

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成24年4月5日 (2012.4.5)

【公表番号】特表2010-519204(P2010-519204A)

【公表日】平成22年6月3日 (2010.6.3)

【年通号数】公開・登録公報2010-022

【出願番号】特願2009-549625(P2009-549625)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 407/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 407/14

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/4436

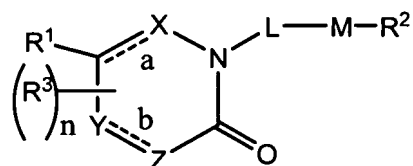
C 0 7 D 401/14

A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	37/08	

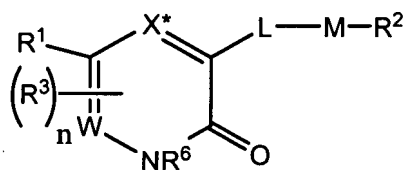
**【手続補正書】****【提出日】**平成23年2月14日(2011.2.14)**【手続補正 1】****【補正対象書類名】**特許請求の範囲**【補正対象項目名】**全文**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【特許請求の範囲】****【請求項 1】**

下記式 I、I I、I I I または I V の化合物、

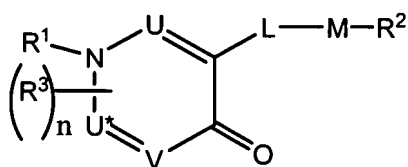
## 【化 1】



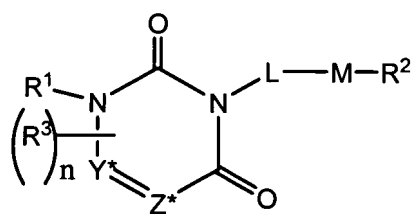
I



II



III



IV

[ 式中、

a および b は、独立に非存在であるか結合であり；

n は、価数によって許容される 0 ~ 6 の整数であり；

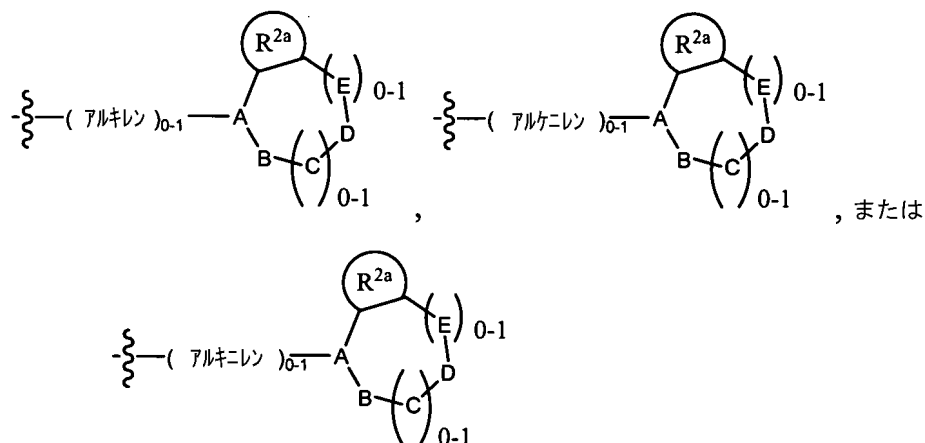
v は、0 ~ 2 の整数であり；

a が結合である場合には X は C R<sup>4</sup> \* または N であり、並びに a が非存在である場合には X は C R<sup>4</sup> R<sup>5</sup> または N R<sup>6</sup> であり；b が結合である場合には Y および Z は独立に C R<sup>4</sup> \* または N であり、並びに b が非存在である場合には Y および Z のうちの一方が C R<sup>4</sup> R<sup>5</sup> であり、他方が N R<sup>6</sup> であり；W、Y \* および Z \* は、独立に C R<sup>4</sup> \* または N であり；V、U および U \* は、独立に C R<sup>4</sup> \* または N であり、但し U および U \* のうちの一方のみが N であり；

L は、非存在、C<sub>1</sub> - 6 アルキレン、C<sub>3</sub> - 10 シクロアルキレン、C<sub>3</sub> - 10 複素環アルキレン、C<sub>2</sub> - 8 アルケニレンまたは C<sub>2</sub> - 8 アルキニレンであり、それらのいずれも 1 以上の八口、- O R<sup>7</sup> または - N R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> で置換されていても良く、並びにさらには同一の 4 個炭素原子に結合したいずれか 2 個の置換基が一体となって、スピロ縮合シクロアルキルまたは複素環を形成していても良く；

M は、非存在、- O -、- S ( O )<sub>v</sub> -、- N R<sup>6</sup> -、- C ( = O ) N R<sup>6</sup> -、- N R<sup>6</sup> ( C = O ) -、- S O<sub>2</sub> N R<sup>6</sup> -、- N R<sup>6</sup> S O<sub>2</sub> - であり、但し、L および M が同時に非存在であることはなく；または - L - M - R<sup>2</sup> が一体となって下記のもの；

## 【化 2】



を形成していても良く、

A は、CH または N であり；並びに B、C、D および E は独立に  $\text{CH}_2$ 、O、 $\text{NR}^6$  または  $\text{S}(\text{O})_v$  であり、但し A、B、C、D および E のうちの一つのみがヘテロ原子であることができ；

$\text{R}^1$  は、

(1) ハロ、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^6$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{NR}^6$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{OR}^7$ 、 $-\text{NR}^6$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{OR}^7$ 、 $-(\text{C}=\text{O})\text{R}^7$ 、 $-\text{S}(\text{O})_v\text{R}^7$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{R}^9$  または  $-\text{OR}^7$ 、

(2) シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル、 $\text{C}_{2-6}$  アルケニルまたは  $\text{C}_{2-6}$  アルキニル（それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $\text{R}^{10}$  で置換されていても良い）

であり；

$\text{R}^2$  は、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルキル、シクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $\text{R}^{10}$  で置換されていても良く；

$\text{R}^{2a}$  は、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルまたは複素環であり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $\text{R}^{10}$  で置換されていても良く；

$\text{R}^3$  は、各場合で独立にハロ、シアノ、置換されていても良いアルキル、置換されていても良いアルケニル、置換されていても良いアルキニル、 $-(\text{C}=\text{O})_{0-1}\text{R}^7$ 、 $-(\text{C}=\text{O})_{0-1}\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_v\text{R}^7$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{C}=\text{OR}^7$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}=\text{OR}^7$ 、 $-\text{NR}^6-\text{C}=\text{O}-\text{NR}^8\text{R}^9$  および  $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^7$  から選択される任意の置換基であり；

$\text{R}^{4*}$ 、 $\text{R}^4$  および  $\text{R}^5$  は各場合で、独立に H または  $\text{R}^3$  の定義で列挙された任意の置換基のうちのいずれかであり、但し、 $\text{R}^4$  および  $\text{R}^5$  が同時に  $-\text{OR}^7$ 、 $-\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_v\text{R}^7$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}=\text{OR}^7$ 、 $-\text{NR}^6-\text{C}=\text{O}-\text{NR}^8\text{R}^9$  および  $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^7$  から選択されることはできず；

$\text{R}^6$  は各場合で、独立に

(1) H、または

(2) アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル（それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $\text{R}^{10}$  で置換されていても良い）

であり；

$\text{R}^7$  は各場合で、独立に

(1) H、または

(2) アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル（それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い）

であり；

$R^8$  および  $R^9$  は各場合で、独立に

(1) H、または

(2) アルキル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル（それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い）であるか、

$R^8$  と  $R^9$  がそれらが結合している窒素原子と一体となって複素環を形成していても良く；

$R^{10}$  は、各場合で独立に価数によって許容される場合八口、オキソ、シアノ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アリール、複素環アルキル、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、 $-(CR^4R^5)_{0-3}OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}NR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)C=OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)(C=O)OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}C=ONR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}O(C=O)NR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}C=OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}(C=O)OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)C=ONR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}S(O)VR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}SO_2NR^8R^9$  または  $-(CR^4R^5)_{0-3}NR^6SO_2R^7$  から選択される 1 以上の任意の置換基である]

該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項 2】

$R^1$  が、

(1)  $-NR^8R^9$ 、 $-NR^6CONR^8R^9$ 、 $-NR^6COOR^7$ 、 $-CN$  または  $-CONR^8R^9$ ；あるいは

(2) アリール、ヘテロアリール、複素環、アルケニルまたはアルキニル（これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い）

