

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 2 年 3 月 19 日 (2020.3.19)

【公表番号】特表 2019-510798 (P2019-510798A)

【公表日】平成 31 年 4 月 18 日 (2019.4.18)

【年通号数】公開・登録公報 2019-015

【出願番号】特願 2018-552846 (P2018-552846)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14 (2006.01)

C 07 D 487/10 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14

C 07 D 487/10

C 07 D 417/14

A 61 P 35/00

A 61 P 37/06

A 61 P 31/12

A 61 P 31/04

A 61 P 35/02

A 61 K 45/00

A 61 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 2 月 6 日 (2020.2.6)

【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

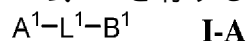
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

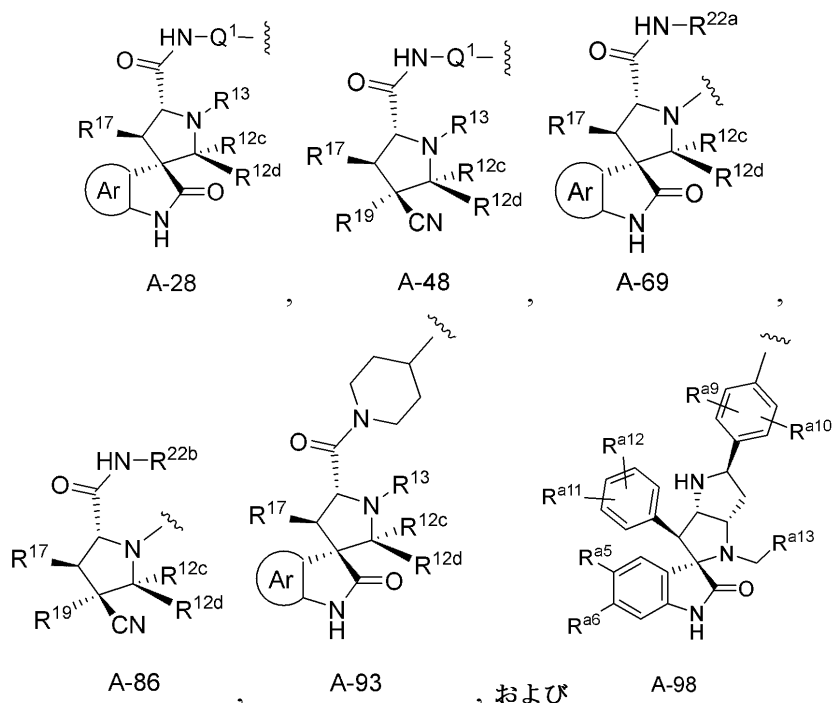
【請求項 1】

式 I-A を有する化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：



式中

A<sup>1</sup>は



からなる群より選択され；

$R^{12c}$  および  $R^{12d}$  は独立して水素および置換されていてもよい  $C_1 \sim 8$  アルキルからなる群より選択されるか；または

$R^{12c}$  および  $R^{12d}$  はそれらが結合している炭素原子と一緒に4～8員の置換されていてもよいシクロアルキルまたは4～8員の置換されていてもよいヘテロ環を形成し；

$R^{13}$  は水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル、およびヘテロアルキルからなる群より選択され；

$R^{17}$  は置換されていてもよいアリールおよび置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{19}$  は置換されていてもよいアリールおよび置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{22a}$  は置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロ環、置換されていてもよいアリール、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{22b}$  は置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロ環、置換されていてもよいアリール、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$Q^1$  はアルキレニル、フェニレニル、ヘテロアリーレニル、シクロアルキレニル、およびヘテロシクレニルからなる群より選択され；



は縮合した置換されていてもよいフェニル、縮合した置換されていてもよいチエニル、縮合した置換されていてもよいピリジル、または縮合した置換されていてもよいピリミジル基であり；

$R^{a5}$ 、 $R^{a6}$ 、 $R^{a11}$ 、および  $R^{a12}$  はそれぞれ独立して水素およびハロからなる群より選択され；

$R^{a9}$  および  $R^{a10}$  は独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択され；

$R^{a13}$  は水素、 $C_1 \sim 4$  アルキル、および  $C_3 \sim 8$  シクロアルキルからなる群より選択され；

$L^1$  は  $-X^1-L^2-Y^1-$  であり；

$X^1$  は  $X^2$  であるか；または

$X^1$ は存在せず；

$X^2$ は-N(H)C(=O)-、-C(=O)N(H)-、-C(=O)N(H)S(O)<sub>2</sub>-、-N(H)C(=O)N(H)-、-N(H)C(=O)O-、-OC(=O)N(H)-、-SO<sub>2</sub>-、-O-、-N(H)-、-SO<sub>2</sub>N(H)-、-N(H)SO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-、および-C C-からなる群より選択され；

$L^2$ はアルキレニル、ヘテロアルキレニル、-A<sup>4</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-W-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-および-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-W-(CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub>-からなる群より選択されるか；または

$L^2$ は存在せず；

A<sup>4</sup>は5員ヘテロアリーレニルおよび6員ヘテロアリーレニルからなる群より選択されるか；または

A<sup>4</sup>は存在せず；

Wはフェニレニル、5員ヘテロアリーレニル、6員ヘテロアリーレニル、ヘテロシクレニル、およびシクロアルキレニルからなる群より選択され；

mは0、1、2、3、4、5、6、または7であり；

nは0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

uは0、1、2、または3であり；

vは1、2、3、または4であり；

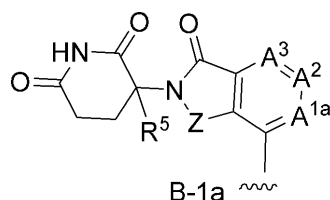
$Y^1$ は-C C-、-CH=CH-、-CH<sub>2</sub>-、-O-、-N(R<sup>2b</sup>)-、-C(=O)N(R<sup>2c</sup>)-、-N(R<sup>2d</sup>)C(=O)CH<sub>2</sub>O-、および-N(R<sup>2e</sup>)C(=O)CH<sub>2</sub>N(R<sup>2f</sup>)-からなる群より選択されるか；または

$Y^1$ は存在せず；

ここで-N(R<sup>2d</sup>)C(=O)CH<sub>2</sub>O-および-N(R<sup>2e</sup>)C(=O)CH<sub>2</sub>N(R<sup>2f</sup>)-のカルボキサミド窒素原子ならびに-C(=O)N(R<sup>2c</sup>)-の炭素原子は $L^2$ に結合し；

R<sup>2a</sup>、R<sup>2b</sup>、R<sup>2c</sup>、R<sup>2d</sup>、R<sup>2e</sup>、およびR<sup>2f</sup>はそれぞれ独立して水素およびC<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキルからなる群より選択され；

B<sup>1</sup>は



であり；

A<sup>1a</sup>は-C(R<sup>16a</sup>)=および-N=からなる群より選択され；

A<sup>2</sup>は-C(R<sup>16b</sup>)=および-N=からなる群より選択され；

A<sup>3</sup>は-C(R<sup>16c</sup>)=および-N=からなる群より選択され；

Gは-C(R<sup>16d</sup>)=および-N=からなる群より選択され；

Zは-CH<sub>2</sub>および-C(=O)-からなる群より選択され；

R<sup>5</sup>は水素、メチル、およびフルオロからなる群より選択され；

R<sup>16a</sup>は水素、ハロ、およびC<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキルからなる群より選択され；

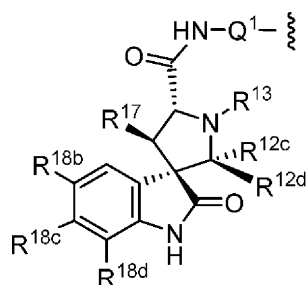
R<sup>16b</sup>は水素、ハロ、およびC<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキルからなる群より選択され；

R<sup>16c</sup>は水素、ハロ、およびC<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキルからなる群より選択され；かつ

R<sup>16d</sup>は水素、ハロ、およびC<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキルからなる群より選択される。

## 【請求項 2】

A<sup>1</sup>が

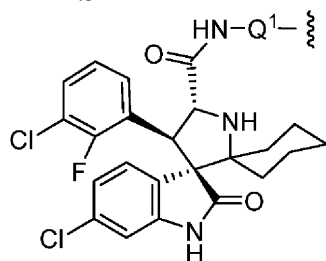


A-35

である、請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項3】

A<sup>1</sup>が

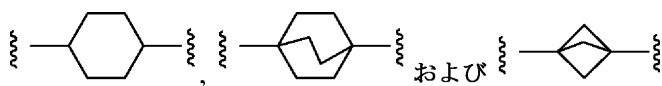


A-100

である、請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項4】

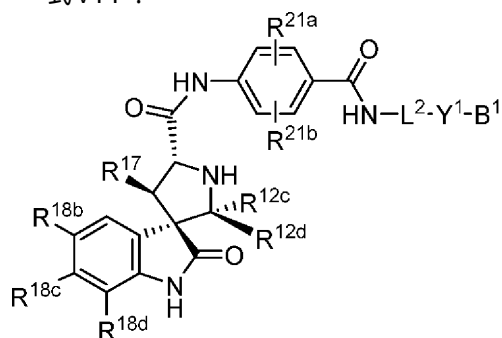
Q<sup>1</sup>が



からなる群より選択されるシクロアルキレニルである、請求項3記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項5】

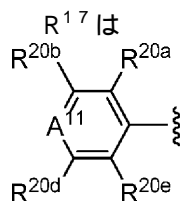
式VII：



VII

を有し、式中

R<sup>12c</sup>およびR<sup>12d</sup>はそれらが結合している炭素原子と一緒に4員シクロアルキルまたは6員の置換されていてもよいシクロアルキルを形成し；



であり；

A<sup>11</sup>は-C(R<sup>20c</sup>)=であり；

R<sup>20a</sup>、R<sup>20b</sup>、およびR<sup>20c</sup>はそれぞれ水素であり；

R<sup>20d</sup>およびR<sup>20e</sup>は独立して水素およびハロゲンからなる群より選択され；

R<sup>18b</sup>、R<sup>18c</sup>、およびR<sup>18d</sup>はそれぞれ独立して水素およびハロゲンからなる群より選択され；

かつ

$R^{21a}$  および  $R^{21b}$  はそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、

請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項6】

$L^2$  が  $C_1 \sim 12$  アルキレニルである、請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項7】

$L^2$  が 3 ~ 12 員ヘテロアルキレニルである、請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項8】

$L^2$  が  $-A^4-(CH_2)_m-W-(CH_2)_n-$  であり；かつ

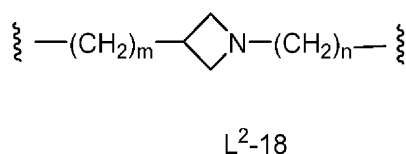
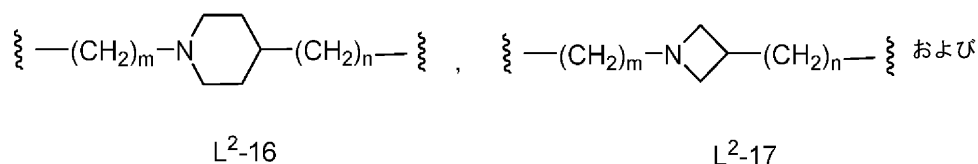
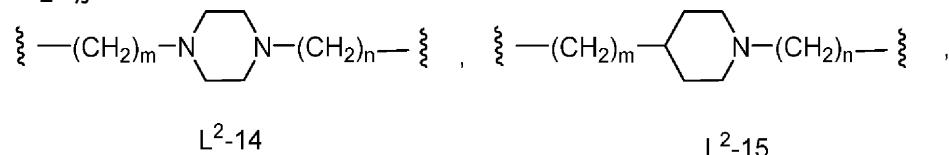
$A^4$  が存在しない、請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項9】

