

【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 21 年 6 月 4 日 (2009.6.4)

【公表番号】特表 2008-536867 (P2008-536867A)

【公表日】平成 20 年 9 月 11 日 (2008.9.11)

【年通号数】公開・登録公報 2008-036

【出願番号】特願 2008-506778 (P2008-506778)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/84 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/10 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/84 C S P

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 409/10

C 0 7 D 413/10

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 4 月 8 日 (2009.4.8)

【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

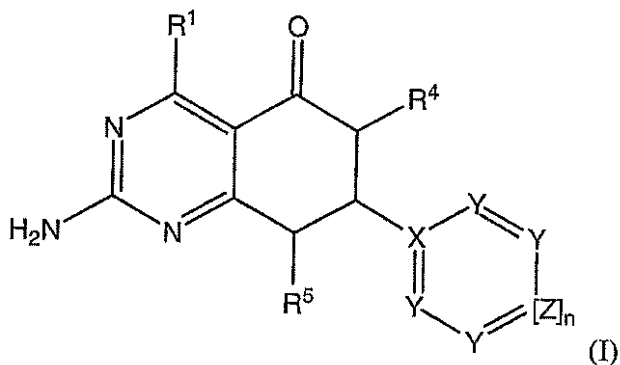
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

## 【化 1】



[ 式中、

$n$  は 0 または 1 であり；

$n$  が 1 である場合、 $X$  は  $C$  であり、 $Y$  は、各位置において、 $CQ^1$  および  $N$  から独立して選択され、 $Z$  は  $CR^2$  および  $N$  から選択され、そして

$n$  が 0 である場合、 $X$  は  $C$  または  $N$  であり、 $Y$  は、各位置において、 $CQ^1$ 、 $N$ 、 $NQ^2$ 、 $O$ 、および  $S$  から独立して選択され；

各  $Q^1$  は、独立して、

( 1 ) 水素、

( 2 ) ハロゲン、

( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、

( 4 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、

( 5 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、

( 6 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、

( 7 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、

( 8 ) 置換されたまたは置換されていないアリール、

( 9 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、

( 10 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、

( 11 ) 置換されたまたは置換されていないアミノ、

( 12 )  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$ 、

( 13 )  $-C(O)R^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)_2$ 、 $-S(O)R^3$ 、 $-SO_2R^3$ 、または  $-SO_2N(R^3)_2$ 、

( 14 )  $-OC(O)R^3$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、または  $-N(R^3)SO_2R^3$ 、

( 15 )  $-CN$ 、および

( 16 )  $-NO_2$

よりなる群から選択され；

各  $Q^2$  は独立して、

( 1 ) 水素、

( 2 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、

( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、

( 4 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、

( 5 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、

( 6 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、

( 7 ) 置換されたまたは置換されていないアリール、

( 8 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、および

( 9 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され；

$R^1$  は、

( 1 ) 水素、

- (2) ハロゲン、
- (3) ヒドロキシル、
- (4)  $C_1 - C_6$  アルコキシ、
- (5) チオール、
- (6)  $C_1 - C_6$  アルキルチオール、
- (7) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- (8) アミノ、アルキルアミノ、アリーールアミノ、またはアラールキルアミノ、
- (9) 置換されたまたは置換されていないアリーール、
- (10) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリーール、および
- (11) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され；

$R^2$  は、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、および
- (4)  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$

よりなる群から選択され；

$R^4$  および  $R^5$  は、独立して、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- (4)  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$ 、および
- (5)  $-OC(O)R^3$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、または  $-N(R^3)SO_2R$

3

よりなる群から選択され；

各  $R^3$  は、独立して、

- (1) 水素、
- (2) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、
- (4) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、
- (5) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- (6) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、
- (7) 置換されたまたは置換されていないアリーール、
- (8) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリーール、
- (9) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、および
- (10) 置換されたまたは置換されていないアミノ

よりなる群から選択され；

但し、 $R^1$  がメチルであって、 $R^4$  および  $R^5$  が水素である場合、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 、および  $n$  は、一緒になって、置換されていないフェニル環も置換されていないフラン - 2 - イル環も形成せず、そして

但し、 $R^1$ 、 $R^4$ 、および  $R^5$  が水素である場合、 $X$ 、 $Y$ 、 $Z$ 、および  $n$  は、一緒になって、フラン - 2 - イル環も、チエン - 2 - イル環も、フェニル環も形成せず、該環は置換されていないか、あるいは  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシルおよびハロよりなる群から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている]

