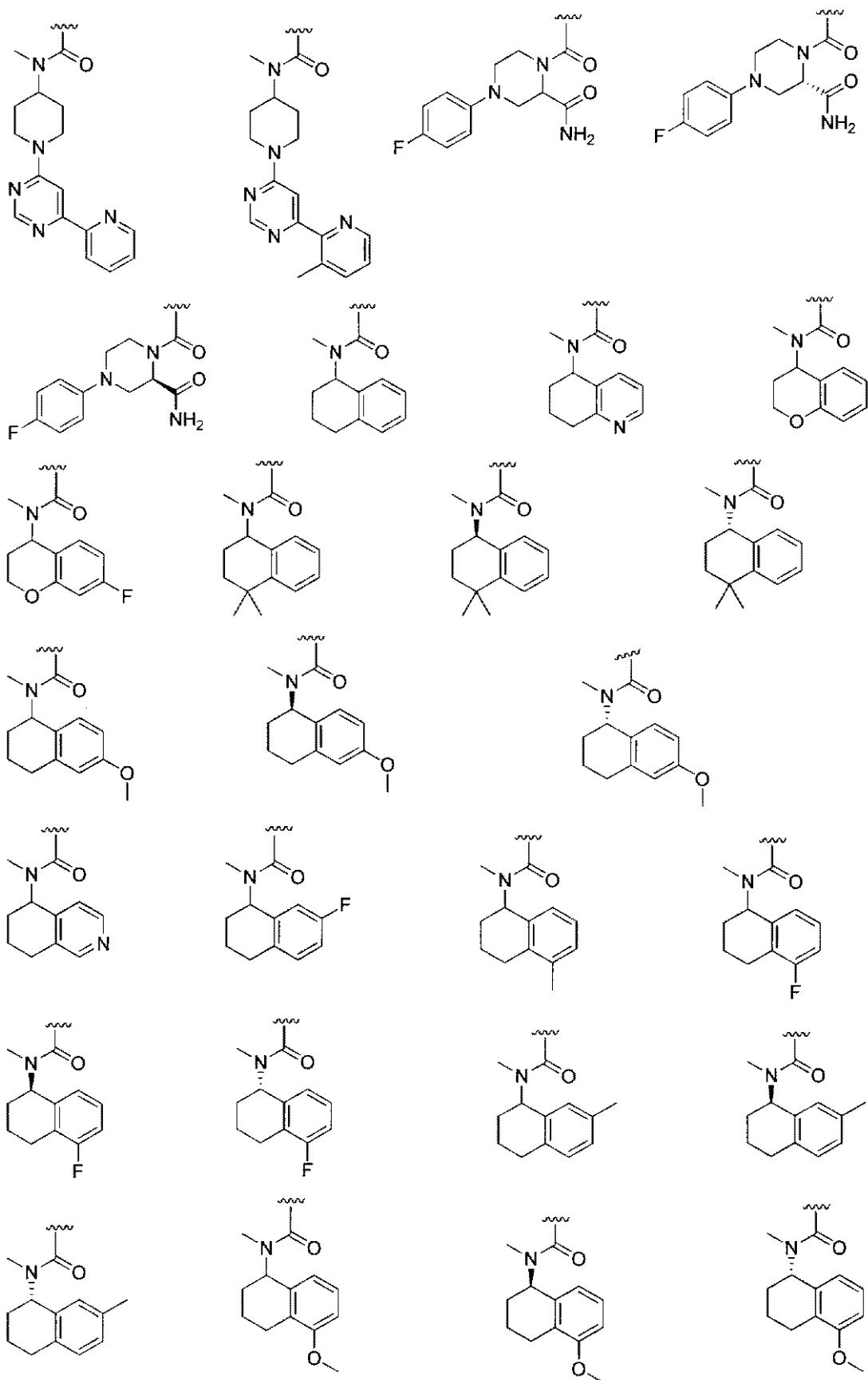
【化 172】



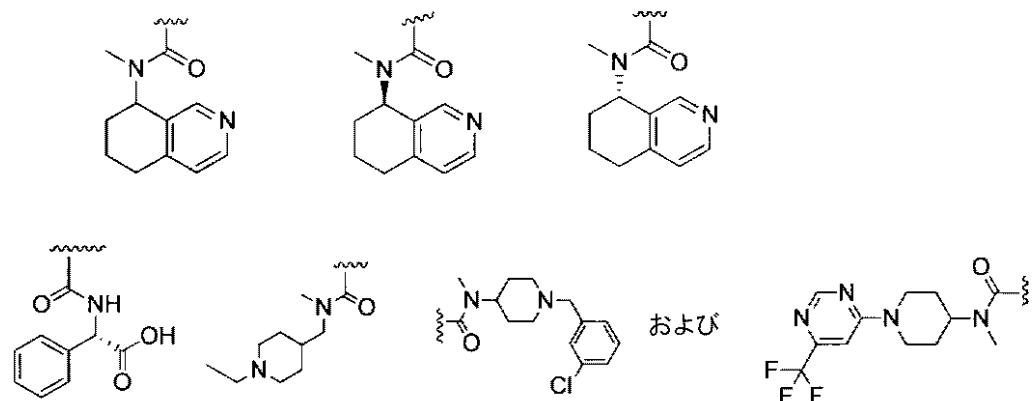
【化 1 7 3】



【化 1 7 4】



【化175】

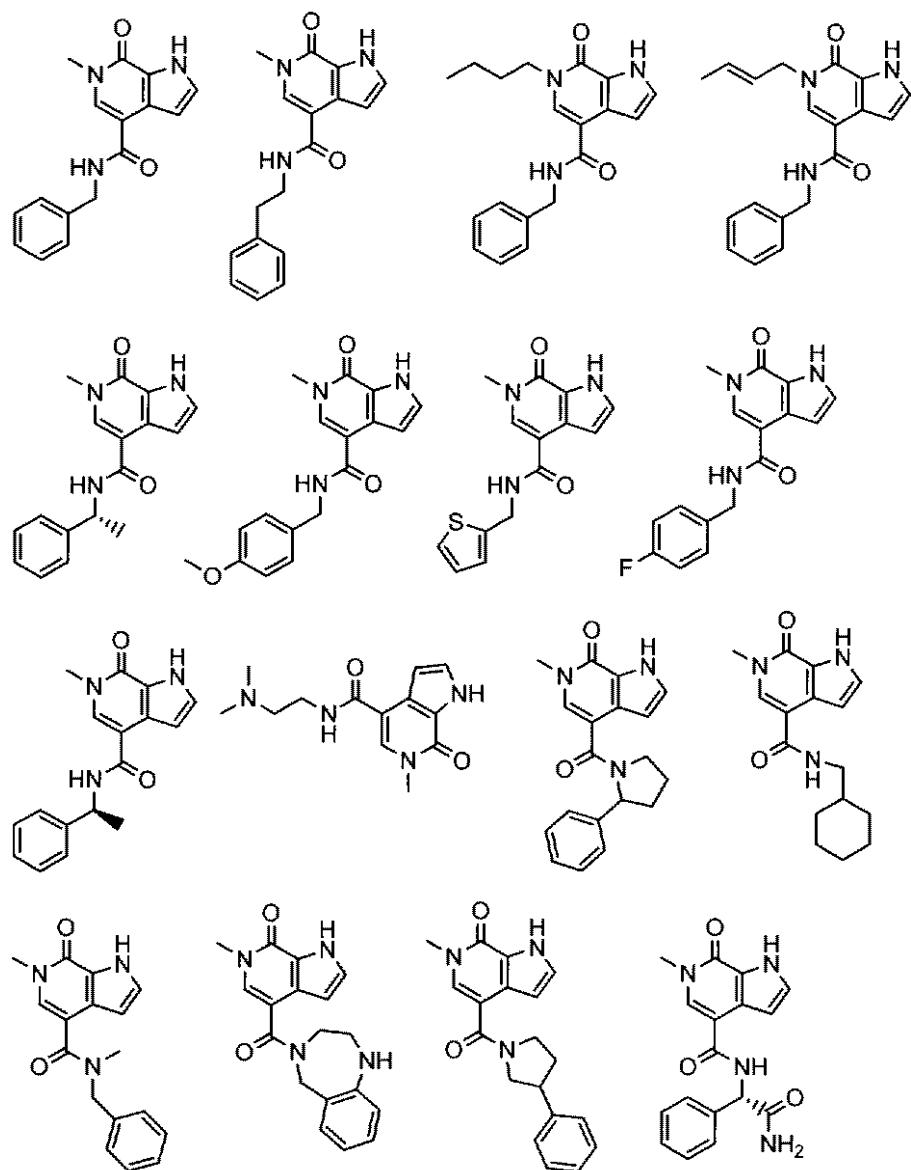


から選択される、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

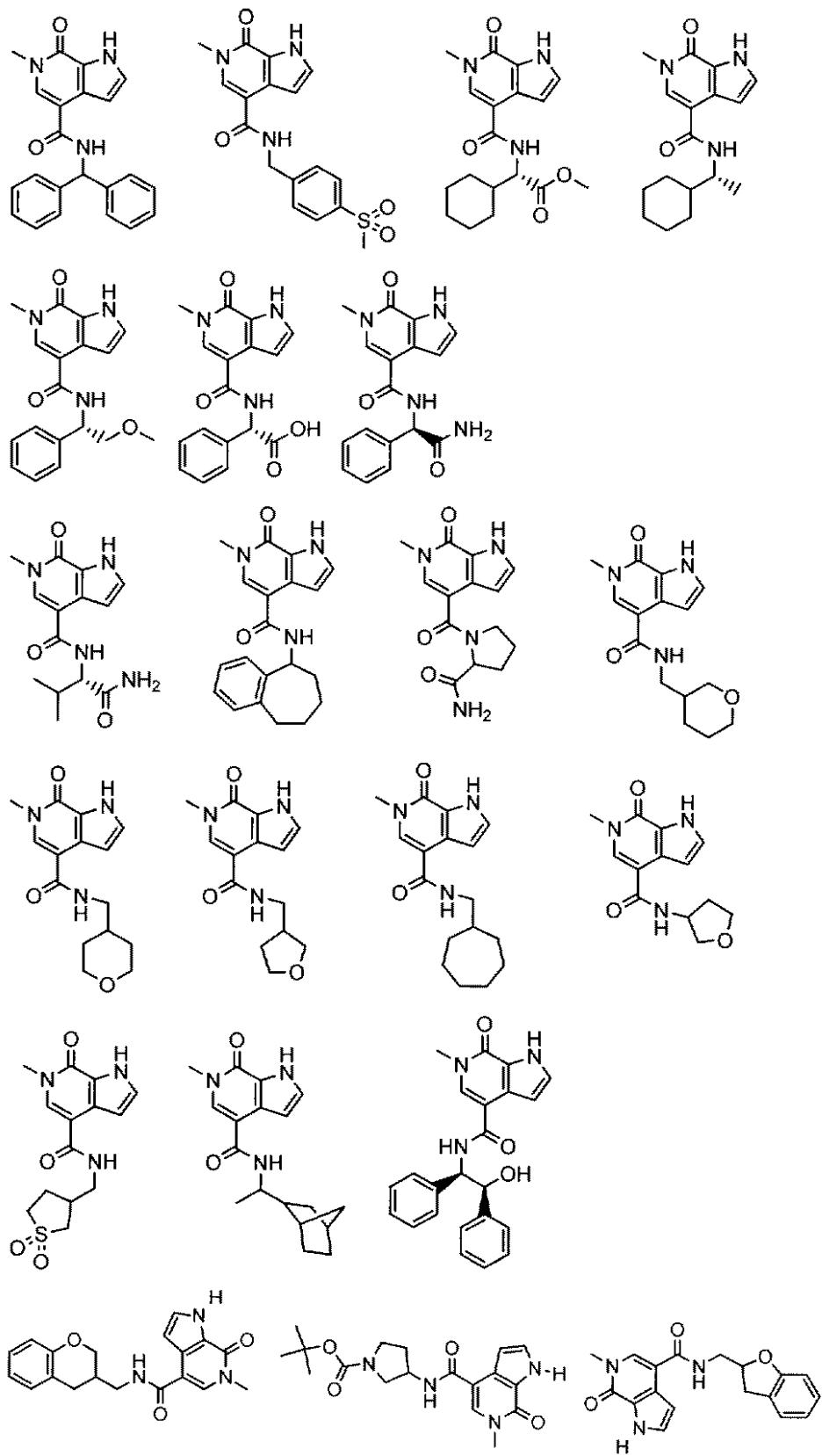
【請求項25】

以下の

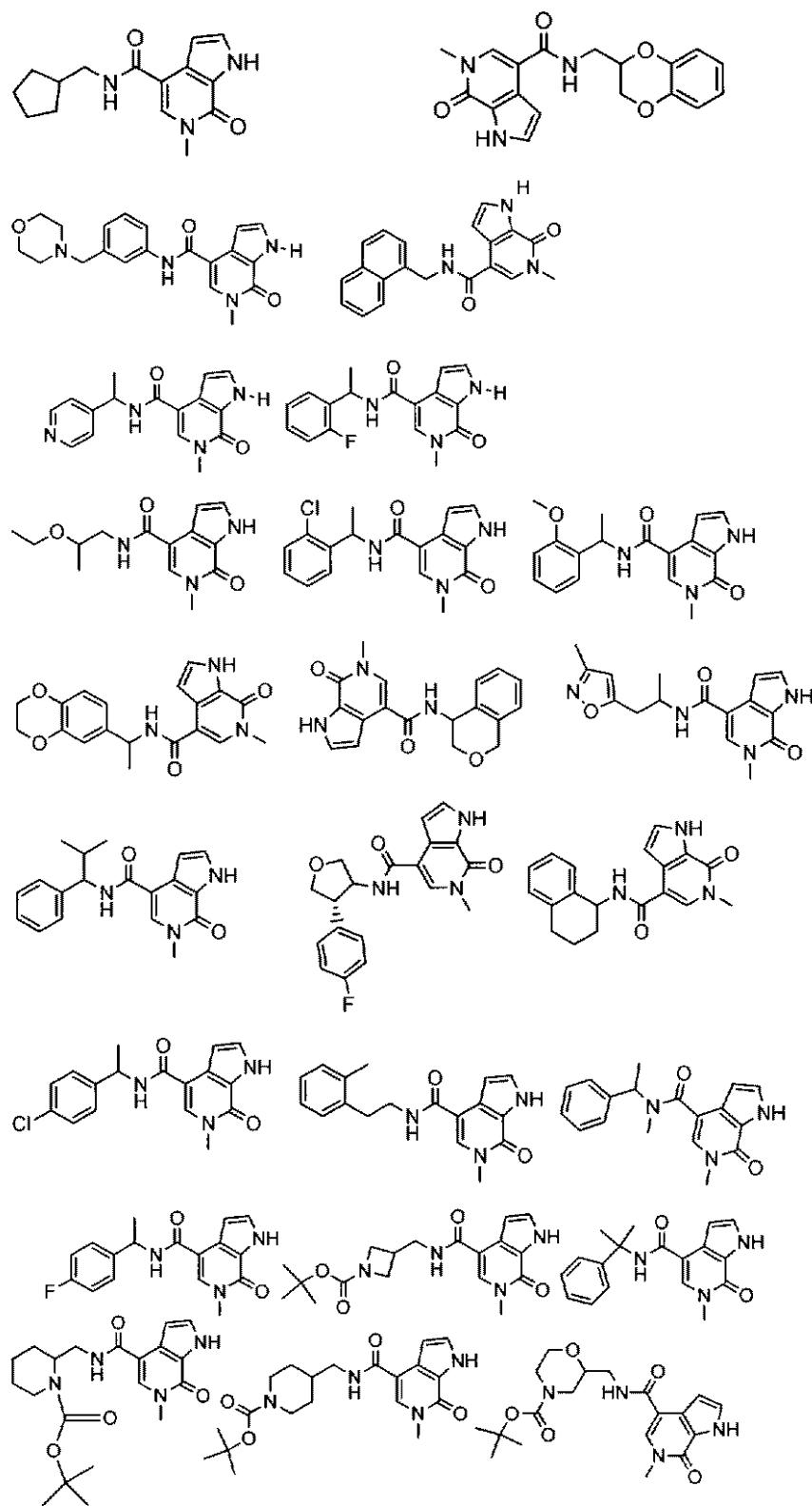
【化 1 7 6】



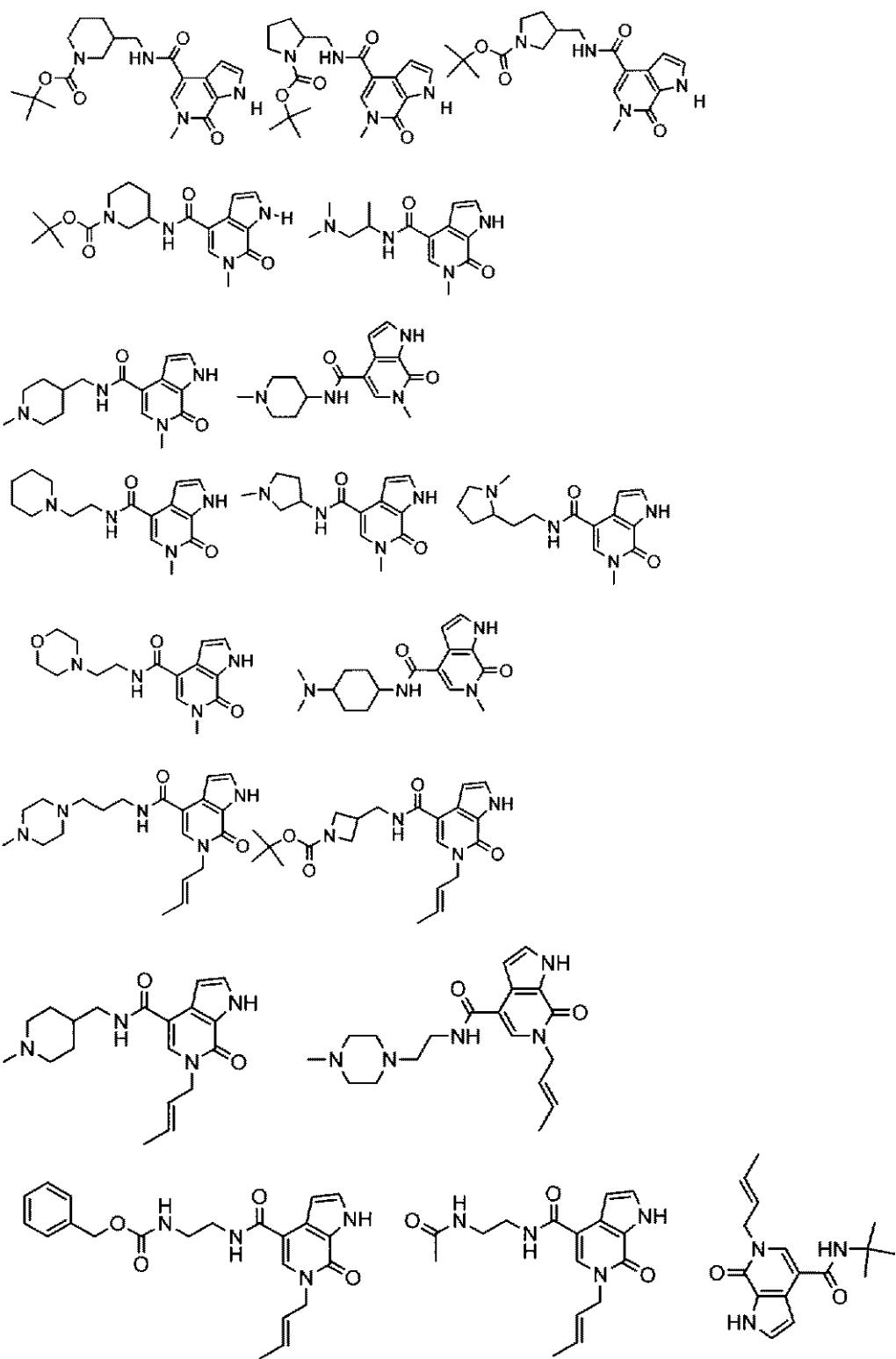
【化 1 7 7 】



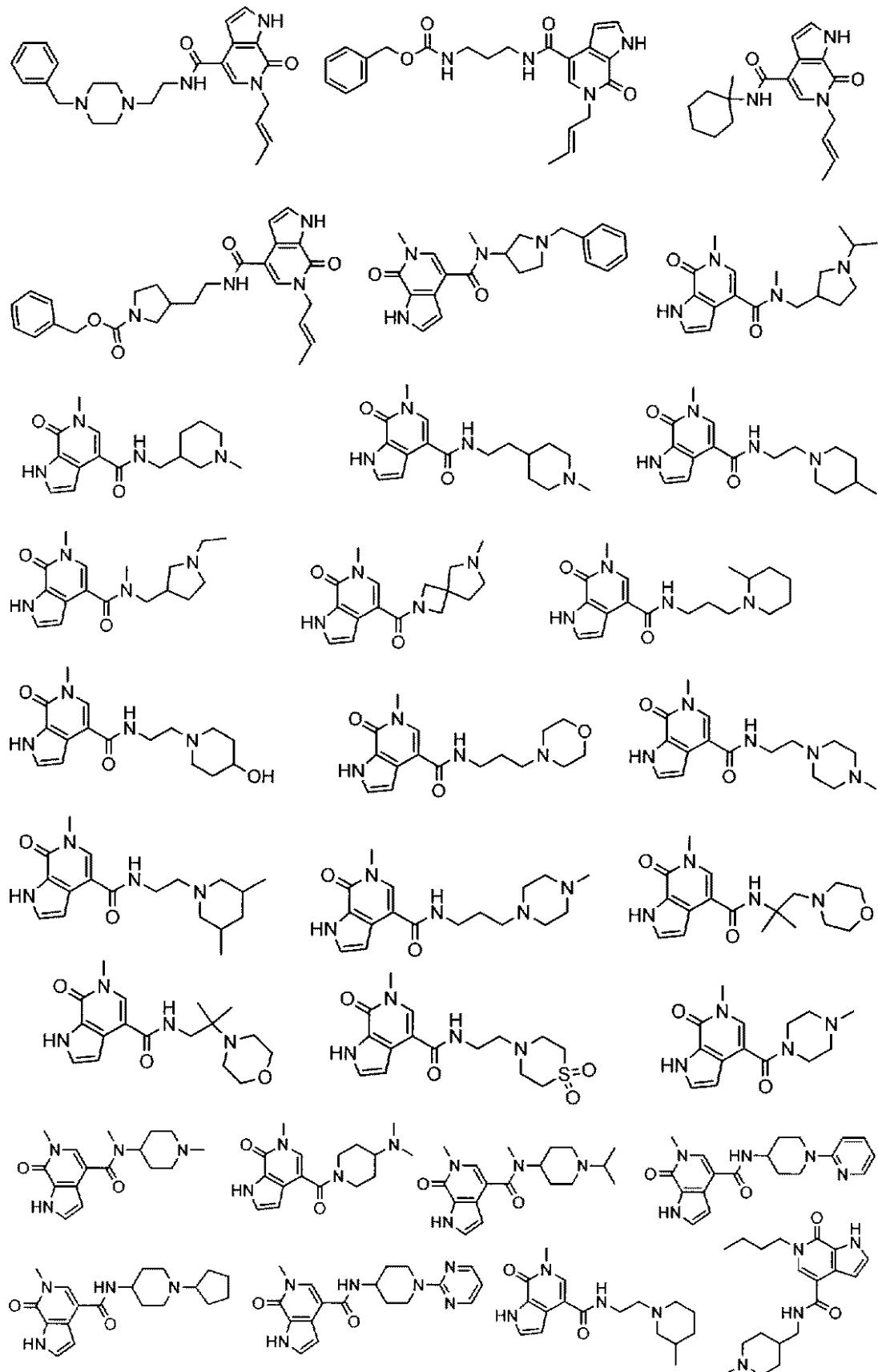
【化 1 7 8】



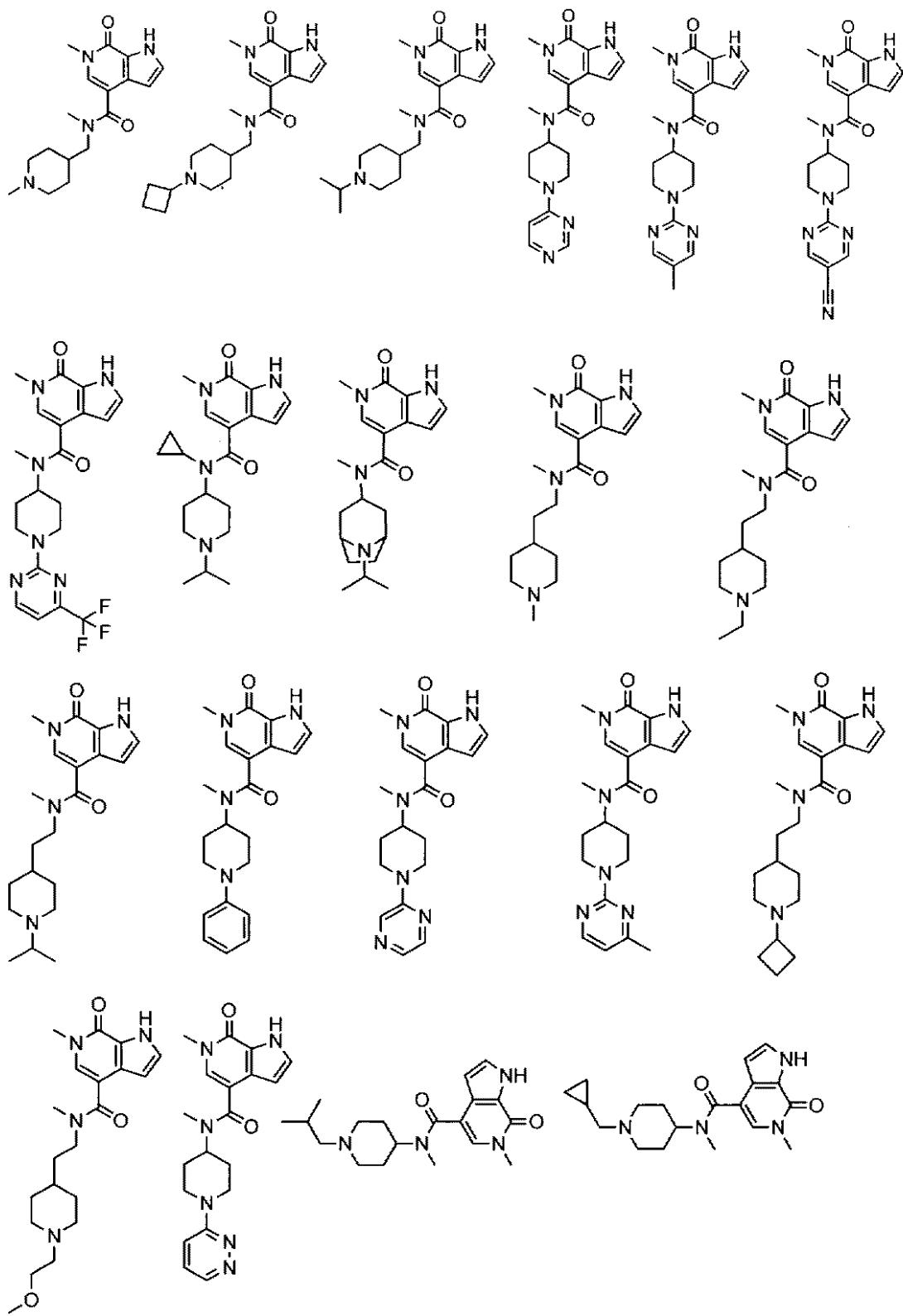
【化 1 7 9】



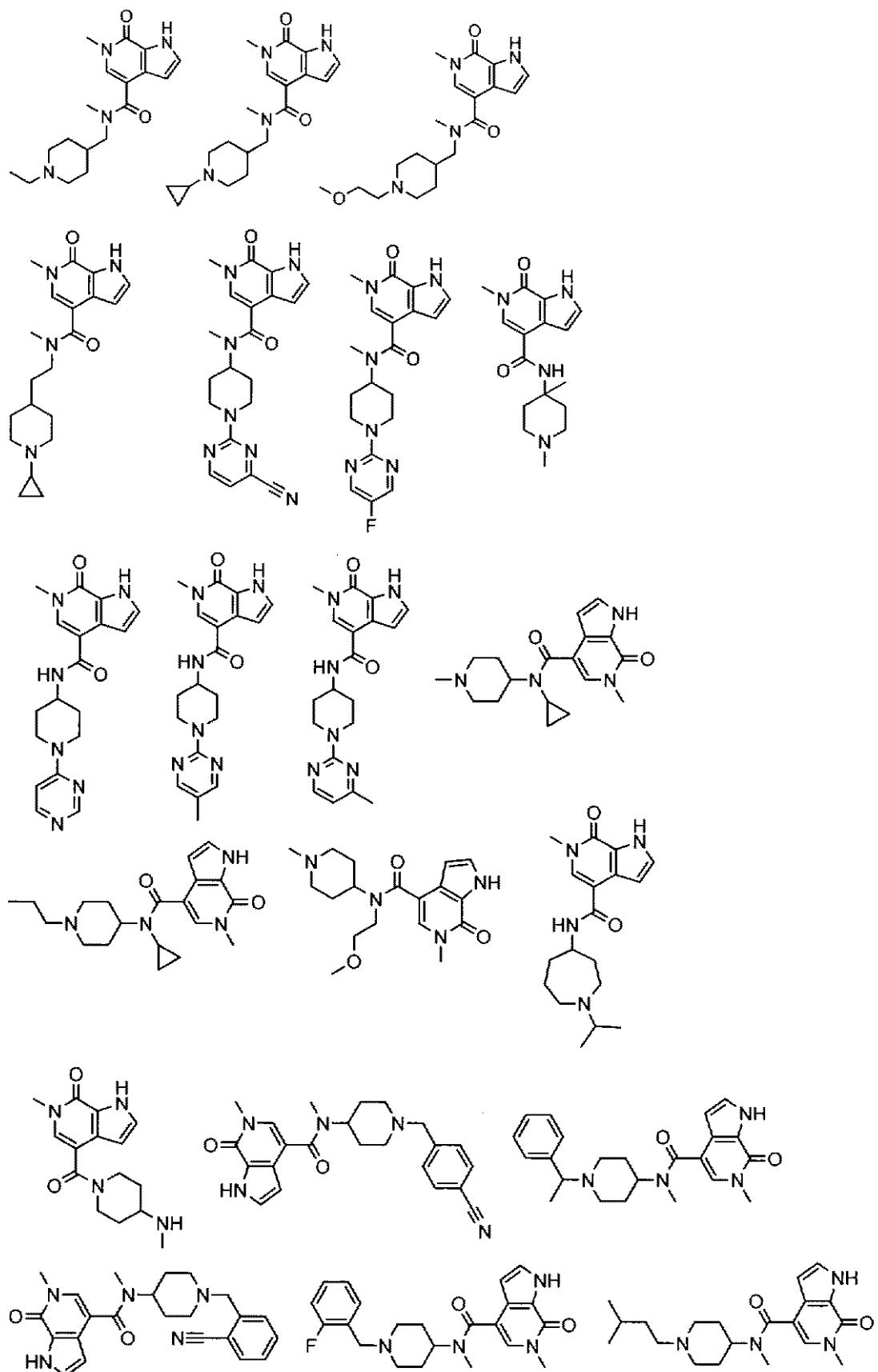
【化 1 8 0】



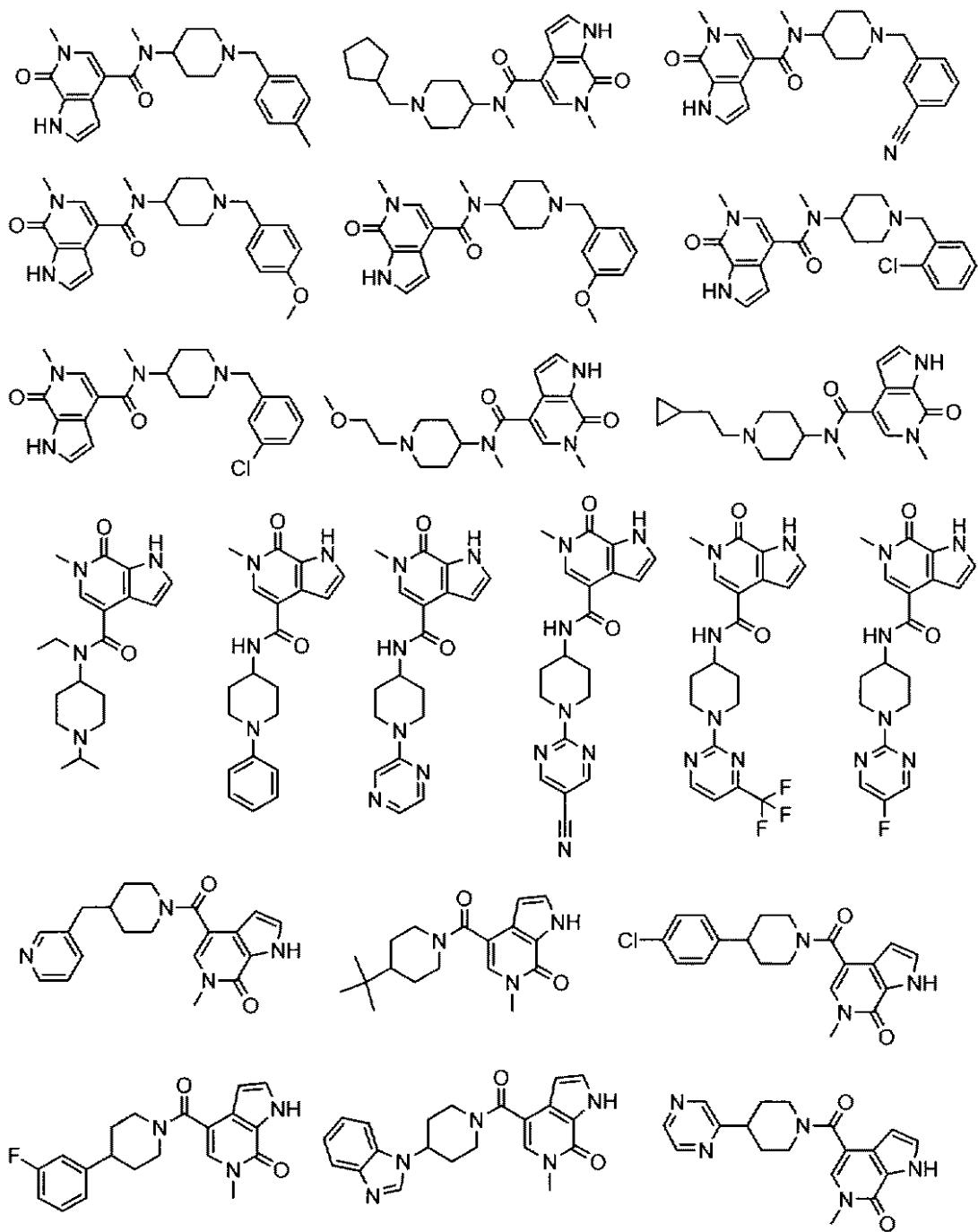
【化 1 8 1 】



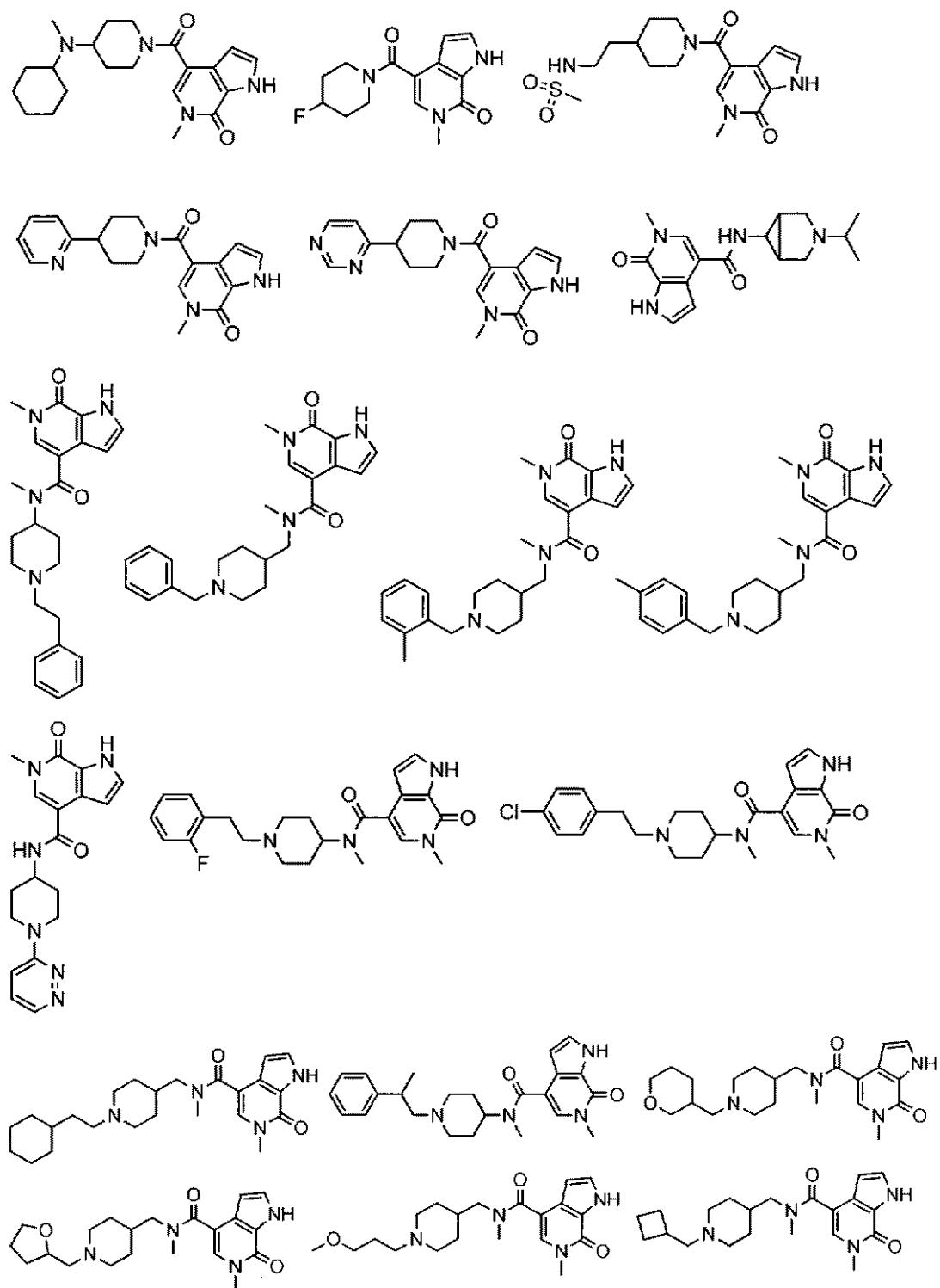
【化 1 8 2】



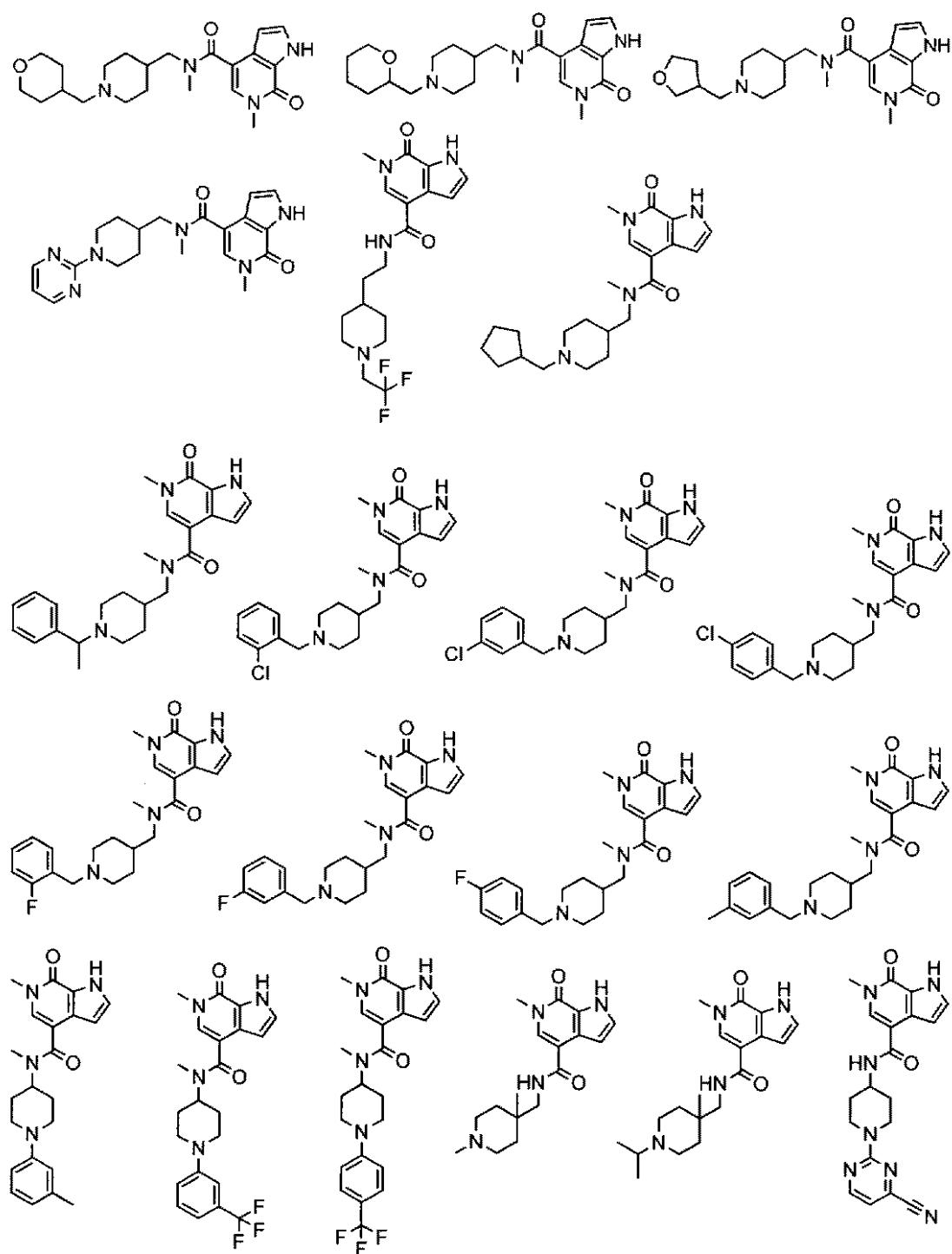
【化 1 8 3】



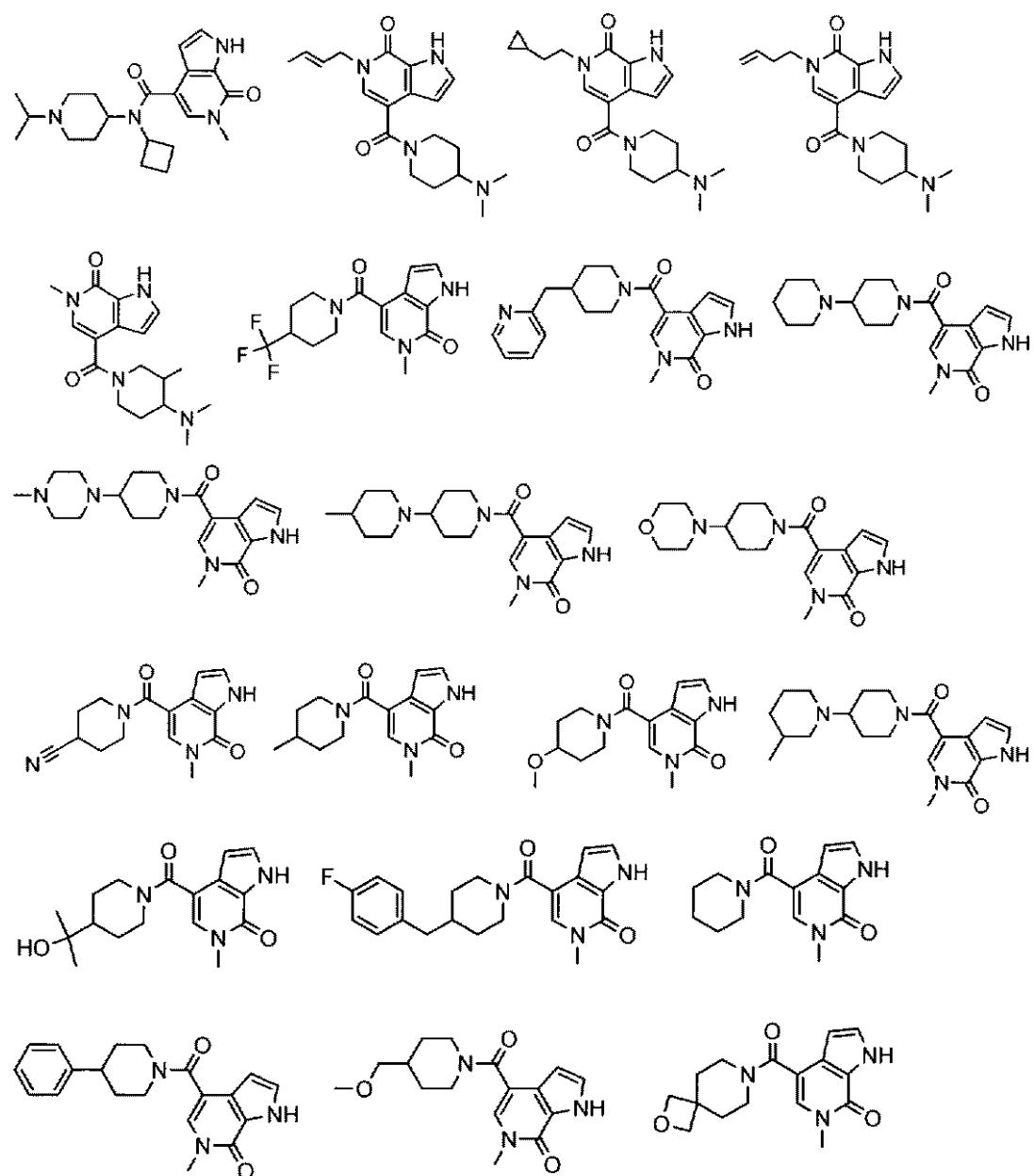
【化 1 8 4】



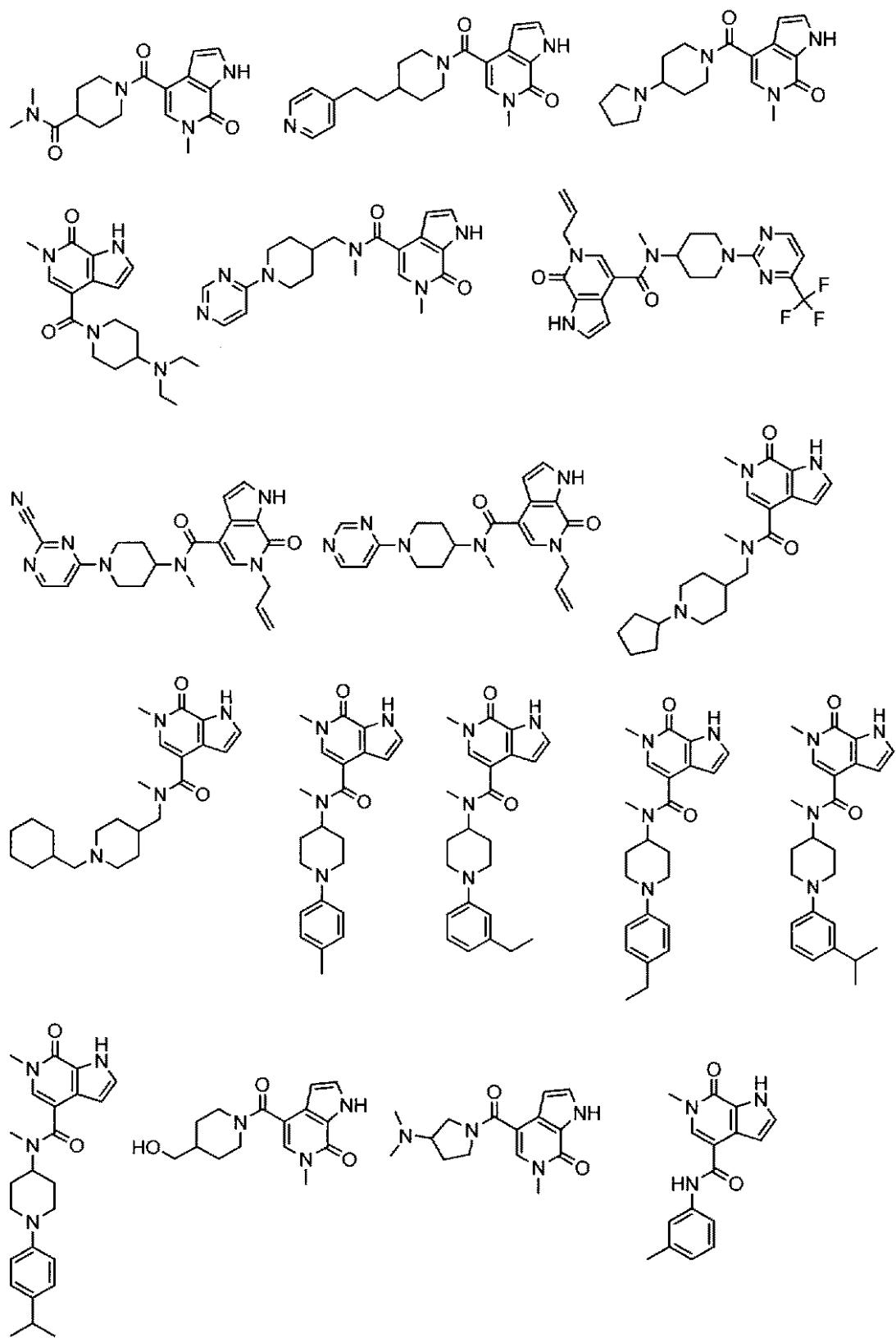
【化 1 8 5】



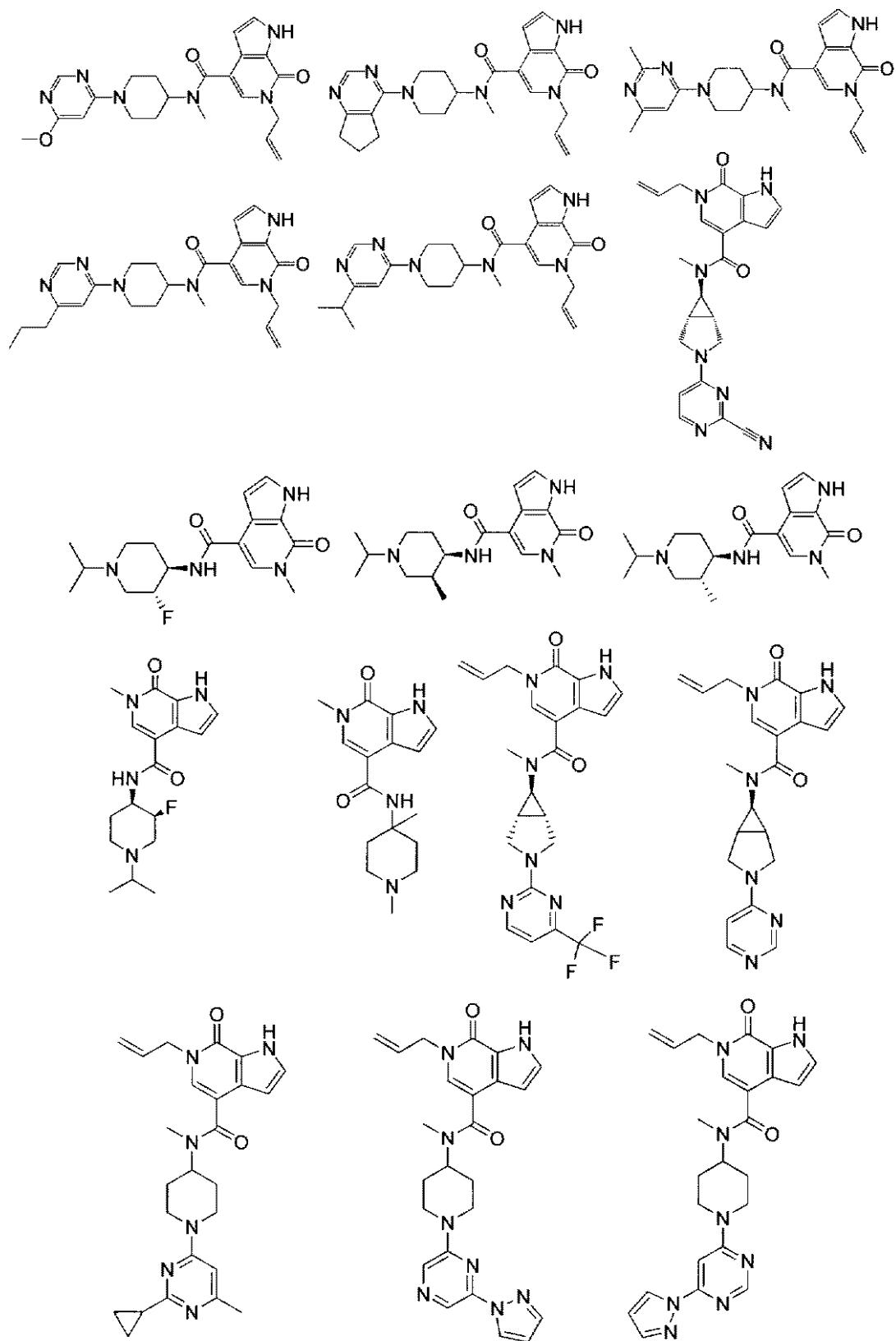
【化 1 8 6 】



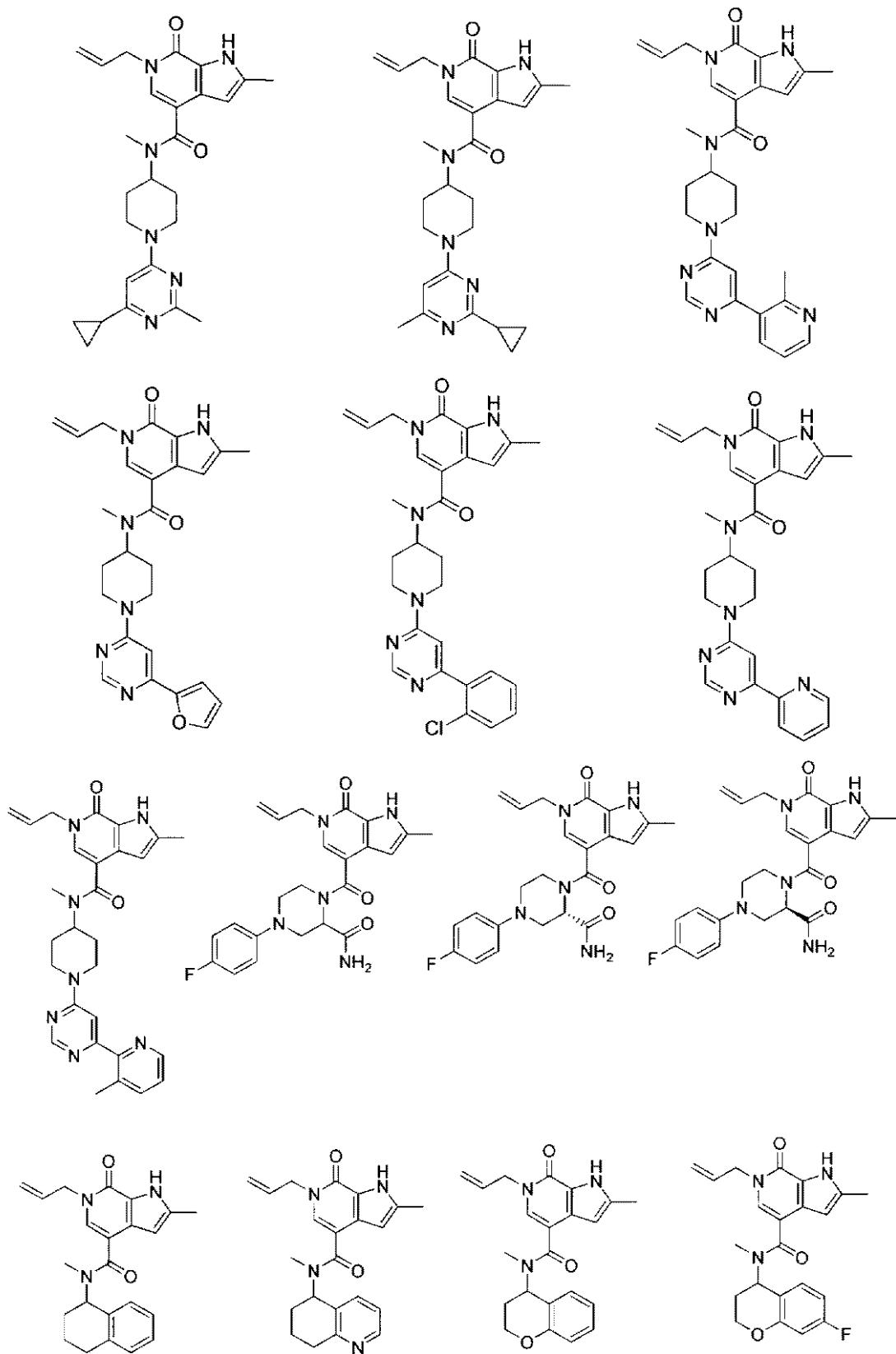
【化 1 8 7】



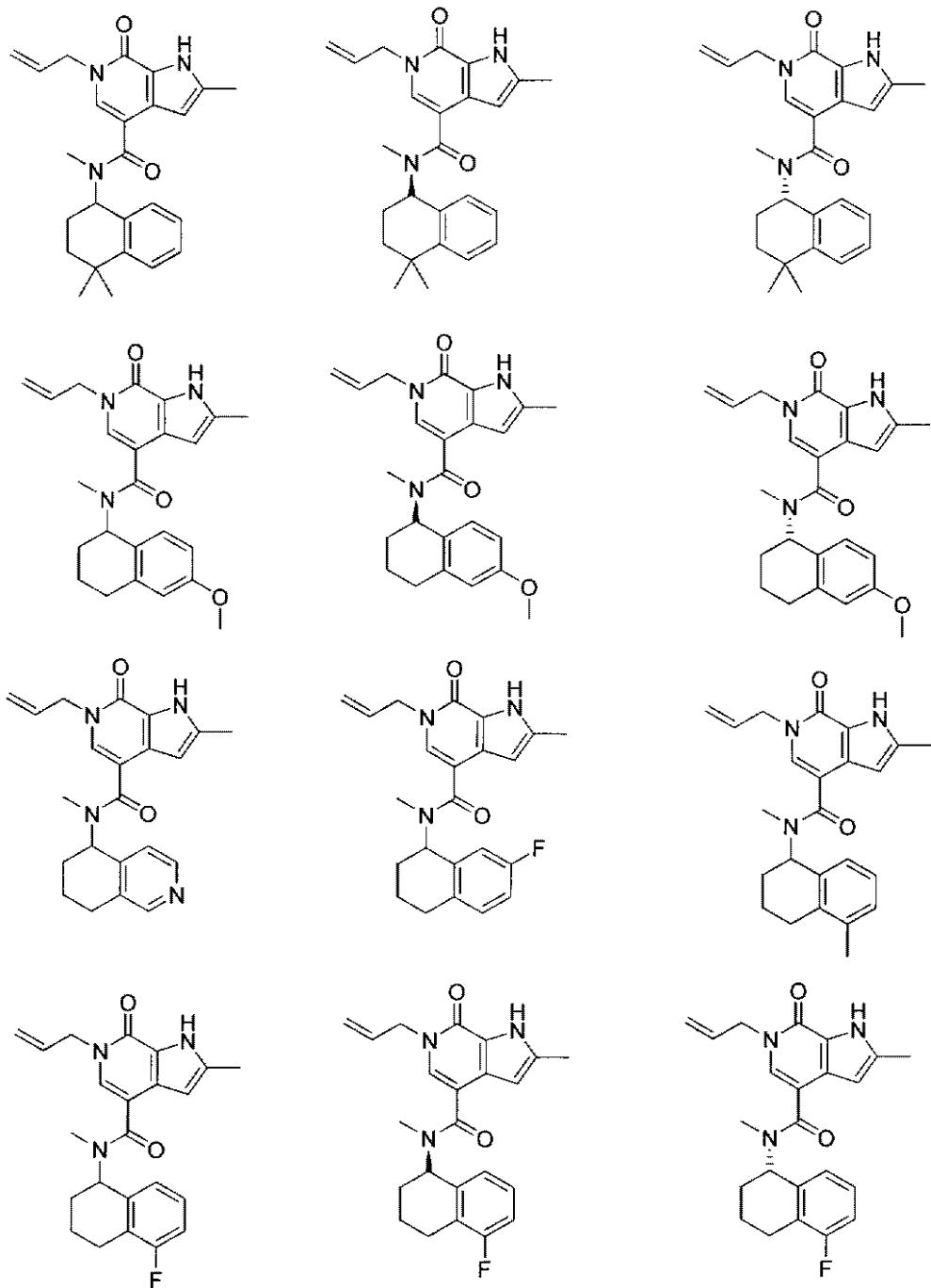
【化 1 8 8】



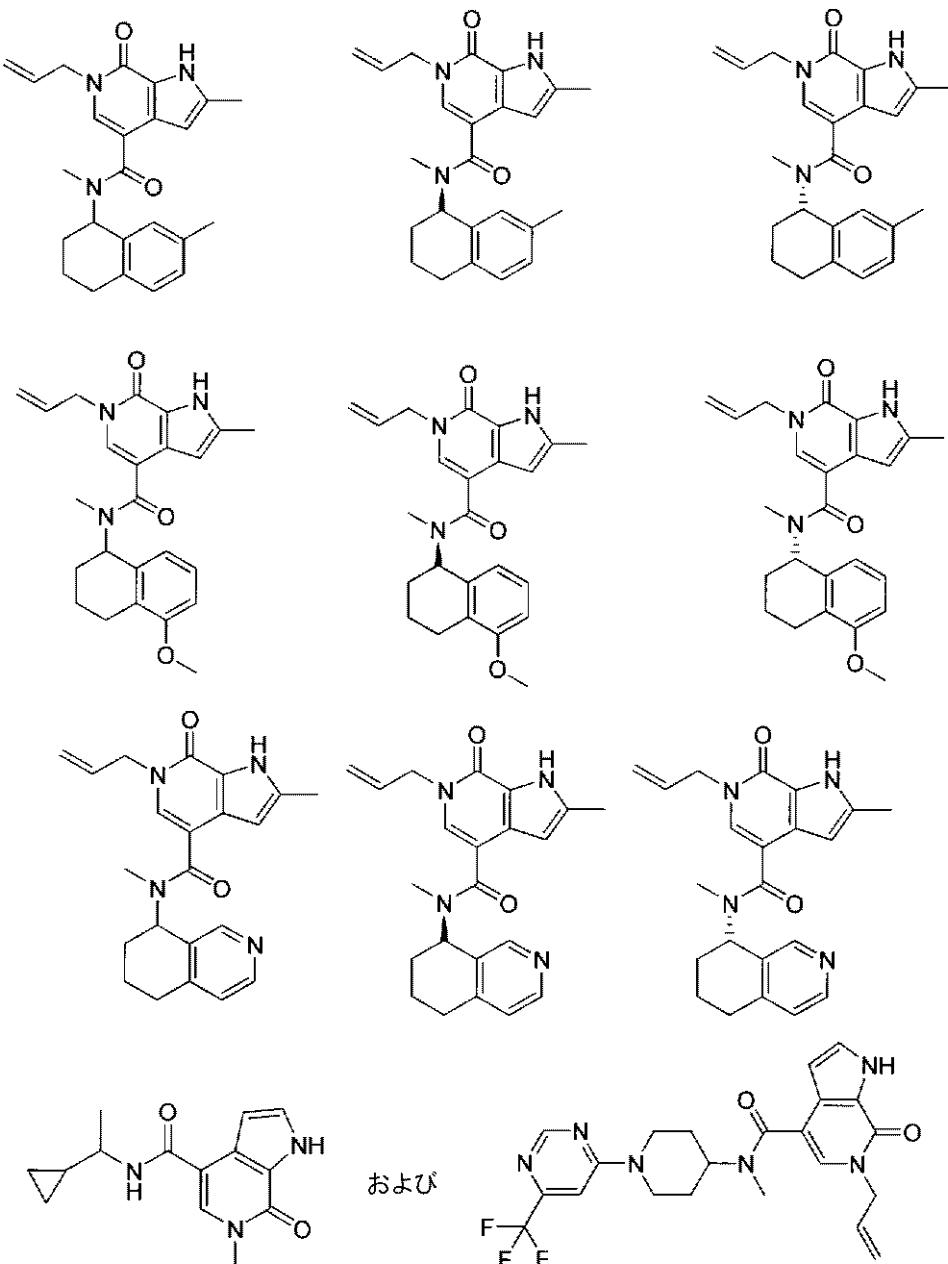
【化 1 8 9】



【化 1 9 0】



【化191】



から選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項26】

請求項1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

【請求項27】

さらなる治療剤と組み合わせた請求項26に記載の組成物。

【請求項28】

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、請求項27に記載の組成物。

【請求項29】

動物におけるプロモドメイン媒介障害を処置するための、請求項1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項30】

前記障害が、がん、炎症性障害、または自己免疫疾患である、請求項29に記載の組成物

。

【請求項 3 1】

前記がんが、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髓球性白血病、急性T細胞白血病、基底細胞癌、胆管癌、膀胱がん、脳がん、乳がん、気管支原性癌、子宮頸がん、軟骨肉腫、脊索腫、緘毛癌、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髓球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸がん、結腸直腸がん、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌、子宮内膜がん、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌、赤白血病、食道がん、エストロゲン受容体陽性乳がん、本態性血小板血症、ユーリング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、胚細胞精巣がん、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部がん、血管芽細胞腫、ヘパトーマ、肝細胞がん、ホルモン非感受性前立腺がん、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺がん、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T細胞またはB細胞起源のリンパ系悪性疾患、髓様癌、髓芽腫、黒色腫、髓膜腫、中皮腫、多発性骨