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^1$  がアリール、ヘテロアリールまたは複素環であり、これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

M が非存在、 $-O-$  または  $-NR^6-$  であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

M が非存在、 $-O-$  または  $-NR^6-$  であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

M が非存在、 $-O-$  または  $-NR^6-$  であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^1$  が、フェニル、ナフチル、ナフチリジニル、チエニル、ベンゾチエニル、フラン、ベンゾフラニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、トリアゾリル、キノキサリニル、ベンゾジオキサリル、ベンゾジオキシニル、ジヒドロベンゾジオキシニ

ル、インドリニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾール、ベンゾイソチオザゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、モルホリニル、ピロリジニル、ピラゾリル、インダゾリル、ピペラジニル、ピペラジニル、アゼチジニル、ピラニル、ピリダジニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、キノリニル、キナゾリニル、シンノリニル、フタラジニル、ジヒドロキノリニルまたはイソキノリニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  によって置換されていても良く；並びに

$R^2$  が、キノリニル、イソキノリニル、ナフチル、ピロロピリジニル、ナフチリジニル、キナゾリニル、インダゾリル、キノキサリニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリドニル、ピリミドニル、シンノリニル、アザインドリル、アザベンゾチエニル、アザインダゾリル、7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジンまたはフェニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 6 に記載の化合物。

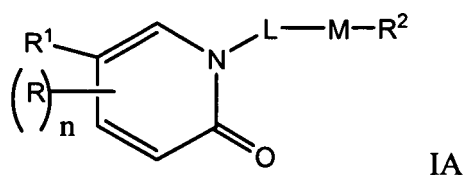
【請求項 8】

$R^2$  がキノリニルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

下記式 I A の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、

【化 3】



該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項 10】

$R^1$  が、

(1)  $-NR^8R^9$ 、 $-NR^6CONR^8R^9$ 、 $-NR^6COOR^7$ 、 $-CN$ または $-CONR^8R^9$ ；あるいは

(2) アリール、ヘテロアリール、複素環、アルケニルまたはアルキニル（これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い）である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

$R^1$  がアリール、ヘテロアリールまたは複素環であり、これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

M が非存在、 $-O-$ または $-NR^6-$ であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 13】

M が非存在、 $-O-$ または $-NR^6-$ であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R^1$  が、フェニル、ナフチル、ナフチリジニル、チエニル、ベンゾチエニル、フラン、ベンゾフラニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、トリアゾリル、キノキサリニル、ベンゾジオキサソリル、ベンゾジオキシニル、ジヒドロベンゾジオキシニル、インドリニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾール、ベンゾイソチオザゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、モルホリニル、ピロリジニル、ピラゾリル、イン

ダゾリル、ピペラジニル、ピペラジニル、アゼチジニル、ピラニル、ピリダジニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、キノリニル、キナゾリニル、シンノリニル、フタラジニル、ジヒドロキノリニルまたはイソキノリニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  によって置換されていても良く；並びに

$R^2$  が、キノリニル、イソキノリニル、ナフチル、ピロロピリジニル、ナフチリジニル、キナゾリニル、インダゾリル、キノキサリニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリドニル、ピリミドニル、シンノリニル、アザインドリル、アザベンゾチエニル、アザインダゾリル、7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジンまたはフェニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 13 に記載の化合物。

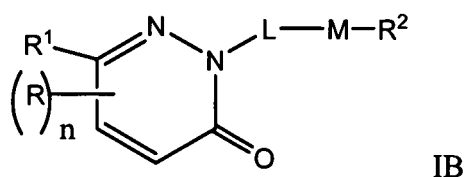
【請求項 15】

$R^2$  がキノリニルである、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

下記式 IB の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、

【化 4】



該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項 17】

$R^1$  が、

(1) -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>7</sup>、-CN または -CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>；あるいは

(2) アリール、ヘテロアリール、複素環、アルケニルまたはアルキニル（これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い）

である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

$R^1$  がアリール、ヘテロアリールまたは複素環であり、これらのいずれも、独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

M が非存在、-O- または -NR<sup>6</sup>- であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 20】

M が非存在、-O- または -NR<sup>6</sup>- であり；並びに

$R^2$  が独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールである、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 21】

$R^1$  が、フェニル、ナフチル、ナフチリジニル、チエニル、ベンゾチエニル、フラン、ベンゾフラニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、トリアゾリル、キノキサリニル、ベンゾジオキサソリル、ベンゾジオキサシニル、ジヒドロベンゾジオキサシニル、インドリニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイソオキサゾール、ベンゾイソチオザゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、モルホリニル、ピロリジニル、ピラゾリル、インダゾリル、ピペラジニル、ピペラジニル、アゼチジニル、ピラニル、ピリダジニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、キノリニル、キナゾリニル、シンノリニル、フタラジニル、ジヒドロキノリニルまたはイソキノリニルであり、それらのいずれも独立に価

数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  によって置換されていても良く；並びに

$R^2$  が、キノリニル、イソキノリニル、ナフチル、ピロロピリジニル、ナフチリジニル、キナゾリニル、インダゾリル、キノキサリニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリドニル、ピリミドニル、シンノリニル、アザインドリル、アザベンゾチエニル、アザインダゾリル、7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジンまたはフェニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い、請求項 20 に記載の化合物。