の化合物、あるいはその立体異性体、互変異性体、または薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】

$R^1$  が水素または置換された  $C_1 - C_6$  アルキルまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R<sup>1</sup> がメチルである、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R<sup>2</sup> が水素またはフルオロである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

R<sup>4</sup> が水素である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

R<sup>5</sup> が水素である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、R<sup>2</sup>、または R<sup>3</sup> のうちの少なくとも 1 つが置換されたまたは置換されていないアリール、置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、置換されたまたは置換されていない C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキル、および置換されたまたは置換されていない C<sub>5</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルケニルよりなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

前記アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキル、および C<sub>5</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルケニルが、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、インドリル、オキサジアゾール、チアジアゾール、フラニル、キノリニル、イソキノリニル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、モルホリノ、ペペリジニル、ピロリジニル、チエニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキセニル、およびシクロペンテニルよりなる群から選択される、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

Q<sup>1</sup> および Q<sup>2</sup> のうちの一方が、(2-ヒドロキシ-エチルアミノ)-ピラジン-2-イル、1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル、2-(5-メチル-ピリジン-2-イル)-フェニル、2,3-ジフルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、2,5-ジフルオロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジメチル-ピリジン-3-イル、2-アセトアミドフェニル、2-アミノカルボニルフェニル、2-アミノ-ピリミジン-5-イル、2-クロロ-4-メトキシ-ピリミジン-5-イル、2-クロロ-5-フルオロ-ピリジン-3-イル、2-クロロ-フェニル、2-クロロ-ピリジン-3-イル、2-クロロ-ピリジン-3-イル、2-クロロ-ピリジン-4-イル、2-ジフルオロ-3-メトキシフェニル、2-エチル-フェニル、2-フルオロ-3-メトキシ-フェニル、2-フルオロ-3-メチルフェニル、2-フルオロ-4-メチルフェニル、2-フルオロ-4-メチル-フェニル、2-フルオロ-5-メトキシ-フェニル、2-フルオロ-5-メトキシ-フェニル、2-フルオロ-5-メトキシ-フェニル、2-フルオロ-5-メチルフェニル、2-フルオロフェニル、2-フルオロ-ピリジン-3-イル、2-ヒドロキシメチル-3-メトキシフェニル、2-ヒドロキシメチルフェニル、2-メトキシ-5-トリフルオロメチル-フェニル、2-メトキシフェニル、2-メトキシ-ピリジン-3-イル、2-メトキシ-ピリミジン-4-イル、2-メチルフェニル、2-メチル-ピリジン-3-イル、2-オキソ-1,2-ジヒドロ-ピリジン-3-イル、2-フェノキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3,5-ジメチル-イソオキサゾール-4-イル、3,6-ジメチル-ピラジン-2-イル、3-アセトアミドフェニル、3-アミノカルボニルフェニル、3-プロモ-フェニル、3-クロロ-ピラジン-2-イル、3-シアノフェニル、3-ジメチルアミノフェニル、3-エトキシ-フェニル、3-エチル-4-メチル-フェニル、3-エチニル-フェニル、3-フルオロ-6-メトキシ-ピリジン-2-イル、3-フルオロ-6-メトキシ-ピリジン-2-イル、3-フルオロフェニル、3-フルオロ-ピラジン-2-イル、3-メタンシルホンアミドフェニル、3-メトキシカルボニルフェニル、3-メトキシフェニル、3-メトキシ-ピラジン-2-イル、3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピラジン-5-イル、3-メチルフェニル、3-メチル-ピリジン-2-イル、3-トリフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシ-フェニル、3-トリフルオロメチルフェ

