

【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 07D 401/12 | (2006.01) |
| C 07D 409/14 | (2006.01) |
| C 07D 403/14 | (2006.01) |
| C 07D 417/14 | (2006.01) |
| C 07D 407/14 | (2006.01) |
| C 07D 471/04 | (2006.01) |
| A 61K 31/4709 | (2006.01) |
| A 61K 31/5377 | (2006.01) |
| A 61K 31/501 | (2006.01) |
| A 61K 31/4436 | (2006.01) |
| C 07D 401/14 | (2006.01) |
| A 61P 35/00 | (2006.01) |
| A 61P 9/00 | (2006.01) |
| A 61P 43/00 | (2006.01) |
| A 61P 9/10 | (2006.01) |
| A 61P 29/00 | (2006.01) |
| A 61P 19/02 | (2006.01) |
| A 61P 37/06 | (2006.01) |
| A 61P 1/04 | (2006.01) |
| A 61P 3/10 | (2006.01) |
| A 61P 17/00 | (2006.01) |
| A 61P 17/06 | (2006.01) |
| A 61P 25/00 | (2006.01) |
| A 61P 5/14 | (2006.01) |
| A 61P 13/12 | (2006.01) |
| A 61P 17/04 | (2006.01) |
| A 61P 11/06 | (2006.01) |
| A 61P 11/02 | (2006.01) |
| A 61P 37/08 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|---------------|---------|
| C 07D 401/12 | C S P |
| C 07D 409/14 | |
| C 07D 403/14 | |
| C 07D 417/14 | |
| C 07D 407/14 | |
| C 07D 471/04 | 1 0 4 Z |
| A 61K 31/4709 | |
| A 61K 31/5377 | |
| A 61K 31/501 | |
| A 61K 31/4436 | |
| C 07D 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

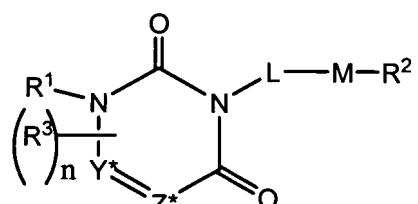
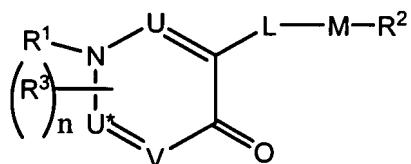
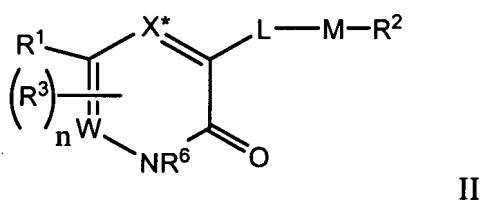
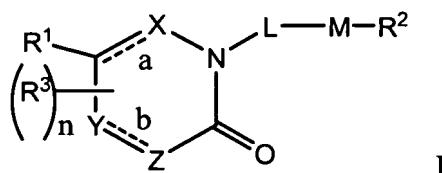
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式I、II、IIIまたはIVの化合物、

【化1】



[式中、

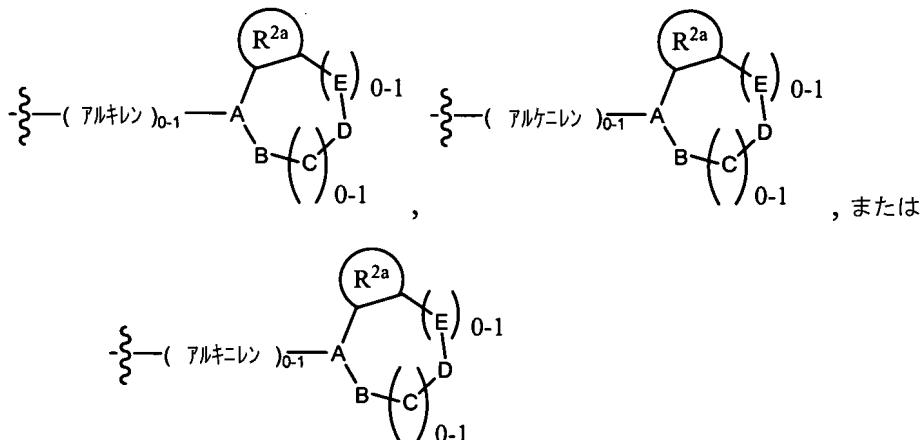
a および b は、独立に非存在であるか結合であり；

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 CR⁴* または N であり、並びに a が非存在である場合には X は CR⁴R⁵ または NR⁶ であり；b が結合である場合には Y および Z は独立に CR⁴* 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 CR⁴R⁵ であり、他方が NR⁶ であり；W、Y* および Z* は、独立に CR⁴* または N であり；V、U および U* は、独立に CR⁴* 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、C₁~₆ アルキレン、C₃~₁₀ シクロアルキレン、C₃~₁₀ 複素環アルキレン、C₂~₈ アルケニレンまたは C₂~₈ アルキニレンであり、それらのいずれも 1 以上のハロ、-OR⁷ または -NR⁸R⁹ 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)_v-、-NR⁶-、-C(=O)NR⁶-、-NR⁶(C=O)-、-SO₂NR⁶-、-NR⁶SO₂- 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-R² が一体となって下記のもの：

【化2】



を形成していくても良く、

Aは、CHまたはNであり；並びにB、C、DおよびEは独立にCH₂、O、NR⁶またはS(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；

R¹は、

(1) ハロ、-CN、-NR⁶-(C=O)R⁷、-NR⁶-(C=O)OR⁷、-NR⁶-(C=O)NR⁸R⁹、-(C=O)NR⁸R⁹、-(C=O)OR⁷、-(C=O)R⁷、-S(O)_vR⁷、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹または-OR⁷、

(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、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニルまたはC₂₋₆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R¹⁻⁰で置換されていても良い)

であり；

R²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R¹⁻⁰で置換されていても良い；

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R¹⁻⁰で置換されていても良い；

R³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)₀₋₁R⁷、-(C=O)₀₋₁NR⁸R⁹、-S(O)_vR⁷、-SO₂NR⁸R⁹、-C=OR⁷、-NR⁸C=OR⁷、-NR⁶-C=O-NR⁸R⁹および-NR⁸SO₂R⁷から選択される任意の置換基であり；

R^{4*}、R⁴およびR⁵は各場合で、独立にHまたはR³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、R⁴およびR⁵が同時に-OR⁷、-NR⁸R⁹、-S(O)_vR⁷、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸C=OR⁷、-NR⁶-C=O-NR⁸R⁹および-NR⁸SO₂R⁷から選択されることはできず；

R⁶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R¹⁻⁰で置換されていても良い)

であり；

R⁷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^{1~0}で置換されていても良い)

であり；

R⁸およびR⁹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^{1~0}で置換されていても良い)であるか、

R⁸とR⁹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も良く；

R^{1~0}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、-(CR⁴R⁵)_{0~3}OR⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}NR⁸R⁹、-(CR⁴R⁵)_{0~3}N(R⁶)C=OR⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}N(R⁶)(C=O)OR⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}C=ONR⁸R⁹、-(CR⁴R⁵)_{0~3}O(C=O)NR⁸R⁹、-(CR⁴R⁵)_{0~3}C=OR⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}(C=O)OR⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}N(R⁶)C=ONR⁸R⁹、-(CR⁴R⁵)_{0~3}S(O)V R⁷、-(CR⁴R⁵)_{0~3}SO₂NR⁸R⁹または-(CR⁴R⁵)_{0~3}NR⁶SO₂R⁷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】