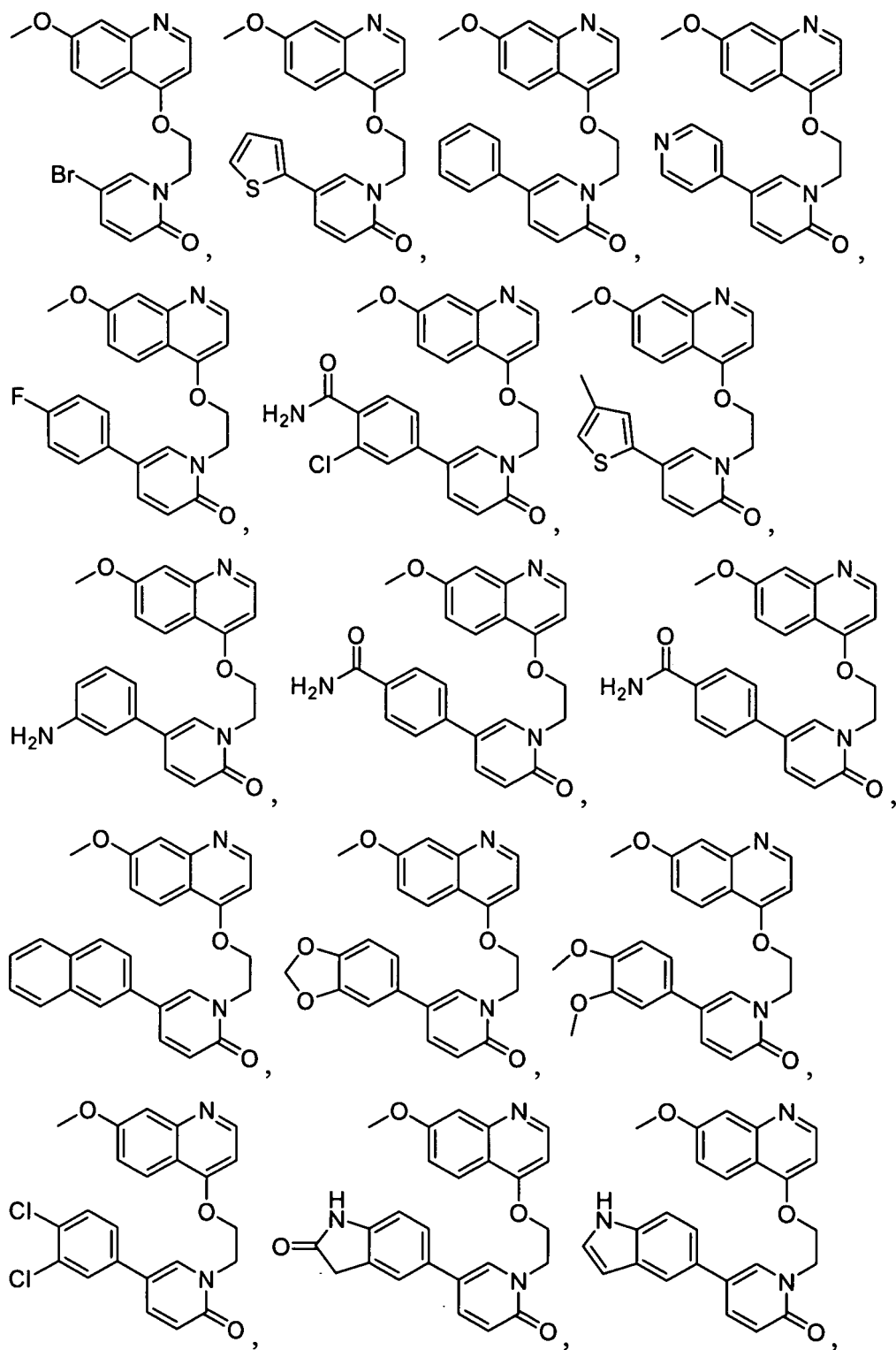
【請求項 22】

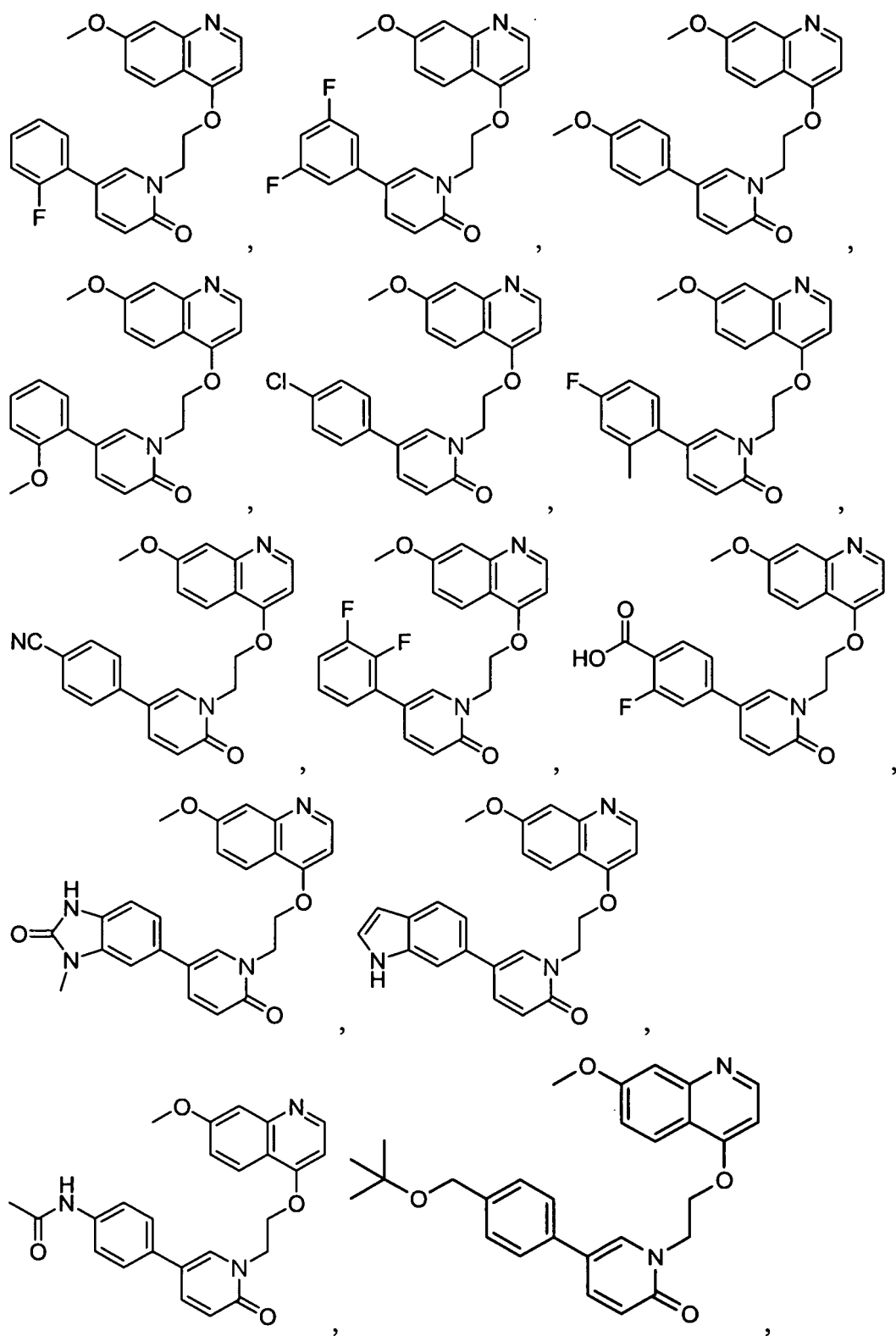
$R^2$  がキノリニルである、請求項 21 に記載の化合物。

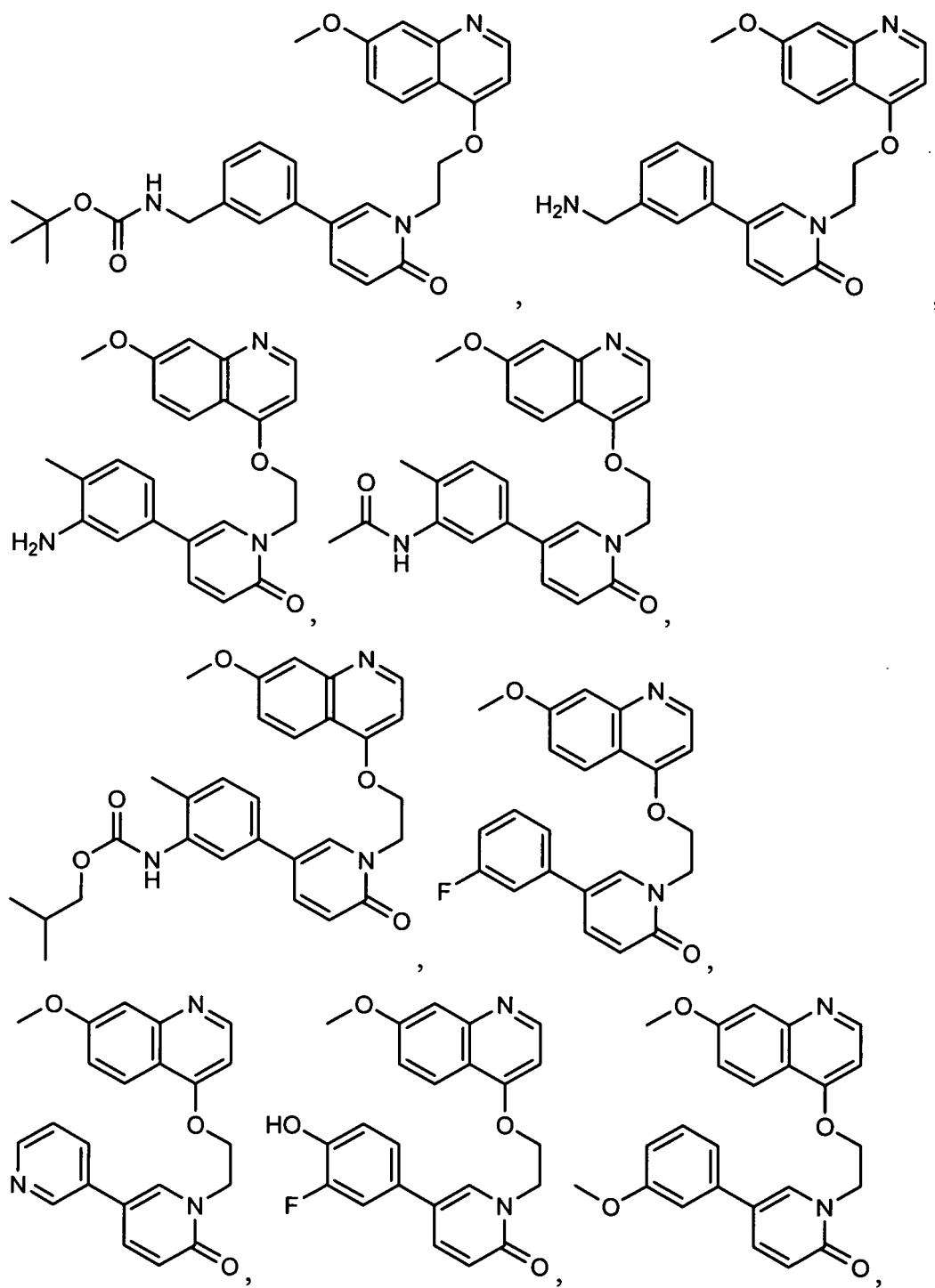
【請求項 23】

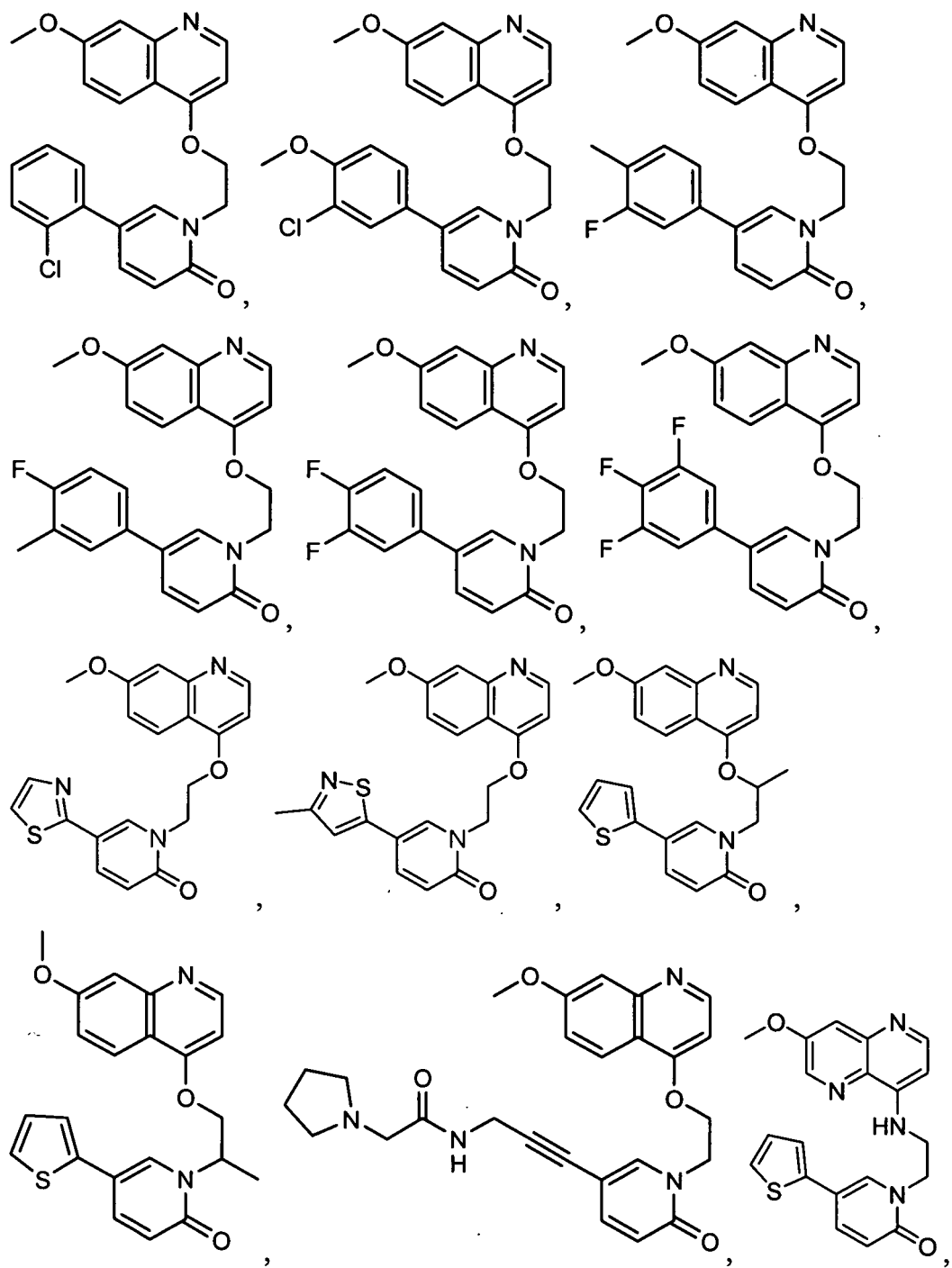


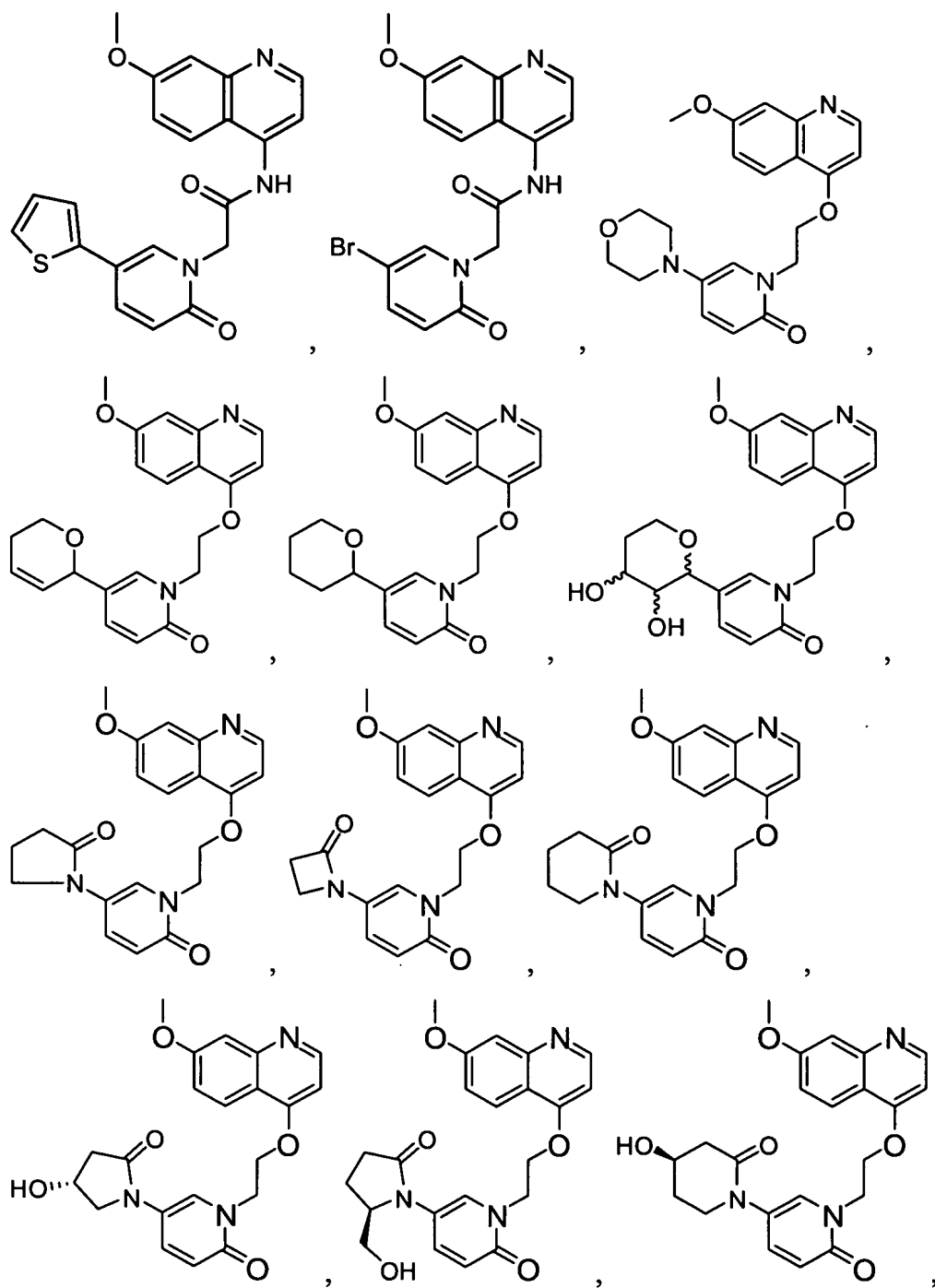
## 【化 5】

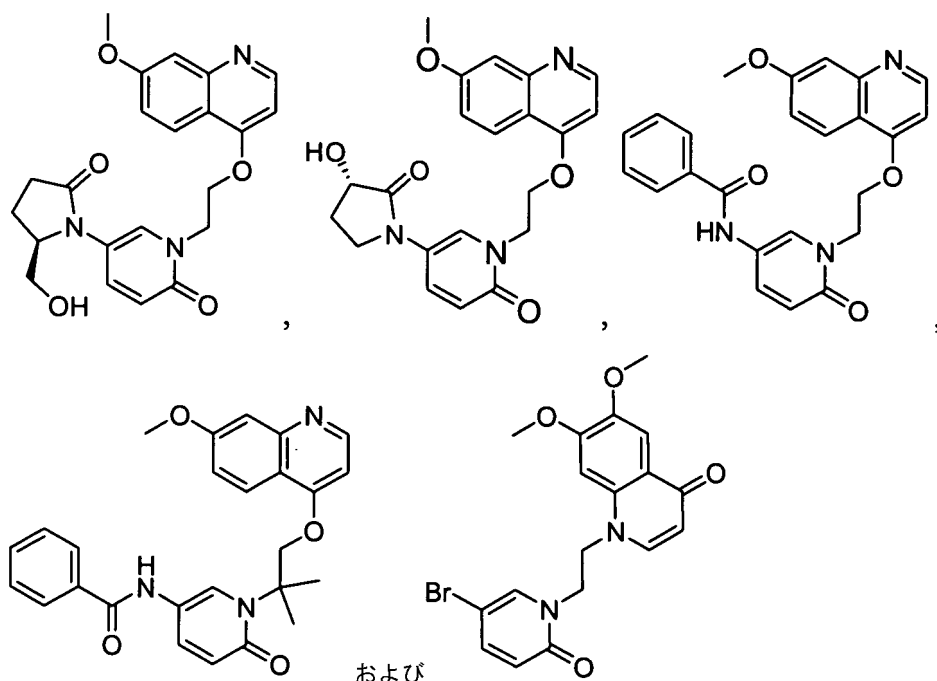








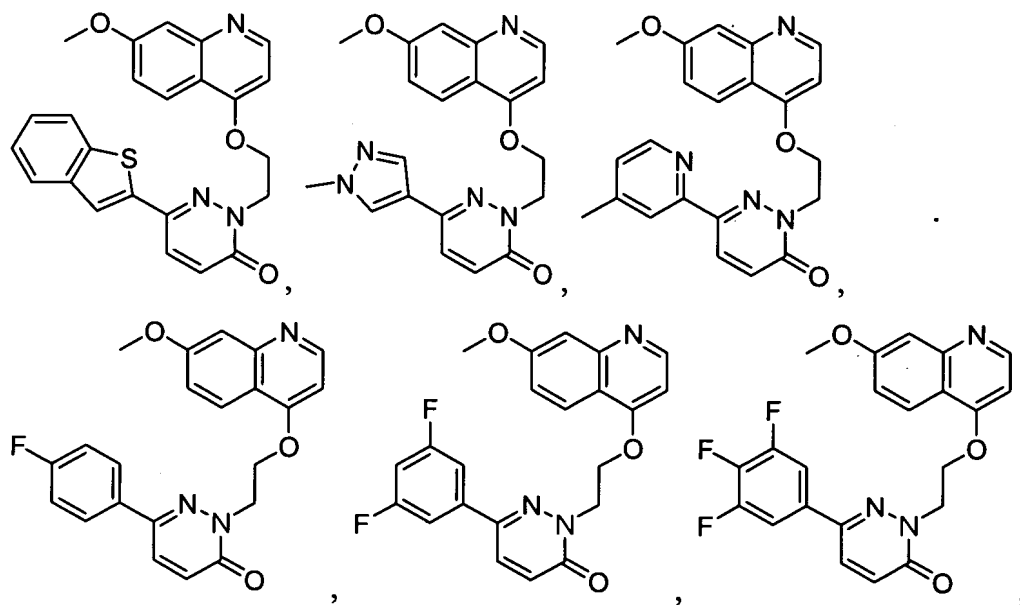


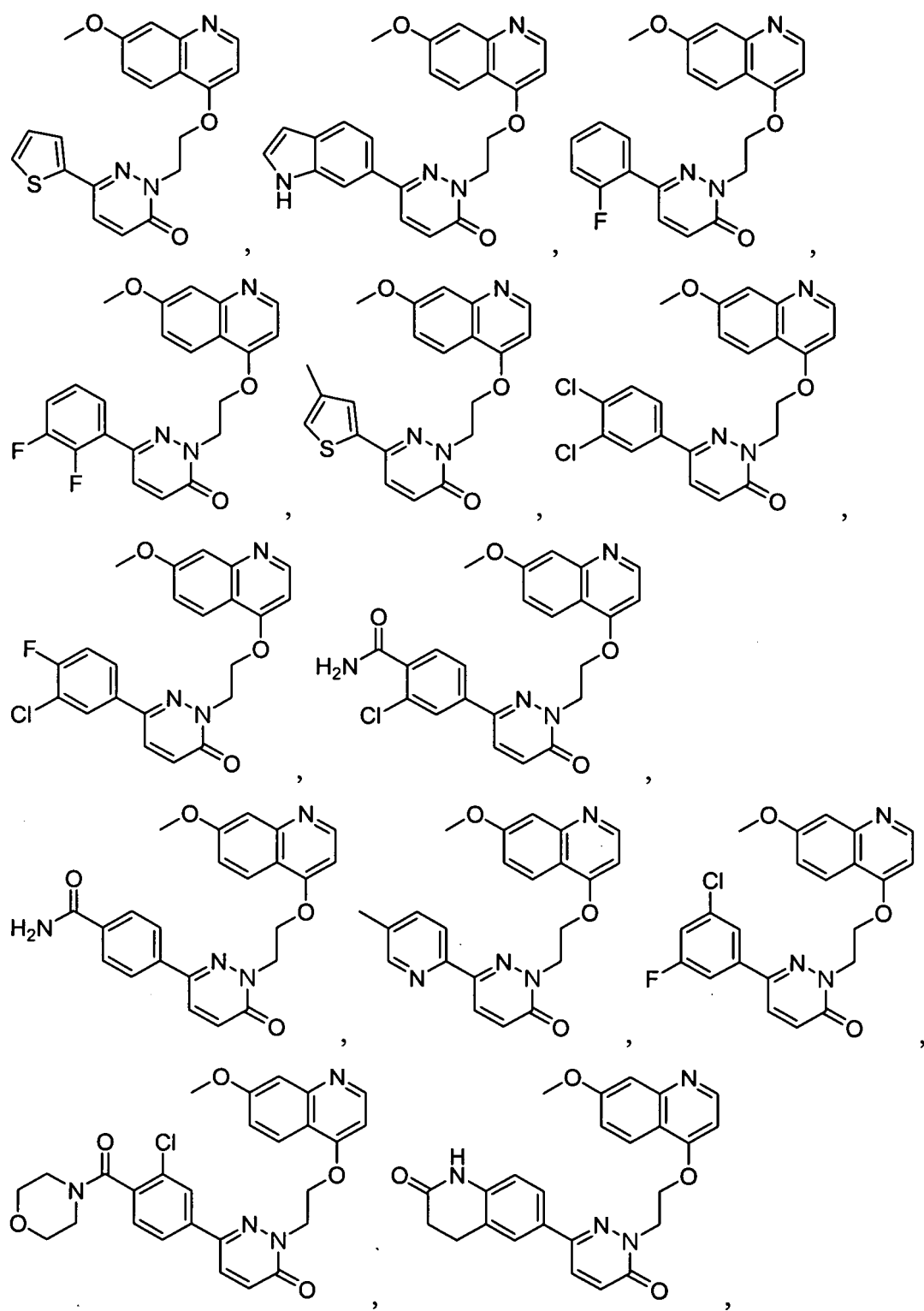


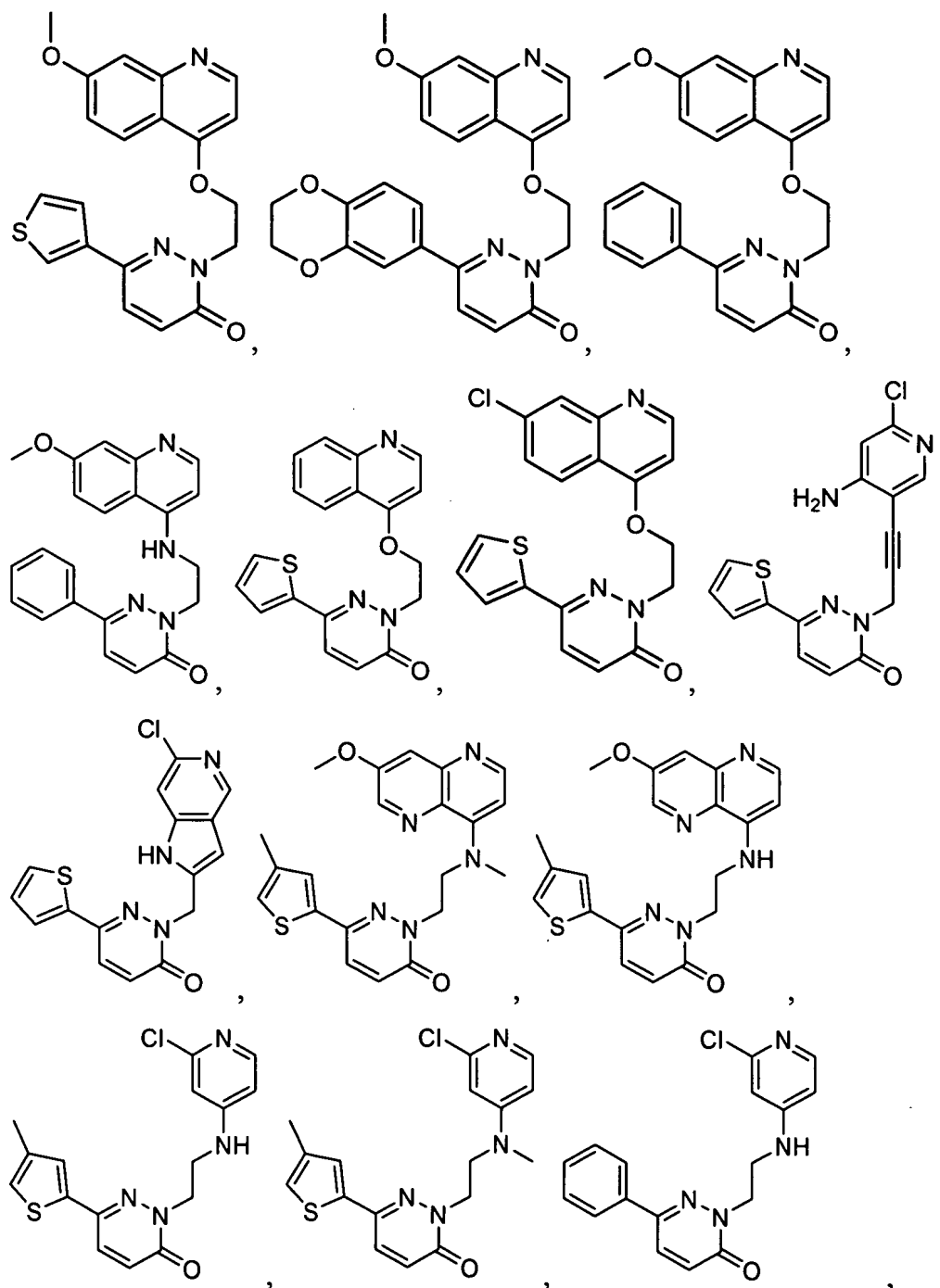
から選択される、請求項 9 に記載の化合物および該化合物の塩。

【請求項 24】

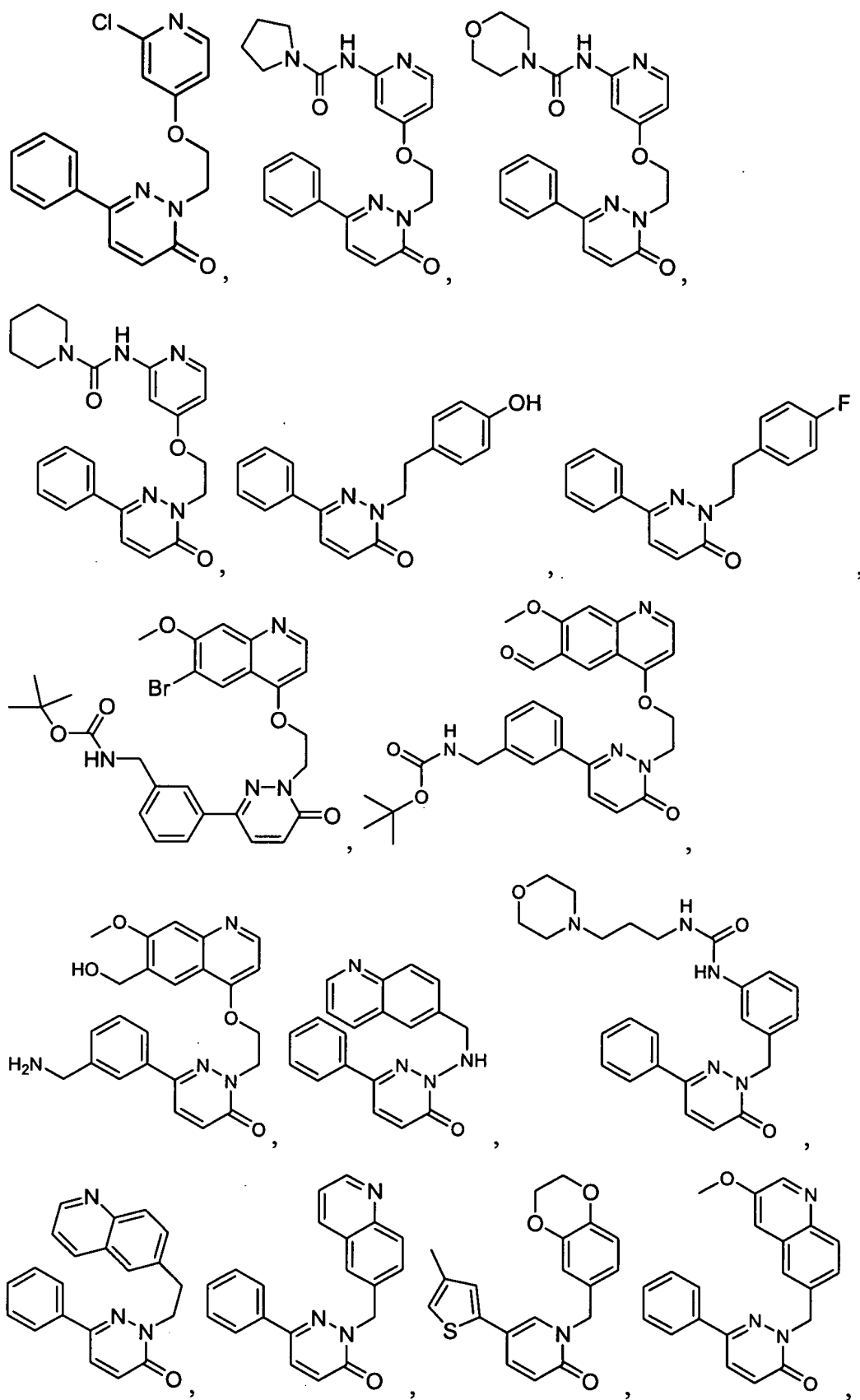
【化 6】

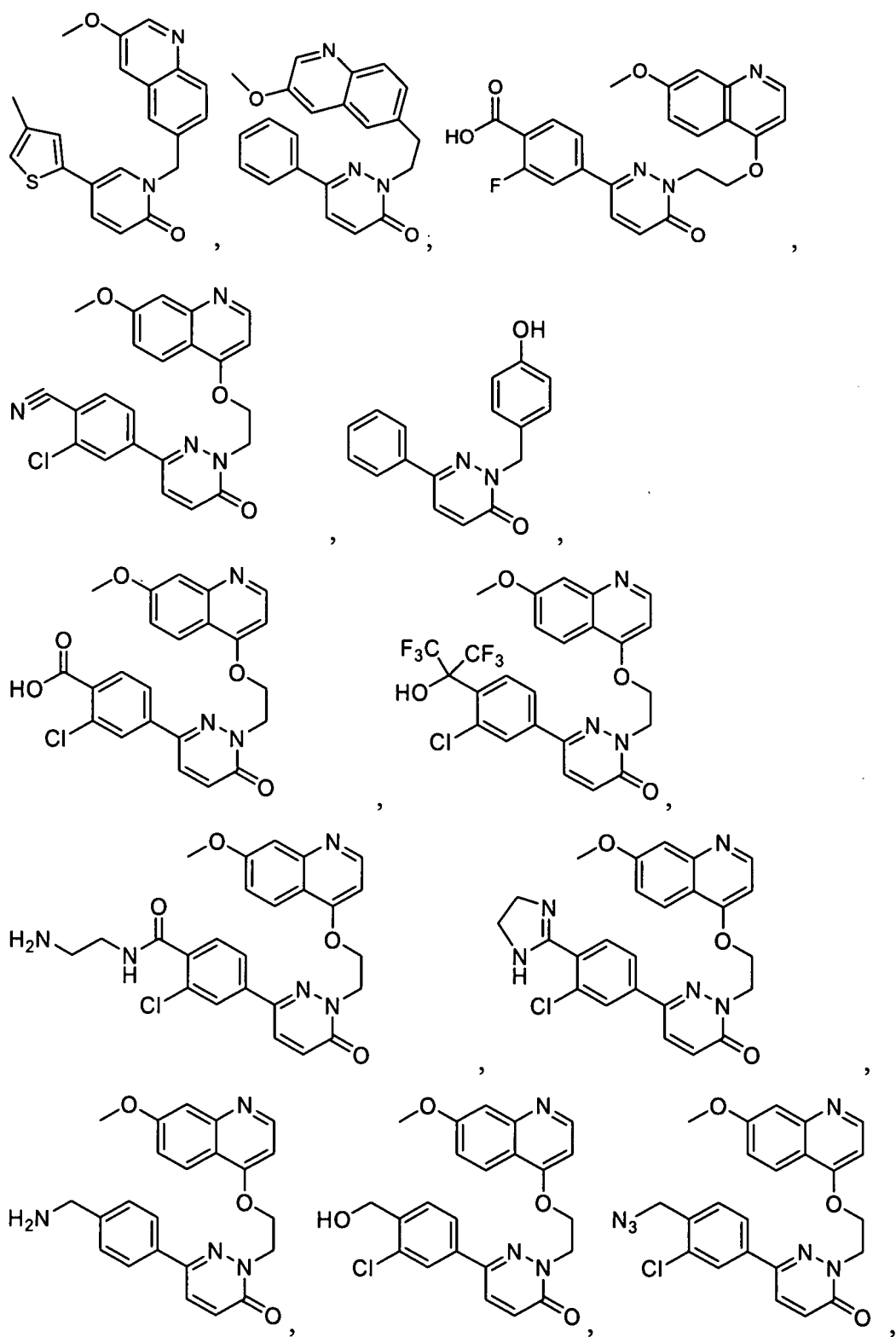


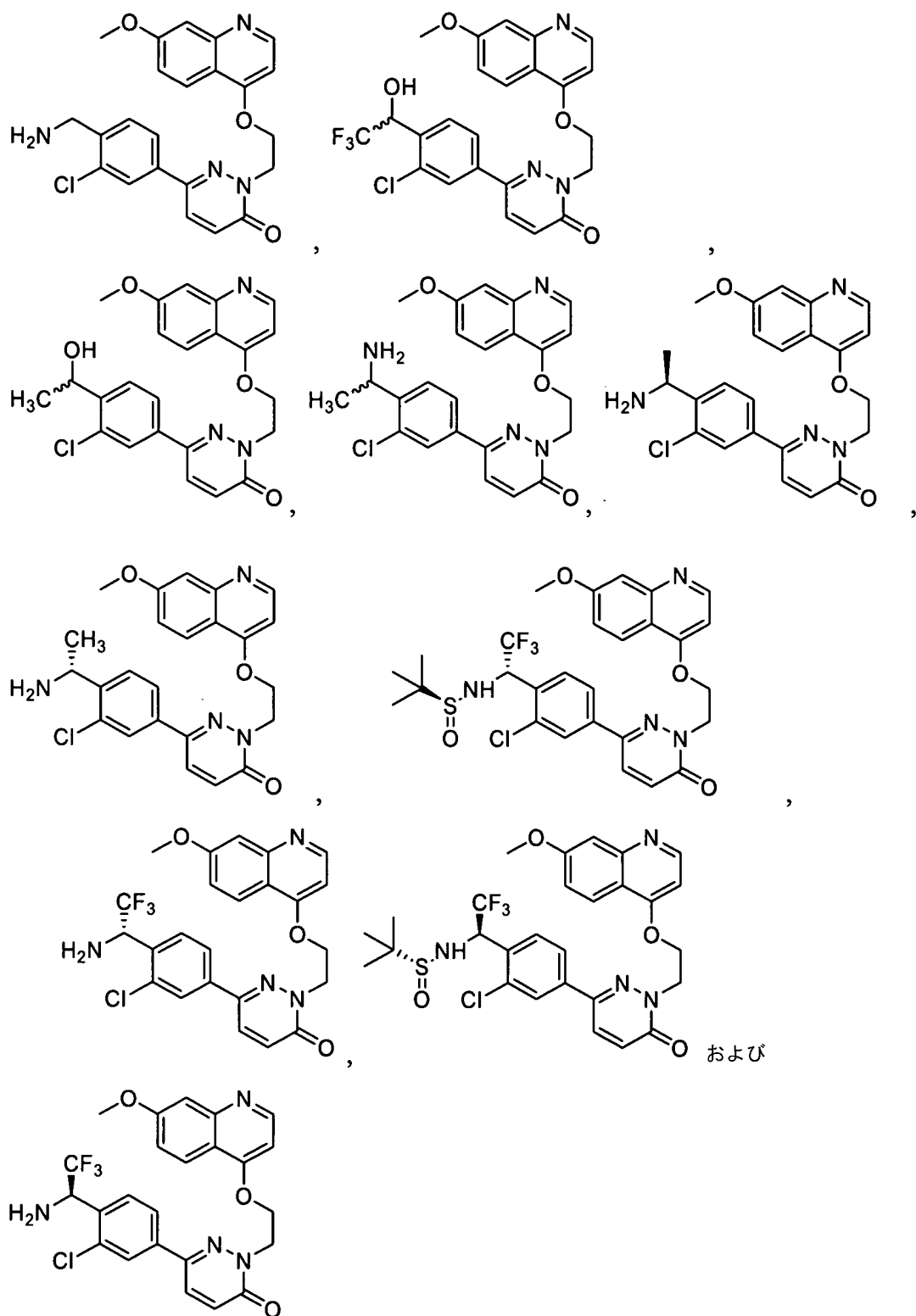










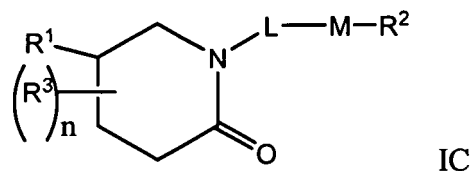


から選択される、請求項 16 に記載の化合物および該化合物の塩。

【請求項 25】

下記式 I C の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、

【化 7】

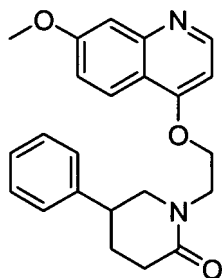


該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項 2 6】

下記の構造を有する、請求項 2 5 に記載の化合物

【化 8】

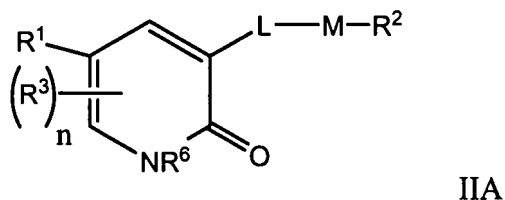


および該化合物の塩。

【請求項 2 7】

下記式 I I A の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、

【化 9】