ニル、4, 5 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4, 5 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4 - アミノ - 5 - フルオロ - ピリミジン - 2 - イル、4 - クロロ - 2, 5 - ジメトキシ - フェニル、4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル、4 - クロロ - 2 - メトキシ - 5 - メチル - フェニル、4 - クロロ - ピリジン - 3 - イル、4 - エトキシ - ピリミジン - 5 - イル、4 - エチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル、4 - フルオロフェニル、4 - メトキシ - 5 - メチル - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - 5 - メチル - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - ピリミジン - 5 - イル、4 - メチル - ピリジン - 2 - イル、4 - メチル - ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジメトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - アセチル - チオフェン - 2 - イル、5 - アミノ - 6 - メトキシ - 3 - メチル - ピラジン - 2 - イル、5 - アミノ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - クロロ - 4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル、5 - フルオロ - 4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル、5 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、5 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2 - イル、6 - アセチル - ピリジン - 2 - イル、6 - クロロ - ピラジン - 2 - イル、6 - エトキシ - ピラジン - 2 - イル、6 - エチル - ピリジン - 2 - イル、6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル、6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル、6 - ヒドロキシ - ピリジン - 2 - イル、6 - メトキシ - 5 - メチル - ピラジン - 2 - イル、6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、6 - メトキシ - ピリジン - 2 - イル、6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、6 - メチルアミノ - ピラジン - 2 - イル、6 - メチル - ピリジン - 2 - イル、および 6 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルよりなる群から選択される、請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

R<sup>3</sup> がメチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルよりなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 11】

R<sup>3</sup> が置換されたフェニルおよび置換されていないフェニル、置換されたチアゾリルおよび置換されていないチアゾリル、置換されたピリジルおよび置換されていないピリジル、置換されたピラジニルおよび置換されていないピラジニル、ならびに置換されたピリミジニルおよび置換されていないピリミジニルよりなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物。

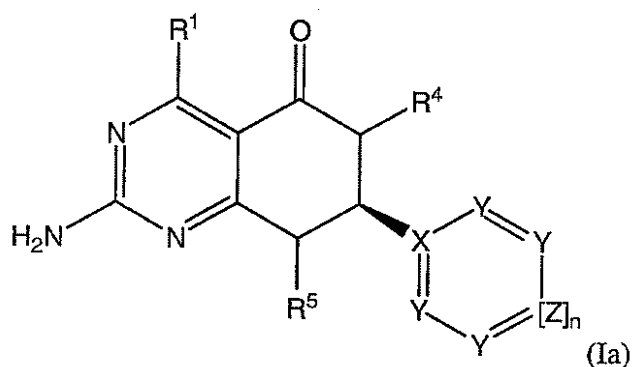
【請求項 12】

R<sup>3</sup> が 2 - アミノエチル、2 - ピペリジニルエチル、2 - ピペラジニルエチル、2 - モルホリニルエチル、および 2 - (N - メチルピペラジニル) エチルよりなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 13】

式 (Ia) :

【化 2】



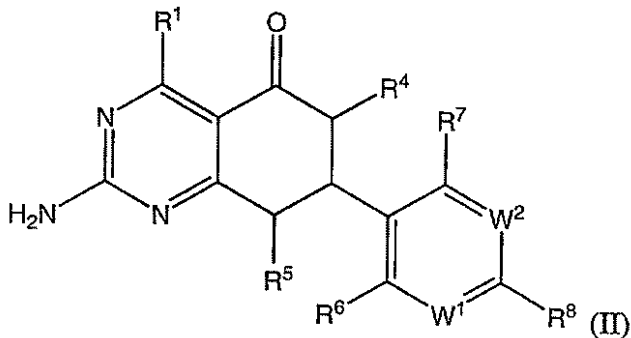
[ 式中、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、X、Y、Z、および n は既に定義されたものである ]

を有する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 4】

式 I I :

【化 3】



[ 式中、 $W^1$  および  $W^2$  は独立して N または  $CQ^1$  であり；

$R^6$  は、

- ( 1 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- ( 2 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル
- ( 3 ) 置換されたまたは置換されていないアリール、
- ( 4 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、および
- ( 5 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され；

$R^7$  および  $R^8$  は、独立して、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) ハロゲン、
- ( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル
- ( 4 )  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$

であり；そして

$Q^1$ 、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、および  $R^5$  は既に定義されているものである ]

を有する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R^1$  が水素または置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキルである、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 6】

$R^1$  がメチルである、請求項 1 5 記載の化合物。

【請求項 1 7】

$R^4$  が水素である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 8】

$R^5$  が水素である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 9】

$W^1$  が N である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 2 0】

$W^2$  が N である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 2 1】

$W^1$  および  $W^2$  が  $CQ^1$  である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 2 2】