R¹が、

(1) -NR⁸R⁹、-NR⁶CNR⁸R⁹、-NR⁶COOR⁷、-CNまたは-CNR⁸R⁹；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^{1~0}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】

R¹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^{1~0}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-NR⁶-であり；並びに

R²が独立に価数が許容する場合1以上のR^{1~0}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-NR⁶-であり；並びに

R²が独立に価数が許容する場合1以上のR^{1~0}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-NR⁶-であり；並びに

R²が独立に価数が許容する場合1以上のR^{1~0}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】

R¹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、ビペラジニル、ビペラジニル、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以上の中のR¹によって置換されていても良く；並びに

R²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以上の中のR¹で置換されていても良い、請求項6に記載の化合物。

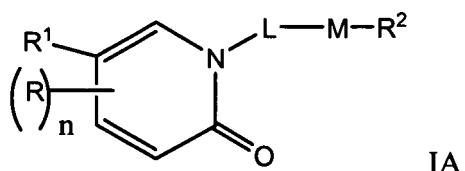
【請求項8】

R²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IA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】

R¹が、

(1) -NR⁸R⁹、-NR⁶C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁶COOR⁷、-CNまたは-C(=O)NR⁸R⁹；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以上の中のR¹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】

R¹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以上の中のR¹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-NR⁶-であり；並びに

R²が独立に価数が許容する場合1以上の中のR¹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-NR⁶-であり；並びに

R²が独立に価数が許容する場合1以上の中のR¹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】

R¹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、ビペラジニル、ビペラジニル、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以上の中のR¹によって置換されていても良く；並びに

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 $R^{1,0}$ 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 $R^{1,0}$ で置換されていても良い、請求項 13 に記載の化合物。

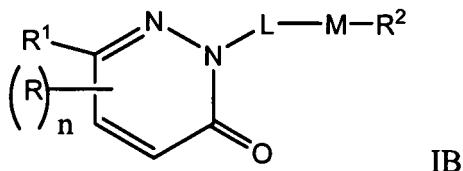
【請求項 15】

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) -NR⁸R⁹、-NR⁶C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁶C(=O)OR⁷、-CN または -C(=O)NR⁸R⁹；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 $R^{1,0}$ 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 $R^{1,0}$ 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 -NR⁶- 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 $R^{1,0}$ 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 -NR⁶- 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 $R^{1,0}$ 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 $R^{1 \sim 0}$ によって置換されていても良く；並びに

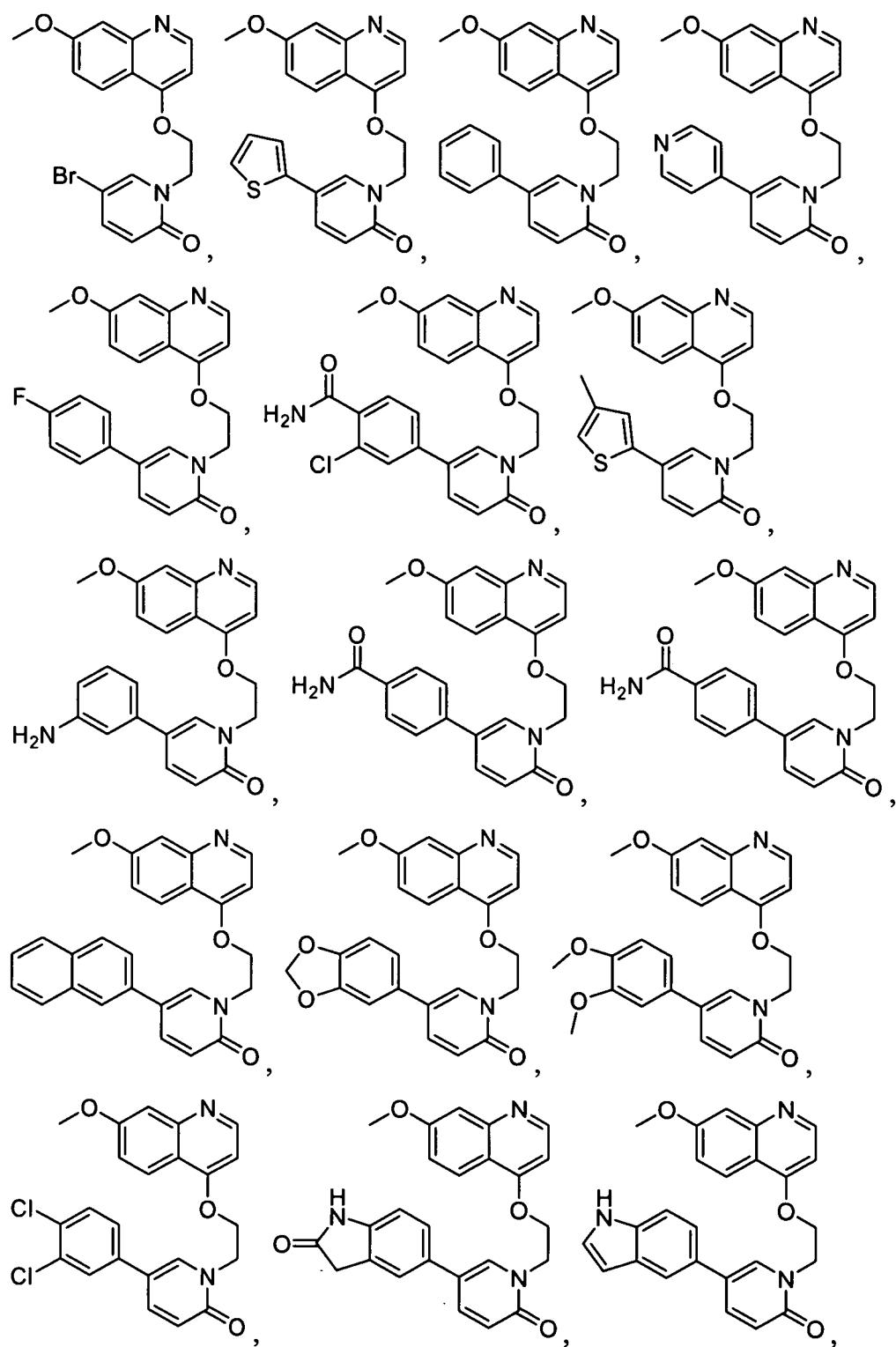
R^2 が、キノリニル、イソキノリニル、ナフチル、ピロロピリジニル、ナフチリジニル、キナゾリニル、インダゾリル、キノキサリニル、ピリジル、ピリミジニル、ピリドニル、ピリミドニル、シンノリニル、アザインドリル、アザベンゾチエニル、アザインダゾリル、7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジンまたはフェニルであり、それらのいずれも独立に価数が許容する場合 1 以上の $R^{1 \sim 0}$ で置換されていても良い、請求項 2-0 に記載の化合物。