髓腫、骨髓性白血病、骨髓腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、NUTミッドラインカルシノーマ(NMC)、非小細胞肺がん、乏突起膠腫、口腔がん、骨原性肉腫、卵巣がん、脾臓がん、乳頭腺癌、乳頭状癌、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺がん、直腸がん、腎細胞癌、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌、セミノーマ、皮膚がん、小細胞性肺癌、固形腫瘍(癌腫および肉腫)、小細胞肺がん、胃がん、扁平上皮癌、滑膜腫、汗腺癌、甲状腺がん、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮がん、およびウィルムス腫瘍から選択される、請求項30に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記がんが、肺がん、乳がん、脾臓がん、結腸直腸がん、および黒色腫から選択される、請求項30に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記炎症性障害または前記自己免疫疾患が、アジソン病、急性痛風、強直性脊椎炎、喘息、アテローム性動脈硬化症、ベーチェット病、水疱性皮膚疾患、慢性閉塞性肺疾患、クローン病、皮膚炎、湿疹、巨細胞動脈炎、線維症、糸球体腎炎、肝血管閉塞、肝炎、下垂体炎、免疫不全症候群、炎症性腸疾患、川崎病、ループス腎炎、多発性硬化症、心筋炎、筋炎、腎炎、移植臓器拒絶、骨関節炎、脾臓炎、心包炎、結節性多発性動脈炎、肺臓炎、原発性胆汁性肝硬変、乾癬、乾癬性関節炎、関節リウマチ、強膜炎、硬化性胆管炎、敗血症、全身性エリテマトーデス、高安動脈炎、中毒性ショック、甲状腺炎、I型糖尿病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、白斑、脈管炎、およびウェゲナー肉芽腫症から選択される、請求項30に記載の組成物。

【請求項 3 4】

前記プロモドメインが、ASH1L、ATAD2、ATAD2B、BAZ1A、BAZ1B、BAZ2A、BAZ2B、BPTF、BRD1、BRD2、BRD3、BRD4、BRD7、BRD8、BRD9、BRDT、BRPF1、BRPF3、BRWD1、BRWD3、CECR2、CREBBP(aka、CBP)、EP300、GCN5L2、KIAA2026、MLL、MLL4、PBRM、PCAF、PHIP、SMARCA2、SMARCA4、SP100、SP110、SP140、SP140L、TAF1、TAF1L、TRIM24、TRIM28、TRIM33、TRIM66、ZMYND8、およびZMYND11から選択される、請求項29に記載の組成物。

【請求項 3 5】

医薬療法における使用のための、請求項1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 3 6】

プロモドメイン媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、請求項1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物。

【請求項 3 7】

動物におけるプロモドメイン媒介障害の処置のための医薬を調製するための、請求項1～

25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項38】

動物における細胞毒性剤を含むがん処置の有効性を増大させるための、有効量の請求項1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を含む、組成物。

【請求項39】

前記組成物が、前記細胞毒性剤と、前記動物に共投与されることを特徴とする、請求項38に記載の組成物。

【請求項40】

動物における細胞毒性剤に対するがん耐性の発生を遅延させるまたは防止するための組成物であって、請求項1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を含む、組成物。

【請求項41】

動物におけるがん治療に対する応答の持続時間を延長させるための組成物であって、請求項1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を含み、該組成物は、該がん治療を受けている動物に投与されることを特徴とし、該組成物を投与したときの該がん治療に対する応答の持続時間が、該組成物を投与しない該がん治療に対する応答の持続時間を超えて延長される、組成物。

【請求項42】

個体におけるがんを処置するための組成物であって、請求項1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を含み、該組成物は、細胞毒性剤と、該個体に共投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項43】