各  $Q^1$  が水素である、請求項 2 1 記載の化合物。

【請求項 2 3】

$R^6$  が置換されたアリール、置換されたヘテロシクリル、置換されたヘテロアリール、置換された  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、および置換された  $C_5 - C_7$  シクロアルケニルよりなる群から選択され、該アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $C_3 - C_7$  シクロ

アルキル、および  $C_5 - C_7$  シクロアルケニルが、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、インドリル、オキサジアゾール、チアジアゾール、フラニル、キノリニル、イソキノリニル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、モルホリノ、ピペリジニル、ピロリジニル、チエニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキセニル、およびシクロペンテニルよりなる群から選択される、請求項 14 記載の化合物。

【請求項 24】

$R^6$  が、(2 - ヒドロキシ - エチルアミノ) - ピラジン - 2 - イル、1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル、2 - (5 - メチル - ピリジン - 2 - イル) - フェニル、2, 3 - ジフルオロフェニル、2, 4 - ジフルオロフェニル、2, 4 - ジメトキシフェニル、2, 5 - ジフルオロフェニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、2, 6 - ジメチル - ピリジン - 3 - イル、2 - アセトアミドフェニル、2 - アミノカルボニルフェニル、2 - アミノ - ピリミジン - 5 - イル、2 - クロロ - 4 - メトキシ - ピリミジン - 5 - イル、2 - クロロ - 5 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル、2 - クロロ - フェニル、2 - クロロ - ピリジン - 3 - イル、2 - クロロ - ピリジン - 3 - イル、2 - クロロ - ピリジン - 4 - イル、2 - ジフルオロ - 3 - メトキシフェニル、2 - エチル - フェニル、2 - フルオロ - 3 - メトキシ - フェニル、2 - フルオロ - 3 - メチルフェニル、2 - フルオロ - 4 - メチルフェニル、2 - フルオロ - 4 - メチル - フェニル、2 - フルオロ - 5 - メトキシ - フェニル、2 - フルオロ - 5 - メトキシ - フェニル、2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル、2 - フルオロフェニル、2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル、2 - ヒドロキシメチル - 3 - メトキシフェニル、2 - ヒドロキシメチルフェニル、2 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル、2 - メトキシフェニル、2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、2 - メトキシ - ピリミジン - 4 - イル、2 - メチルフェニル、2 - メチル - ピリジン - 3 - イル、2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - イル、2 - フェノキシフェニル、2 - トリフルオロメトキシフェニル、3, 5 - ジメチル - イソオキサゾール - 4 - イル、3, 6 - ジメチル - ピラジン - 2 - イル、3 - アセトアミドフェニル、3 - アミノカルボニルフェニル、3 - プロモ - フェニル、3 - クロロ - ピラジン - 2 - イル、3 - シアノフェニル、3 - ジメチルアミノフェニル、3 - エトキシ - フェニル、3 - エチル - 4 - メチル - フェニル、3 - エチニル - フェニル、3 - フルオロ - 6 - メトキシ - ピリジン - 2 - イル、3 - フルオロ - 6 - メトキシ - ピリジン - 2 - イル、3 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - ピラジン - 2 - イル、3 - メタンスルホンアミドフェニル、3 - メトキシカルボニルフェニル、3 - メトキシフェニル、3 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、3 - メチル - 3H - イミダゾ [4, 5 - b] ピラジン - 5 - イル、3 - メチルフェニル、3 - メチル - ピリジン - 2 - イル、3 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - トリフルオロメトキシ - フェニル、3 - トリフルオロメチルフェニル、4, 5 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4, 5 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4 - アミノ - 5 - フルオロ - ピリミジン - 2 - イル、4 - クロロ - 2, 5 - ジメトキシ - フェニル、4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル、4 - クロロ - 2 - メトキシ - 5 - メチル - フェニル、4 - クロロ - ピリジン - 3 - イル、4 - エトキシ - ピリミジン - 5 - イル、4 - エチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル、4 - フルオロフェニル、4 - メトキシ - 5 - メチル - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - 5 - メチル - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、4 - メトキシ - ピリミジン - 5 - イル、4 - メチル - ピリジン - 2 - イル、4 - メチル - ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジメトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - アセチル - チオフェン - 2 - イル、5 - アミノ - 6 - メトキシ - 3 - メチル - ピラジン - 2 - イル、5 - アミノ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - クロロ - 4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル、5 - フルオロ - 4 - メトキシ - ピリミジン - 2 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシ - ピラジン - 2 - イル、5 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル、5 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル、5 - トリフルオロメチル - ピリミジン - 2