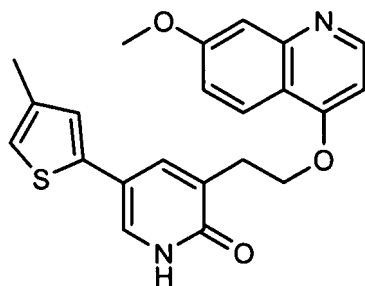


該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項 2 8】

下記の構造を有する、請求項 2 7 に記載の化合物

【化 1 0】

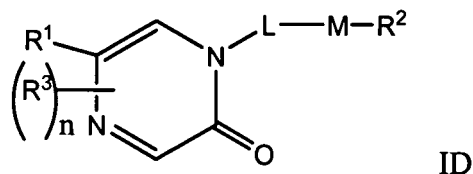


および該化合物の塩。

【請求項 2 9】

下記式 I D の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、

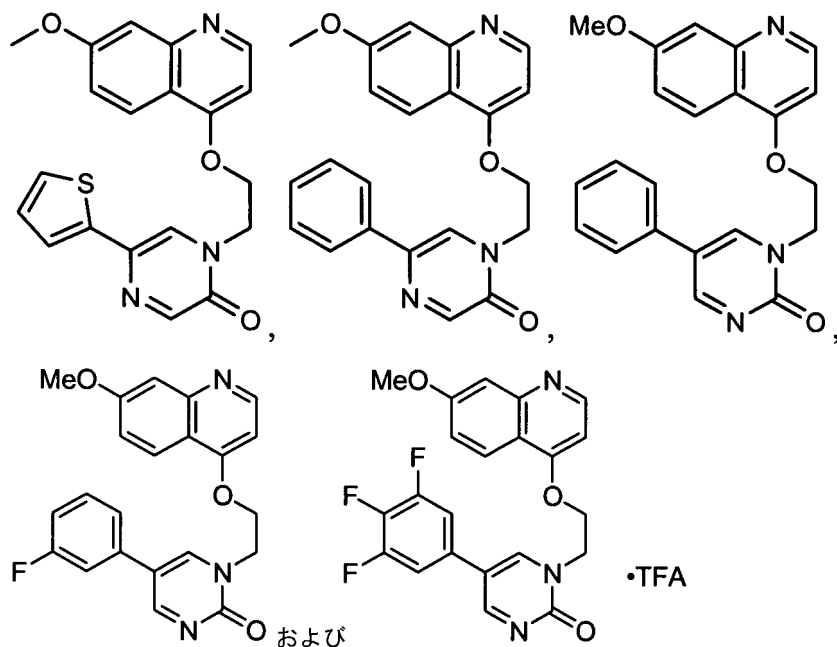
## 【化 1 1】



該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

## 【請求項 3 0】

## 【化 1 2】

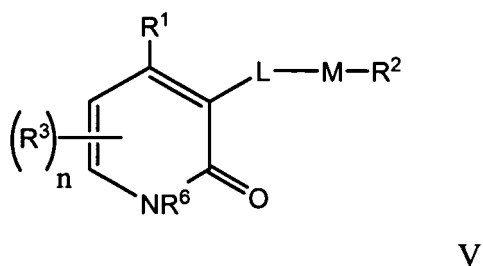


から選択される、請求項 2 9 に記載の化合物および該化合物の塩。

## 【請求項 3 1】

下記式 V に記載の化合物、

## 【化 1 3】



[ 式中、

n は、0 ~ 3 の整数であり；

v は、0 ~ 2 の整数であり；

L は、非存在、C<sub>1</sub> - 6 アルキレン、C<sub>3</sub> - 10 シクロアルキレン、C<sub>3</sub> - 10 複素環アルキレン、C<sub>2</sub> - 8 アルケニレンまたは C<sub>2</sub> - 8 アルキニレンであり、それらのいずれも独立に 1 以上の八口、-OR<sup>7</sup> または -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup> で置換されていても良く、並びにさらには同一の 4 価炭素原子に結合したいずれか 2 個の置換基が一体となって、スピロ縮合シクロアルキルまたは複素環を形成していても良く；

M は、非存在、-O-、-S(O)<sub>v</sub>-、-NR<sup>6</sup>-、-C(O)NR<sup>6</sup>-、-NR<sup>6</sup>(CO)-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>-、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>- であり、但し、L および M が同時に非存在であることはなく；