$W$  がヘテロシクレニルである、請求項8記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項10】

$L^2$  が



からなる群より選択される、請求項9記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項11】

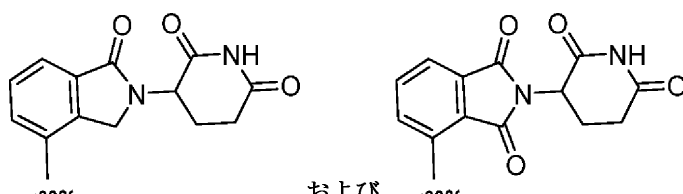
$m$  が 0 であり、かつ  $n$  が 0 または 1 である、請求項10記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項12】

$Y^1$  が  $-C \quad C-$  である、請求項11記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項13】

$B^1$  が

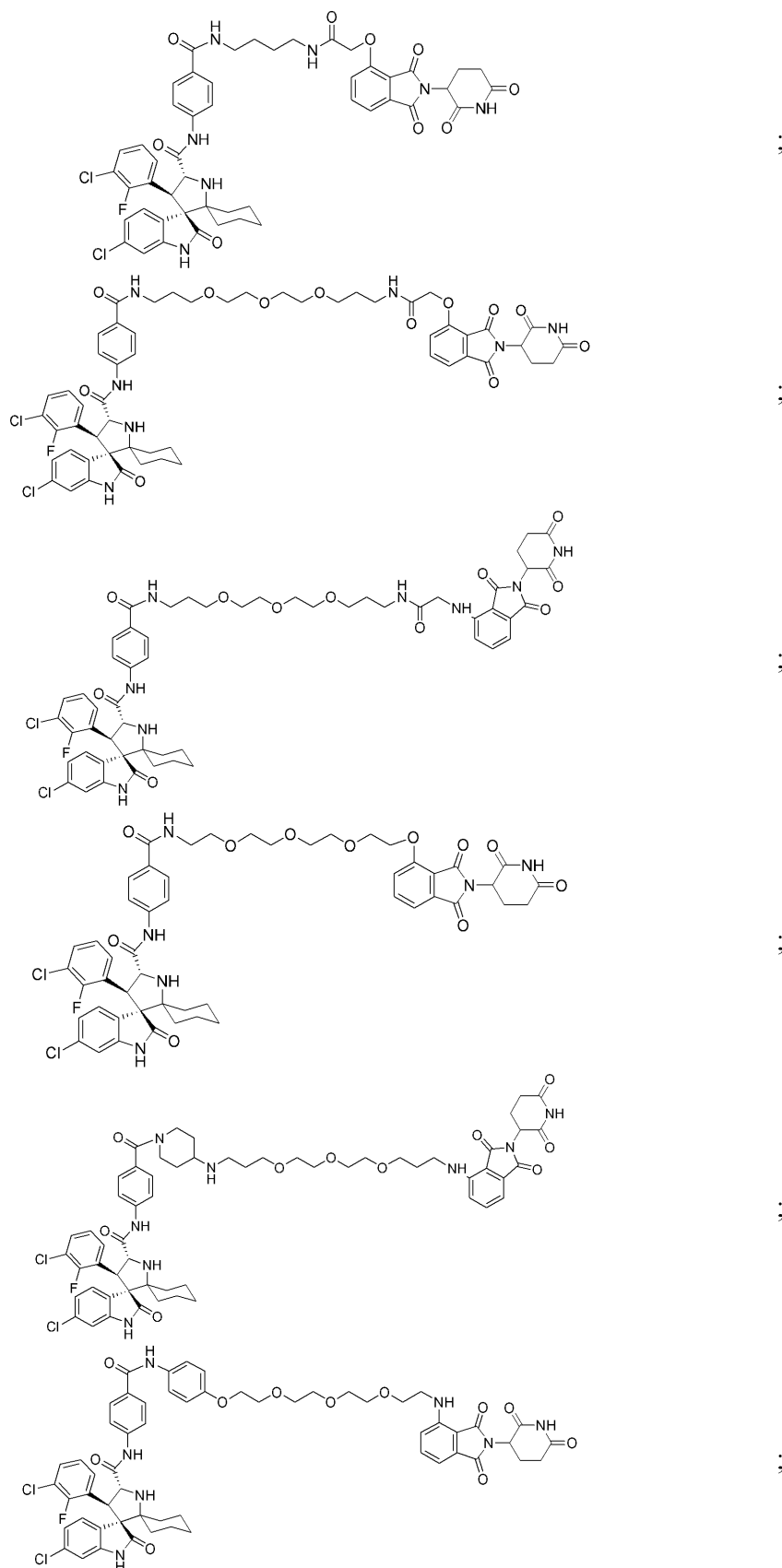


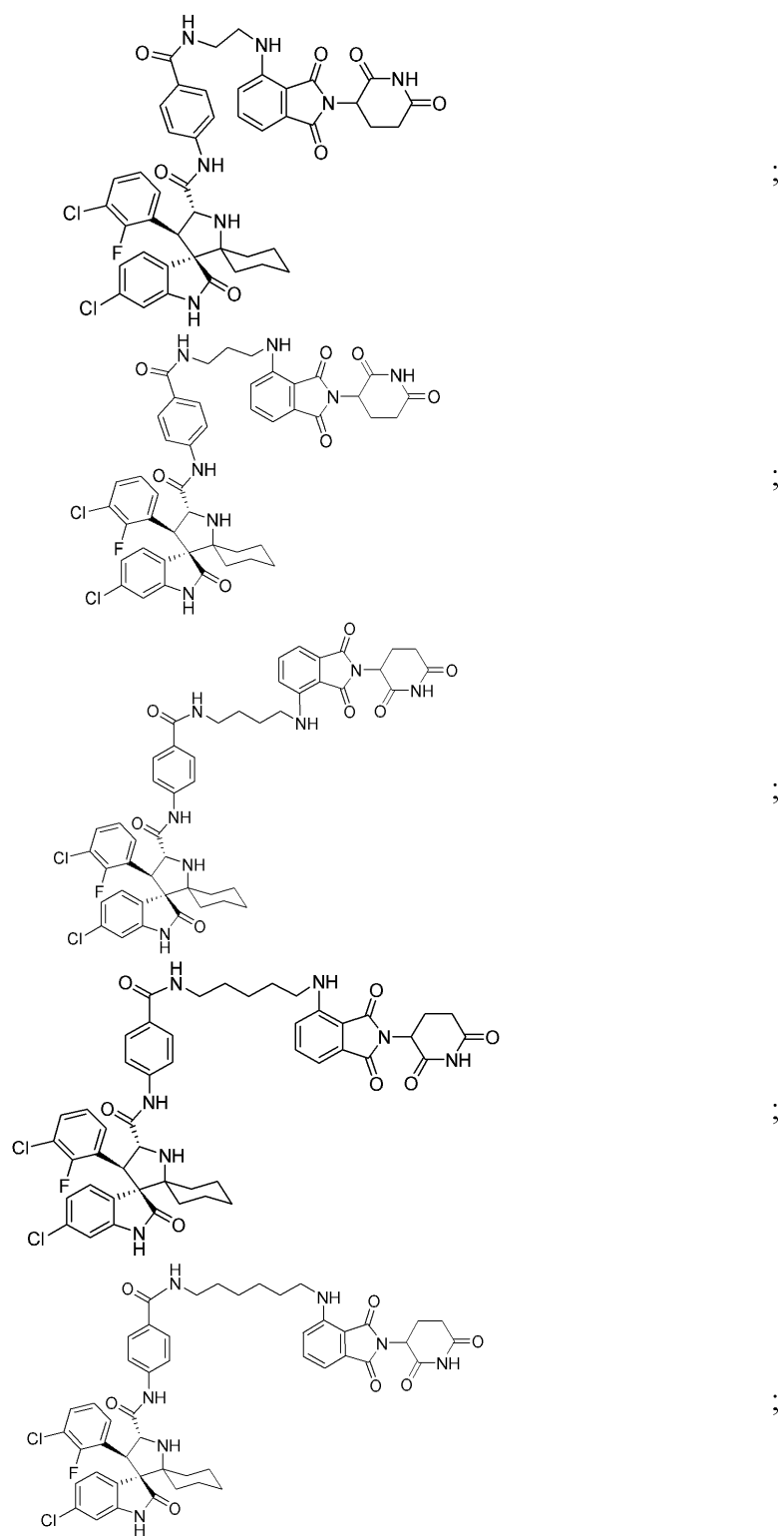
からなる群より選択される、請求項2記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは

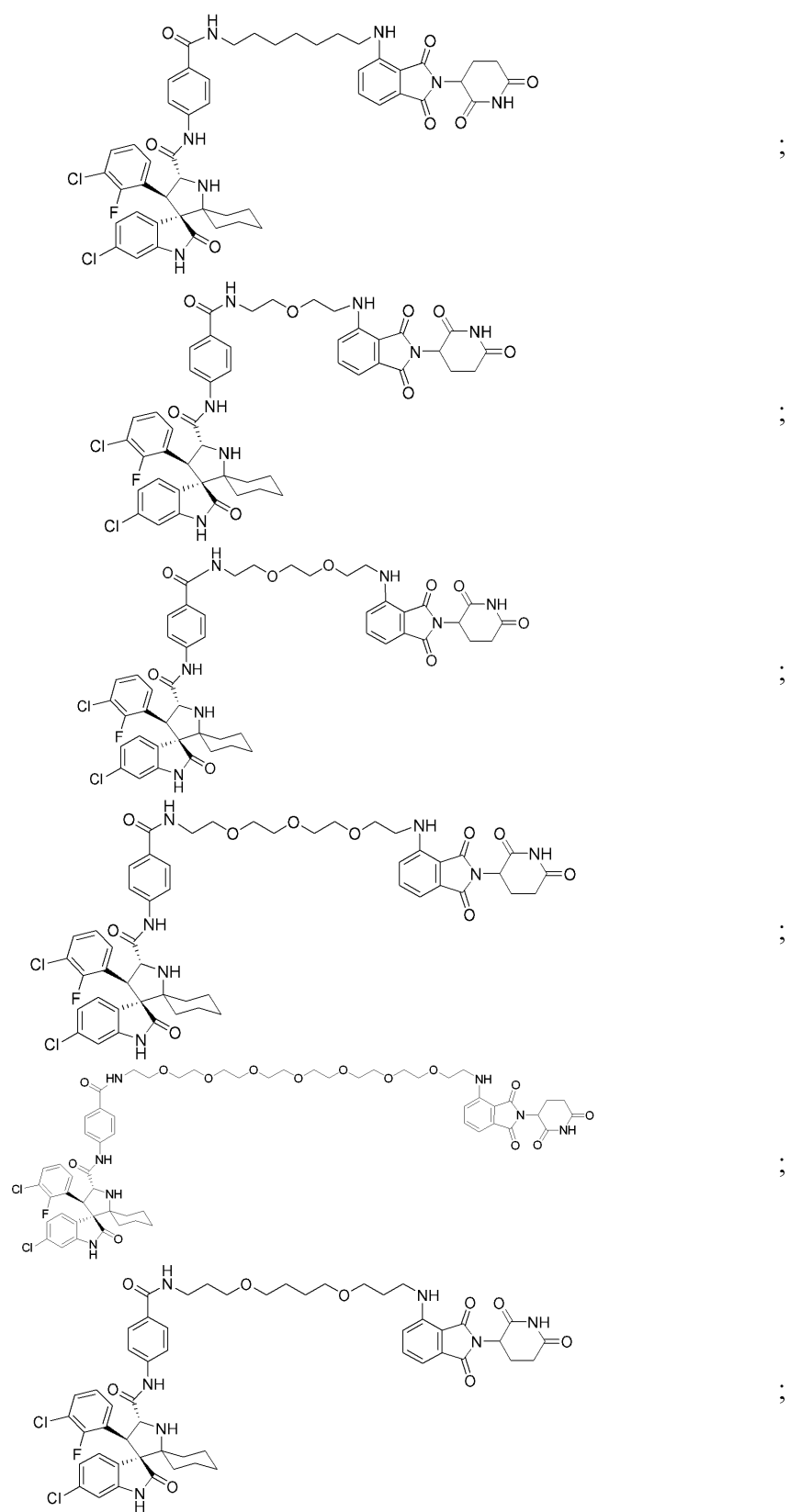
くは溶媒和物。

【請求項 14】

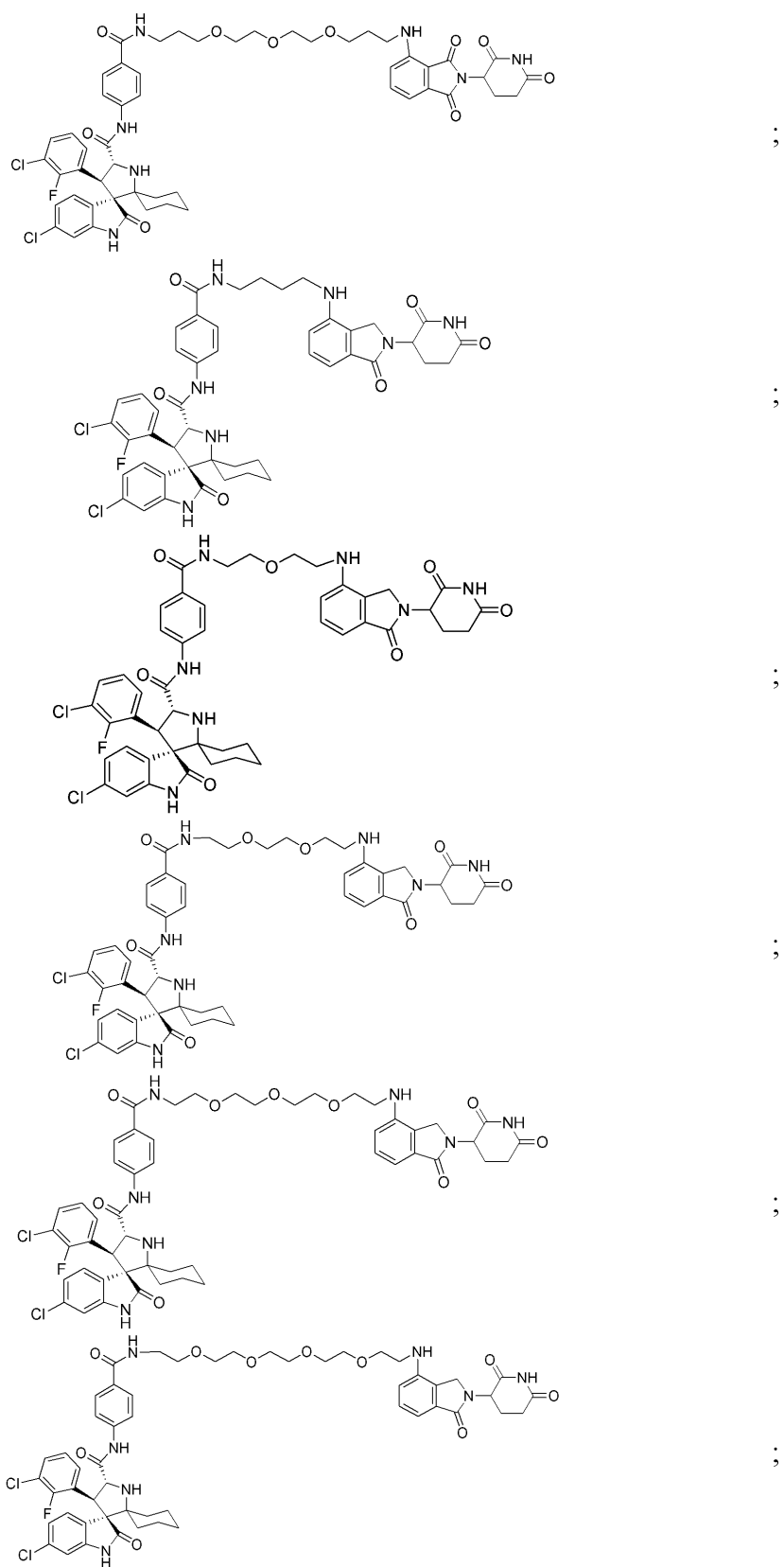
以下：

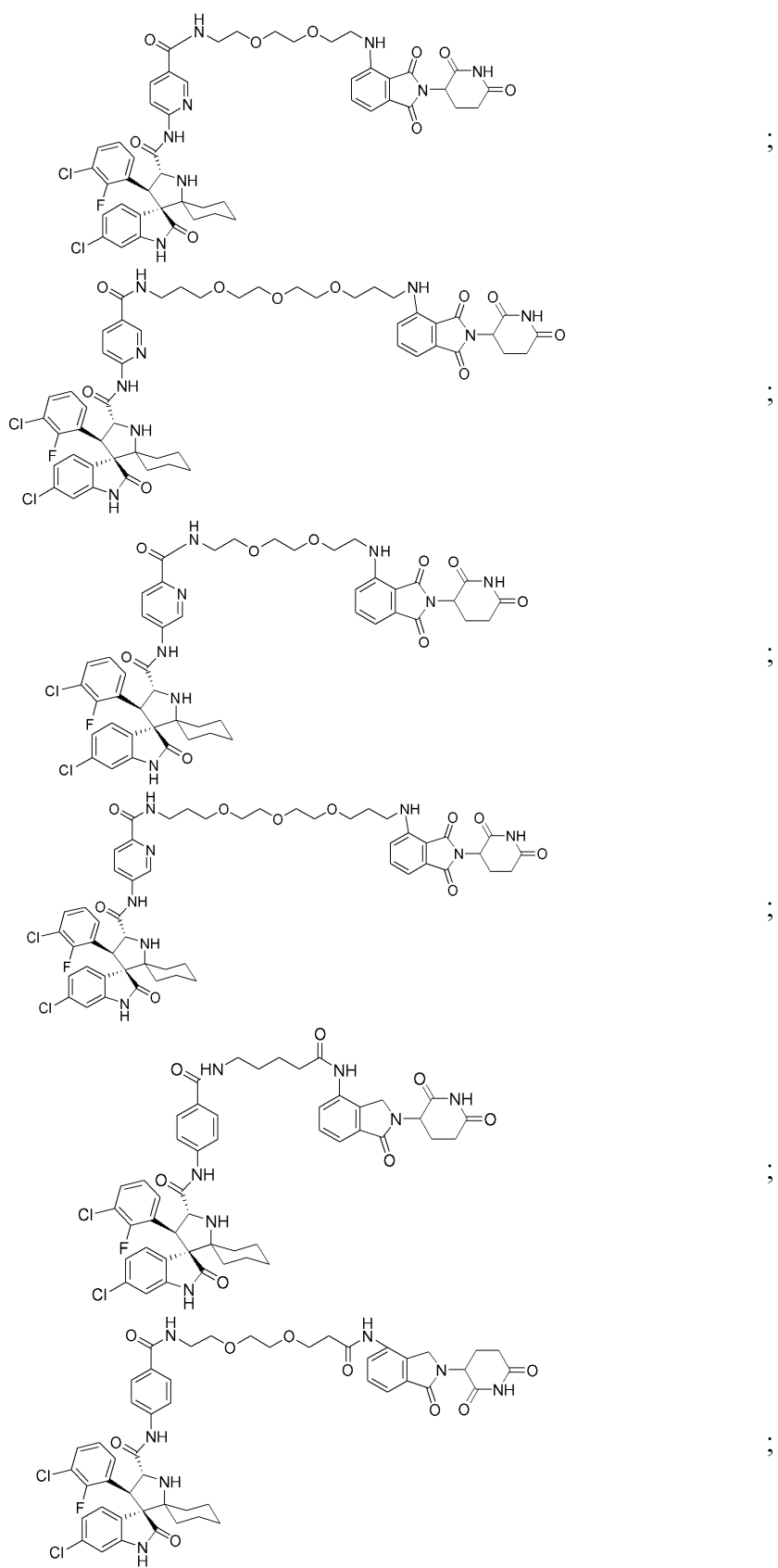


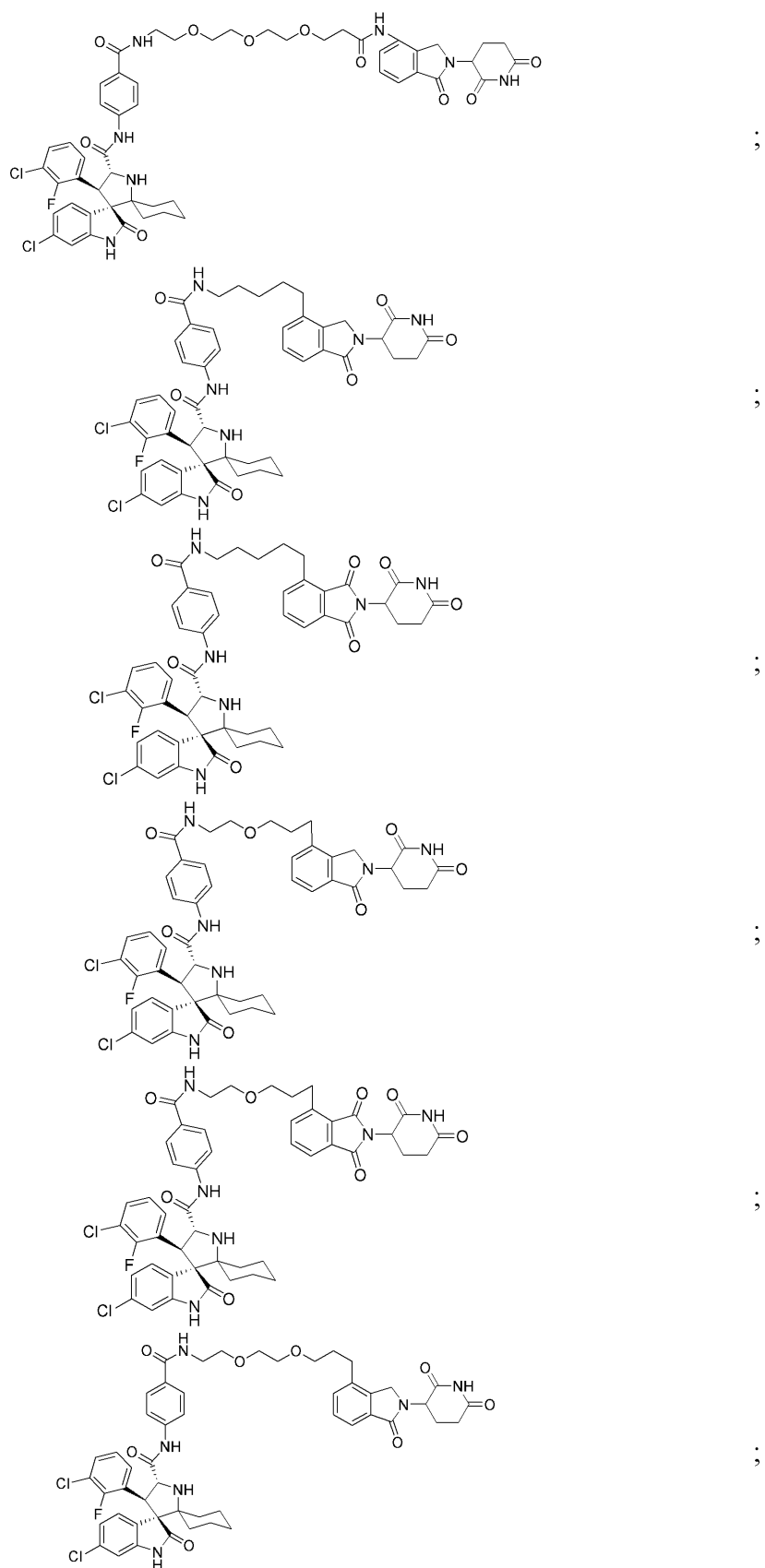


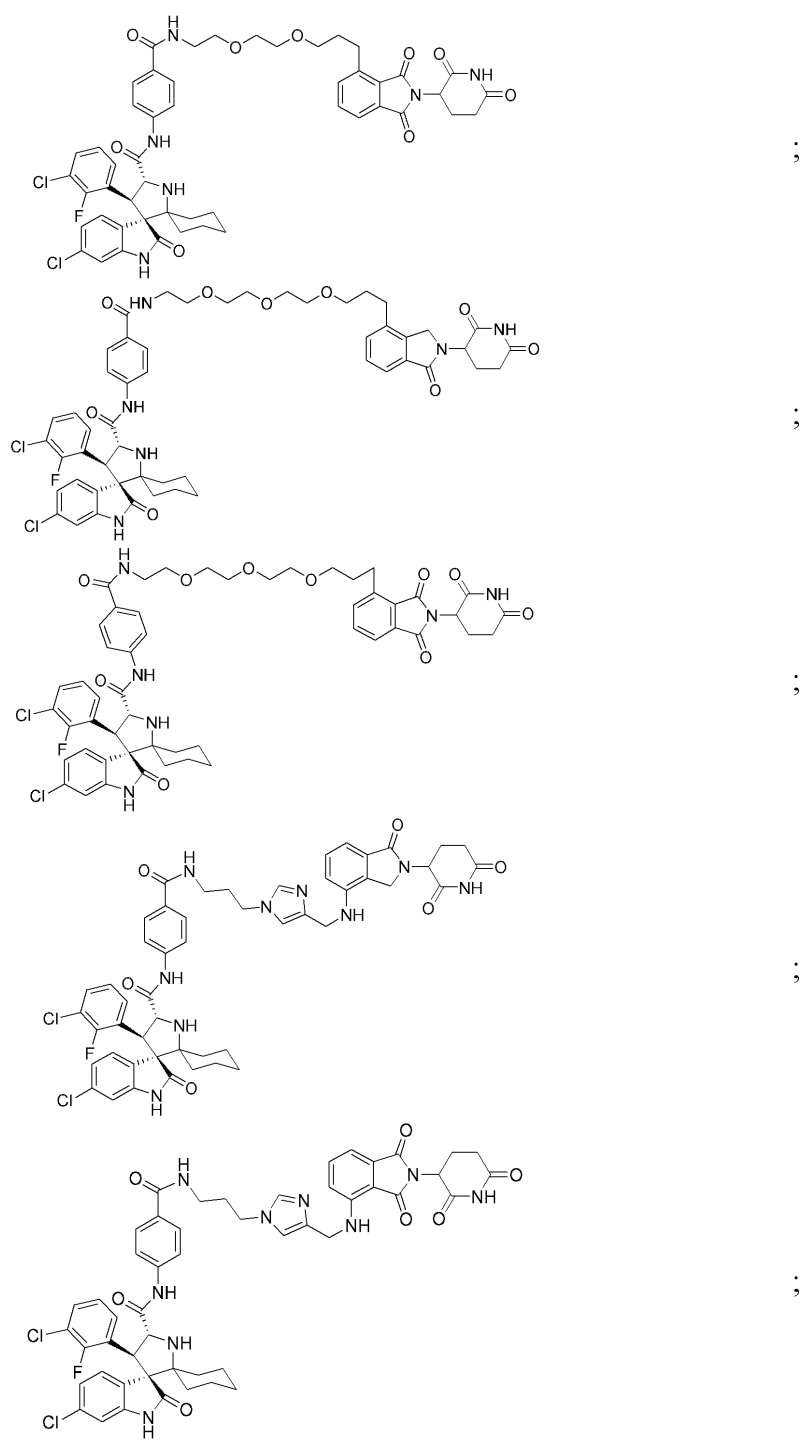




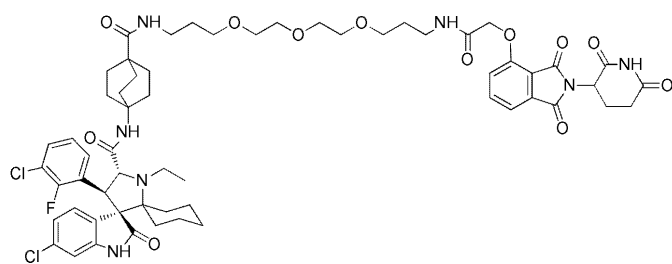




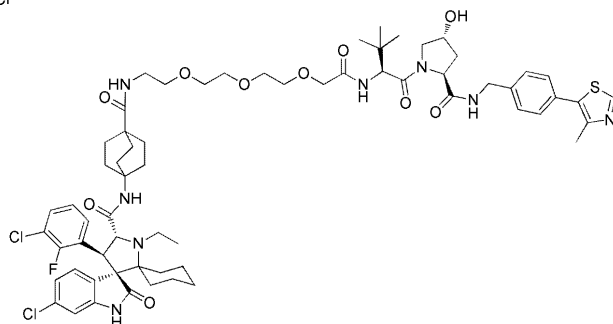