-イル、6-アセチル-ピリジン-2-イル、6-クロロ-ピラジン-2-イル、6-エトキシ-ピラジン-2-イル、6-エチル-ピリジン-2-イル、6-フルオロ-ピリジン-2-イル、6-フルオロ-ピリジン-3-イル、6-ヒドロキシ-ピリジン-2-イル、6-メトキシ-5-メチル-ピラジン-2-イル、6-メトキシ-ピラジン-2-イル、6-メトキシ-ピリジン-2-イル、6-メトキシ-ピリジン-3-イル、6-メチルアミノ-ピラジン-2-イル、6-メチル-ピリジン-2-イル、および6-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イルよりなる群から選択される、請求項14記載の化合物。

【請求項25】

R<sup>7</sup> が水素である、請求項14記載の化合物。

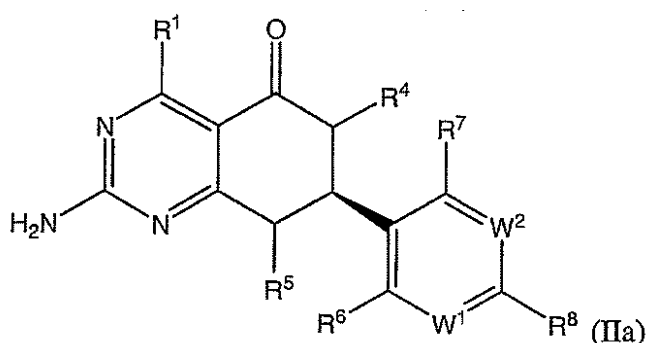
【請求項26】

R<sup>8</sup> が水素またはフルオロである、請求項14記載の化合物。

【請求項27】

式(I Ia)：

【化4】



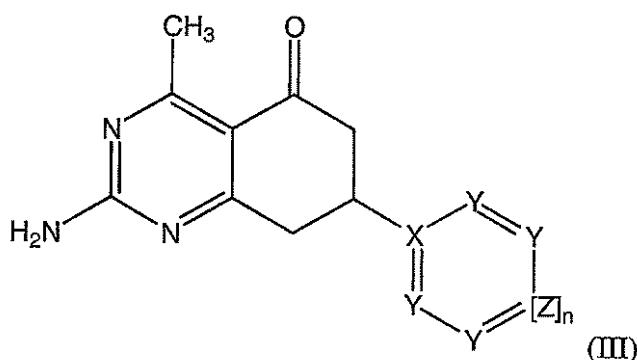
[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、W<sup>1</sup>、およびW<sup>2</sup>は既に定義されているものである]

を有する、請求項14記載の化合物。

【請求項28】

式(I II)：

【化5】



[式中、

nは0または1であり、

nが1である場合、XはCであり、Yは、各位置において、C<sup>Q1</sup>およびNから独立して選択され、そしてZはC<sup>R2</sup>およびNから選択され、および、

nが0である場合、XはCまたはNであり、Yは、各位置において、C<sup>Q1</sup>、N、N<sup>Q2</sup>、O、およびSから独立して選択され；

Q<sup>1</sup>は、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) 置換されたまたは置換されていないC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、

(4) 置換されたまたは置換されていないC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、

- (5) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、
- (6) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- (7) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、
- (8) 置換されたまたは置換されていないアリール、
- (9) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、
- (10) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、
- (11) 置換されたまたは置換されていないアミノ、
- (12)  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$ 、
- (13)  $-C(O)R^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)_2$ 、 $-S(O)R^3$ 、 $-SO_2R^3$ 、または  $-SO_2N(R^3)_2$ 、
- (14)  $-OC(O)R^3$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、または  $-N(R^3)SO_2R^3$ 、
- (15)  $-CN$ 、および
- (16)  $-NO_2$

よりなる群から選択され；

$Q^2$  は

- (1) 水素、
- (2) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、
- (4) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、
- (5) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- (6) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、
- (7) 置換されたまたは置換されていないアリール、
- (8) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、および
- (9) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され、