前記細胞毒性剤が、抗微小管剤、白金配位錯体、アルキル化剤、抗生物質製剤、トポイソメラーゼIIインヒビター、代謝拮抗物質、トポイソメラーゼIインヒビター、ホルモンおよびホルモンアナログ、シグナル伝達経路インヒビター、非受容体チロシンキナーゼ血管形成インヒビター、免疫治療剤、アポトーシス促進剤、LDH-Aのインヒビター、脂肪酸合成のインヒビター、細胞周期シグナル伝達インヒビター、HDACインヒビター、プロテアソームインヒビター、およびがん代謝のインヒビターから選択される、請求項42に記載の組成物。

【請求項44】

前記細胞毒性剤がタキサンである、請求項42に記載の組成物。

【請求項45】

前記タキサンがパクリタキセルまたはドセタキセルである、請求項44に記載の組成物。

【請求項46】

前記細胞毒性剤が白金製剤である、請求項42に記載の組成物。

【請求項47】

前記細胞毒性剤がEGFRのアンタゴニストである、請求項42に記載の組成物。

【請求項48】

前記EGFRのアンタゴニストがN-(3-エチルフェニル)-6,7-ビス(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-アミンまたはその薬学的に許容され得る塩である、請求項47に記載の組成物。

【請求項49】

前記細胞毒性剤がRAFインヒビターである、請求項42に記載の組成物。

【請求項50】

前記RAFインヒビターがBRAFインヒビターまたはCRAFインヒビターである、請求項49に記載の組成物。

【請求項51】

前記RAFインヒビターがベムラフェニブである、請求項49に記載の組成物。

【請求項 5 2】

前記細胞毒性剤がP.I.3.K.インヒビターである、請求項4.2に記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 3 1 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 3 1 2 】

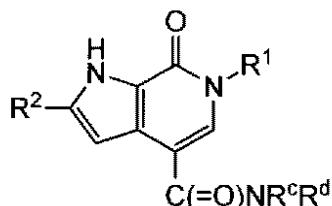
多数の実施形態を記載しているが、これらの実施例を、本明細書中に記載の化合物および方法を利用する他の実施形態を得るために変更することができる。したがって、本発明の範囲を、例で示した特定の実施形態ではなく添付の特許請求の範囲によって定義すべきである。

本発明の実施形態の一部の例として、以下の項目が挙げられる。

(項目 1)

式 (I)

【化 1 6 3 】



(1)

の化合物またはその塩であって、式中、

R^1 は、H、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル、またはカルボシクリルであり、ここで、 R^1 の C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル、およびカルボシクリルの各々は、1つまたは複数の R^a 基で任意選択的に置換され：

R^2 は、 H 、 C_{1-1} 、 アルキル、 C_{2-1} 、 アルケニル、 C_{2-1} 、 アルキニル、 または C_{3-8} シクロアルキルであり、 ここで、 R^2 の C_{1-1} 、 アルキル、 C_{2-1} 、 アルケニル、 C_{2-1} 、 アルキニル、 および C_{3-8} シクロアルキルの各々は、 1つまたは複数の R^b 基で任意選択的に置換され：

各 R^a は、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^v)₂、-S(O)-N(R^v)₂、-S(O)₂-N(R^v)₂、-O-R^v、-S-R^v、-O-C(O)-R^v、-O-C(O)-O-R^v、-C(O)-R^v、-C(O)-O-R^v、-S(O)-R^v、-S(O)₂-R^v、-O-C(O)-N(R^v)₂、-N(R^v)-C(O)-O-R^v、-N(R^v)-C(O)-N(R^v)₂、-N(R^v)-S(O)-R^v、-N(R^v)-S(O)₂-R^v、-N(R^v)-S(O)-N(R^v)₂、および-N(R^v)-S(O)₂-N(R^v)₂ から独立して選択され、ここで、任意の C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^v)₂、-S(O)-N(R^v)₂、-S(O)₂-N(R^v)₂、-O-R^v、-S-R^v、-O-C(O)-R^v、-C(O)-R^v、-C(O)-O-R^v、-S(O)-R^v、-S(O)₂-R^v、-C(O)-N(R^v)-C(O)-R^v、-N(R^v)-S(O)-N(R^v)₂、-N(R^v)-S(O)₂-N(R^v)₂ から独立して選択され、