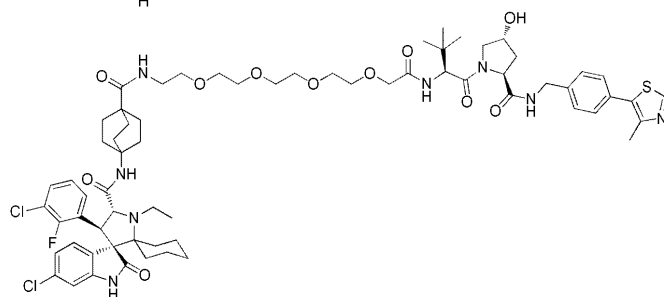




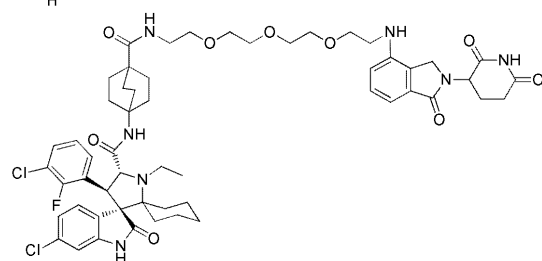
;



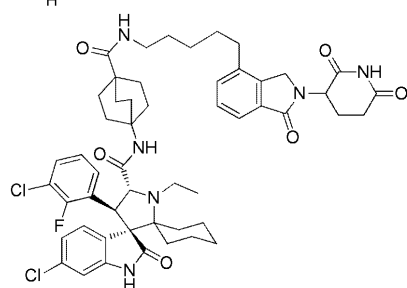
;



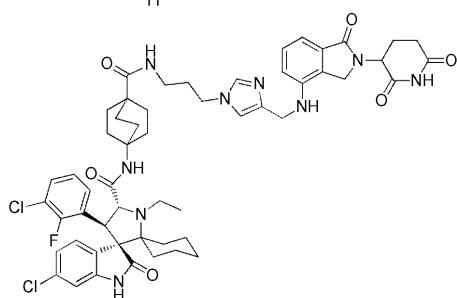
;



;

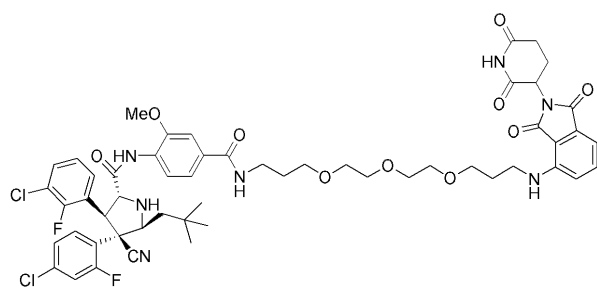


;

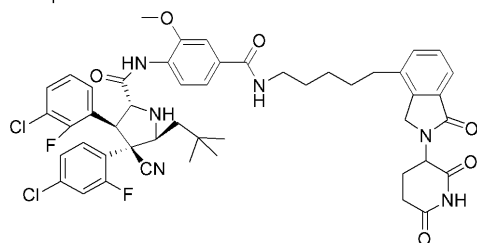


;

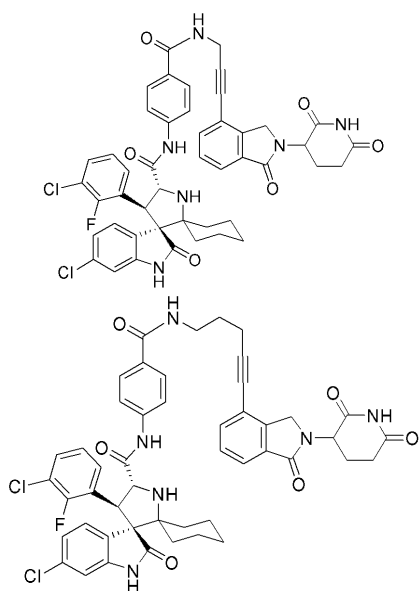




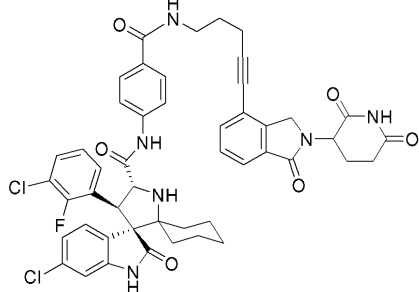
;



;