$R^2$  は、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_3$  アルキル、および
- (4) ハロ置換されたまたは置換されていない  $-OCH_3$ 、 $-SCH_3$ 、または  $-NCH_3$

よりなる群から選択され、そして

$R^3$  は、各位置において、

- (1) 水素、
- (2) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- (3) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、
- (4) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、
- (5) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- (6) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、
- (7) 置換されたまたは置換されていないアリール、
- (8) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、
- (9) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、および
- (10) 置換されたまたは置換されていないアミノ

よりなる群から独立して選択され、

但し、 $n$  が 1 であり、 $X$  が  $C$  であり、 $Y$  が  $CQ^1$  であって、 $Z$  が  $CR^2$  である場合、 $Q^1$  および  $R^2$  の両方が水素であるわけではなく、

但し、 $n$  が 0 である場合、 $X$  は  $C$  であって、 $X$  に隣接する  $Y$  は  $O$  ではなく、

さらに、但し、合計分子量は 750 ダルトンを超えない]

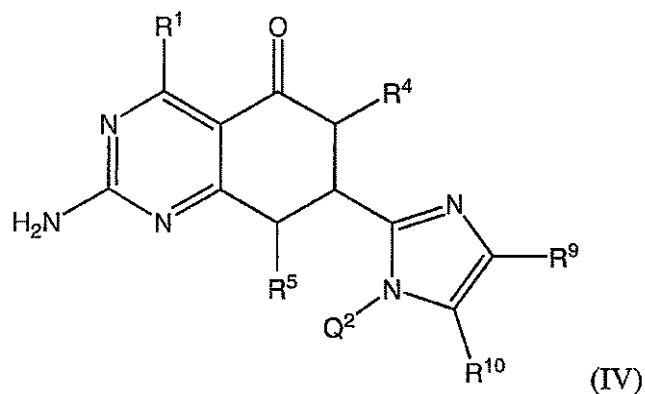
を有する請求項 1 記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、または薬学的に受

容可能な塩。

【請求項 29】

式 (IV) :

【化 6】



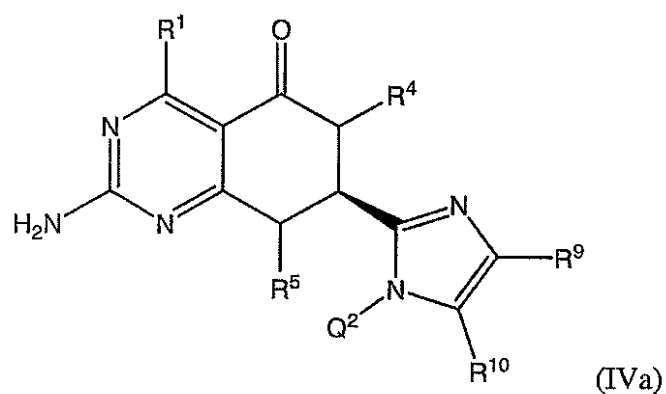
[ 式中、 $R^9$  および  $R^{10}$  は独立して  $Q^1$  であり、そして  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $Q^1$  および  $Q^2$  は既に定義されているものである ]

を有する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 30】

式 (IVa)

【化 7】



[ 式中、 $R^9$  および  $R^{10}$  は独立して  $Q^1$  であり、そして  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $Q^1$  および  $Q^2$  は既に定義したものである ]

を有する、請求項 29 記載の化合物。

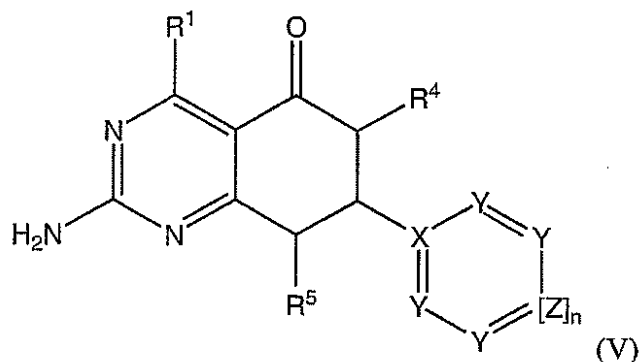
【請求項 31】

表 I および表 II から選択される化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または薬学的に受容可能な塩。

【請求項 32】

薬学的に受容可能なキャリア、および式 (V) :