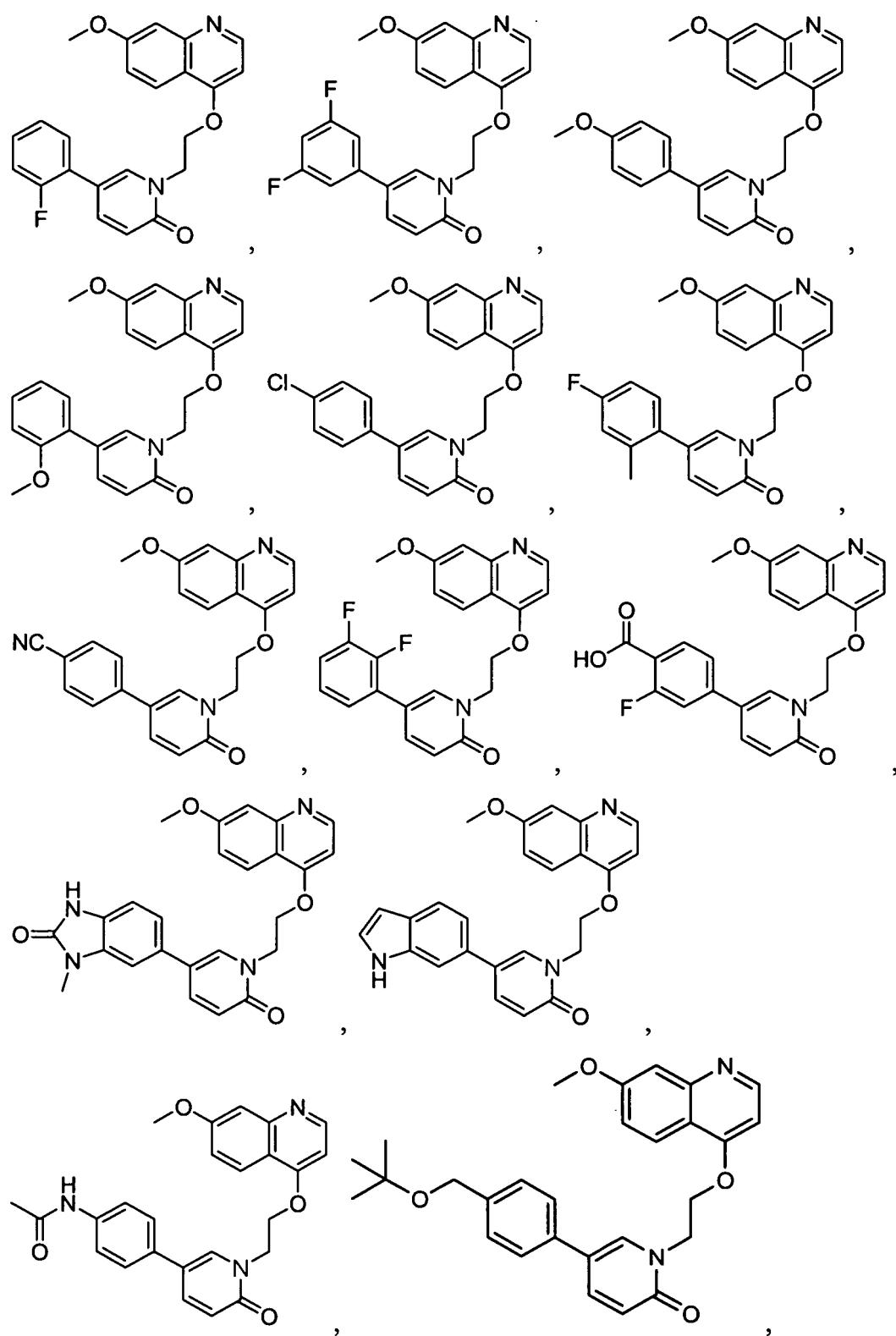
【請求項 2-2】

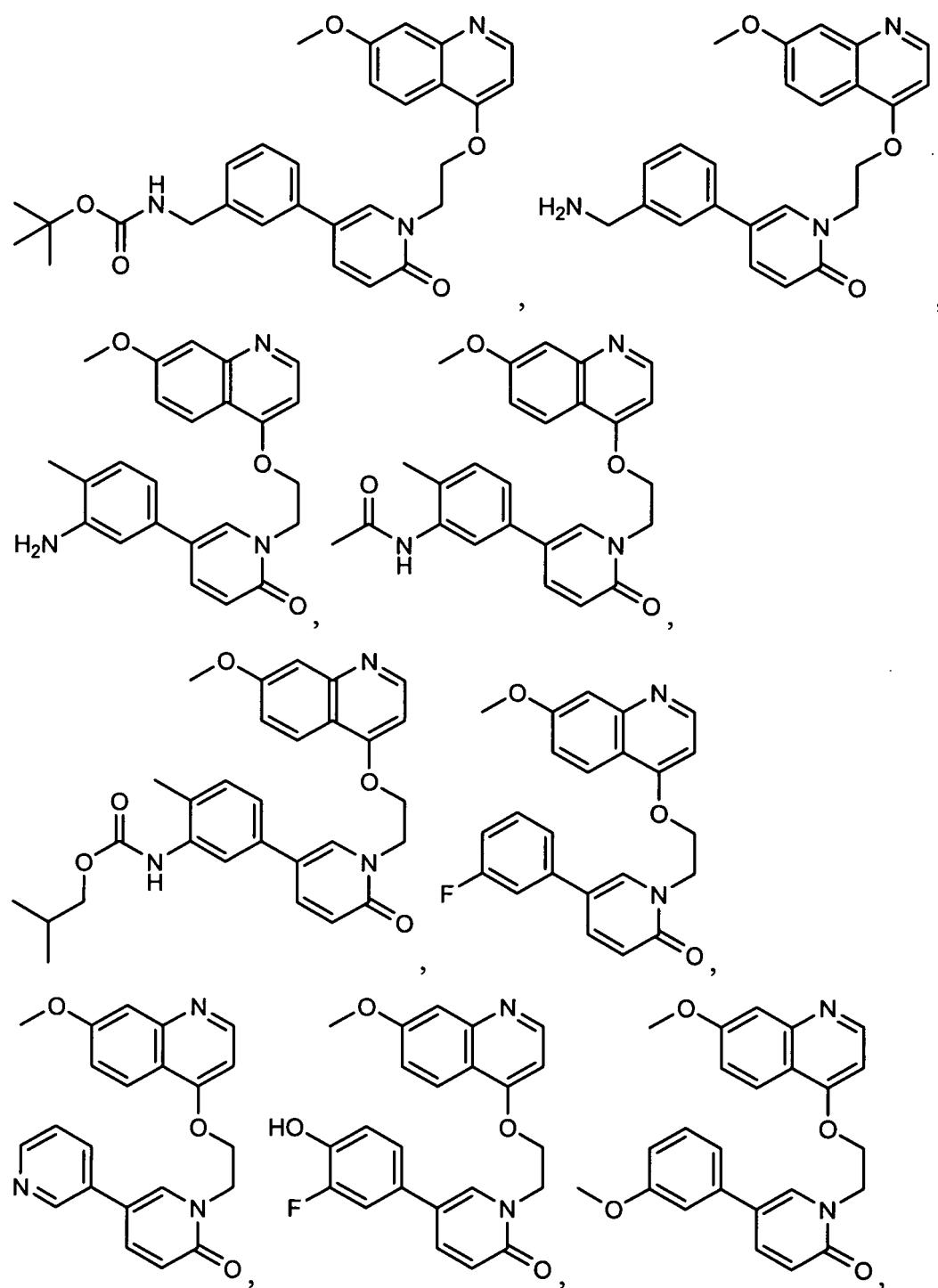
R^2 がキノリニルである、請求項 2-1 に記載の化合物。

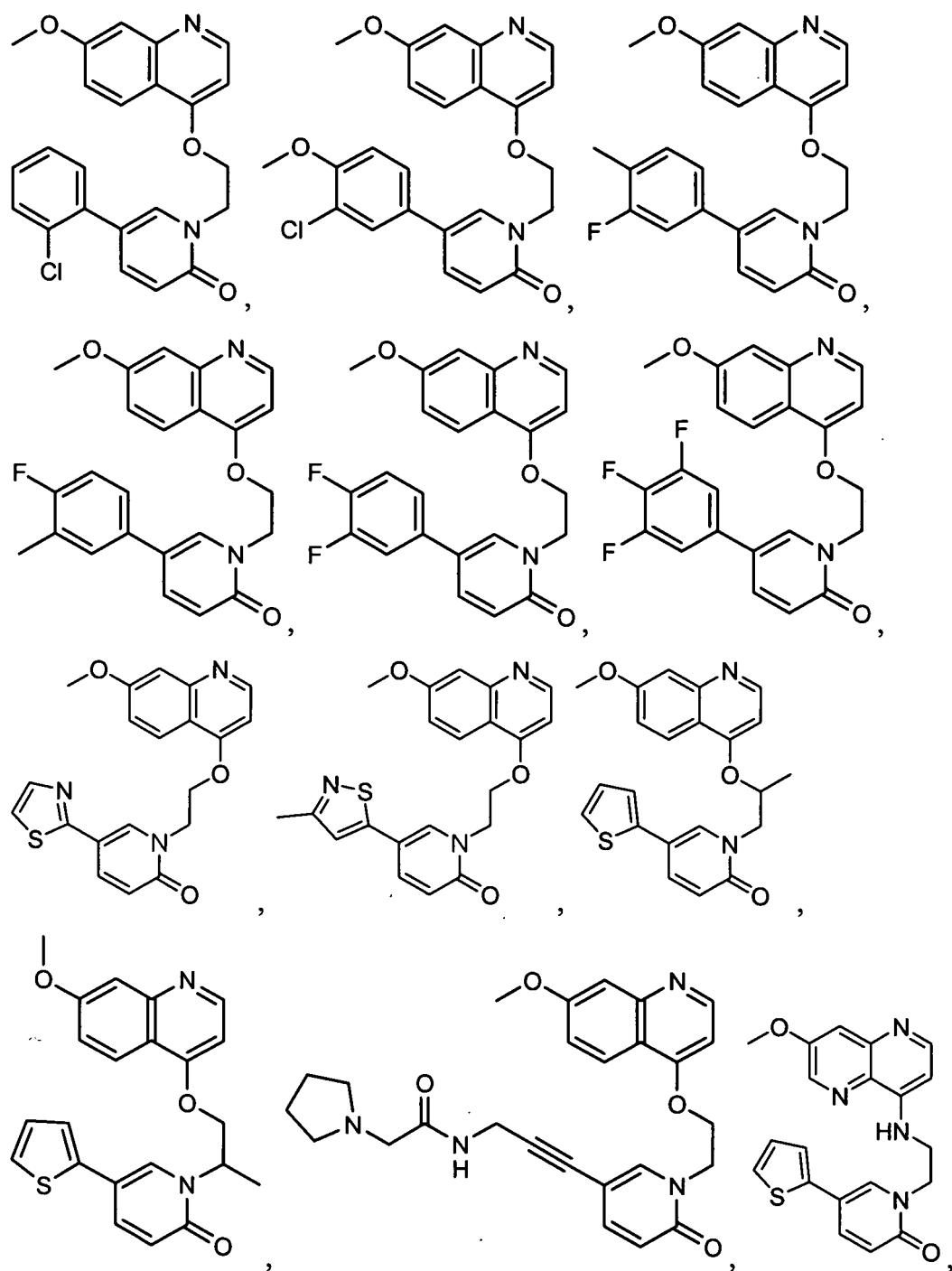
【請求項 2-3】

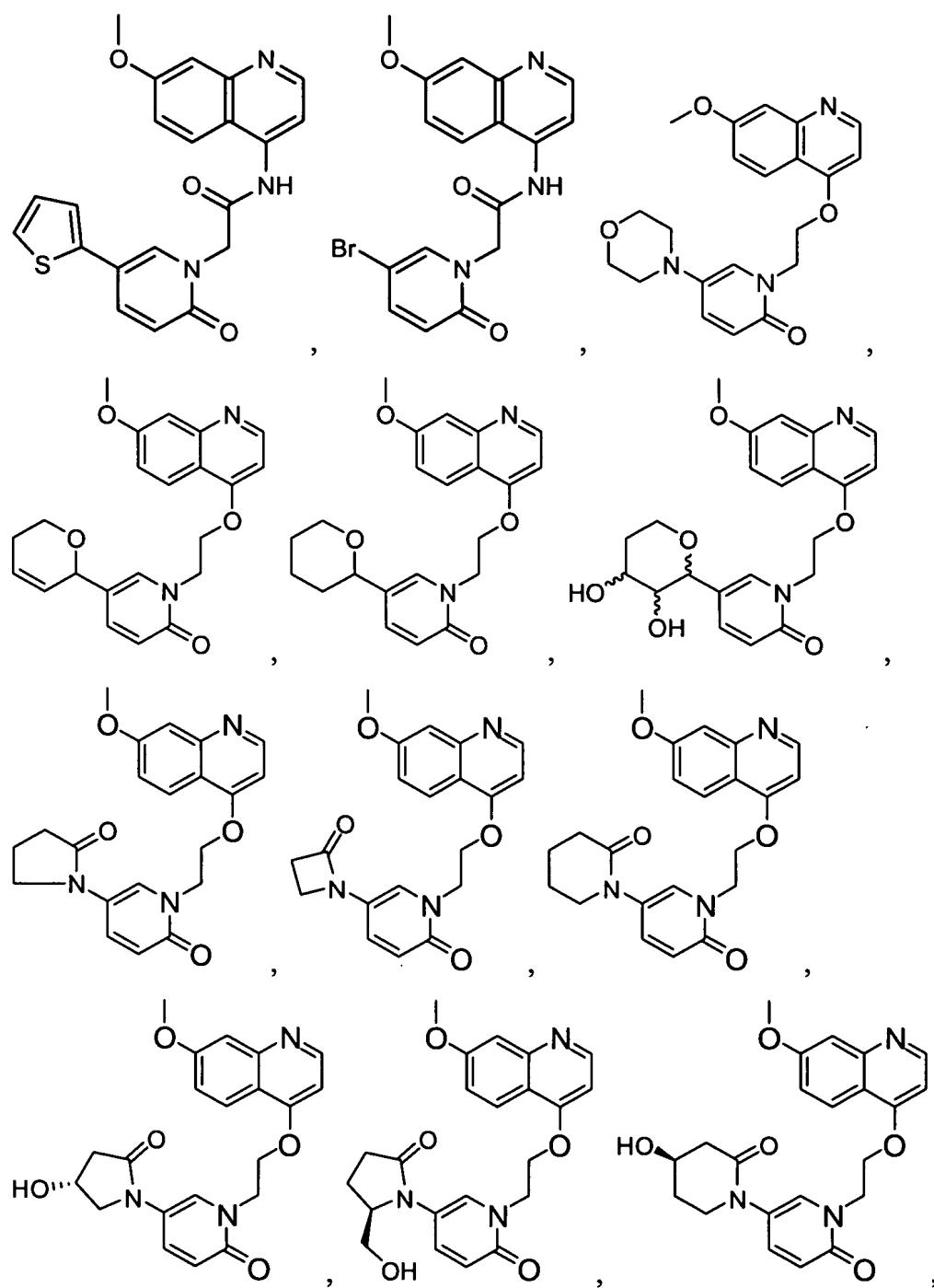
【化 5】

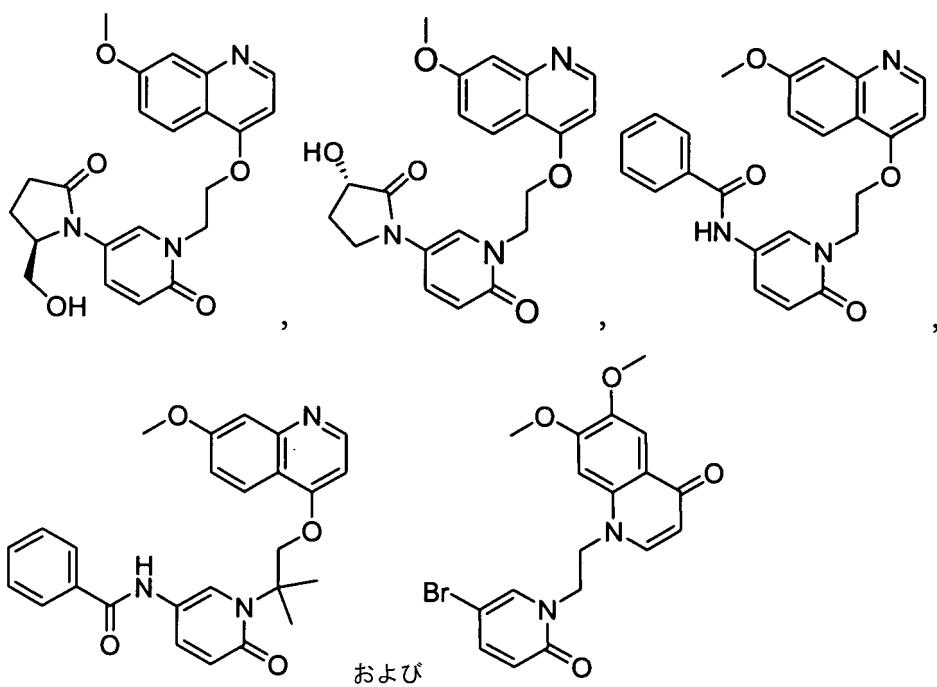








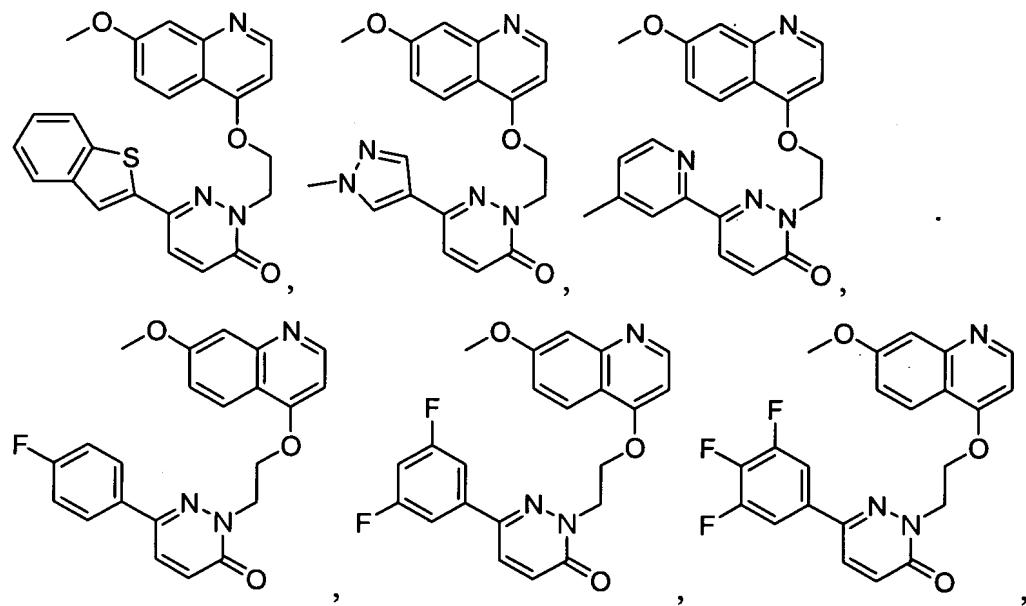


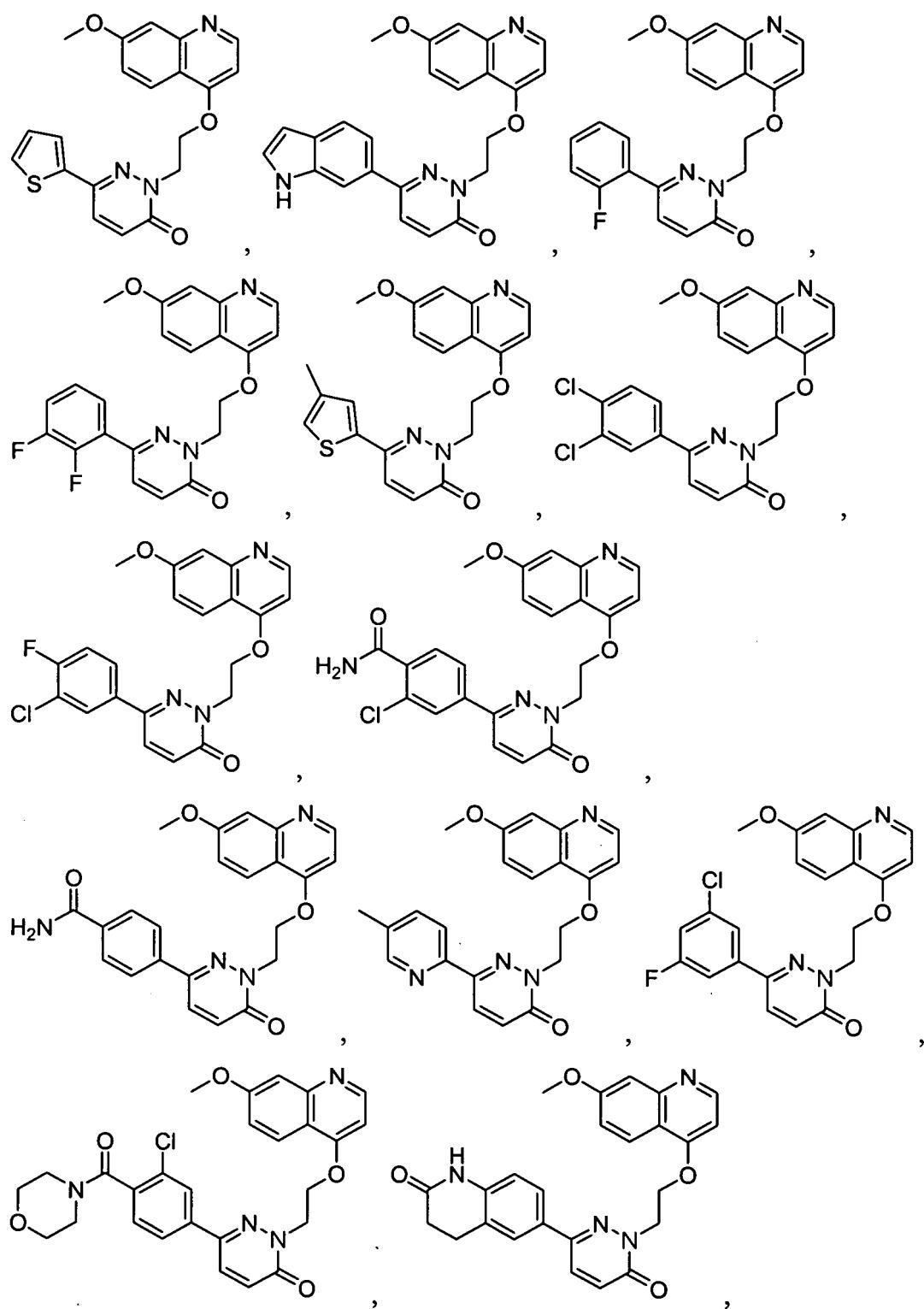


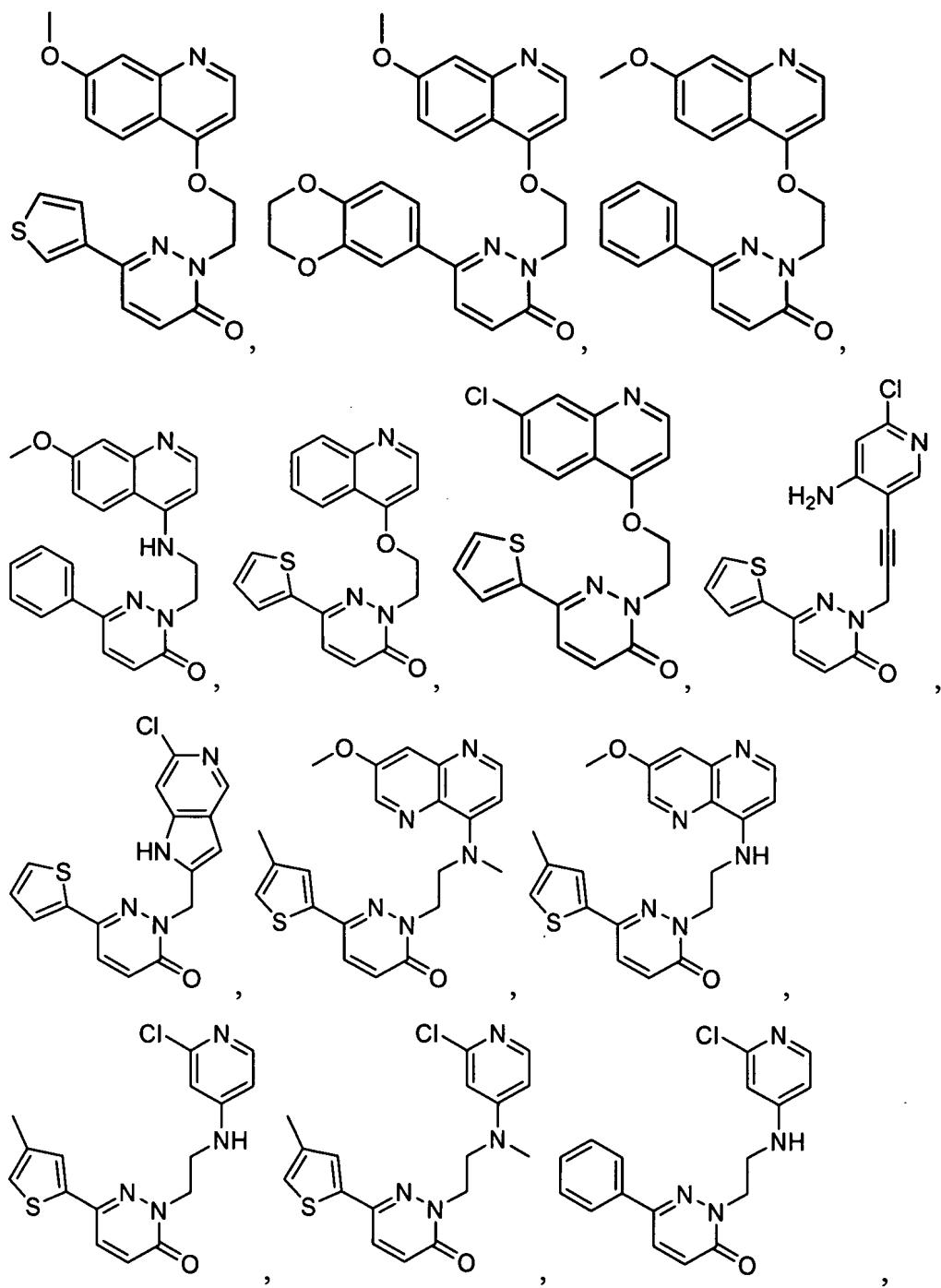
から選択される、請求項 9 に記載の化合物および該化合物の塩。

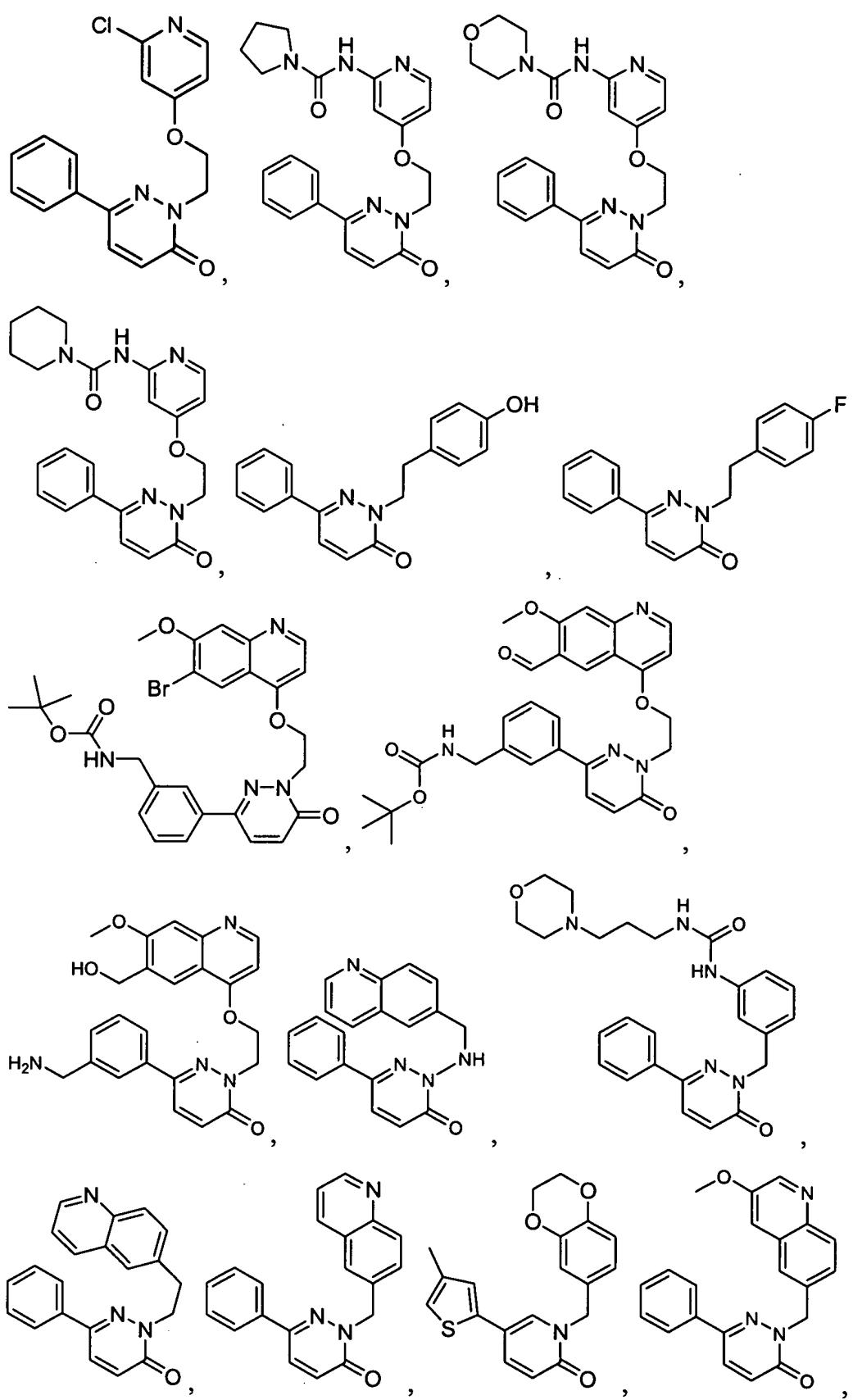
【請求項 24】

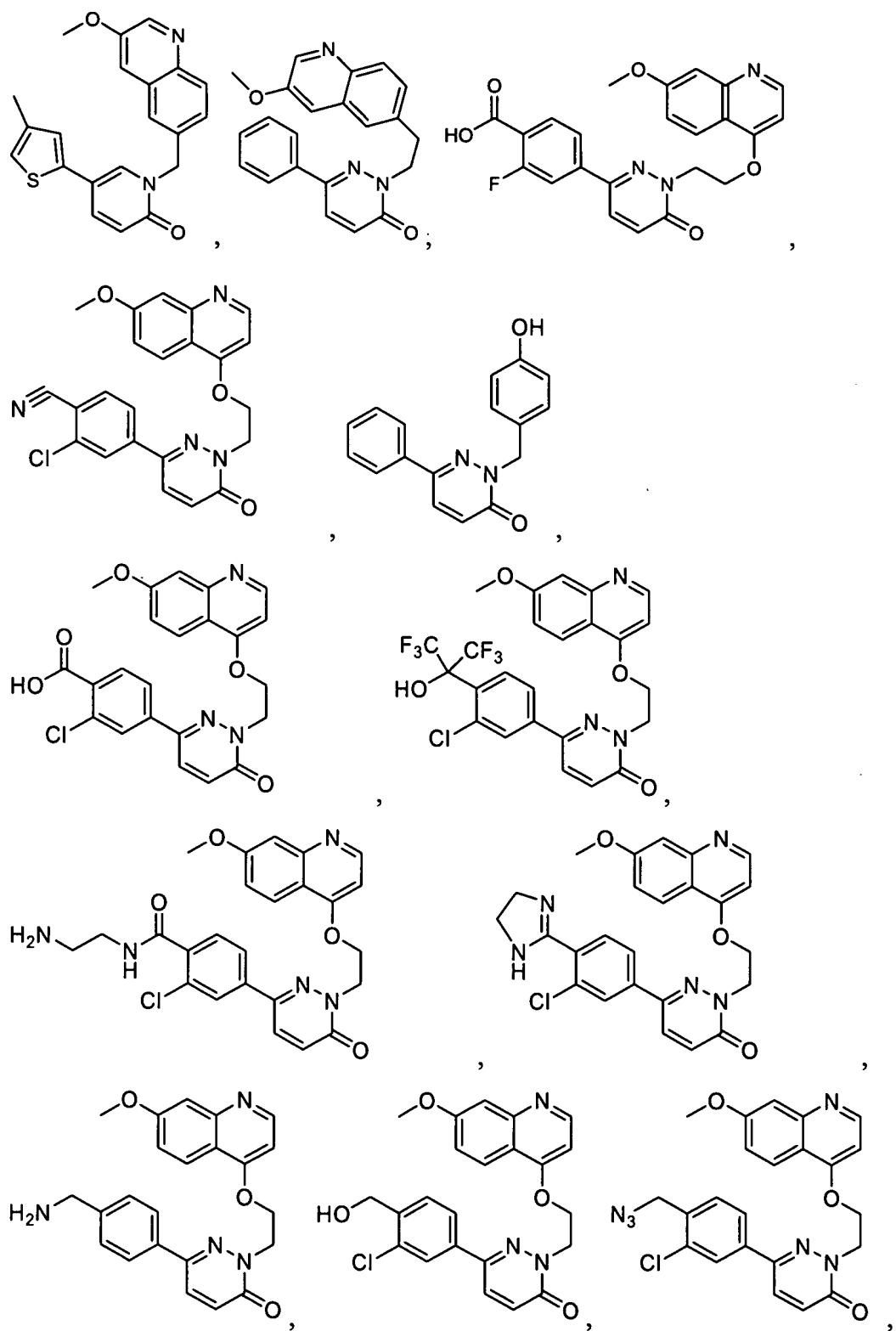
【化 6】

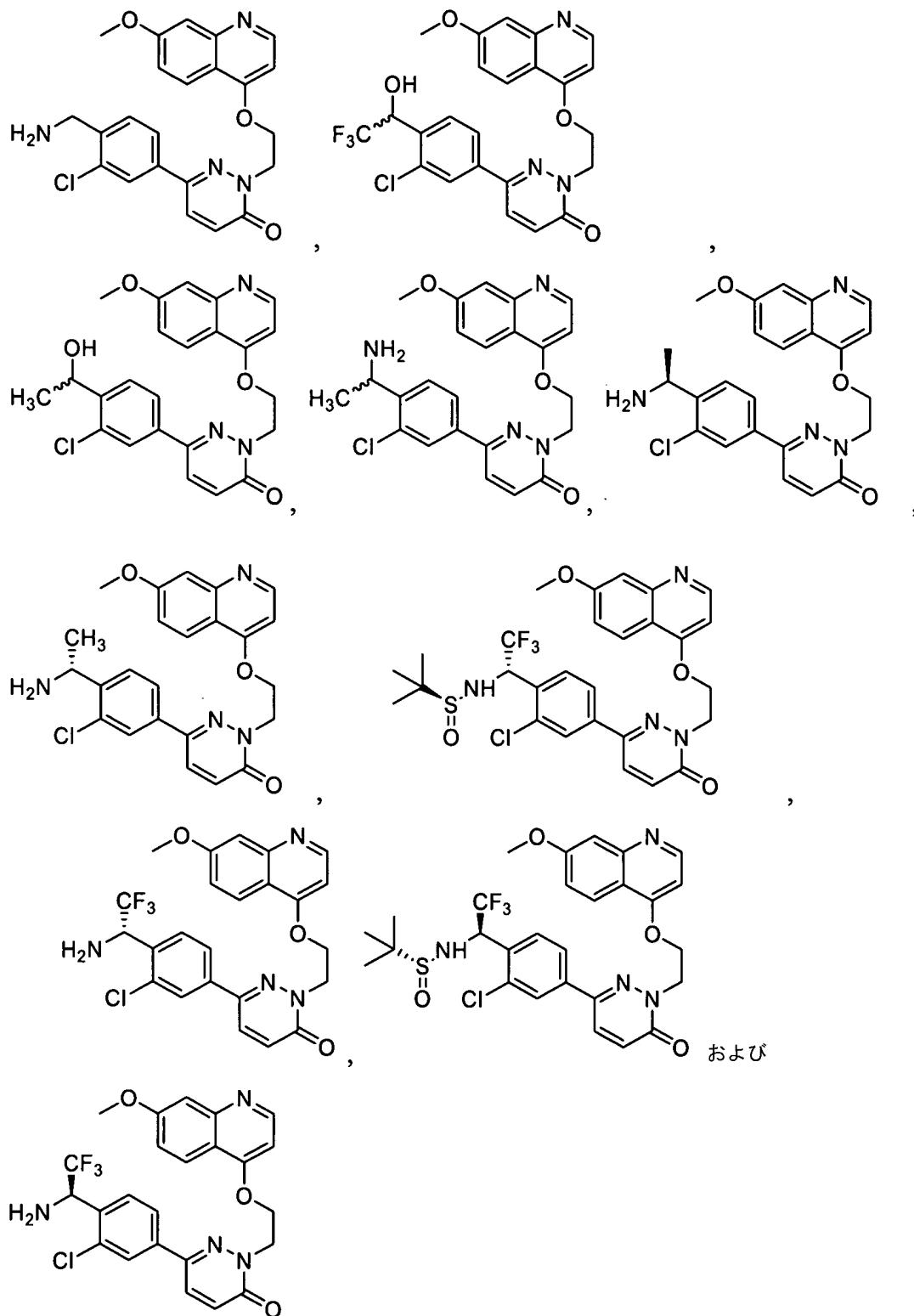










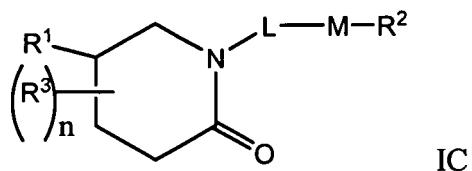