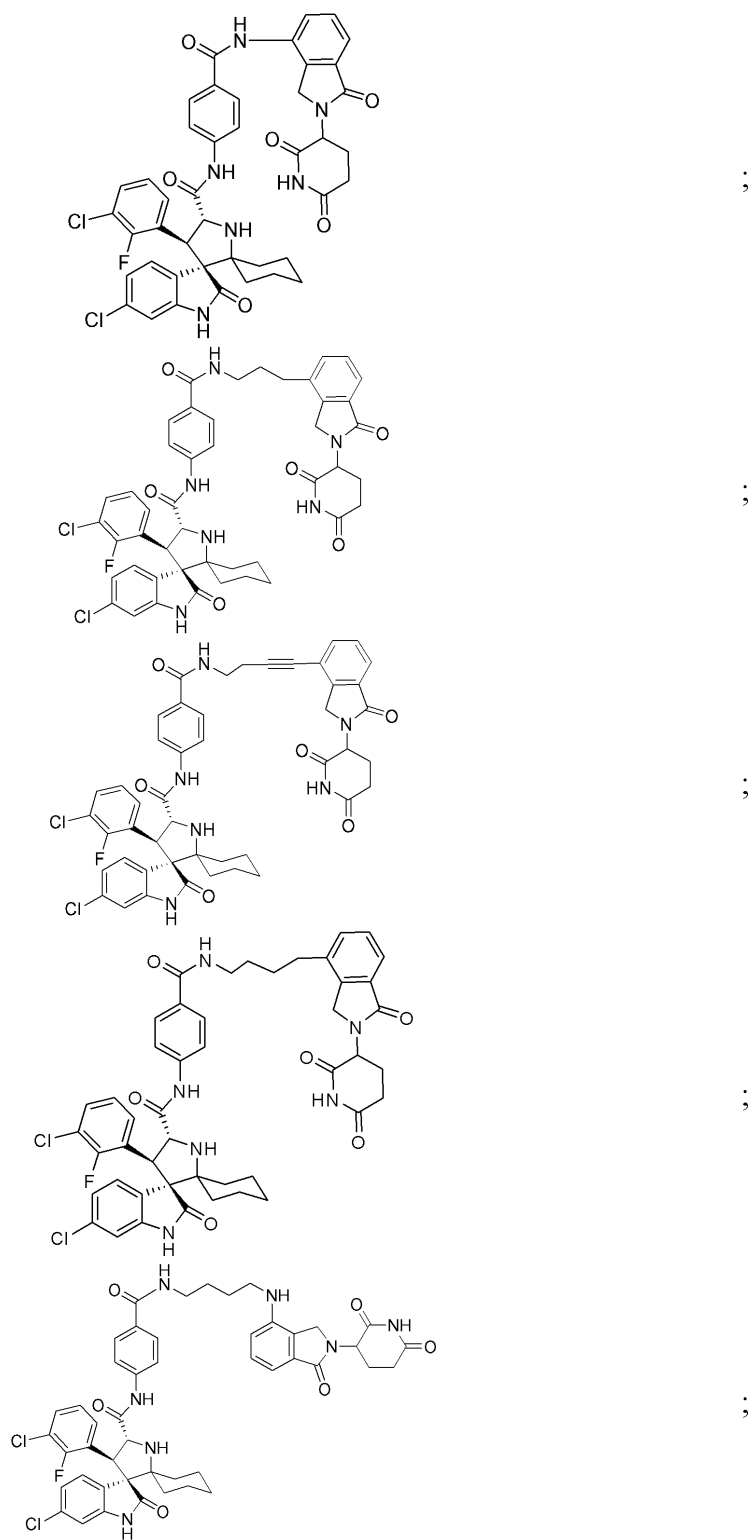


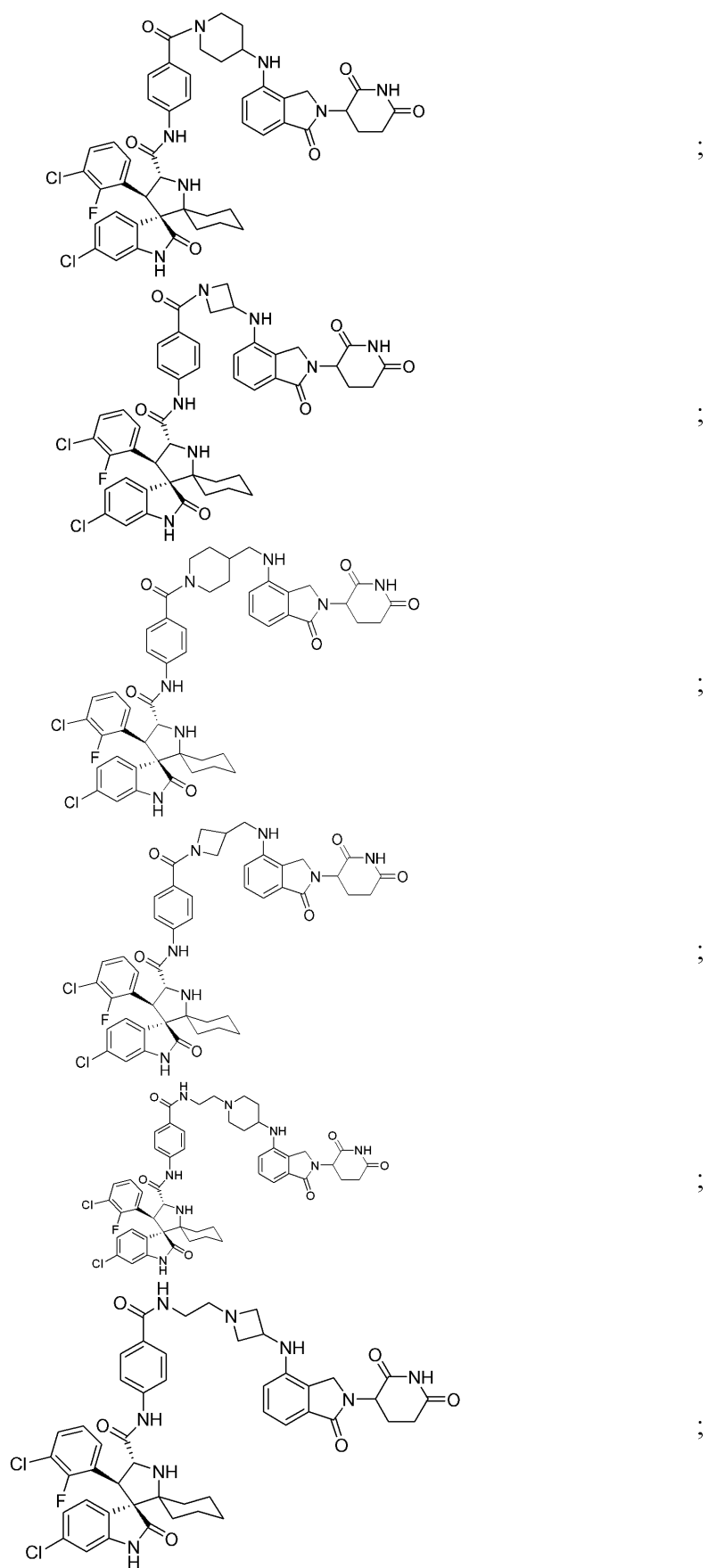
;