## 【化 8】



[ 式中、

$n$  は 0 または 1 であり；

$n$  が 1 である場合、 $X$  は  $C$  であり、 $Y$  は、各位置において、 $CQ^1$  および  $N$  から独立して選択され、 $Z$  は  $CR^2$  および  $N$  から独立して選択され、そして

$n$  が 0 である場合、 $X$  は  $C$  または  $N$  であり、 $Y$  は、各位置において、 $CQ^1$ 、 $N$ 、 $NQ^2$ 、 $O$ 、および  $S$  から独立して選択され；

各  $Q^1$  は、独立して、

( 1 ) 水素、

( 2 ) ハロゲン、

( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、

( 4 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、

( 5 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、

( 6 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、

( 7 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、

( 8 ) 置換されたまたは置換されていないアリール、

( 9 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、

( 10 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、

( 11 ) 置換されたまたは置換されていないアミノ、

( 12 )  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$ 、

( 13 )  $-C(O)R^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-C(O)N(R^3)_2$ 、 $-S(O)R^3$ 、 $-SO_2R^3$ 、または  $-SO_2N(R^3)_2$ 、

( 14 )  $-OC(O)R^3$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、または  $-N(R^3)SO_2R^3$ 、

( 15 )  $-CN$ 、および

( 16 )  $-NO_2$

よりなる群から選択され；

各  $Q^2$  は独立して、

( 1 ) 水素、

( 2 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、

( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、

( 4 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、

( 5 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、

( 6 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、

( 7 ) 置換されたまたは置換されていないアリール、

( 8 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリール、および

( 9 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され；

$R^1$  は、

( 1 ) 水素、

- ( 2 ) ハロゲン、
- ( 3 ) ヒドロキシル、
- ( 4 )  $C_1 - C_6$  アルコキシ、
- ( 5 ) チオール、
- ( 6 )  $C_1 - C_6$  アルキルチオール、
- ( 7 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- ( 8 ) アミノ、アルキルアミノ、アリーールアミノ、またはアラールキルアミノ、
- ( 9 ) 置換されたまたは置換されていないアリーール、
- ( 10 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリーール、および
- ( 11 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル

よりなる群から選択され；

$R^2$  は、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) ハロゲン、
- ( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、および
- ( 4 )  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$

よりなる群から選択され；

$R^4$  および  $R^5$  は、独立して、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) ハロゲン、
- ( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- ( 4 )  $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、または  $-N(R^3)_2$ 、および
- ( 5 )  $-OC(O)R^3$ 、 $-N(R^3)C(O)R^3$ 、または  $-N(R^3)SO_2R^3$

3

よりなる群から選択され；

各  $R^3$  は、独立して、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_1 - C_6$  アルキル、
- ( 3 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルケニル、
- ( 4 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_2 - C_6$  アルキニル、
- ( 5 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、
- ( 6 ) 置換されたまたは置換されていない  $C_5 - C_7$  シクロアルケニル、
- ( 7 ) 置換されたまたは置換されていないアリーール、
- ( 8 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロアリーール、
- ( 9 ) 置換されたまたは置換されていないヘテロシクリル、および
- ( 10 ) 置換されたまたは置換されていないアミノ

よりなる群から選択される]

を有する化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または薬学的に受容可能な塩を含む組成物。

#### 【請求項 33】

さらに、イリノテカン、トポテカン、ゲムシタビン、イマチニブ、トラスツズマブ、5-フルオロウラシル、ロイコボリン、カルボプラチン、シスプラチン、タキサン、テザシタビン、シクロホスファミド、ピンカルカロイド、ゲフィチニブ、パタラニブ、スニチニブ、ソラフェニブ、エルロチニブ、デクスラゾキサン、アントラサイクリン、およびリツキシマブよりなる群から選択される少なくとも1種のさらなる薬剤を含む、請求項 32 記載の組成物。

#### 【請求項 34】

HSP90 活性を調節することによって疾患を治療する ための組成物 であって、有効量の請求項 32 記載の組成物を含む、組成物。

#### 【請求項 35】

疾患が癌である、請求項 3 4 記載の組成物。

【請求項 3 6】

H S P 9 0 活性を調節することによってヒトまたは動物対象において疾患を治療するための医薬の製造における、請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 3 7】

疾患が癌である、請求項 3 6 記載の使用。

【請求項 3 8】

癌の治療で用いられる、請求項 1 記載の化合物。