$R^1$  は、

(1) ハロ、 $-CN$ 、 $-NR^6 - (C=O)R^7$ 、 $-NR^6 - (C=O)OR^7$ 、 $-NR^6 - (C=O)NR^8R^9$ 、 $-(C=O)NR^8R^9$ 、 $-(C=O)OR^7$ 、 $-(C=O)R^7$ 、 $-S(O)_vR^7$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8R^9$  または  $-OR^7$ 、

(2) シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、複素環、複素環アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニルまたは  $C_{2-6}$  アルキニル (それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い)

であり；

$R^2$  は、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルキル、シクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良く；

$R^3$  は、各場合で独立にハロ、シアノ、置換されていても良いアルキル、置換されていても良いアルケニル、置換されていても良いアルキニル、 $-(C=O)_{0-1}R^7$ 、 $-(C=O)_{0-1}NR^8R^9$ 、 $-S(O)_vR^7$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-C=OR^7$ 、 $-NR^8C=OR^7$ 、 $-NR^6 - C=O - NR^8R^9$  および  $-NR^8SO_2R^7$  から選択される任意の置換基であり；

$R^{4*}$ 、 $R^4$  および  $R^5$  は各場合で、独立に H または  $R^3$  の定義で列挙された任意の置換基のうちのいずれかであり、但し、 $R^4$  および  $R^5$  が同時に  $-OR^7$ 、 $-NR^8R^9$ 、 $-S(O)_vR^7$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8C=OR^7$ 、 $-NR^6 - C=O - NR^8R^9$  および  $-NR^8SO_2R^7$  から選択されることはできず；