$\text{v}^- \text{S(O)}_2^- \text{R}^{\text{v}}$ 、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各 R^b は、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^w)₂、-CN、-C(O)-N(R^w)₂、-S(O)-N(R^w)₂、-S(O)-N(R^w)₂、-O-R^w、-S-R^w、-O-C(O)-R^w、-O-C(O)-O-R^w、-C(O)-R^w、-S(O)-R^w、-O-C(O)-N(R^w)₂、-N(R^w)-C(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)-N(R^w)₂、および-N(R^w)-S(O)-N(R^w)₂から独立して選択され、ここで、任意のC_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、C_{1～6}ハロアルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、-NO₂、-N(R^w)₂、-CN、-C(O)-N(R^w)₂、-S(O)-N(R^w)₂、-S(O)-N(R^w)₂、-N(R^w)₂、-O-R^w、-S-R^w、-O-C(O)-R^w、-C(O)-R^w、-C(O)-O-R^w、-S(O)-R^w、-S(O)-N(R^w)₂、-N(R^w)-C(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)-R^w、-N(R^w)-S(O)-N(R^w)₂、-S(O)-R^w、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC_{1～6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R^c および R^d は各々、水素、C₁ ~ ₆ アルキル、C₂ ~ ₆ アルケニル、C₂ ~ ₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、C₁ ~ ₆ アルキル、C₂ ~ ₆ アルケニル、C₂ ~ ₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、C₁ ~ ₆ アルキル、C₂ ~ ₆ アルケニル、C₂ ~ ₆ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および -N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意の C₁ ~ ₆ アルキル、C₂ ~ ₆ アルケニル、C₂ ~ ₆ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)₂-R^h、および C₁ ~ ₆ アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、および C₁ ~ ₆ アルキルは、オキソ、ハロ、C₁ ~ ₆ アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよび C₁ ~ ₆ アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；

または、R^cおよびR^dが、それらが結合する窒素とともに、オキソ、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-

$O - R^h$ 、 $- S(O) - R^h$ 、 $- S(O)_2 - R^h$ 、 $- O - C(O) - N(R^h)_2$ 、 $- N(R^h) - C(O) - OR^h$ 、 $- N(R^h) - C(O) - N(R^h)_2$ 、 $- N(R^h)$
 $- C(O) - R^h$ 、 $- N(R^h) - S(O) - R^h$ 、 $- N(R^h) - S(O)_2 - R^h$ 、 $- N(R^h) - S(O) - N(R^h)_2$ 、および $- N(R^h) - S(O)_2 - N(R^h)$
 から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し、ここで、任意の C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 $- F$ 、 $- Cl$ 、 $- Br$ 、 $- I$ 、 $- NO_2$ 、 $- N(R^h)_2$ 、 $- CN$ 、 $- C(O) - N(R^h)_2$ 、 $- S(O) - N(R^h)_2$ 、 $- S(O)_2 - N(R^h)_2$ 、 $- O - R^h$ 、 $- S - R^h$ 、 $- O - C(O) - R^h$ 、 $- O - C(O) - O - R^h$ 、 $- C(O) - R^h$ 、 $- C(O) - O - R^h$ 、 $- S(O) - R^h$ 、 $- S(O)_2 - R^h$ 、 $- O - C(O) - N(R^h)_2$ 、 $- N(R^h) - C(O) - OR^h$ 、 $- N(R^h) - C(O) - N(R^h)_2$ 、 $- N(R^h) - C(O) - R^h$ 、 $- N(R^h) - S(O) - R^h$ 、 $- N(R^h) - S(O)_2 - R^h$ 、および $- N(R^h) - S(O)_2 - N(R^h)_2$ から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該 C_{1-6} アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロおよび C_{1-6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各 R^h は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-C_6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または、2つの R^h が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各 R^v は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-C_6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または2つの R^v が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各 R^w は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシル、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-C_6} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されるか；または2つの R^w が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、ならびにオキソおよびハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、

化合物またはその塩。

(項目2)

R^1 は C_{1-12} アルキルまたは C_{2-12} アルケニルであり、ここで、 C_{1-12} アルキルおよび C_{2-12} アルケニルは各々、1つまたは複数の R^a 基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R^1 は $C_{1\sim6}$ アルキルまたは $C_{2\sim6}$ アルケニルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよび $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、1つまたは複数の R^a 基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目4)

R^1 は $C_{1\sim6}$ アルキルまたは $C_{2\sim6}$ アルケニルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよび $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^v)₂、-O-R^v、-O-C(O)-R^v、-C(O)-R^v、および-C(O)-O-R^v から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目5)

R^1 は $C_{1\sim6}$ アルキルまたは $C_{2\sim6}$ アルケニルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよび $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、カルボシクリル、-F、-Cl、-O-R^v、-O-C(O)-R^v、-C(O)-R^v、および-C(O)-O-R^v から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目6)

R^1 は $C_{1\sim6}$ アルキルまたは $C_{2\sim6}$ アルケニルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよび $C_{2\sim6}$ アルケニルは各々、 $C_{3\sim6}$ シクロアルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物。

(項目7)

R^1 は、メチル、ブチル、2-プロペニル、2-ブテン-1-イル、3-ブテン-1-イル、または2-シクロプロピルエチルである、項目1に記載の化合物。

(項目8)

R^2 は H または $C_{1\sim12}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim12}$ アルキルは、1つまたは複数の R^b 基で任意選択的に置換される、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目9)

R^2 は H または $C_{1\sim6}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim6}$ アルキルは、1つまたは複数の R^b 基で任意選択的に置換される、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目10)

R^2 は H または $C_{1\sim6}$ アルキルであり、ここで、各 $C_{1\sim12}$ アルキルは、1つまたは複数のカルボシクリル、-F、-Cl、-O-R^w、-O-C(O)-R^w、-C(O)-R^w、-C(O)-O-R^w で任意選択的に置換される、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目11)

R^2 は、H またはメチルである、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

R^2 は H である、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目13)

R^c は、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、またはカルボシクリルであり、ここで、 $C_{1\sim6}$ アルキルおよびカルボシクリルは各々、オキソ、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂ から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意の $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、カルボシクリ

ル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)-R^h、-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)₂-C(O)-R^h、-N(R^h)₂-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)₂-R^h、およびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該カルボシクリルおよびC_{1~6}アルキルは、オキソ、ハロ、C_{1~6}アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

R^cは、水素、C_{1~6}アルキル、またはC_{3~8}シクロアルキルであり、ここで、C_{1~6}アルキルおよびC_{3~8}シクロアルキルは各々、-O-R^hから独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換される、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

R^cは、水素、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、または2-メトキシエチルである、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目16)

R^cは水素である、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目17)

R^cは、メチル、エチル、シクロプロピル、シクロブチル、または2-メトキシエチルである、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

R^dは、C_{1~6}アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、ここで、C_{1~6}アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは各々、オキソ、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換され、ここで、該置換基の任意のC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)-R^h、およびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC_{1~6}アルキルは、オキソ、ハロ、C_{1~6}アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1~17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目19)

R^dは、オキソ、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボ

シクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換されたC_{1~6}アルキルであり、ここで、該置換基の任意のC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)₂-R^h、およびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC_{1~6}アルキルは、オキソ、ハロ、C_{1~6}アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1~17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目20)

R^dは、オキソ、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-O-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-OR^h、-N(R^h)-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-S(O)₂-R^h、-N(R^h)-S(O)-N(R^h)₂、および-N(R^h)-S(O)₂-N(R^h)₂から独立して選択される1つまたは複数の置換基で任意選択的に置換されたカルボシクリルであり、ここで、該置換基の任意のC_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、-NO₂、-N(R^h)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-C(O)-N(R^h)₂、-N(R^h)-C(O)-R^h、-N(R^h)-S(O)-R^h、N(R^h)-S(O)₂-R^h、およびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、およびC_{1~6}アルキルは、オキソ、ハロ、C_{1~6}アルキル、シアノ、-O-R^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよびC_{1~6}アルキルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1~17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目21)

R^dは、オキソ、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、-F、-Cl、-Br、-I、-NO₂、-N(R^v)₂、-CN、-C(O)-N(R^h)₂、-S(O)-N(R^h)₂、-S(O)₂-N(R^h)₂、-O-R^h、-S-R^h、-O-C(O)-R^h、-O-C(O)-O-R^h、-C(O)-R^h、-C(O)-O-R^h、-S(O)-R^h、-S(O)₂-R^h、-

O - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - O R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O)₂ - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - N (R ^h)₂、 および - N (R ^h) - S (O)₂ - N (R ^h)₂、 から独立して選択される 1 つまたは複数の置換基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルであり、ここで、該置換基の任意の C_{1 ~ 6} アルキル、 C_{2 ~ 6} アルケニル、 C_{2 ~ 6} アルキニル、カルボシクリル、 およびヘテロシクリルは、オキソ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、ハロ、 - NO₂、 - N (R ^h)₂、 - C N、 - C (O) - N (R ^h)₂、 - S (O) - N (R ^h)₂、 - S (O)₂ - N (R ^h)₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - R ^h、 - C (O) - R ^h、 - C (O) - O - R ^h、 - S (O) - R ^h、 - S (O)₂ - R ^h、 - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 N (R ^h) - S (O)₂ - R ^h、 および C_{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該ヘテロシクリル、カルボシクリル、 および C_{1 ~ 6} アルキルは、オキソ、ハロ、 C_{1 ~ 6} アルキル、シアノ、 - O - R ^h、ヘテロシクリル、ならびにハロおよび C_{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたカルボシクリルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 22)

R ^c および R ^d が、 それらが結合する窒素とともに、 オキソ、 C_{1 ~ 6} アルキル、 C_{2 ~ 6} アルケニル、 C_{2 ~ 6} アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 - F、 - C₁、 - Br、 - I、 - NO₂、 - N (R ^h)₂、 - CN、 - C (O) - N (R ^h)₂、 - S (O) - N (R ^v)₂、 - S (O)₂ - N (R ^h)₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - O - R ^h、 - C (O) - R ^h、 - C (O) - O - R ^h、 - S (O) - R ^h、 - S (O)₂ - R ^h、 - O - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O)₂ - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - N (R ^h)₂、 および - N (R ^h) - S (O)₂ - N (R ^h)₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し、 ここで、 任意の C_{1 ~ 6} アルキル、 C_{2 ~ 6} アルケニル、 C_{2 ~ 6} アルキニル、カルボシクリル、 およびヘテロシクリルは、 C_{1 ~ 6} アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 - F、 - C₁、 - Br、 - I、 - NO₂、 - N (R ^h)₂、 - CN、 - C (O) - N (R ^h)₂、 - S (O) - N (R ^h)₂、 - S (O)₂ - N (R ^h)₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - R ^h、 - O - C (O) - O - R ^h、 - C (O) - R ^h、 - C (O) - O - R ^h、 - S (O) - R ^h、 - S (O)₂ - R ^h、 - O - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - O R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - N (R ^h)₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O)₂ - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - N (R ^h)₂、 および - N (R ^h) - S (O)₂ - N (R ^h)₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、 該 C_{1 ~ 6} アルキル、カルボシクリル、 およびヘテロシクリルは、ハロおよび C_{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 23)

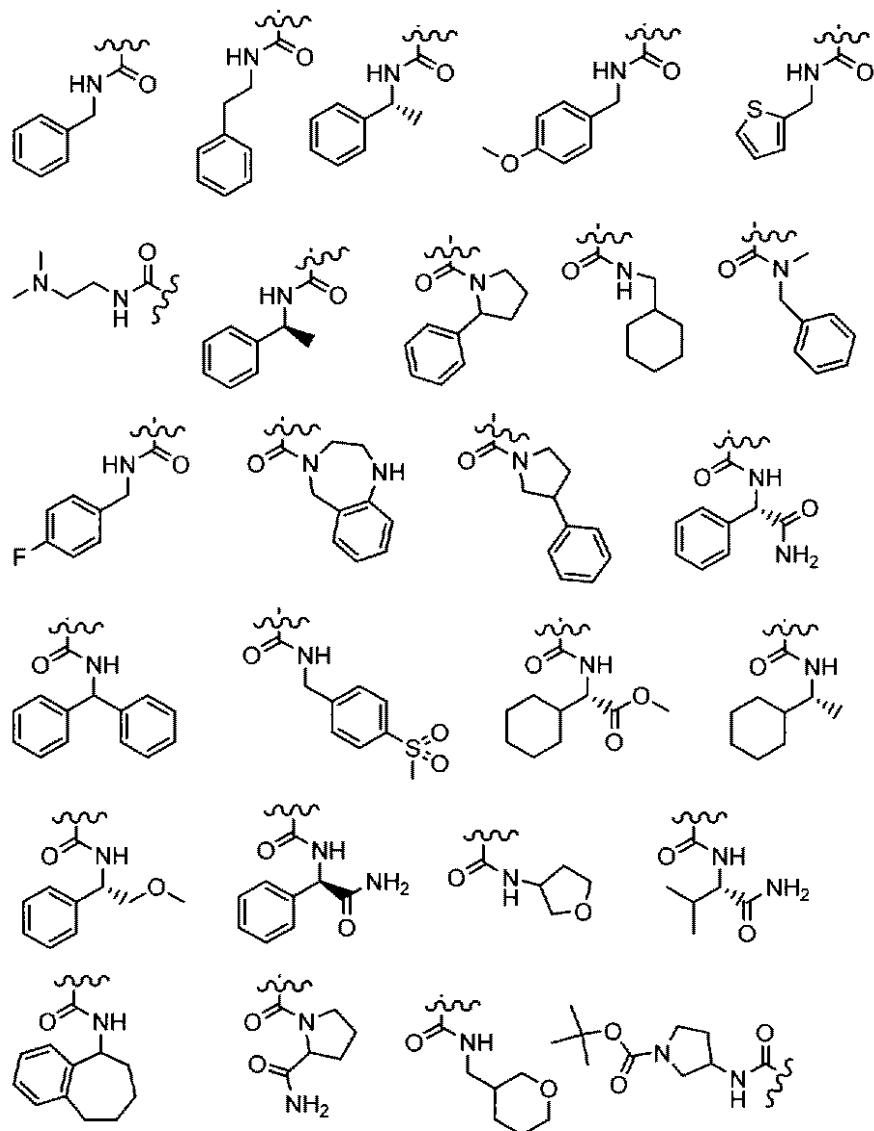
R ^c および R ^d が、 それらが結合する窒素とともに、 5 ~ 6 員の单環式ヘテロシクリルまたは 8 ~ 12 員の二環式ヘテロシクリルを形成し、 ここで、 該单環式または二環式のヘテロシクリルは、 オキソ、 C_{1 ~ 6} アルキル、 C_{2 ~ 6} アルケニル、 C_{2 ~ 6} アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 - F、 - C₁、 - Br、 - I、 - NO₂、 - N (R ^v)₂、 - CN、 - C (O) - N (R ^h)₂、 - S (O) - N (R ^h)₂、 - S (O)₂ - N (R ^h)₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - R ^h、 - O - C (O) - O - R ^h、 - C (O) - R ^h、 - C (O) - O - R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - O R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - N (R ^h)₂、 -

C (O) - N (R ^h) ₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) ₂ - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - N (R ^h) ₂、 および - N (R ^h) - S (O) ₂ - N (R ^h) ₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、ここで、任意の C _{1 ~ 6} アルキル、 C _{2 ~ 6} アルケニル、 C _{2 ~ 6} アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 C _{1 ~ 6} アルキル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、 - F、 - Cl、 - Br、 - I、 - NO ₂、 - N (R ^h) ₂、 - CN、 - C (O) - N (R ^h) ₂、 - S (O) - N (R ^h) ₂、 - S (O) ₂ - N (R ^h) ₂、 - O - R ^h、 - S - R ^h、 - O - C (O) - R ^h、 - O - C (O) - O - R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - O R ^h、 - N (R ^h) - C (O) - N (R ^h) ₂、 - N (R ^h) - C (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) ₂ - R ^h、 - N (R ^h) - S (O) ₂ - N (R ^h) ₂ から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、該 C _{1 ~ 6} アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロおよび C _{1 ~ 6} アルキルから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

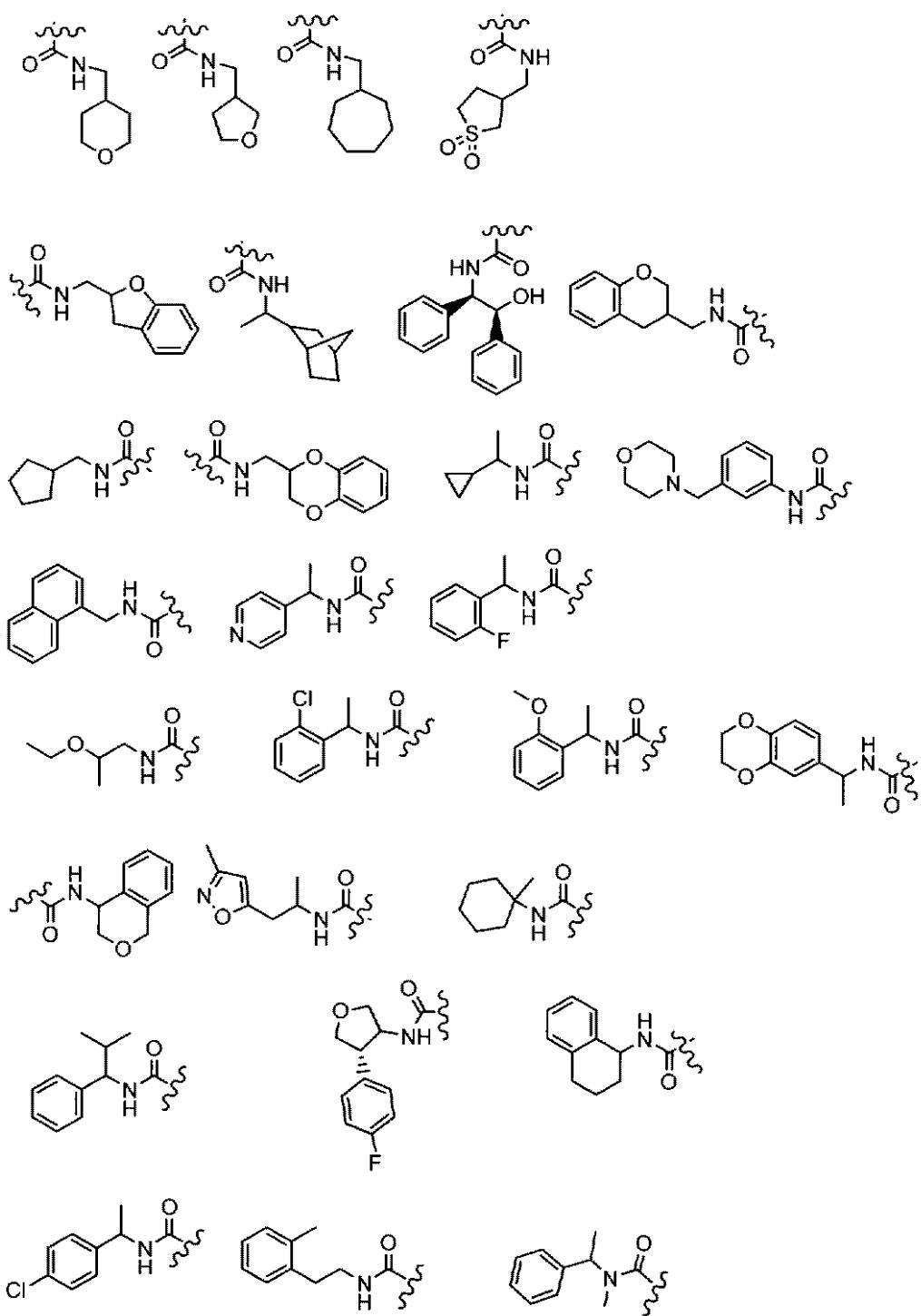
(項目 24)