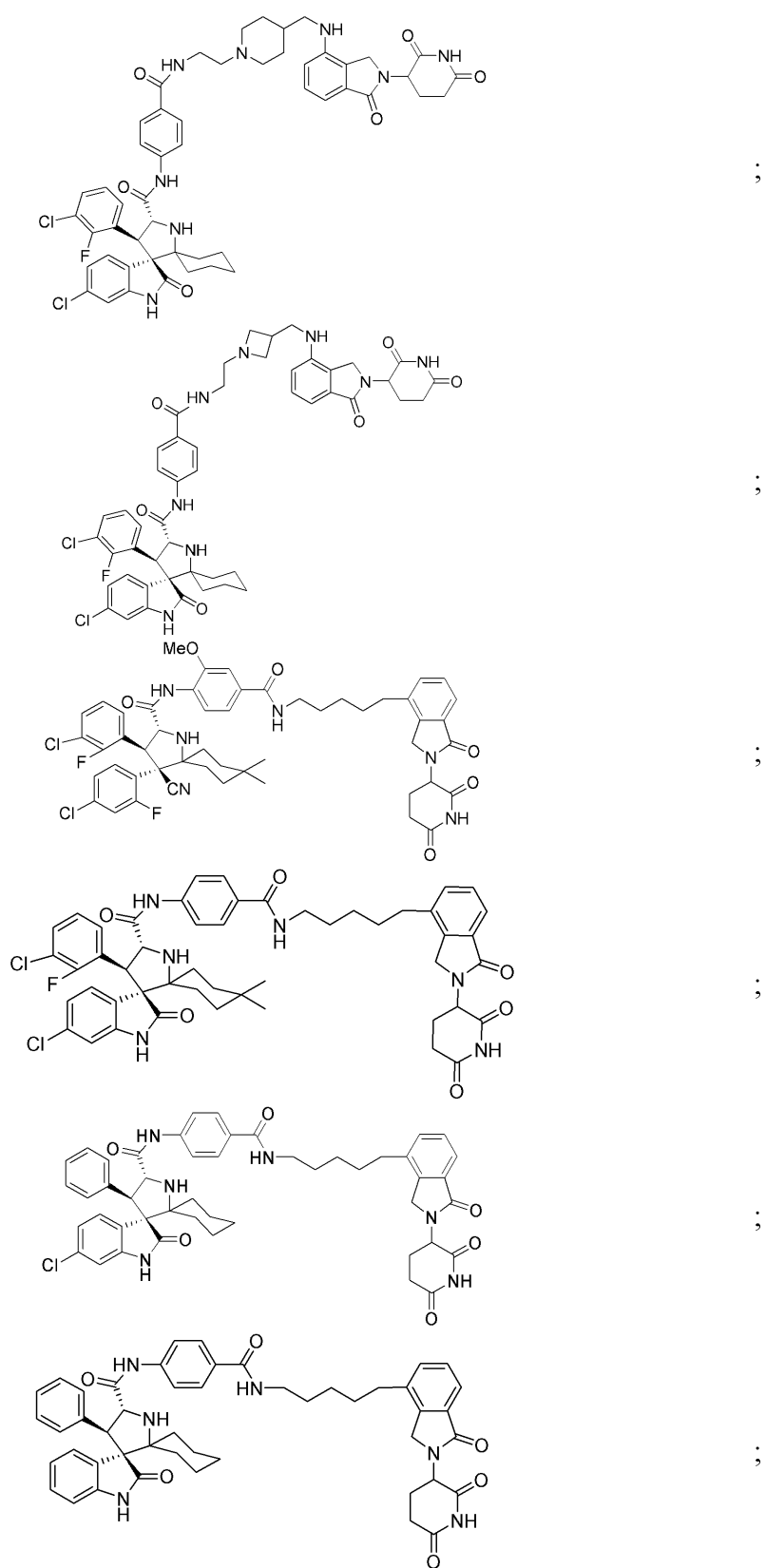


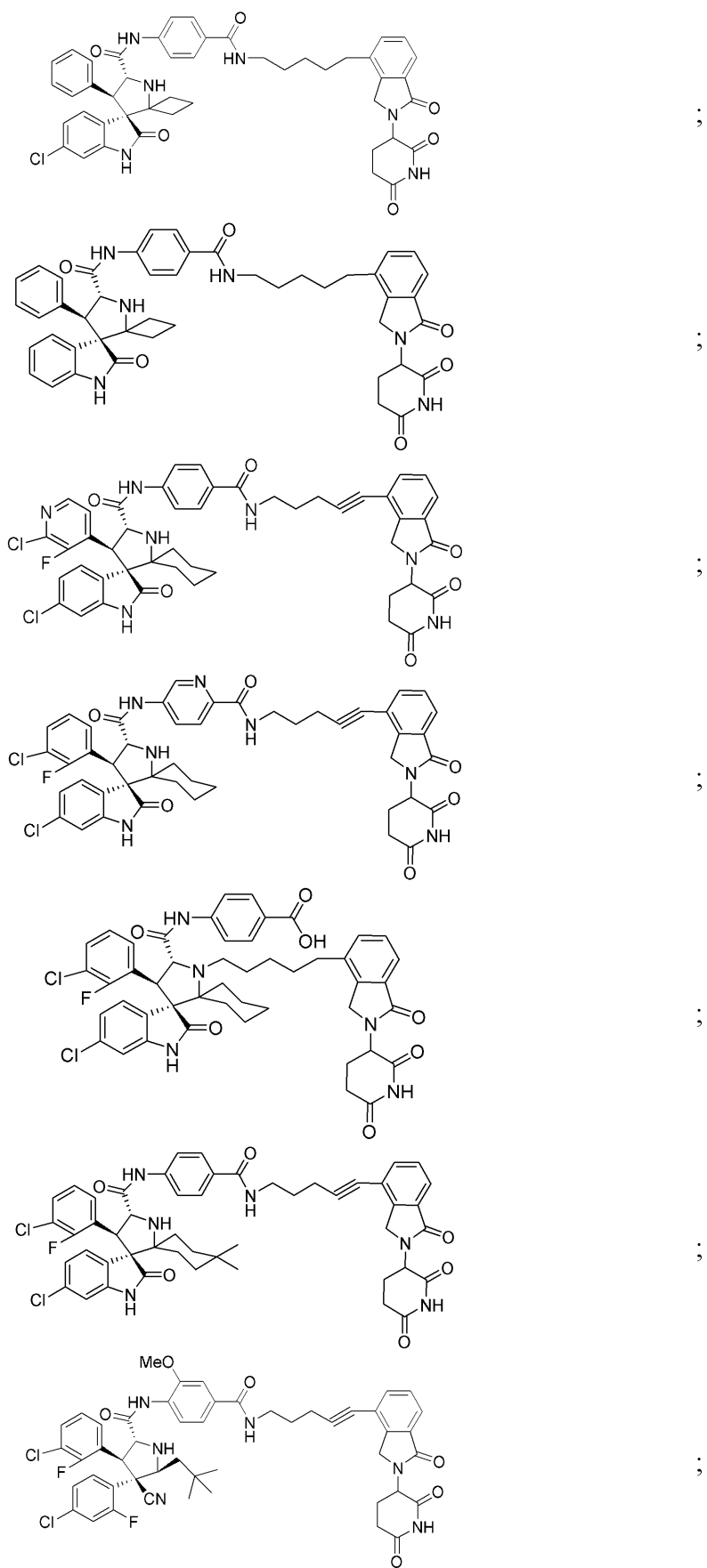
;