から選択される、請求項 1 6 に記載の化合物および該化合物の塩。

【請求項 2 5】

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】

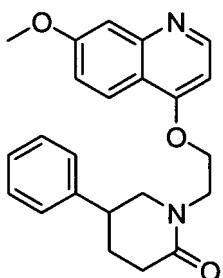


該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項26】

下記の構造を有する、請求項25に記載の化合物

【化8】

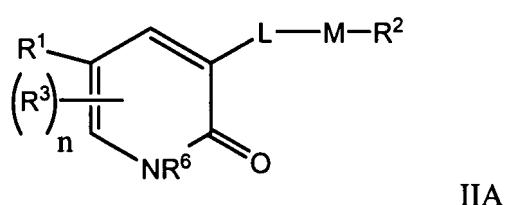


および該化合物の塩。

【請求項27】

下記式IIIAの構造を有する、請求項1に記載の化合物、

【化9】

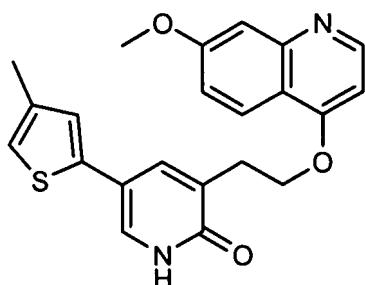


該化合物のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび塩。

【請求項28】

下記の構造を有する、請求項27に記載の化合物

【化10】

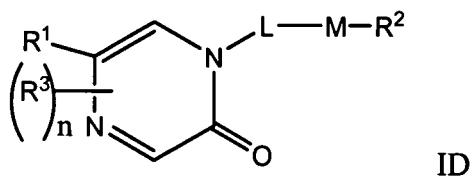


および該化合物の塩。

【請求項29】

下記式IDの構造を有する、請求項1に記載の化合物、

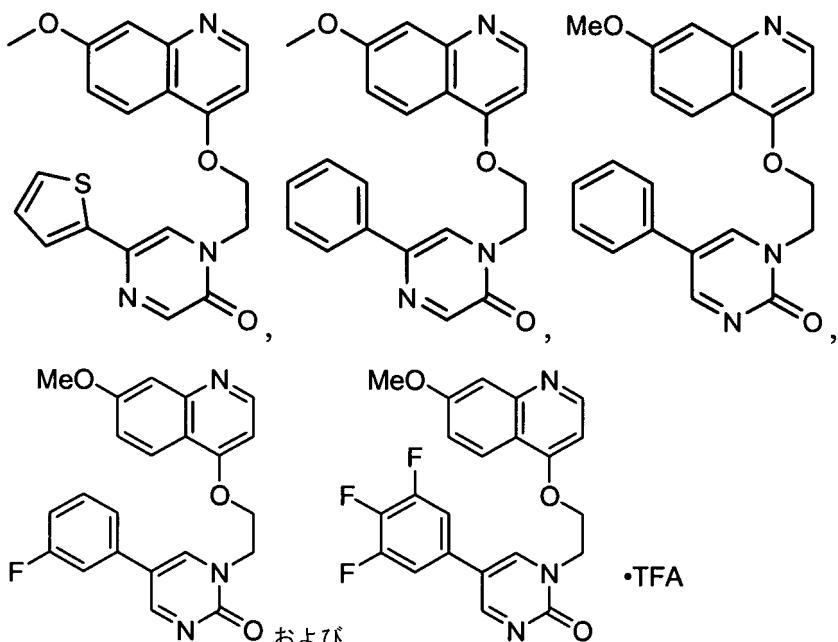