- C (= O) N R ^c R ^d が、

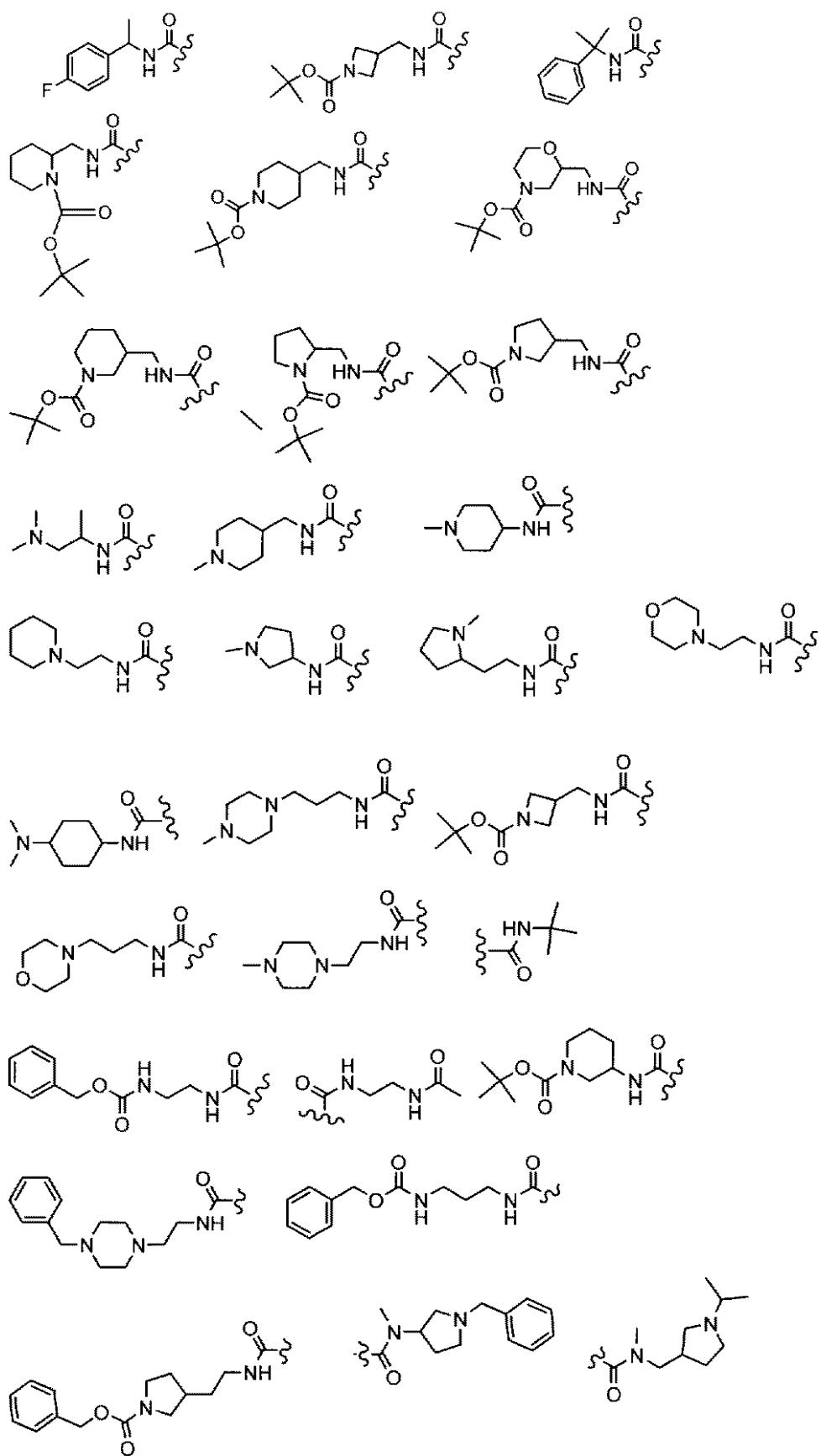
【化 1 6 4】



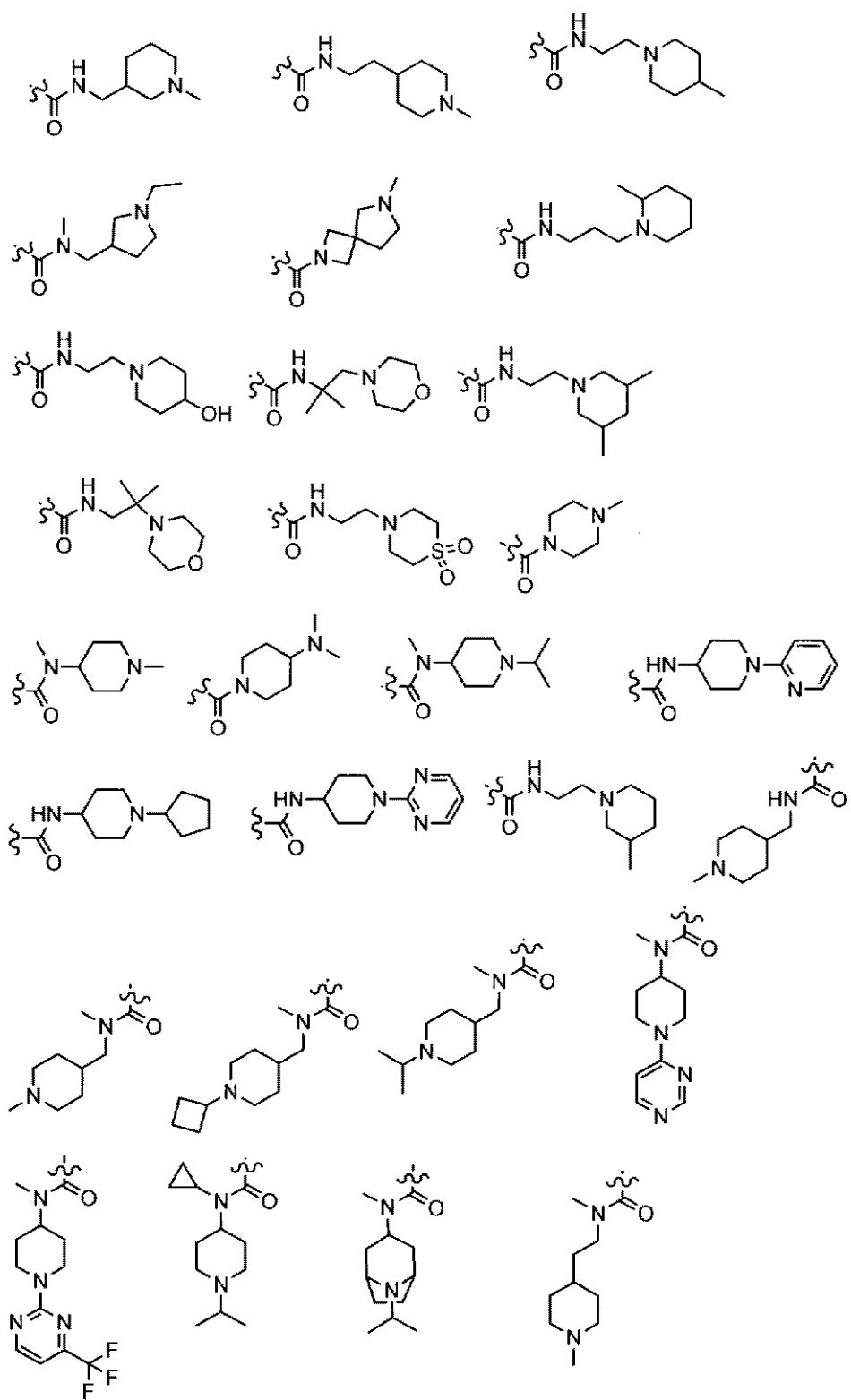
【化 1 6 5】



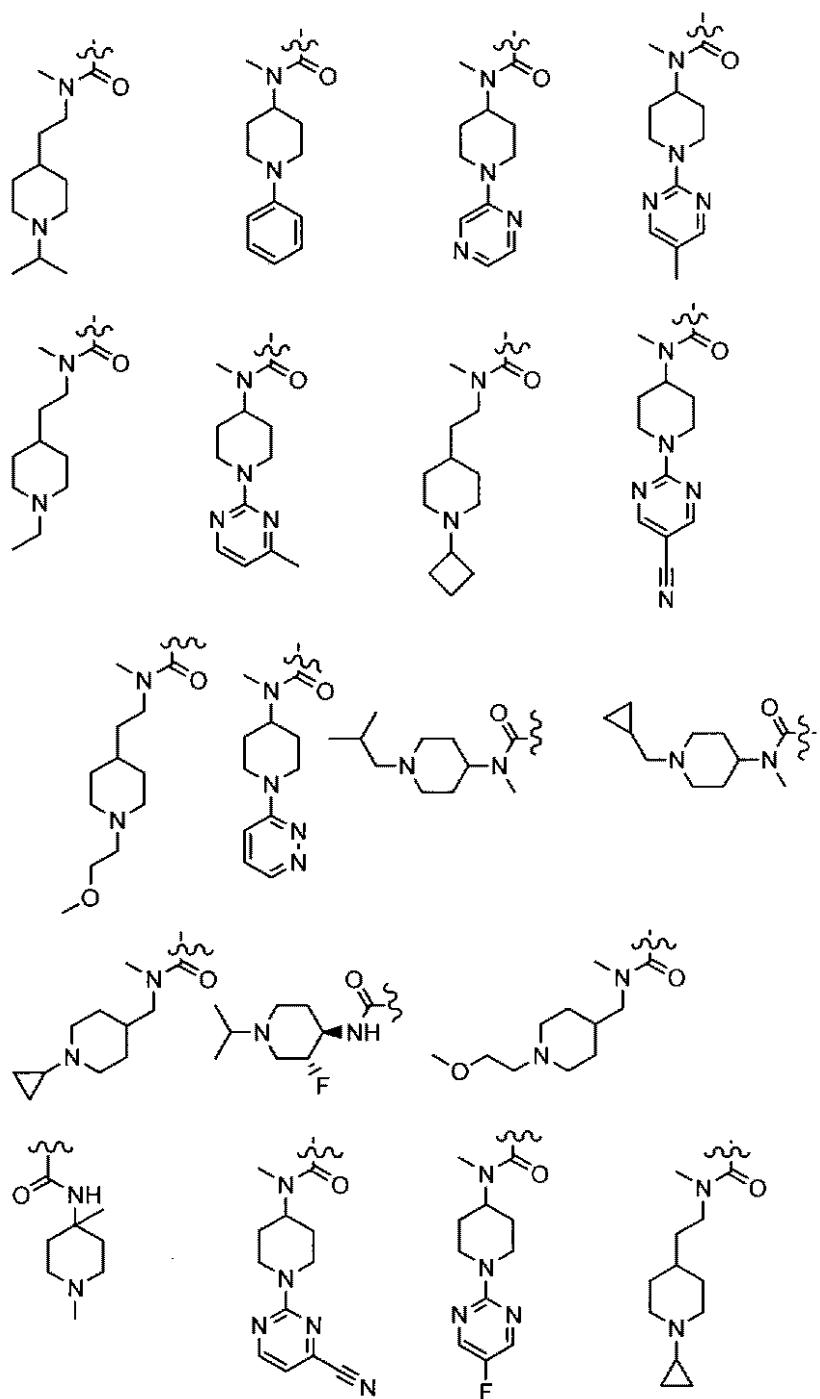
【化 1 6 6】



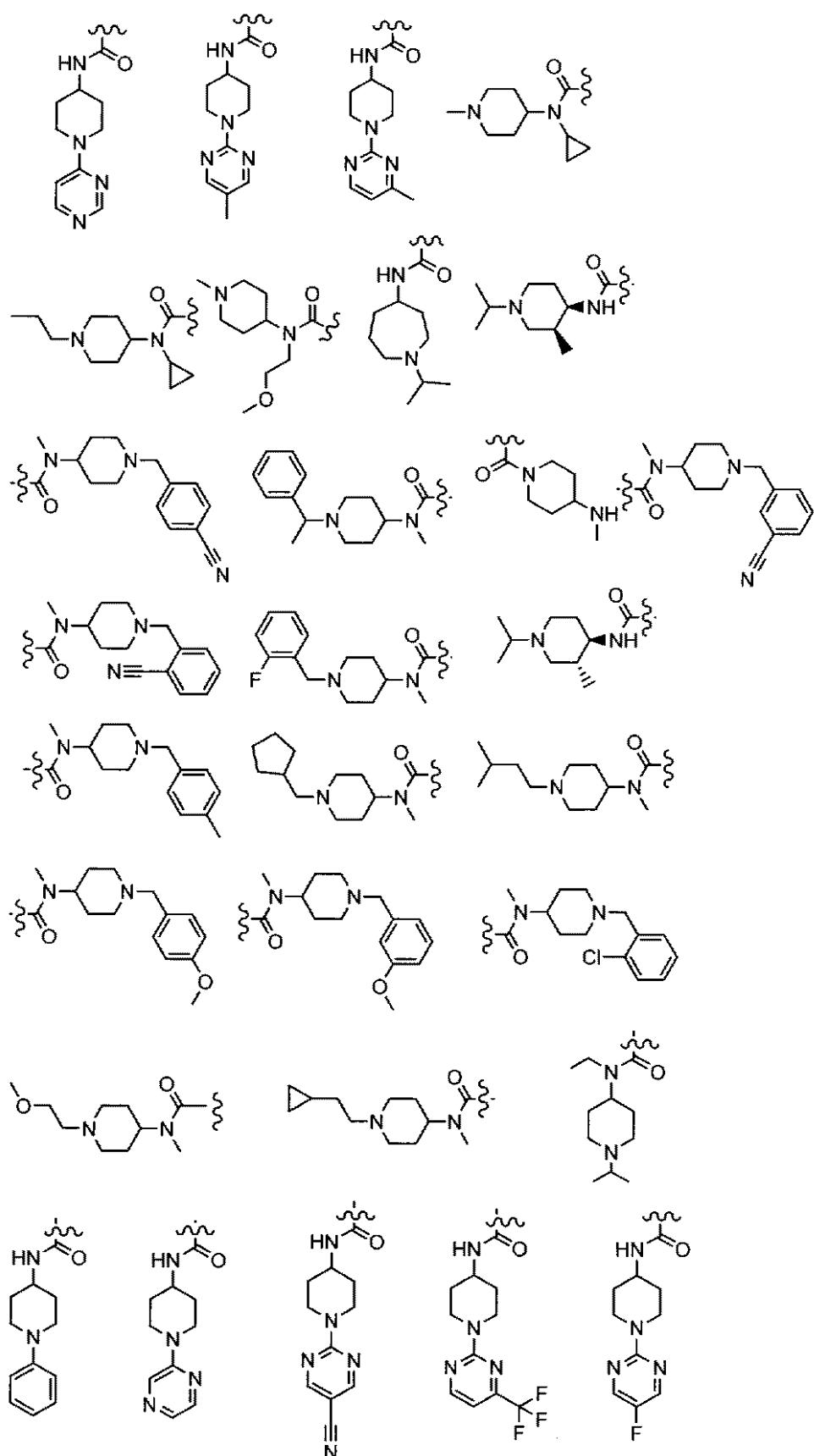
【化 1 6 7】



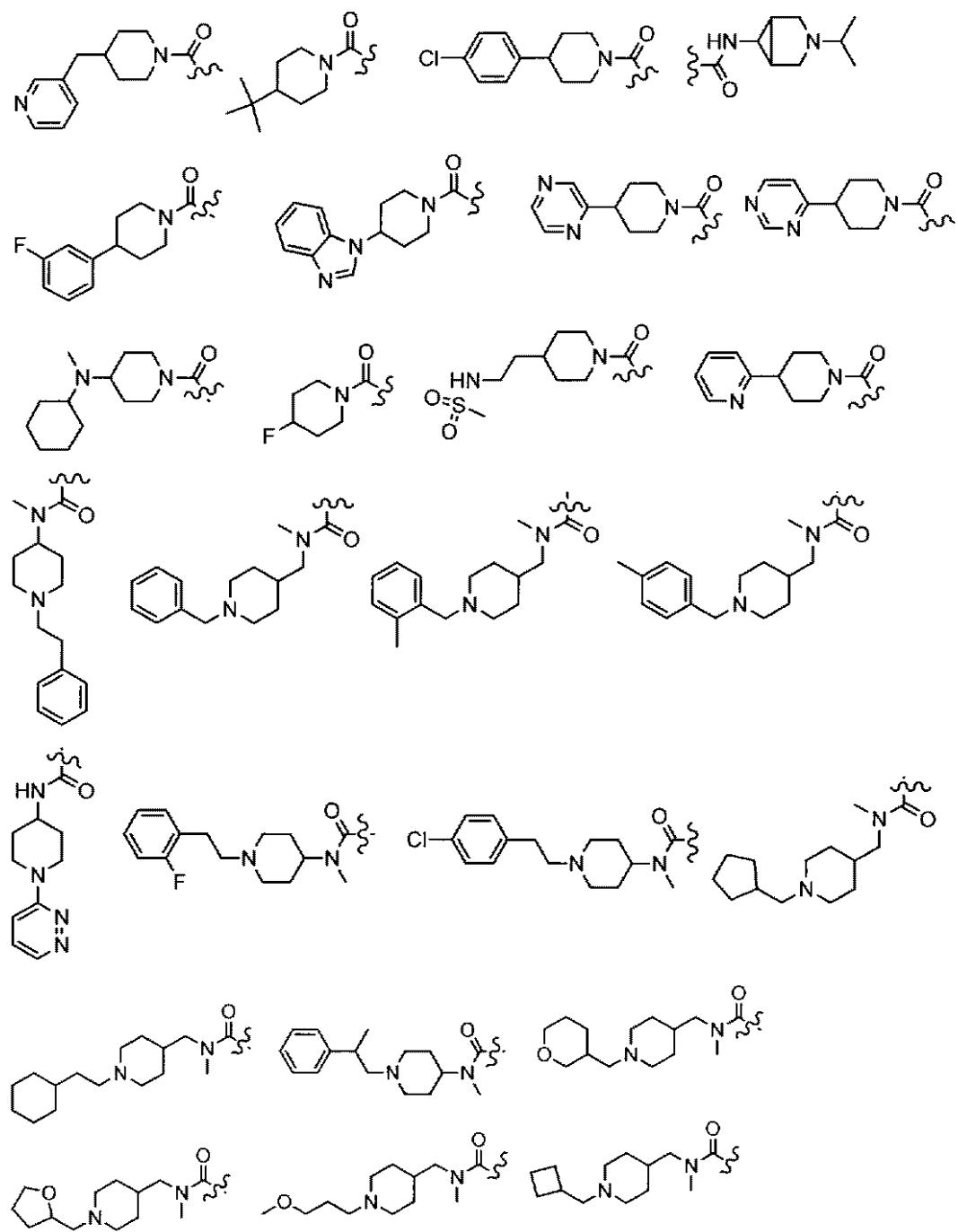
【化 1 6 8 】



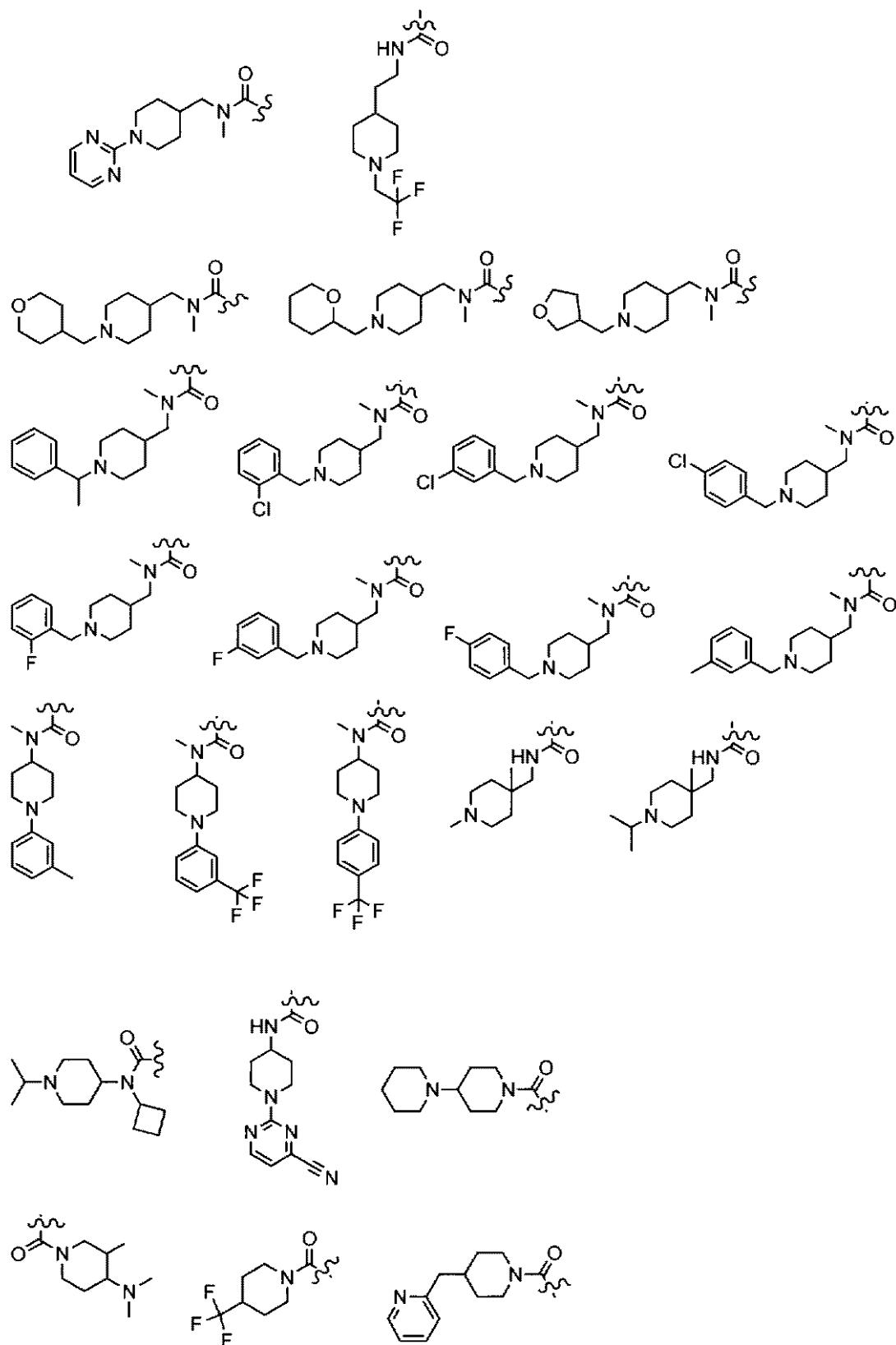
【化 169】