$R^6$  は各場合で、独立に

(1) H、または

(2) アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル (それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い)

であり；

$R^7$  は各場合で、独立に

(1) H、または

(2) アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル (それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の  $R^{10}$  で置換されていても良い)

であり；

$R^8$  および  $R^9$  は各場合で、独立に H、アルキル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキルであるか、 $R^8$  と  $R^9$  がそれらが結合している窒素原子と一体となって複素環を形成していても良く；並びに

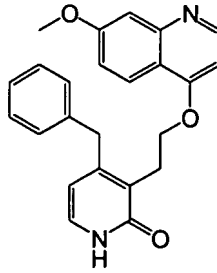
$R^{10}$  は、各場合で独立に価数によって許容される場合ハロ、オキソ、シアノ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、複素環、ヘテロアリール、アリール、複素環アルキル、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、 $-(CR^4R^5)_{0-3}OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}NR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)C=OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)(C=O)OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}C=ONR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}O(C=O)NR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}C=OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}(C=O)OR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}N(R^6)C=ONR^8R^9$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}S(O)_vR^7$ 、 $-(CR^4R^5)_{0-3}SO_2NR^8R^9$  または  $-(CR^4R^5)_{0-3}NR^6SO_2R^7$  から選択される 1 以上の任意の置換基である]

該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

## 【請求項 3 2】

下記構造を有する、請求項 3 1 に記載の化合物

## 【化 1 4】



および該化合物の塩。

## 【請求項 3 3】

請求項 1 に記載の化合物と、製薬上許容される担体と、を含む医薬組成物。

## 【請求項 3 4】

対象における癌を治療するための、有効量の請求項 1 に記載の化合物を含む医薬組成物

。

## 【請求項 3 5】

抗生物質型薬剤、アルキル化剤、代謝拮抗剤、ホルモン剤、免疫剤、インターフェロン型薬剤およびその他薬剤から選択される化合物をさらに含む、請求項 3 4 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 6】

対象における血管形成を治療するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物

。

## 【請求項 3 7】

哺乳動物における増殖関連障害を治療するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 3 8】

対象における腫瘍での血流を低減するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 3 9】