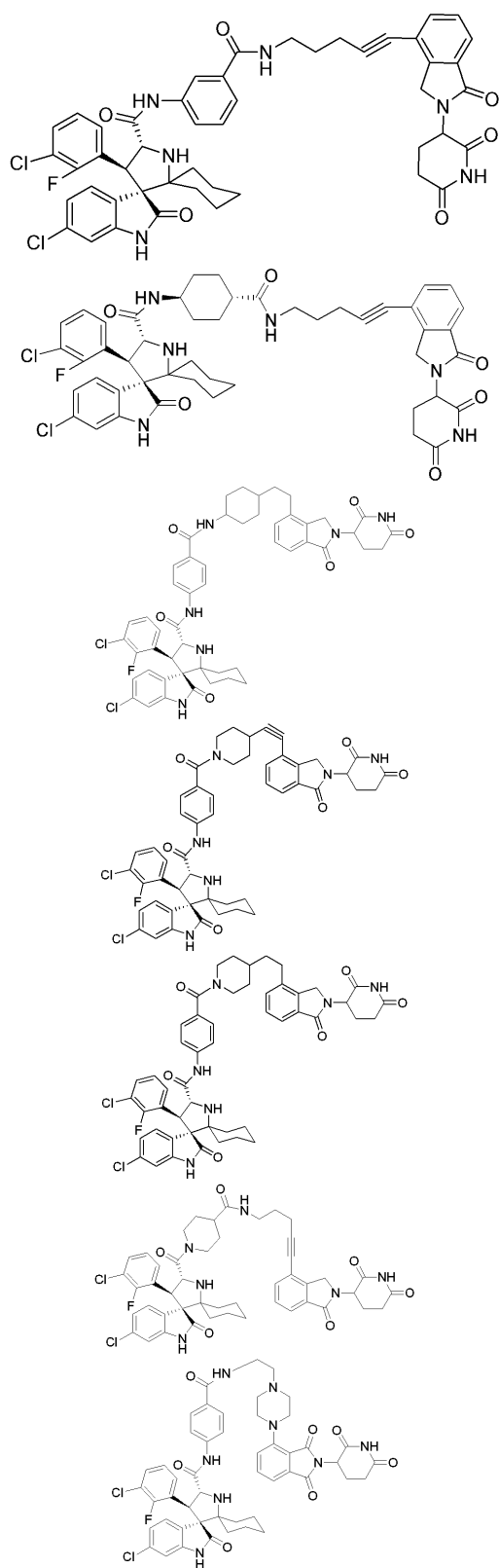


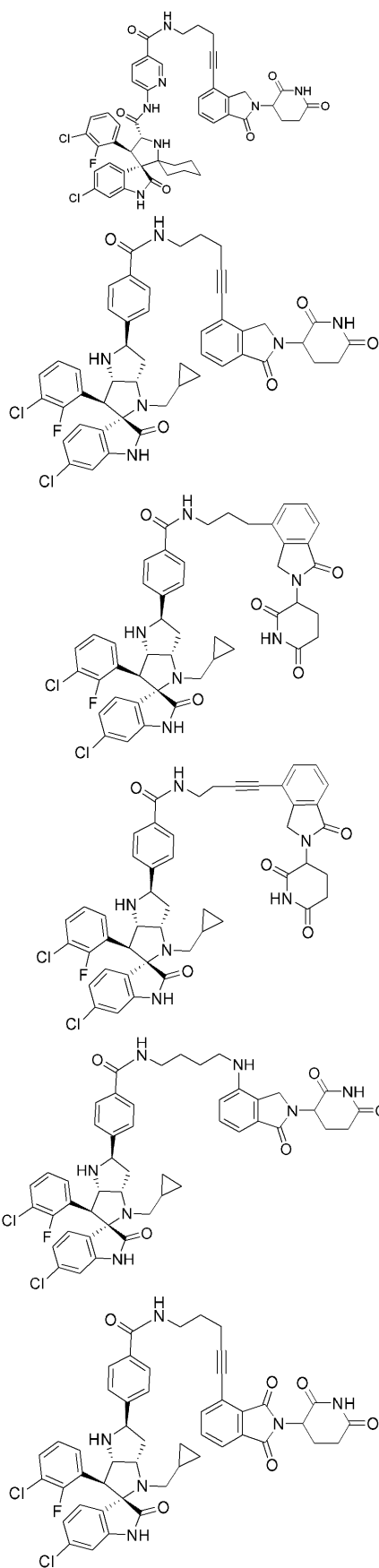


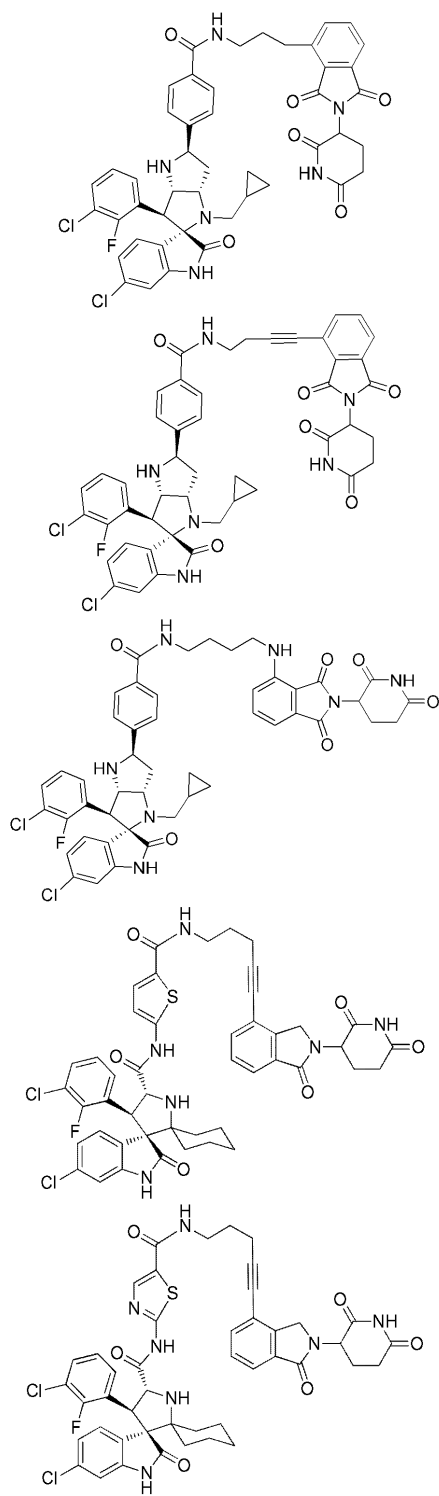


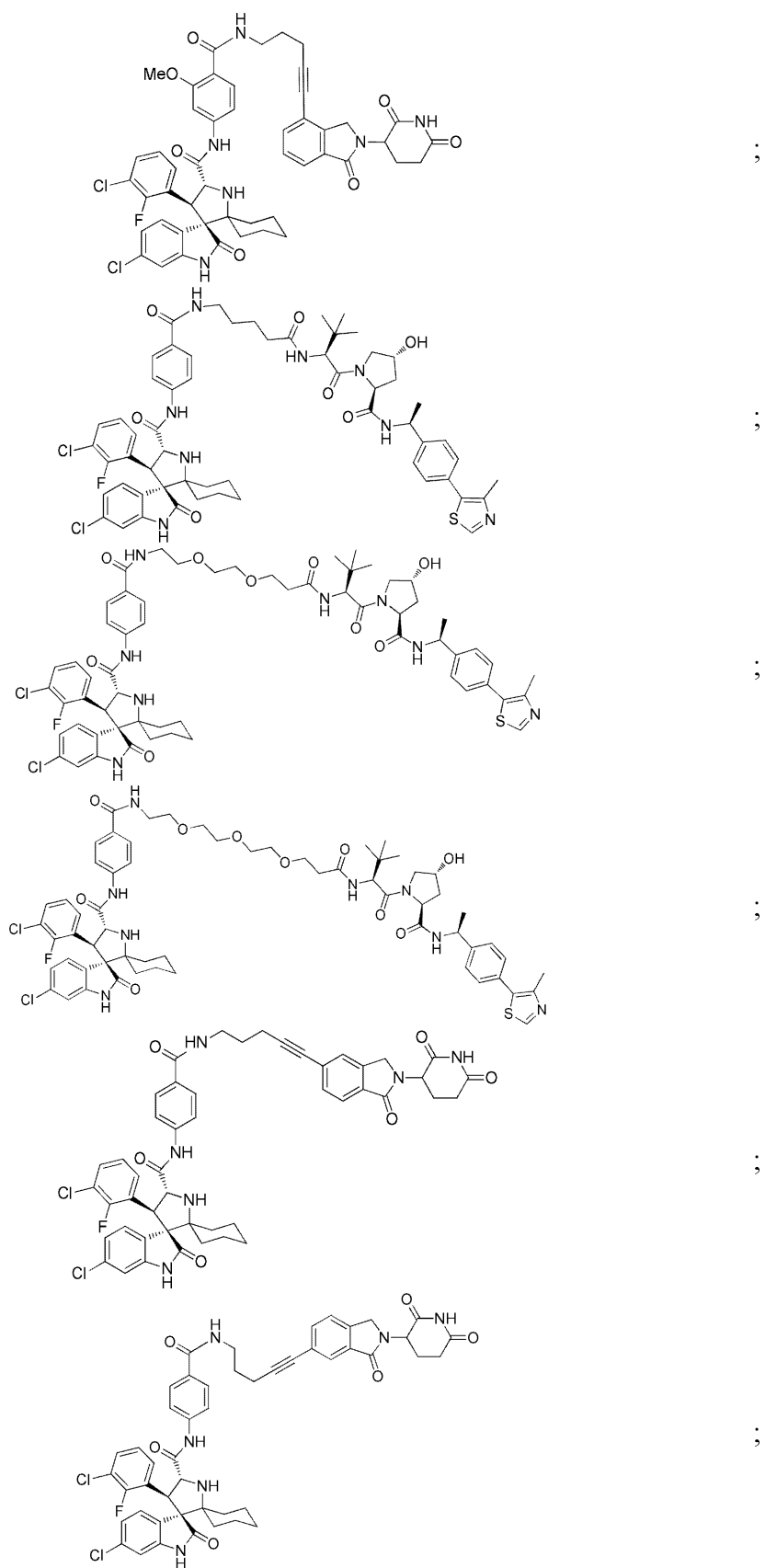




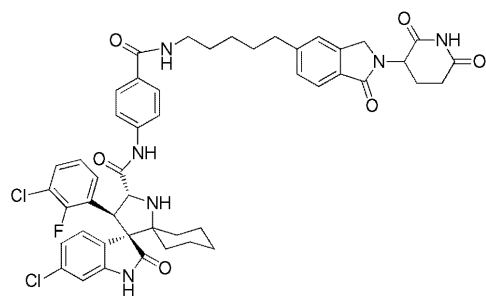




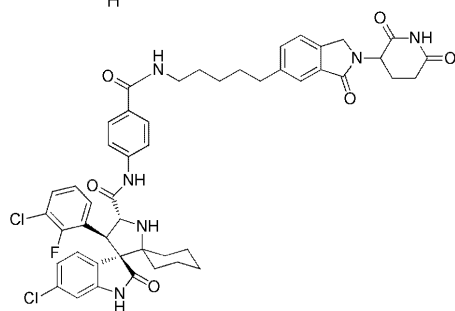




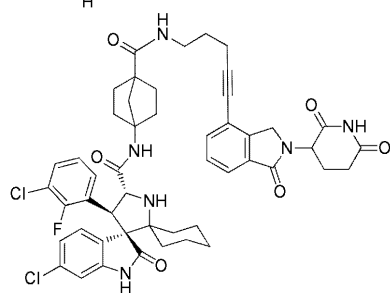




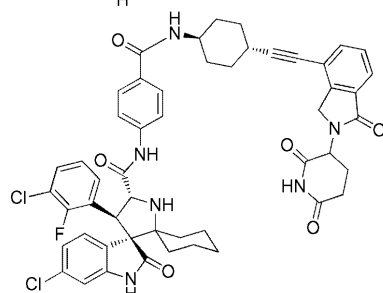
;



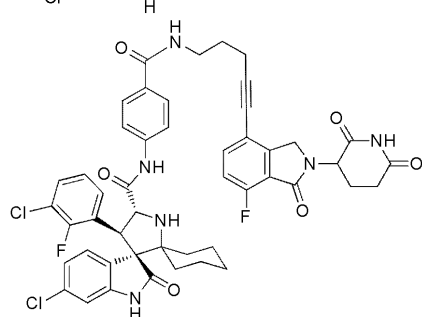
;



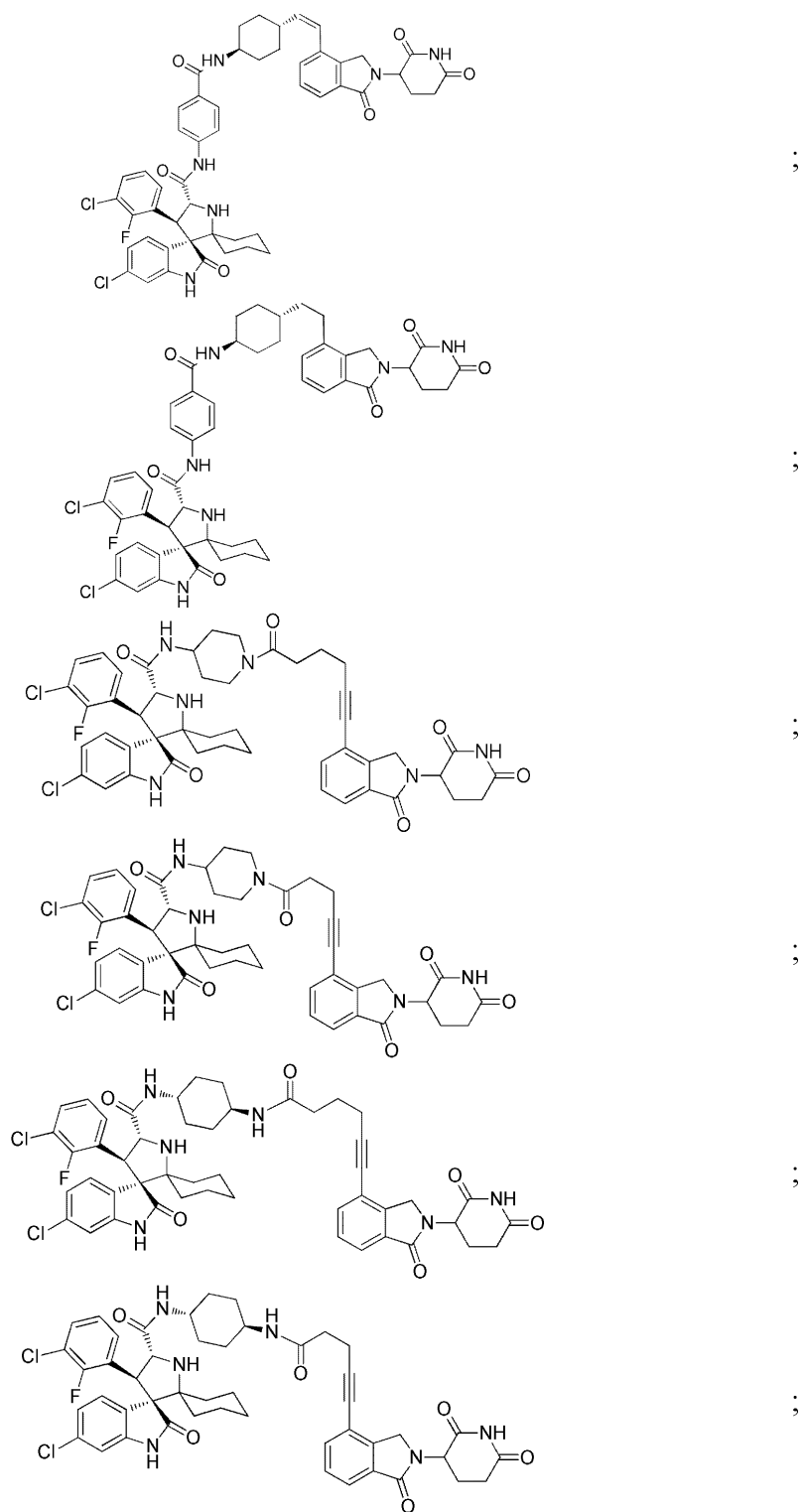
;

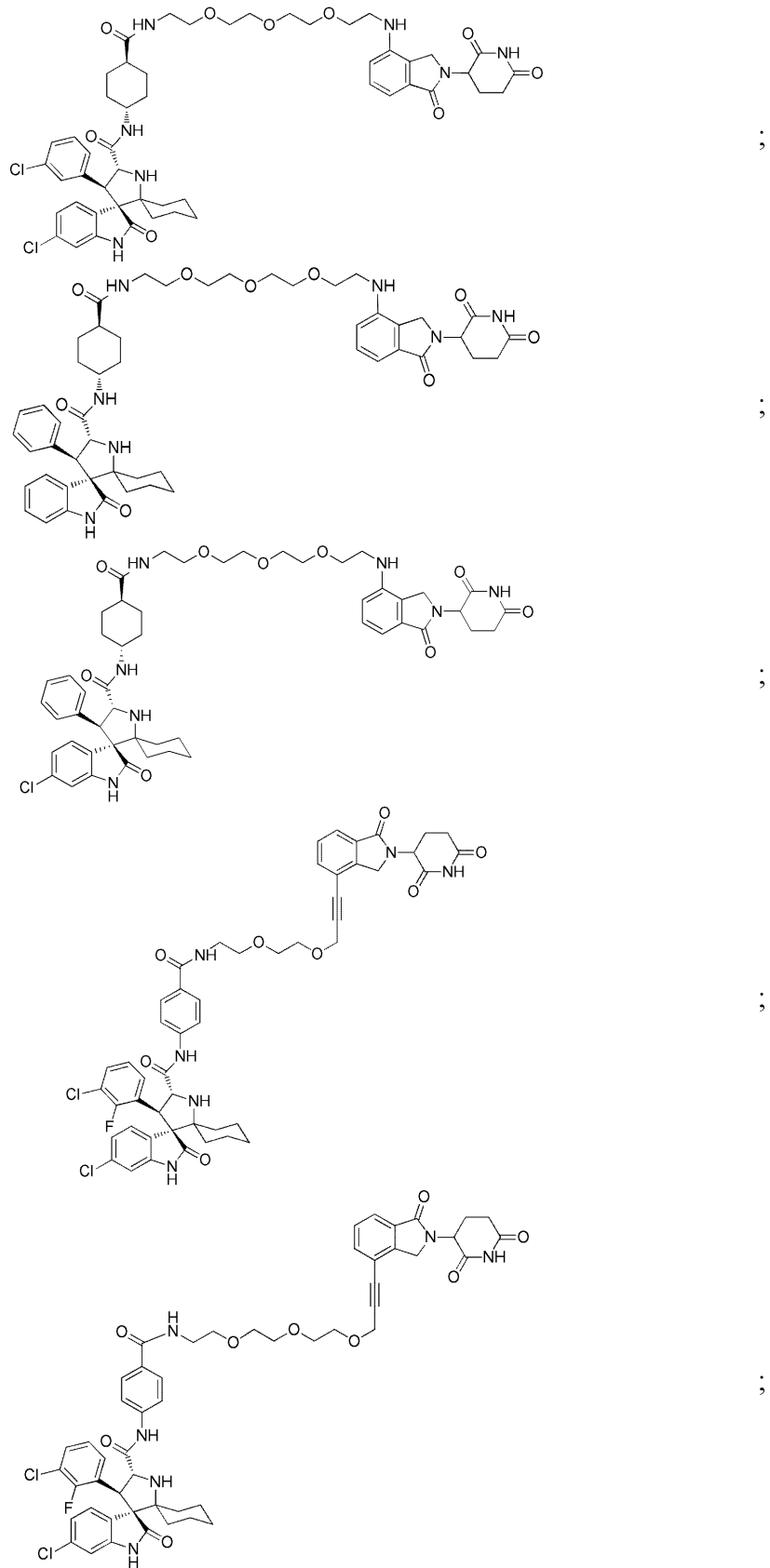


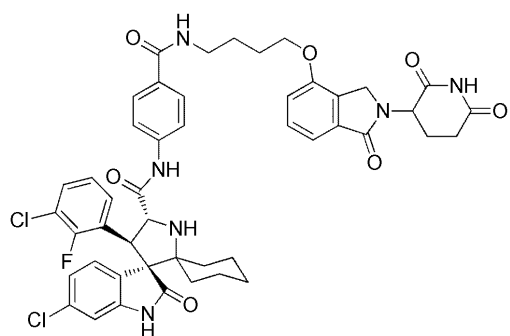
;