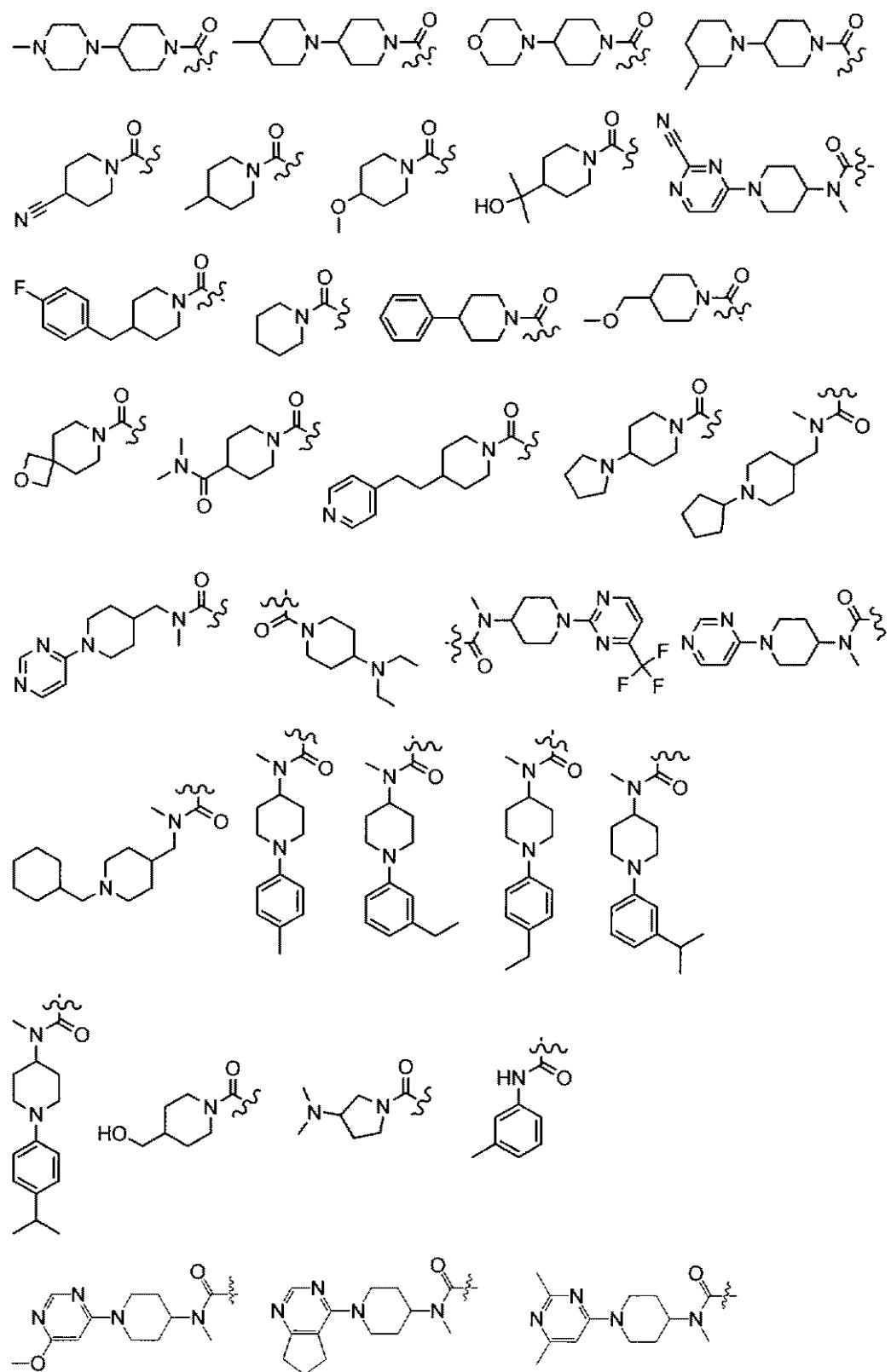
【化 1 7 0 】



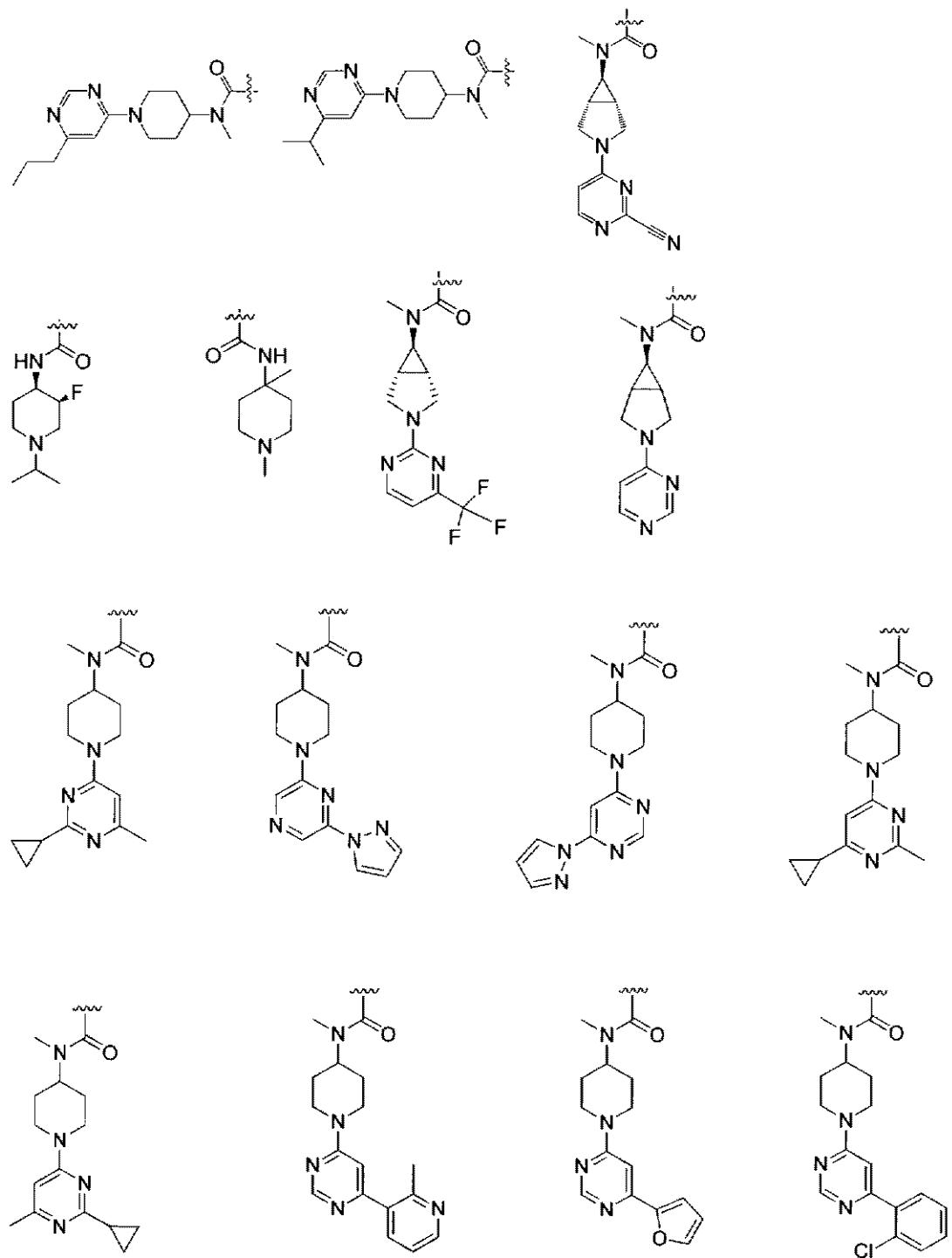
【化 171】



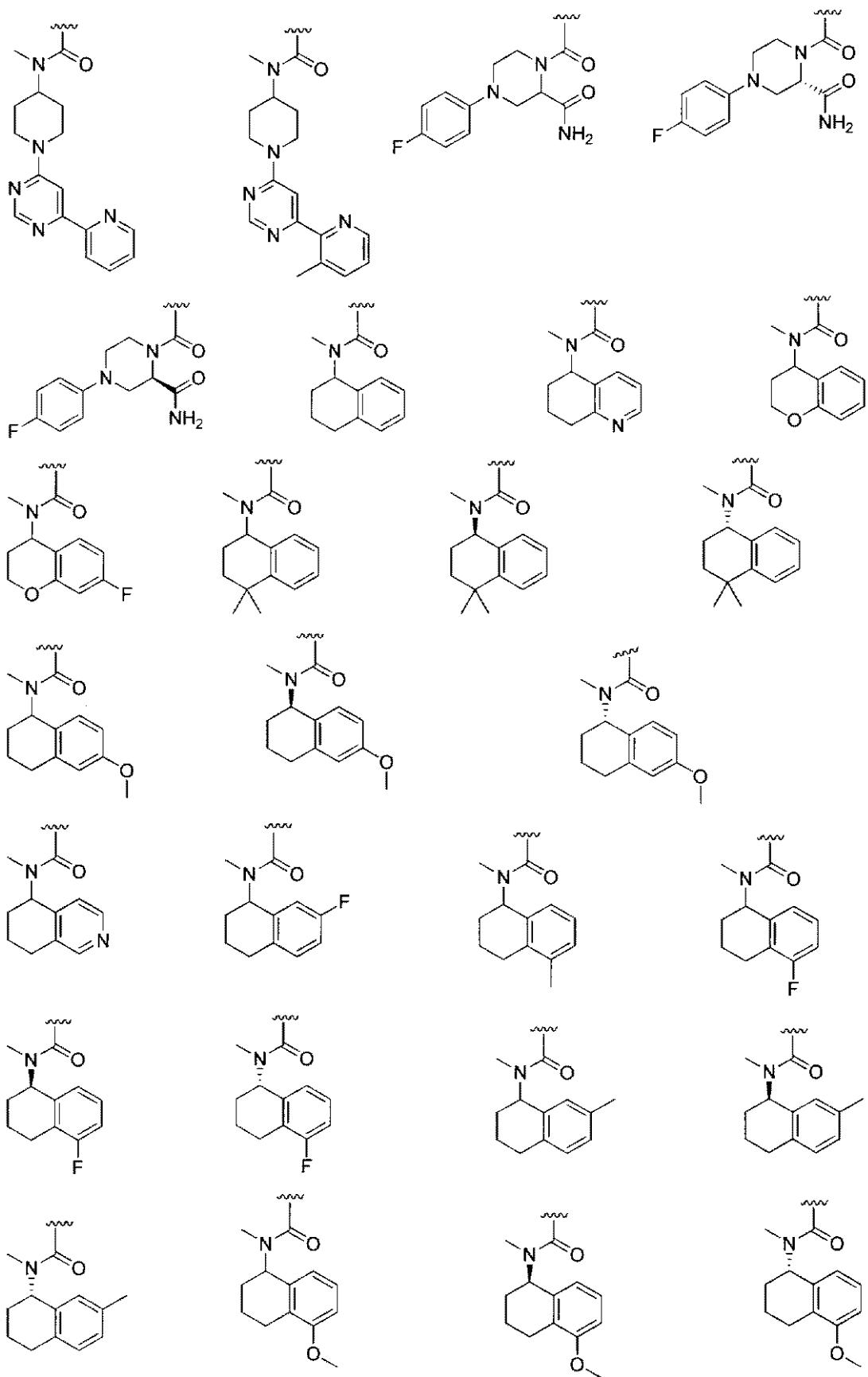
【化 172】



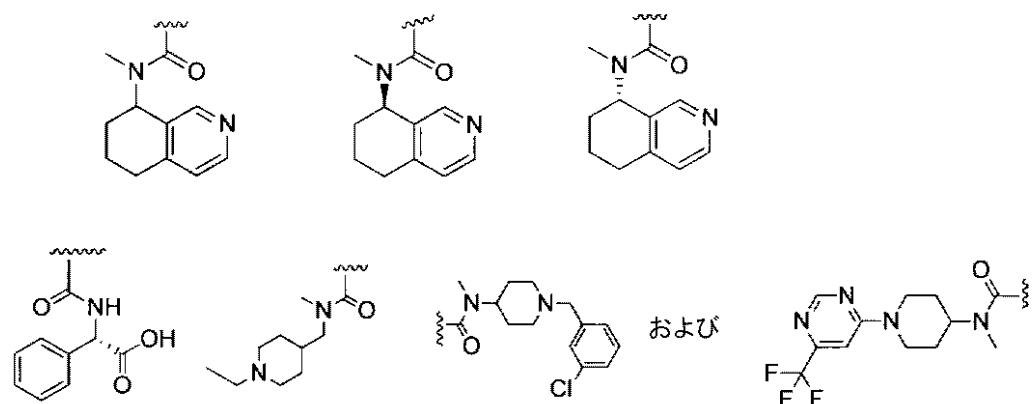
【化 1 7 3】



【化 1 7 4】



【化175】

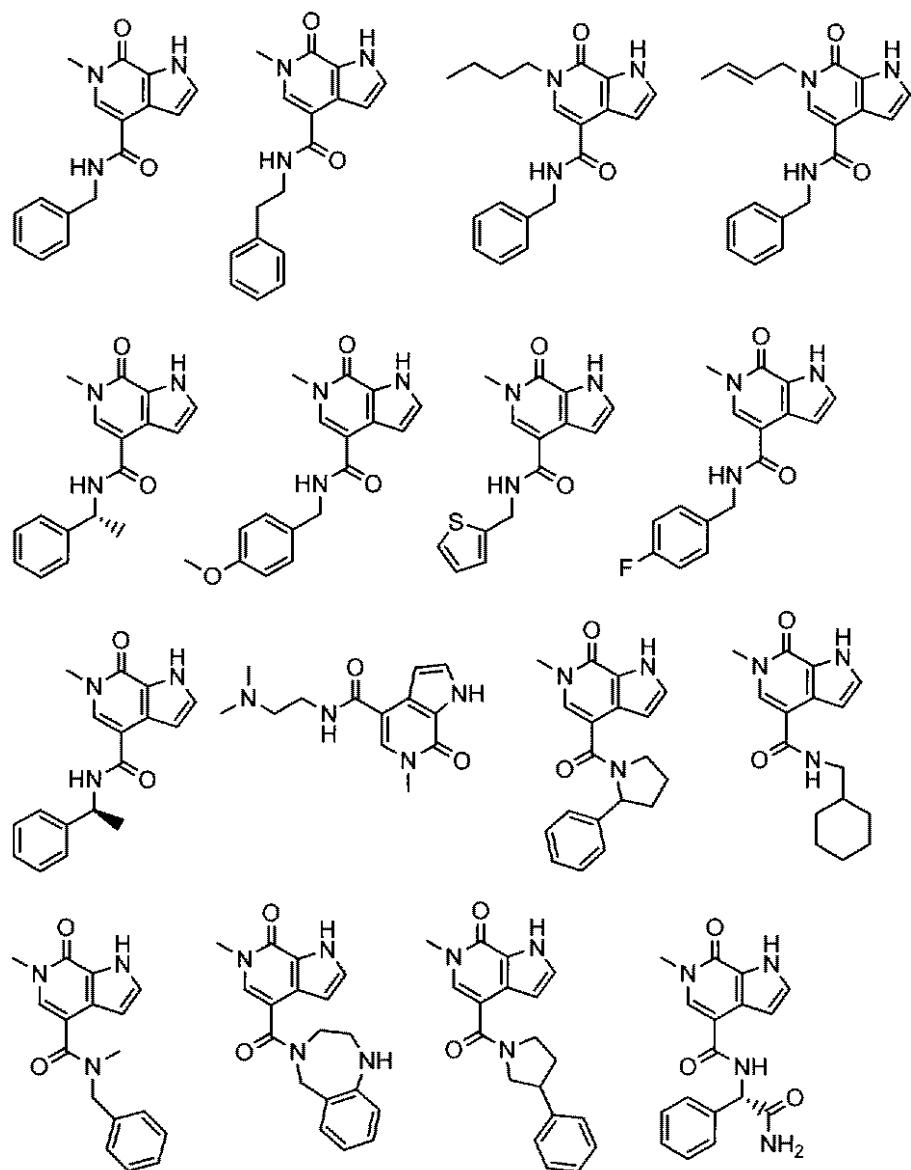


から選択される、項目1～12のいずれか1項に記載の化合物。

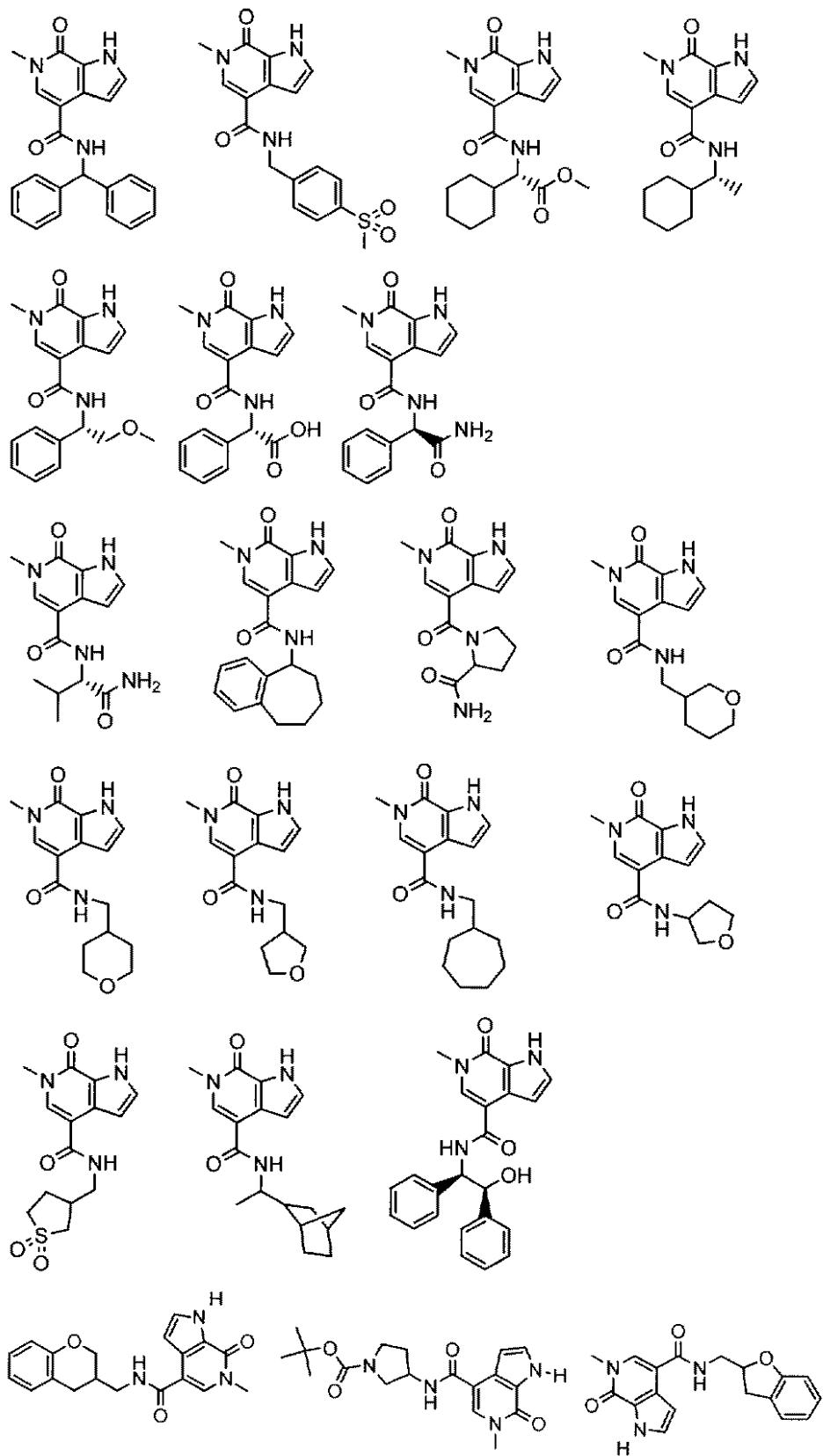
(項目25)