【化11】



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30】

【化12】

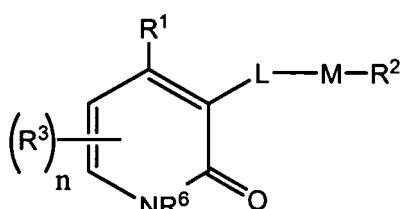


から選択される、請求項29に記載の化合物および該化合物の塩。

【請求項31】

下記式Vに記載の化合物、

【化13】



V

[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、C₁～₆アルキレン、C₃～₁₀シクロアルキレン、C₃～₁₀複素環アルキレン C₂～₈アルケニレンまたはC₂～₈アルキニレンであり、それらのいずれも独立に1以上のハロ、-OR⁷または-NR⁸R⁹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)_v-、-NR⁶-、-C(=O)NR⁶-、-NR⁶(CO)-、-SO₂NR⁶-、-NR⁶SO₂-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、 -NR⁶ - (C=O)R⁷、 -NR⁶ - (C=O)OR⁷、 -NR⁶ - (C=O)NR⁸R⁹、 -(C=O)NR⁸R⁹、 -(C=O)OR⁷、 -(C=O)R⁷、 -S(O)_vR⁷、 -SO₂NR⁸R⁹、 -NR⁸R⁹ または -OR⁷、