対象における腫瘍の大きさを低減するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 4 0】

対象における糖尿病性網膜症を治療するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 4 1】

哺乳動物における炎症を治療するための、有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物

。

## 【請求項 4 2】

哺乳動物における T 細胞活性化を阻害するための、治療上有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 4 3】

哺乳動物における関節炎、関節リウマチ、乾癬性関節炎または骨関節炎を治療するための、治療上有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 4 4】

哺乳動物における臓器移植、急性移植片もしくは異種移植片もしくは同種移植片拒絶または移植耐性誘発を治療するための、治療上有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物

。

## 【請求項 4 5】

哺乳動物における虚血性もしくは再灌流性損傷、心筋梗塞または卒中を治療するための、治療上有効量の請求項 1 の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 46】

哺乳動物における多発性硬化症、潰瘍性大腸炎を含む炎症性腸疾患、クローン病、狼瘡、接触過敏症、遅延型過敏およびグルテン過敏性腸疾患、I 型糖尿病、乾癬、接触皮膚炎、橋本甲状腺炎、シェーグレン症候群、自己免疫性甲状腺機能亢進症、アジソン病、自己免疫性多腺性疾患、自己免疫性脱毛症、悪性貧血、白斑、自己免疫性下垂体機能低下症、ギラン・バレー症候群、糸球体腎炎、血清病、蕁麻疹 (urticaria)、アレルギー疾患、喘息、花粉症、アレルギー性鼻炎、強皮症 (scleroderma)、菌状息肉腫、皮膚筋炎、円形脱毛症、慢性光線性皮膚炎、湿疹、ベーチェット病、掌蹠膿疱症、壞疽性膿皮症、セザリー症候群、アトピー性皮膚炎、全身性硬化症、限局性強皮症、アトピー性皮膚炎を治療する、または哺乳動物において画像診断するための、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を含む医薬組成物。