以下の

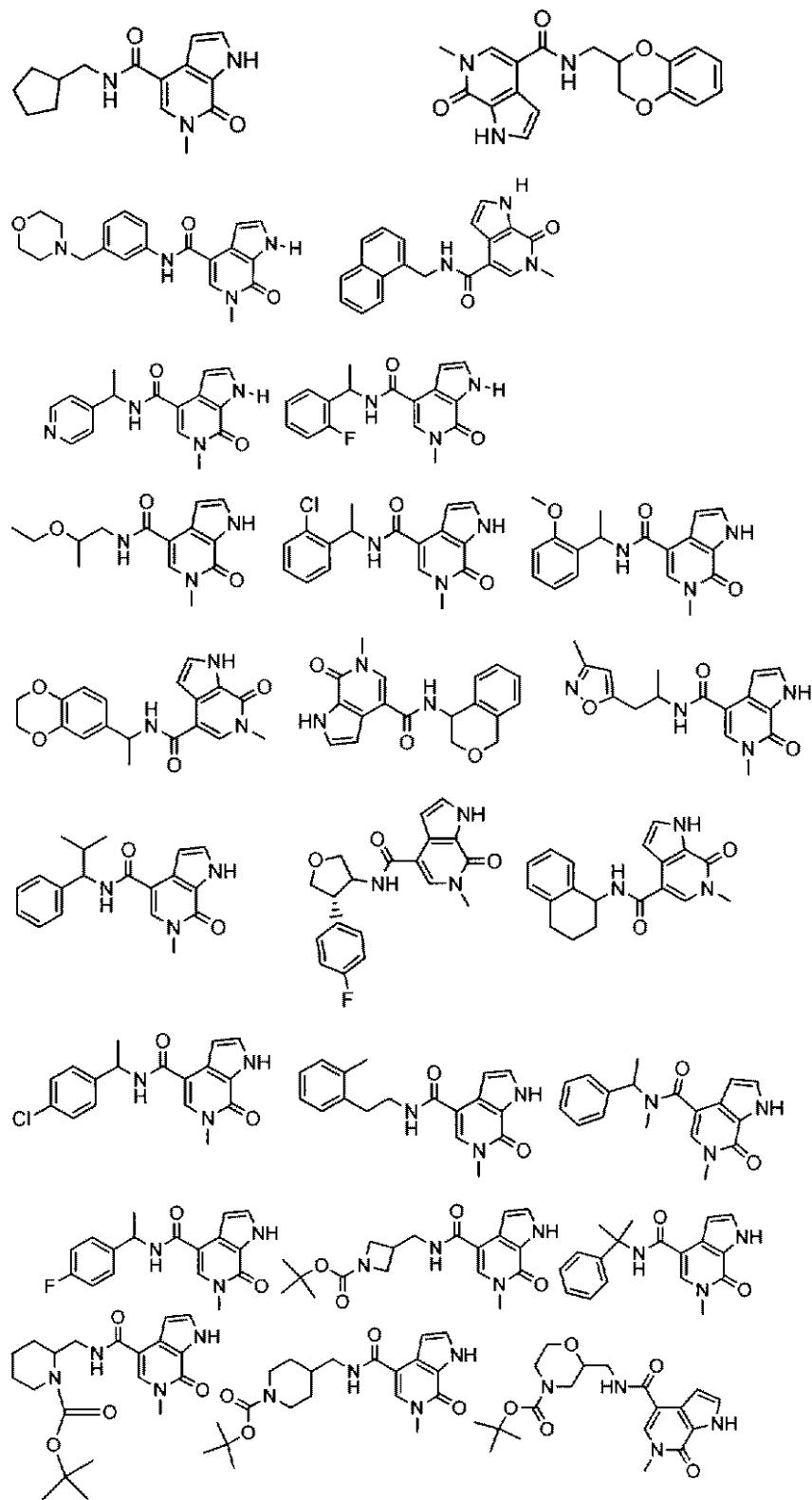
【化 1 7 6】



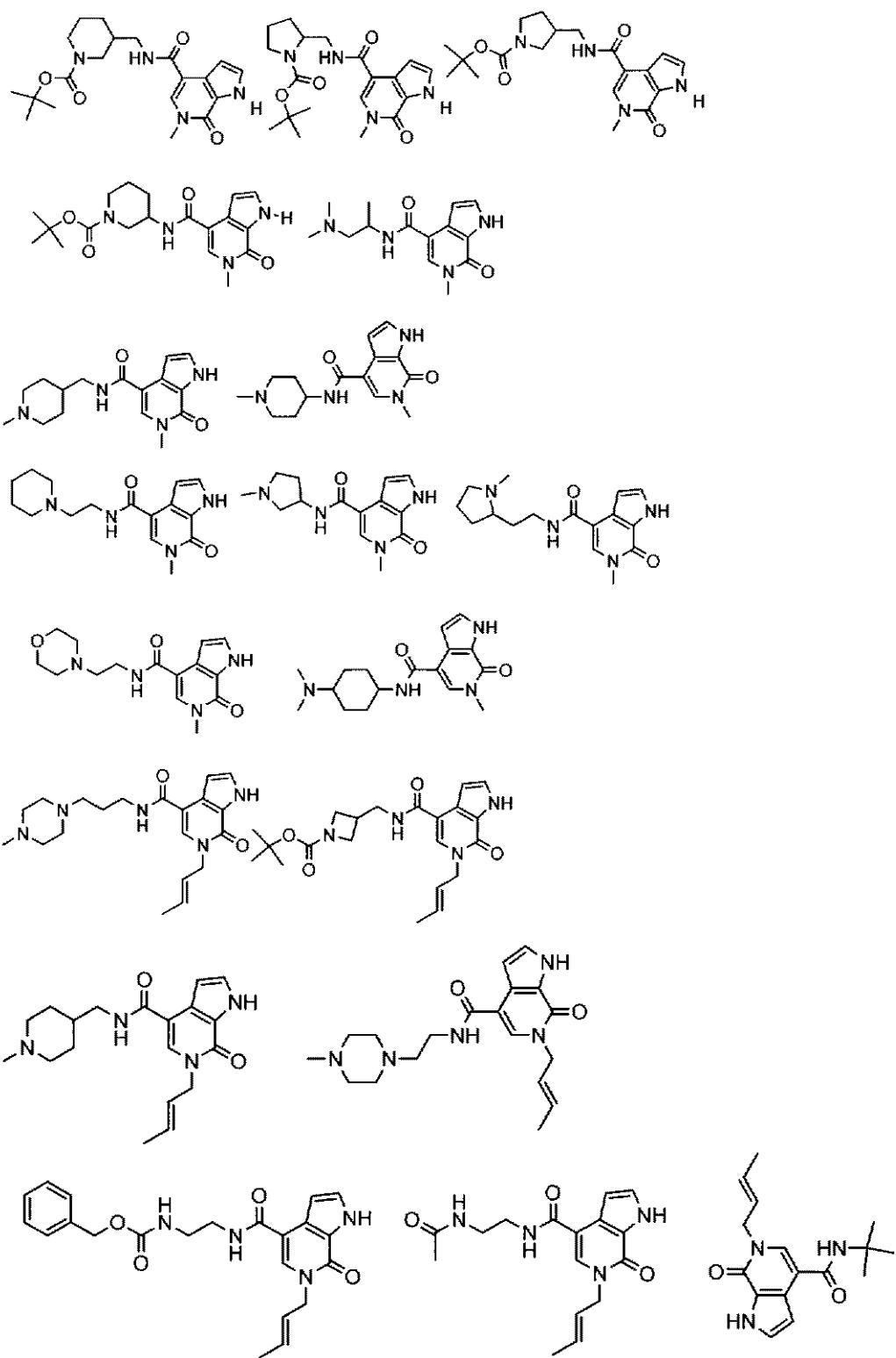
【化 1 7 7 】



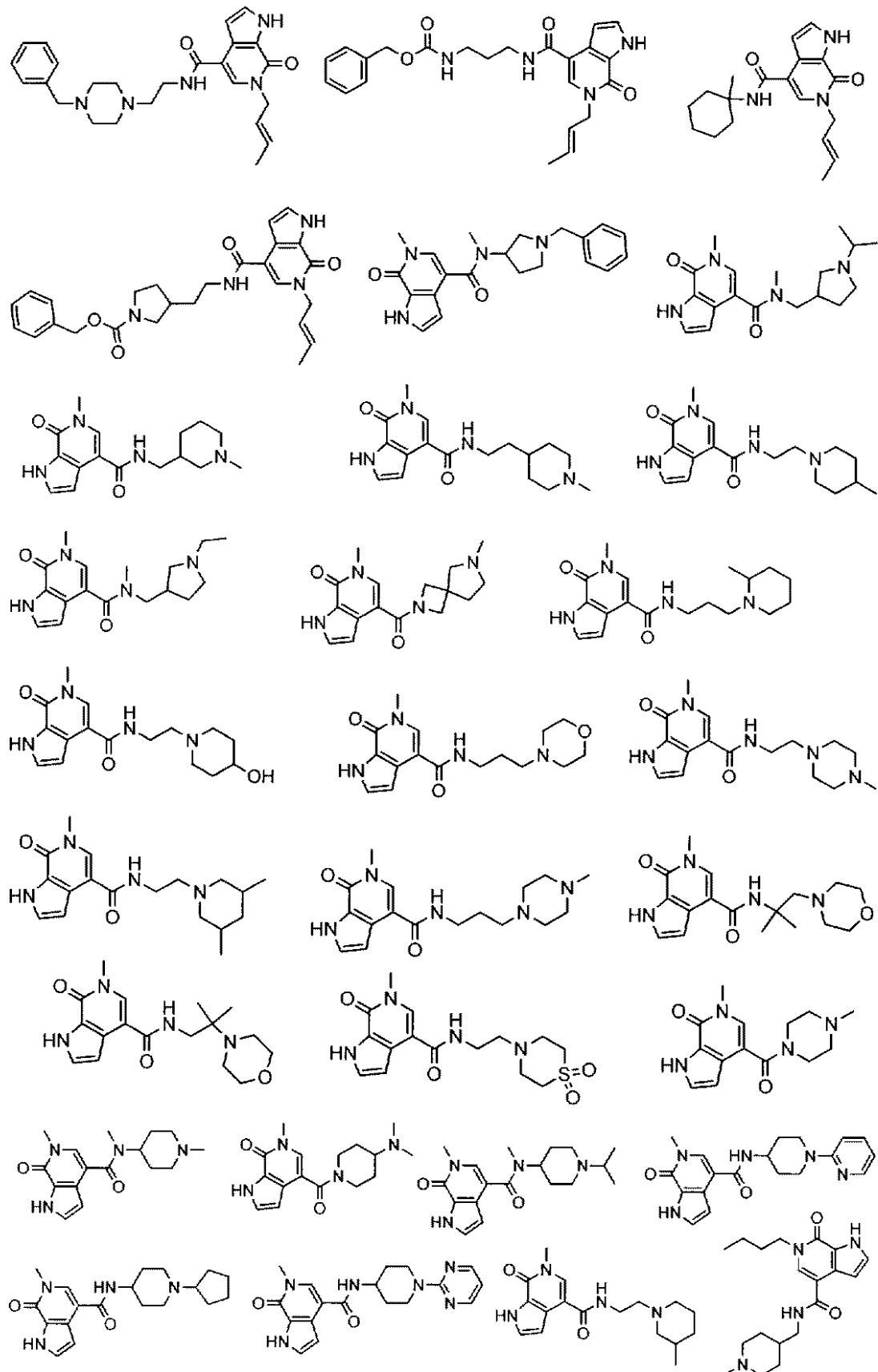
【化 1 7 8】



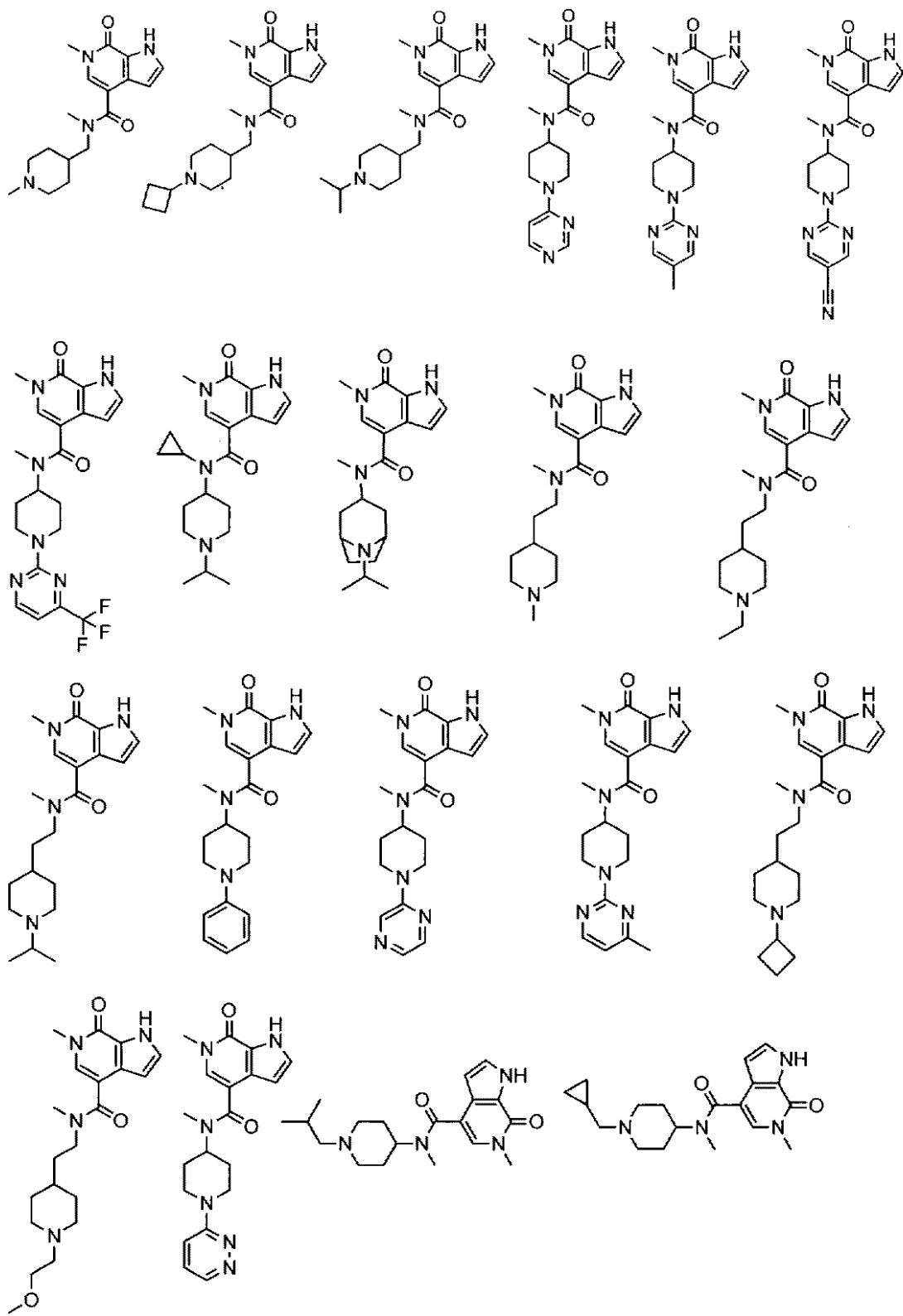
【化 1 7 9】



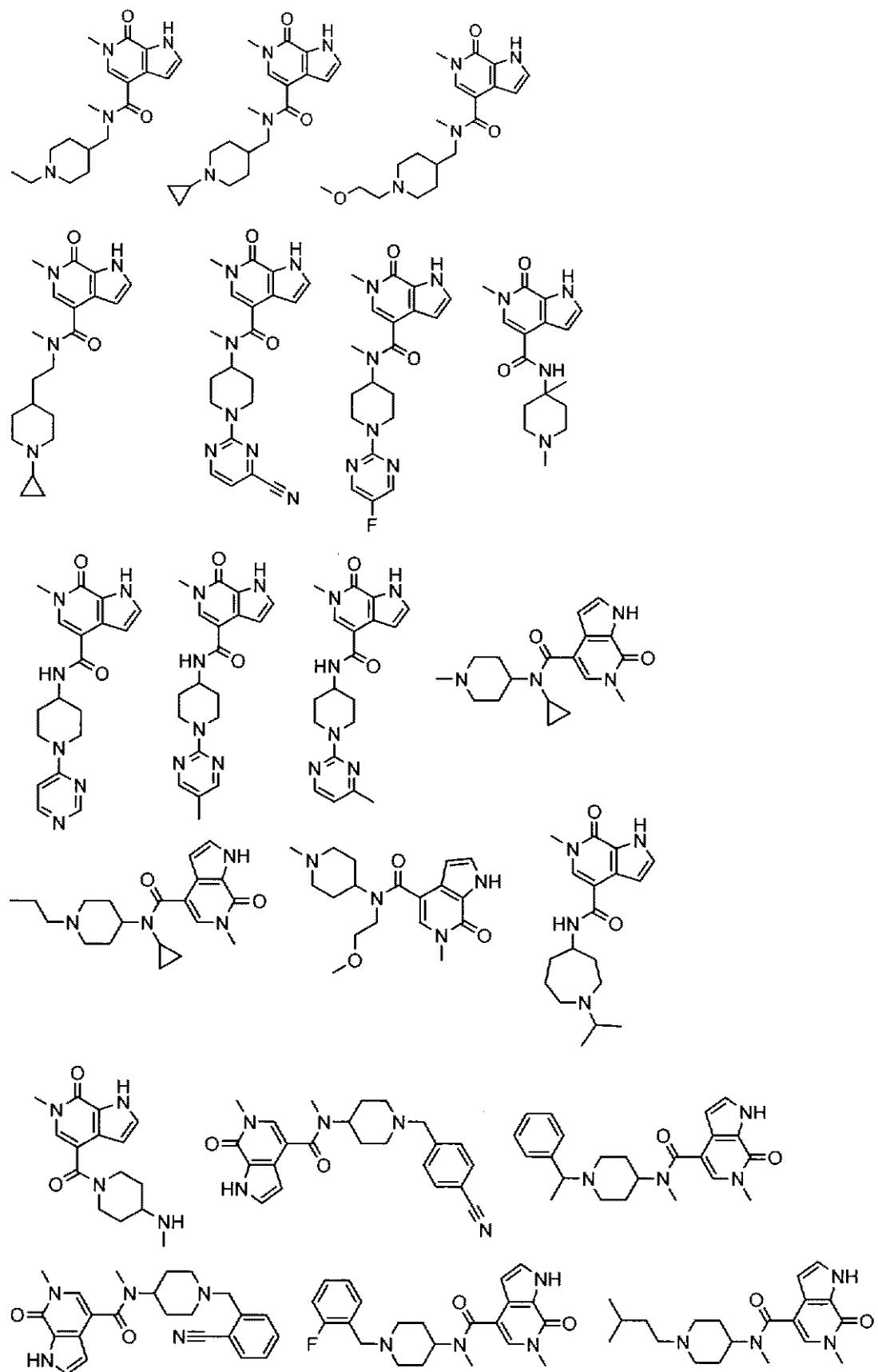
【化 1 8 0】



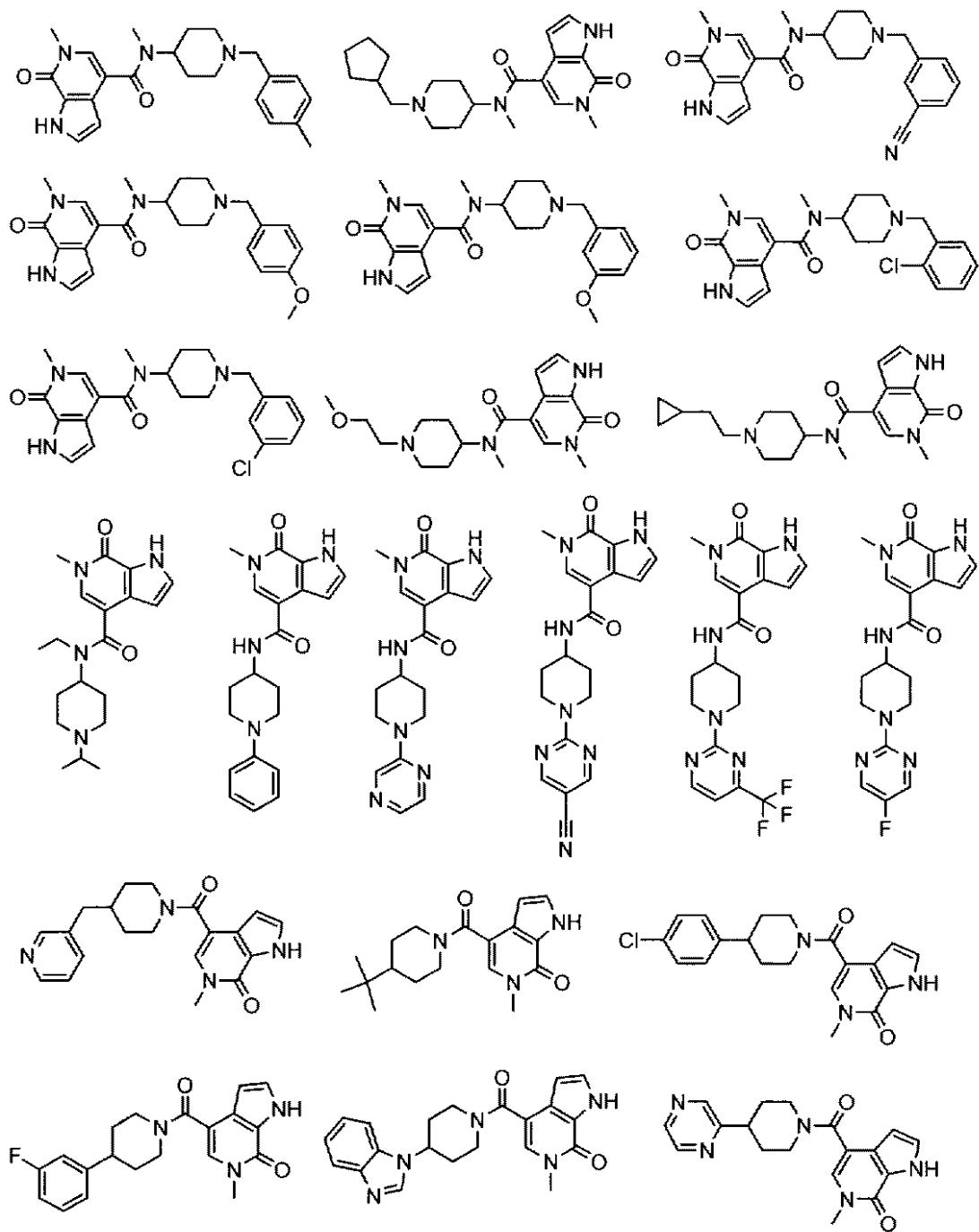
【化 1 8 1 】



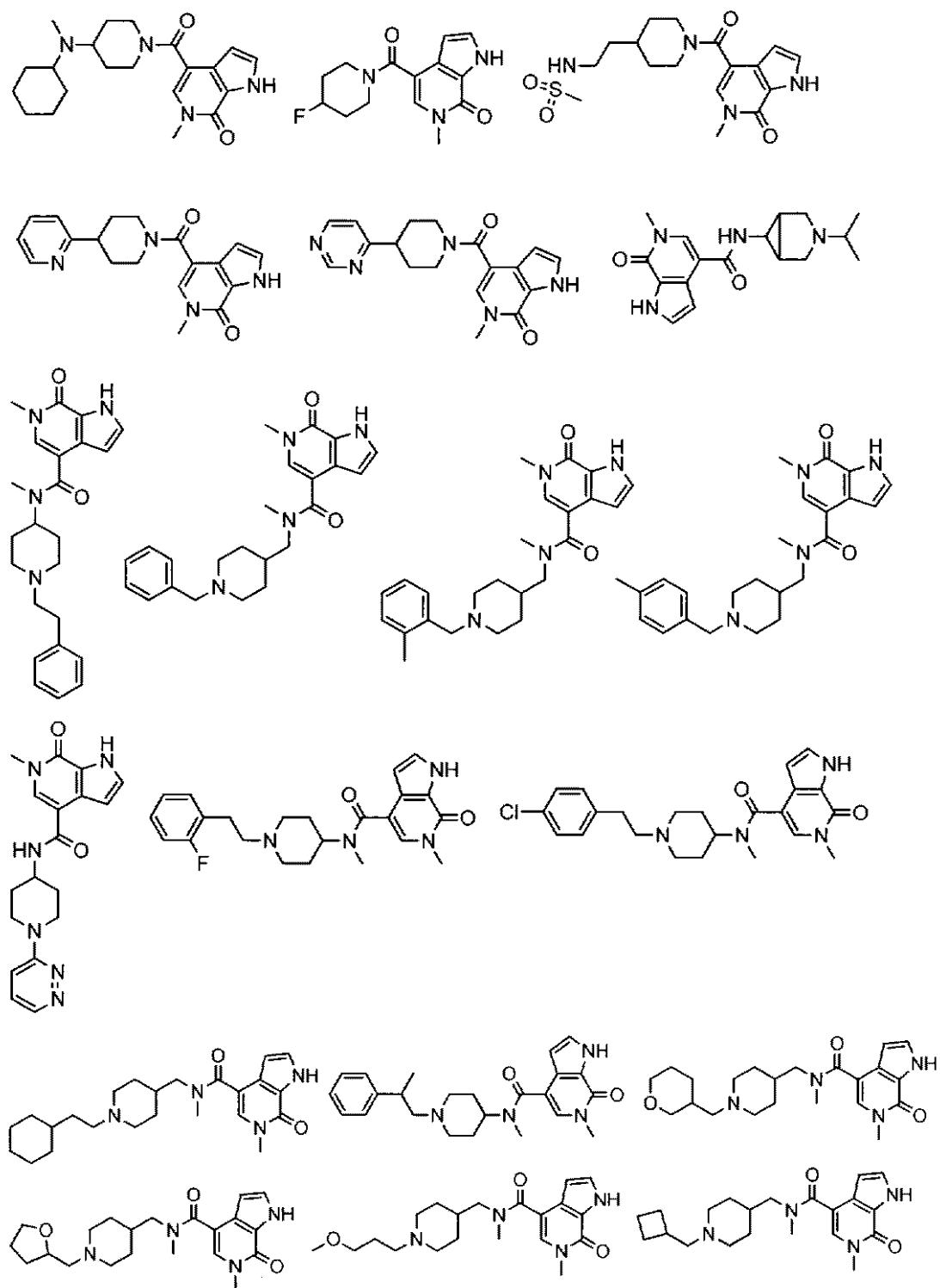
【化 1 8 2】



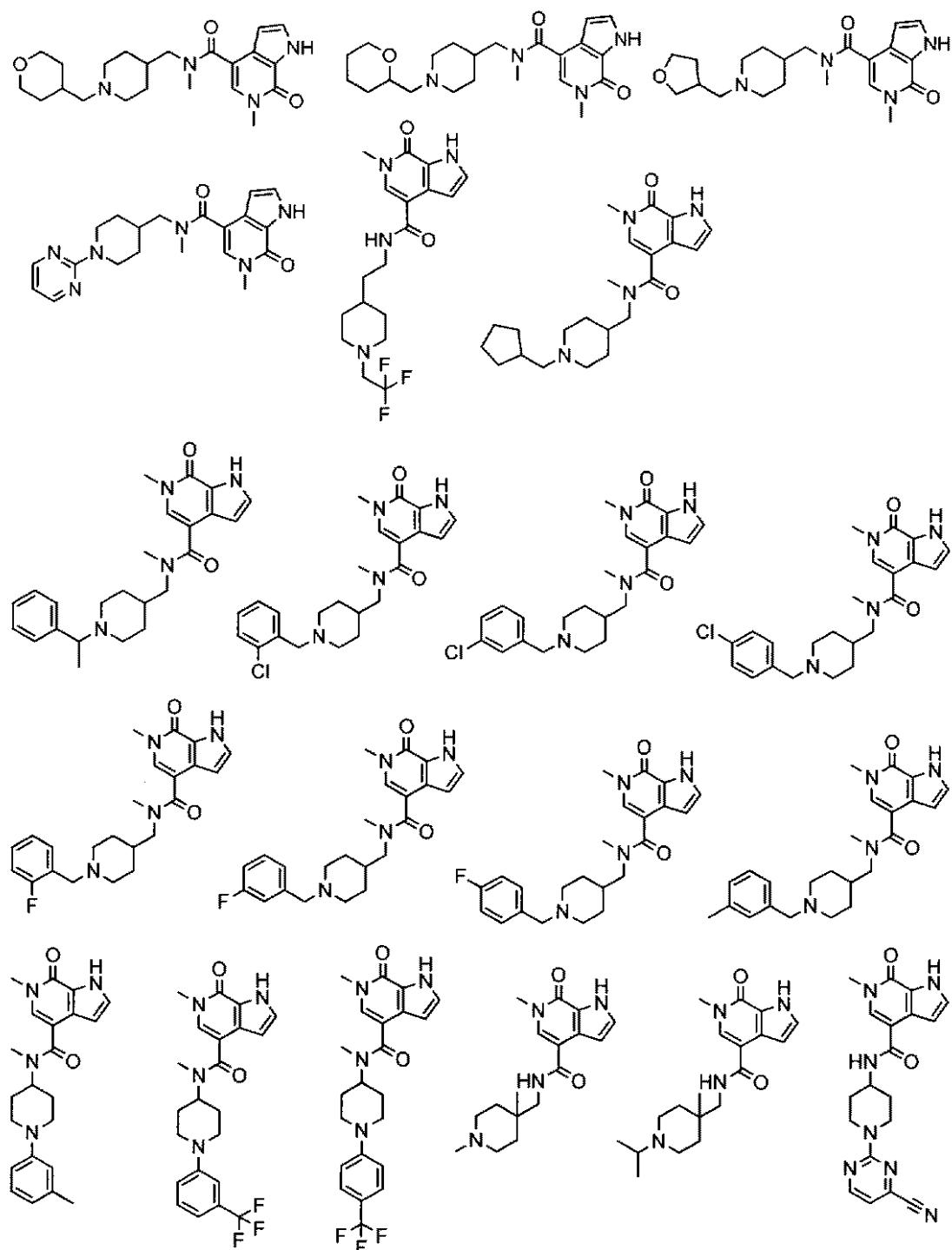
【化 1 8 3】



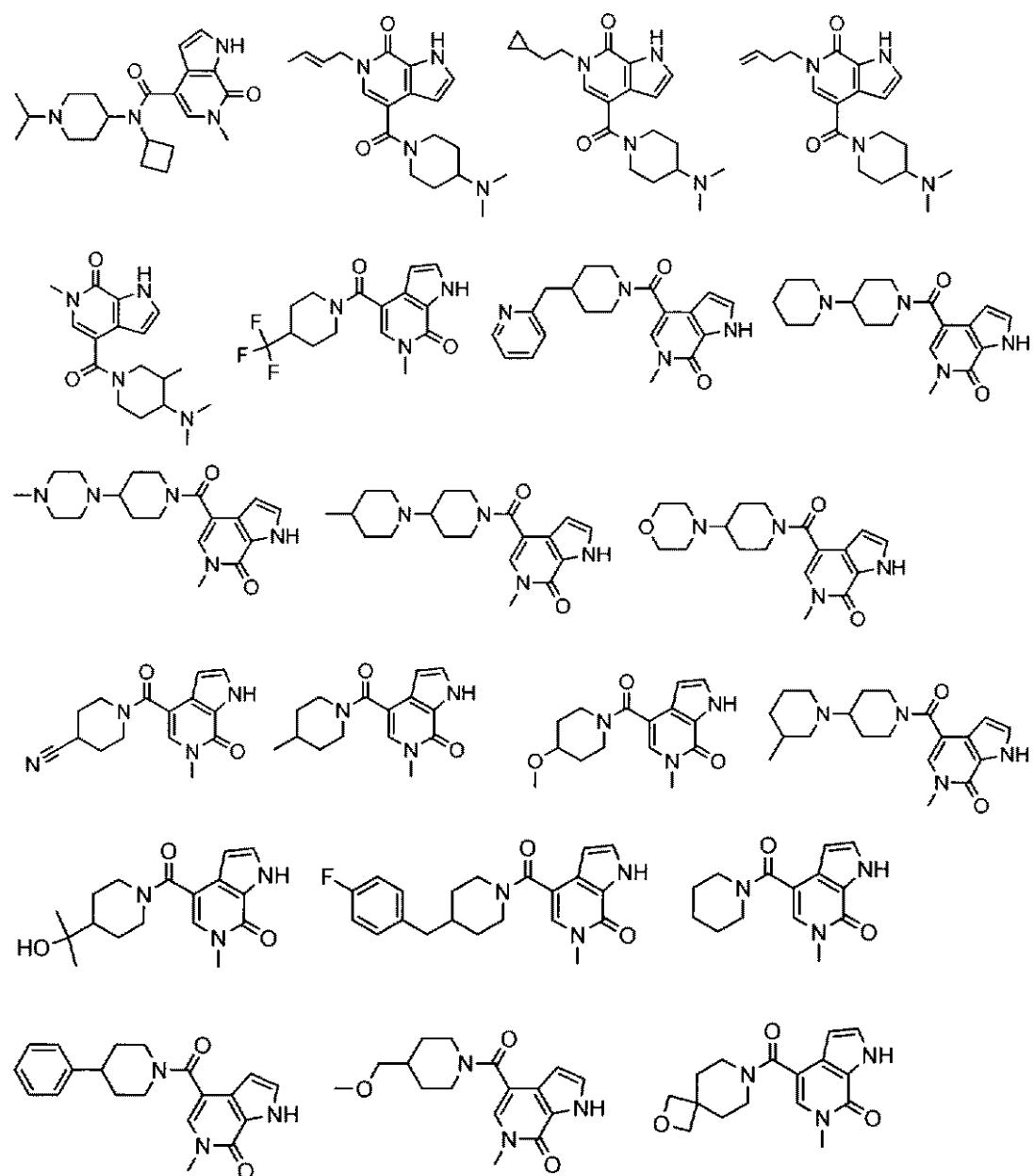
【化 1 8 4】



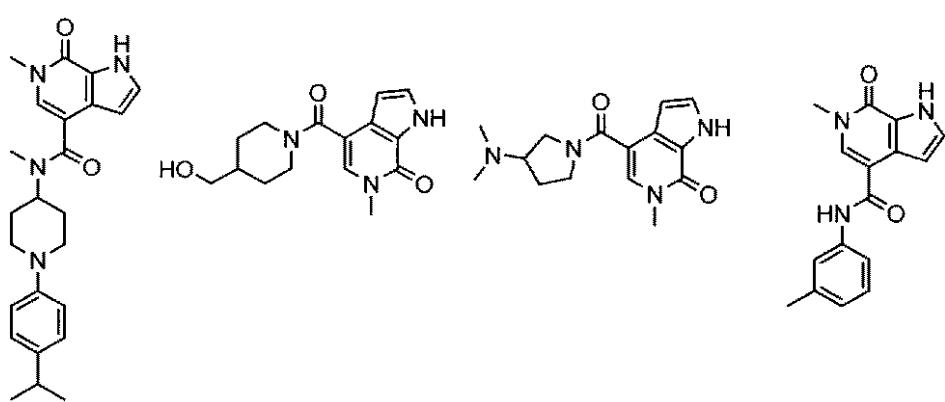
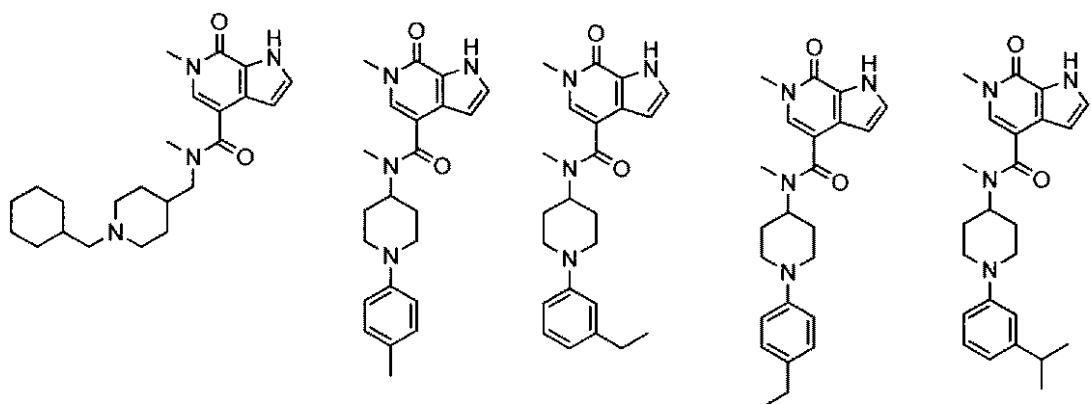
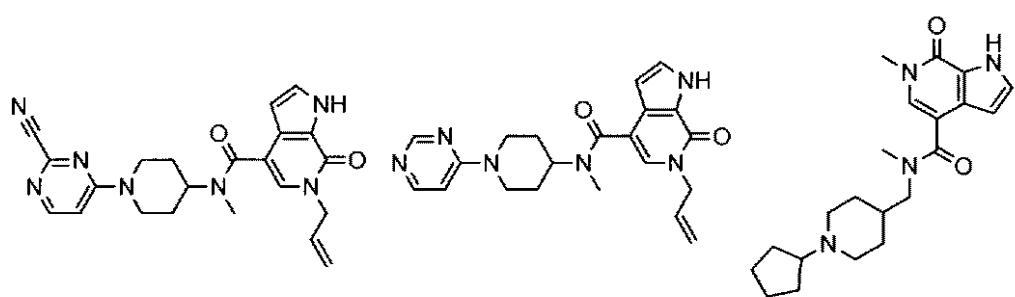
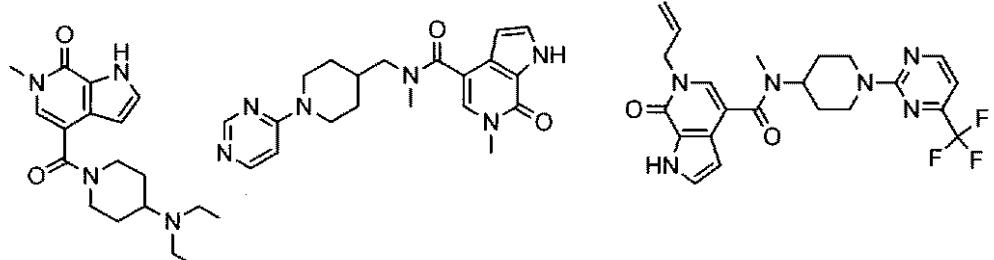
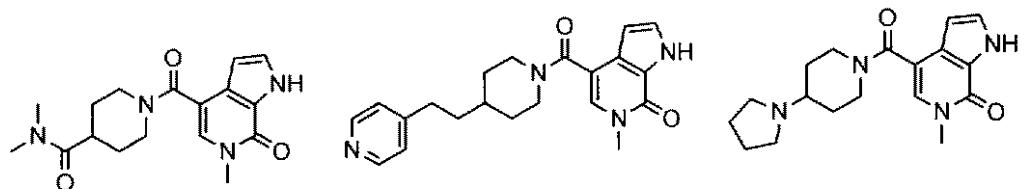
【化 1 8 5】