(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、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニルまたはC₂₋₆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R¹⁻⁰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R¹⁻⁰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)₀₋₁R⁷、 -(C=O)₀₋₁NR⁸R⁹、 -S(O)_vR⁷、 -SO₂NR⁸R⁹、 -C=OR⁷、 -NR⁸C=OR⁷、 -NR⁶-C=O-NR⁸R⁹ および -NR⁸SO₂R⁷ 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 -OR⁷、 -NR⁸R⁹、 -S(O)_vR⁷、 -SO₂NR⁸R⁹、 -NR⁸C=OR⁷、 -NR⁶-C=O-NR⁸R⁹ および -NR⁸SO₂R⁷ 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R¹⁻⁰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R¹⁻⁰で置換されていても良い)

であり；

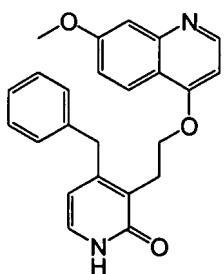
R^8 および R^9 は各場合で、独立にH、アルキル、シクロアルキル、ヘテロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロアルキルアルキル、複素環アルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキルであるか、 R^8 と R^9 がそれらが結合している窒素原子と一体となって複素環を形成しても良く；並びに

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、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃OR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃NR⁸R⁹、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃N(R⁶)C=OR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃N(R⁶)(C=O)OR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃C=ONR⁸R⁹、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃O(C=O)NR⁸R⁹、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃C=OR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃(C=O)OR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃N(R⁶)C=ONR⁸R⁹、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃S(O)_vR⁷、 -(CR⁴R⁵)₀₋₃SO₂NR⁸R⁹ または -(CR⁴R⁵)₀₋₃NR⁶SO₂R⁷ 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】

抗生素質型薬剤、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(*scleracelma*)、菌状息肉腫、皮膚筋炎、円形脱毛症、慢性光線性皮膚炎、湿疹、ペーチェット病、掌蹠膿疱症、壞疽性膿皮症、セザリ一症候群、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。