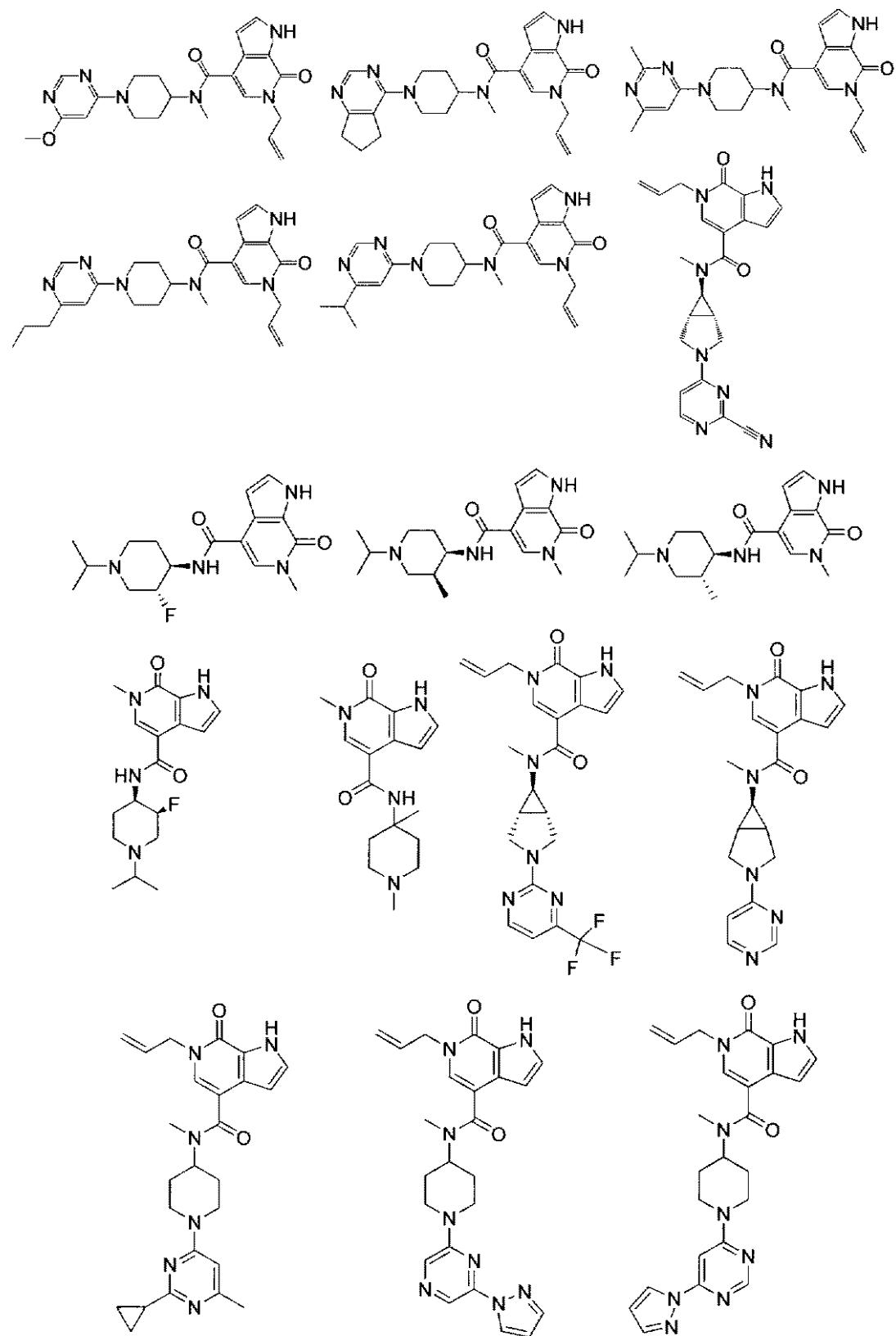
【化 1 8 6 】



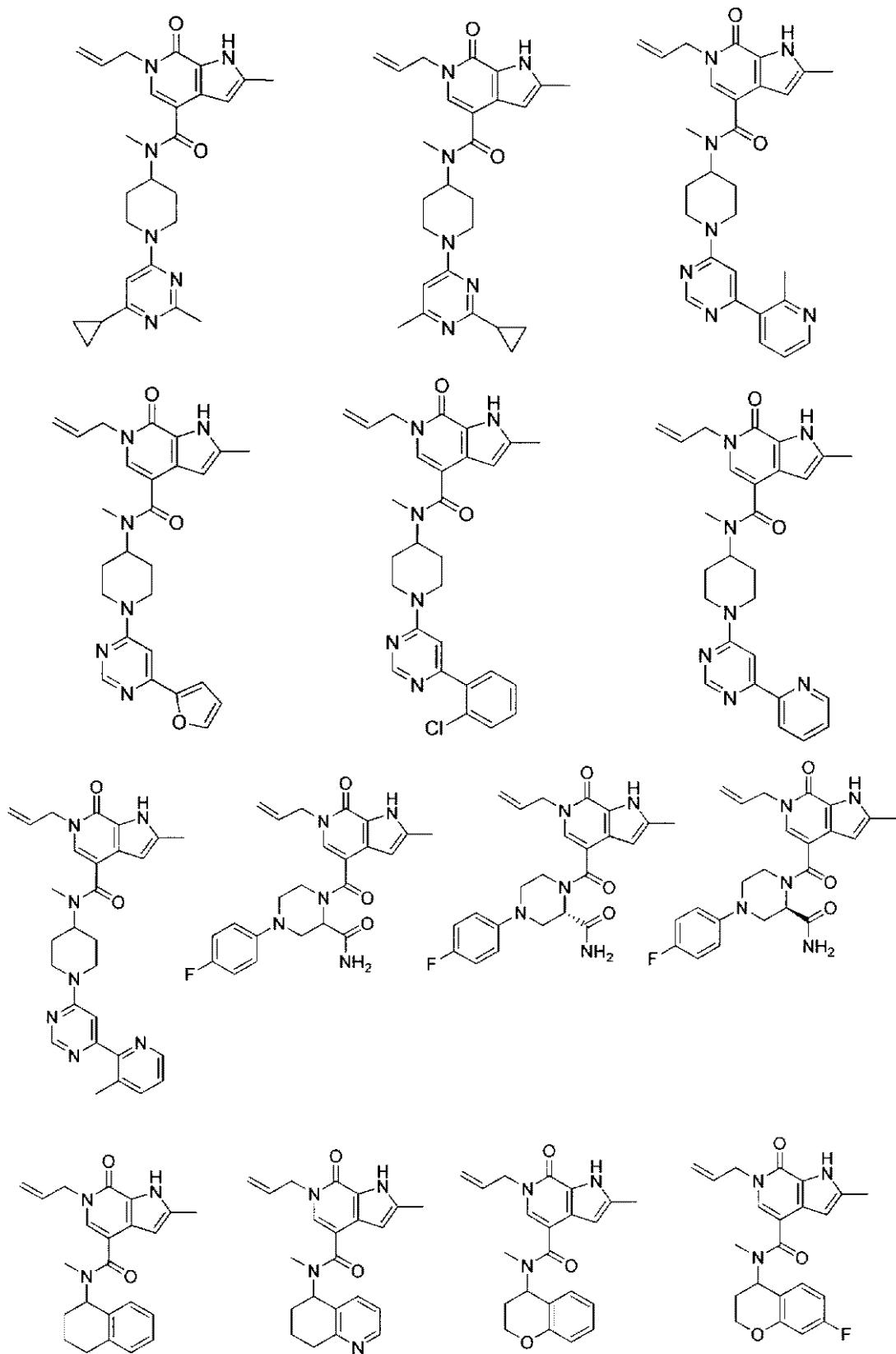
【化 1 8 7 】



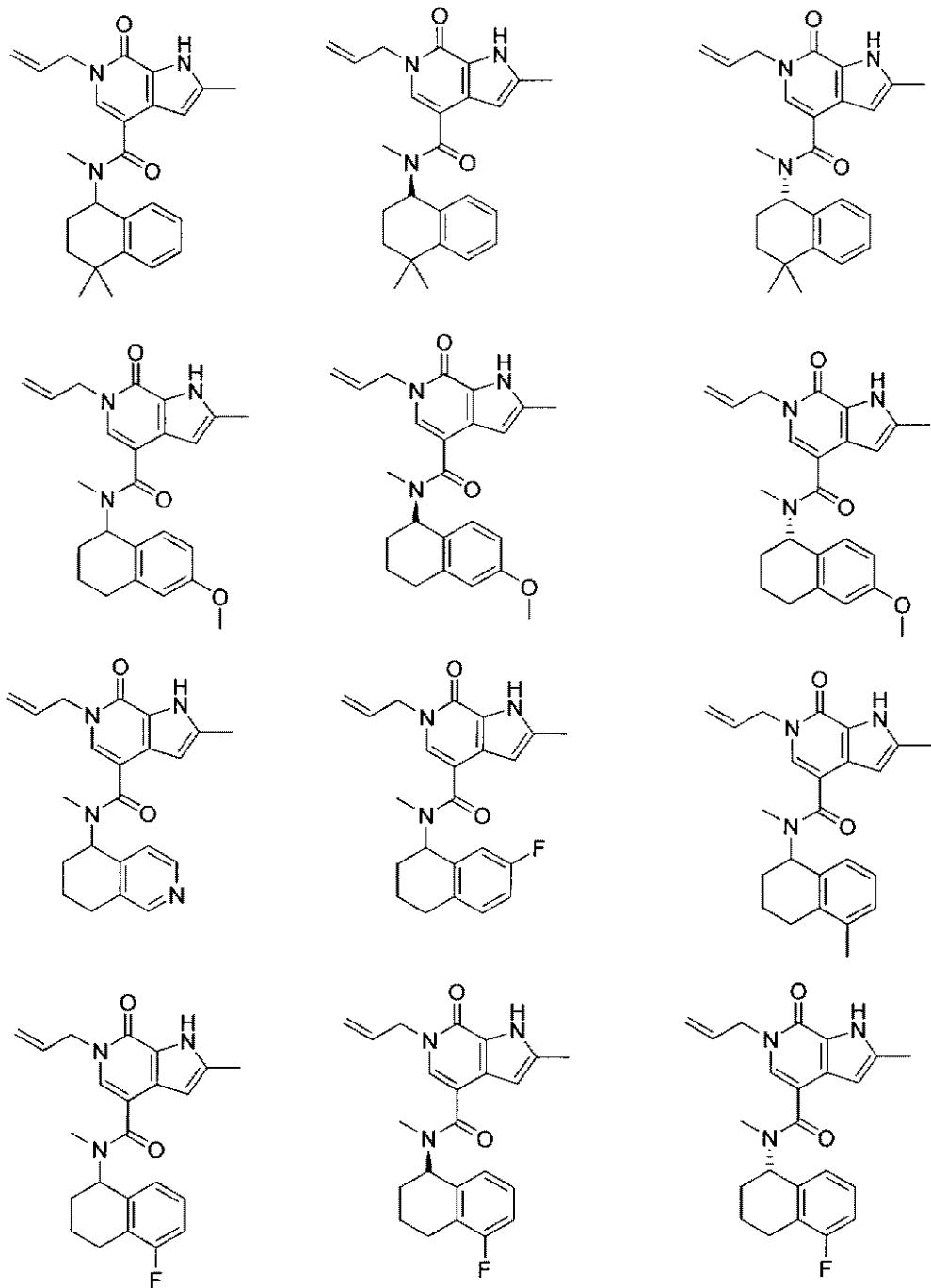
【化 1 8 8】



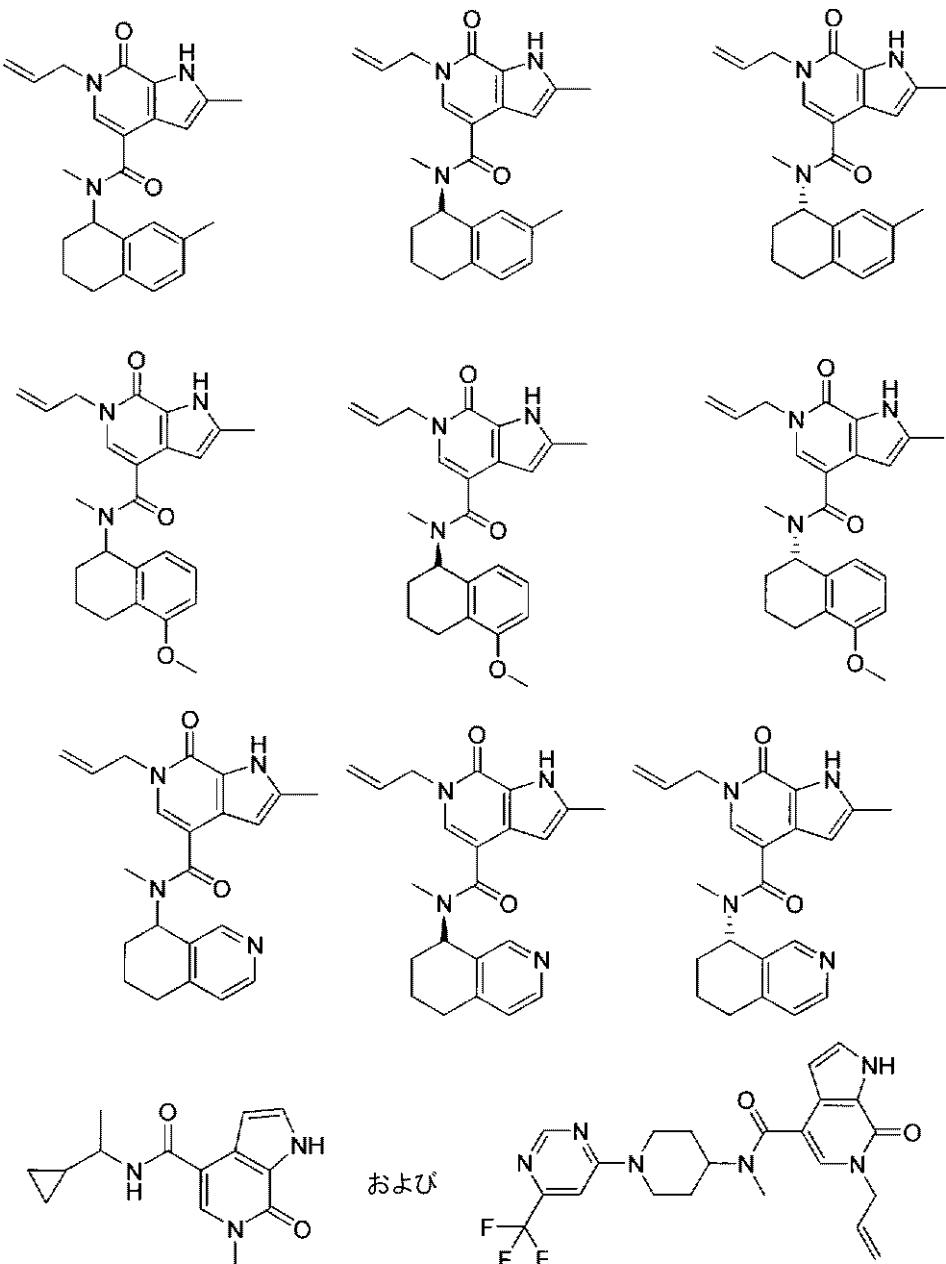
【化 1 8 9】



【化 1 9 0】



【化191】



から選択される、項目1に記載の化合物およびその塩。

(項目26)

項目1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

(項目27)

さらなる治療剤と組み合わせた項目26に記載の組成物。

(項目28)

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、項目27に記載の組成物。

(項目29)

動物におけるプロモドメイン媒介障害を処置する方法であって、項目1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を該動物に投与する工程を含む、方法。

(項目30)

前記障害が、がん、炎症性障害、または自己免疫疾患である、項目29に記載の方法。

(項目31)

前記がんが、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髓球性白血病、急性T細胞白血病、基底細胞癌、胆管癌、膀胱がん、脳がん、乳がん、気管支原性癌、子宮頸がん、軟骨肉腫、脊索腫、緘毛癌、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髓球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸がん、結腸直腸がん、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌、子宮内膜がん、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌、赤白血病、食道がん、エストロゲン受容体陽性乳がん、本態性血小板血症、ユーリング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、胚細胞精巣がん、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部がん、血管芽細胞腫、ヘパトーマ、肝細胞がん、ホルモン非感受性前立腺がん、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺がん、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T細胞またはB細胞起源のリンパ系悪性疾患、髓様癌、髓芽腫、黒色腫、髓膜腫、中皮腫、多発性骨髓腫、骨髓性白血病、骨髓腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、NUTミッドラインカルシノーマ(NMC)、非小細胞肺がん、乏突起膠腫、口腔がん、骨原性肉腫、卵巣がん、脾臓がん、乳頭腺癌、乳頭状癌、松果体腫、真性赤血球増加症、前立腺がん、直腸がん、腎細胞癌、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌、セミノーマ、皮膚がん、小細胞性肺癌、固形腫瘍(癌腫および肉腫)、小細胞肺癌がん、胃がん、扁平上皮癌、滑膜腫、汗腺癌、甲状腺がん、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮がん、およびウィルムス腫瘍から選択される、項目30に記載の方法。

(項目32)

前記がんが、肺がん、乳がん、脾臓がん、結腸直腸がん、および黒色腫から選択される、項目30に記載の方法。

(項目33)

前記炎症性障害または前記自己免疫疾患が、アジソン病、急性痛風、強直性脊椎炎、喘息、アテローム性動脈硬化症、ベーチェット病、水疱性皮膚疾患、慢性閉塞性肺疾患、クローン病、皮膚炎、湿疹、巨細胞動脈炎、線維症、糸球体腎炎、肝血管閉塞、肝炎、下垂体炎、免疫不全症候群、炎症性腸疾患、川崎病、ループス腎炎、多発性硬化症、心筋炎、筋炎、腎炎、移植臓器拒絶、骨関節炎、脾臓炎、心包炎、結節性多発性動脈炎、肺臓炎、原発性胆汁性肝硬変、乾癬、乾癬性関節炎、関節リウマチ、強膜炎、硬化性胆管炎、敗血症、全身性エリテマトーデス、高安動脈炎、中毒性ショック、甲状腺炎、I型糖尿病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、白斑、脈管炎、およびウェゲナー肉芽腫症から選択される、項目30に記載の方法。

(項目34)

前記プロモドメインが、ASH1L、ATAD2、ATAD2B、BAZ1A、BAZ1B、BAZ2A、BAZ2B、BPTF、BRD1、BRD2、BRD3、BRD4、BRD7、BRD8、BRD9、BRDT、BRPF1、BRPF3、BRWD1、BRWD3、CECR2、CREBBP(aka、CBP)、EP300、GCN5L2、KIAA2026、MLL、MLL4、PBRM、PCAF、PHIP、SMARCA2、SMARCA4、SP100、SP110、SP140、SP140L、TAF1、TAF1L、TRIM24、TRIM28、TRIM33、TRIM66、ZMYND8、およびZMYND11から選択される、項目29に記載の方法。

(項目35)

医薬療法における使用のための、項目1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目36)

プロモドメイン媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、項目1～25のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目37)

動物におけるプロモドメイン媒介障害の処置のための医薬を調製するための、項目1～2

5のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。
(項目38)

動物における細胞毒性剤を含むがん処置の有効性を増大させる方法であって、有効量の項目1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を該動物に投与することを含む、方法。

(項目39)

前記細胞毒性剤を前記動物に投与することをさらに含む、項目38に記載の方法。

(項目40)

動物における細胞毒性剤に対するがん耐性の発生を遅延させるまたは防止する方法であって、項目1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を該動物に投与することを含む、方法。

(項目41)

動物におけるがん治療に対する応答の持続時間を延長させる方法であって、該方法は、項目1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物を該がん治療を受けている動物に投与することを含み、該式(I)の化合物または該その薬学的に許容され得る塩を投与したときの該がん治療に対する応答の持続時間が、該式(I)の化合物または該その薬学的に許容され得る塩を投与しない該がん治療に対する応答の持続時間を超えて延長される、方法。

(項目42)

個体におけるがんを処置する方法であって、(a)項目1~26のいずれか1項に記載の式(I)の化合物、その薬学的に許容され得る塩、またはその組成物、および(b)細胞毒性剤を該個体に投与することを含む、方法。

(項目43)

前記細胞毒性剤が、抗微小管剤、白金配位錯体、アルキル化剤、抗生物質製剤、トポイソメラーゼIIインヒビター、代謝拮抗物質、トポイソメラーゼIインヒビター、ホルモンおよびホルモンアナログ、シグナル伝達経路インヒビター、非受容体チロシンキナーゼ血管形成インヒビター、免疫治療剤、アポトーシス促進剤、LDH-Aのインヒビター、脂肪酸合成のインヒビター、細胞周期シグナル伝達インヒビター、HDACインヒビター、プロテアソームインヒビター、およびがん代謝のインヒビターから選択される、項目42に記載の方法。

(項目44)

前記細胞毒性剤がタキサンである、項目42に記載の方法。

(項目45)

前記タキサンがパクリタキセルまたはドセタキセルである、項目44に記載の方法。

(項目46)

前記細胞毒性剤が白金製剤である、項目42に記載の方法。

(項目47)

前記細胞毒性剤がEGFRのアンタゴニストである、項目42に記載の方法。

(項目48)

前記EGFRのアンタゴニストがN-(3-エチニルフェニル)-6,7-ビス(2-メトキシエトキシ)キナゾリン-4-アミンまたはその薬学的に許容され得る塩である、項目47に記載の方法。

(項目49)

前記細胞毒性剤がRAFインヒビターである、項目42に記載の方法。

(項目50)

前記RAFインヒビターがBRAFインヒビターまたはCRAFインヒビターである、項目49に記載の方法。

(項目51)

前記RAFインヒビターがベムラフェニブである、項目49に記載の方法。

(項目52)

前記細胞毒性剤がP I 3 Kインヒビターである、項目42に記載の方法。