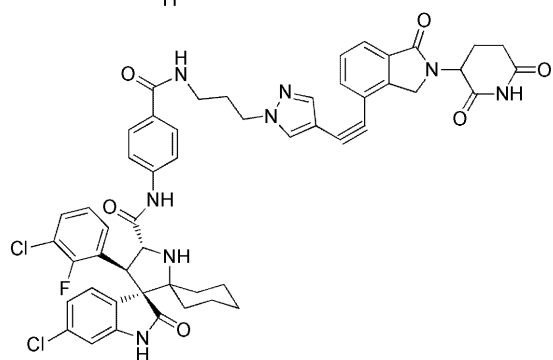
;



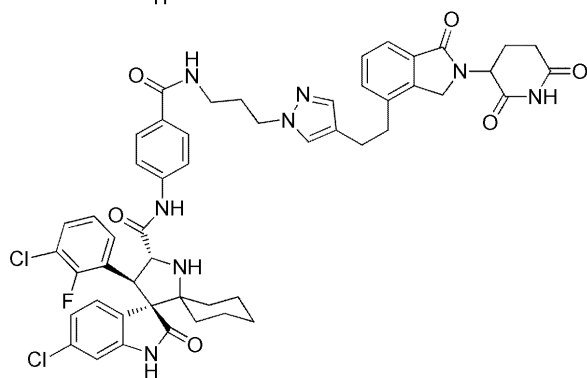




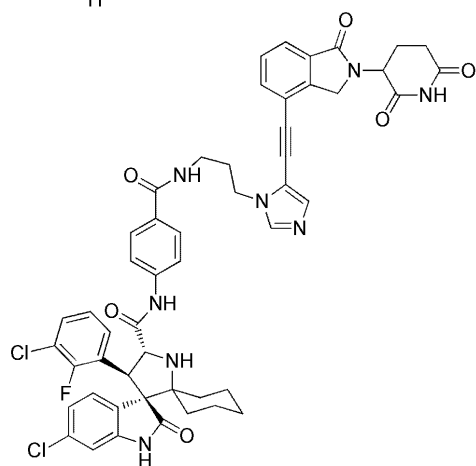
;



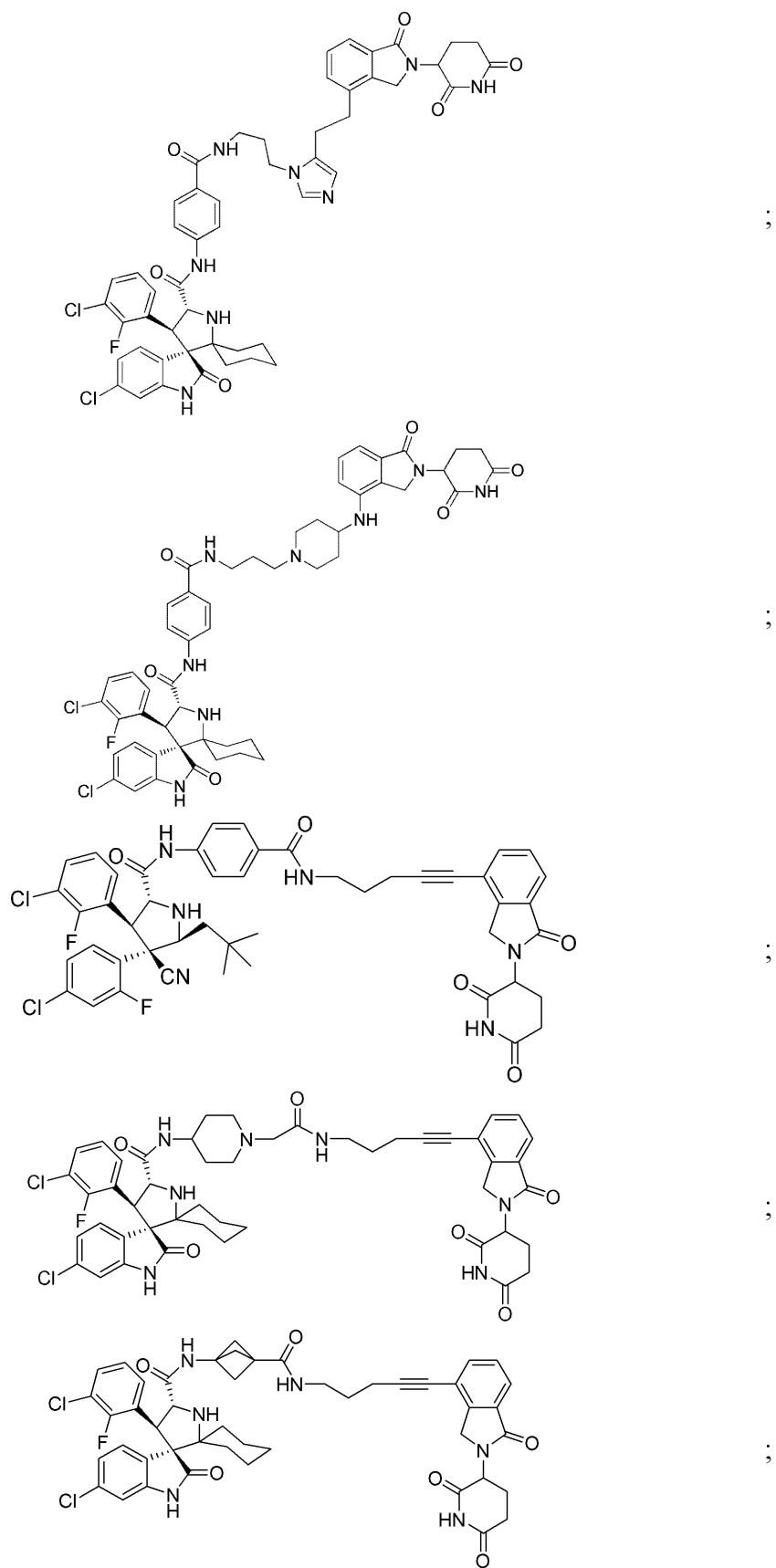
;

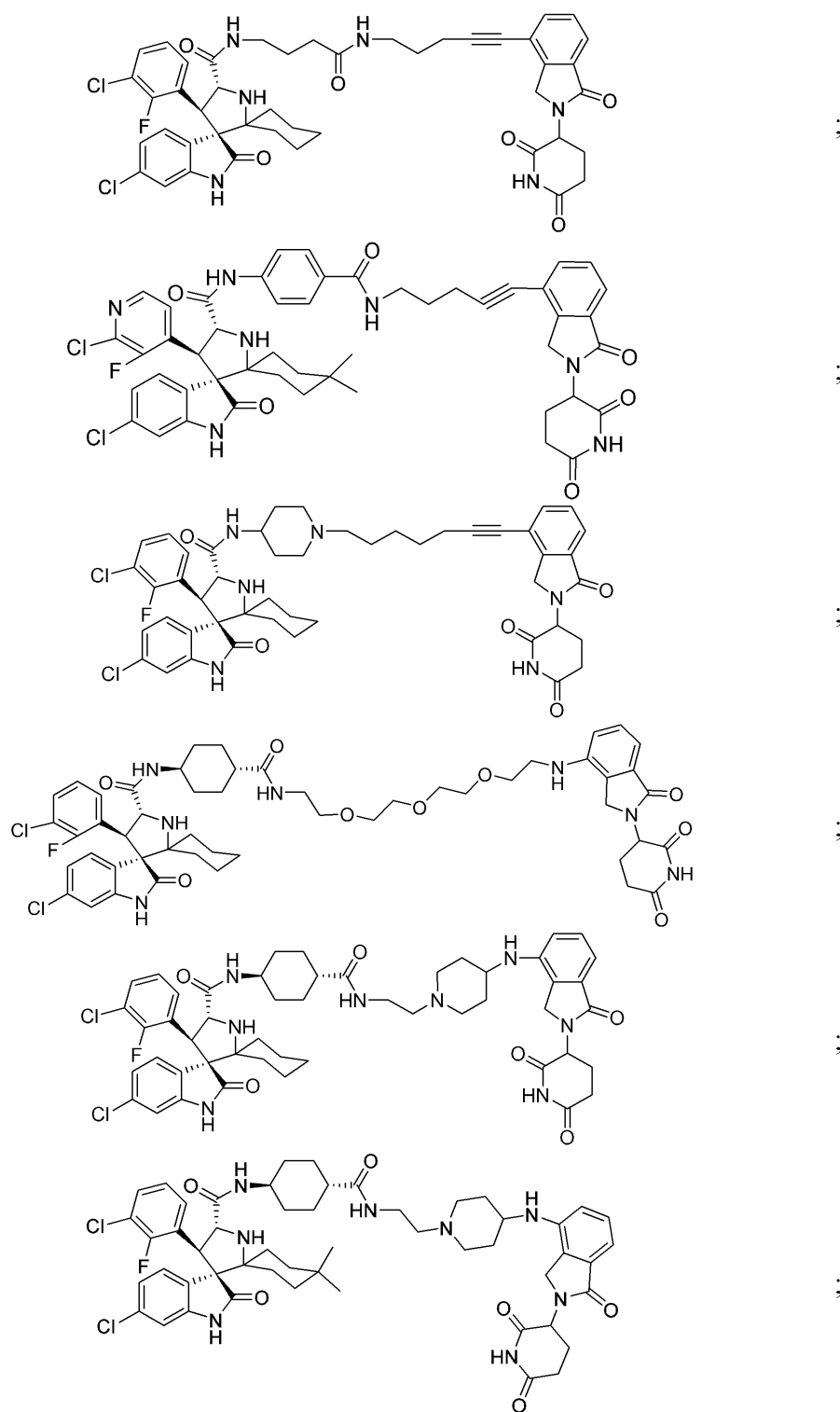


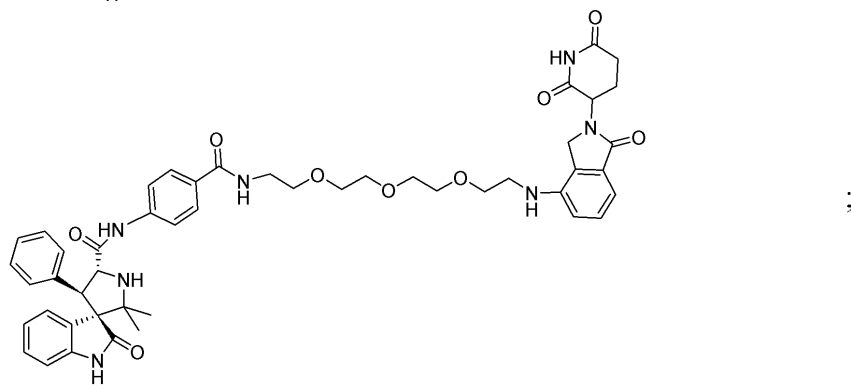
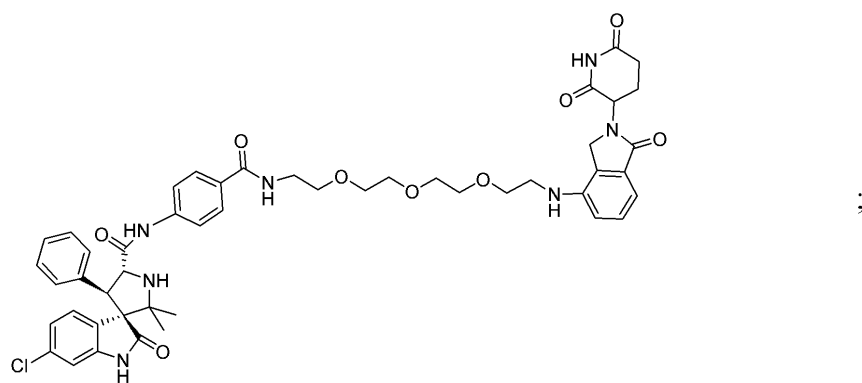
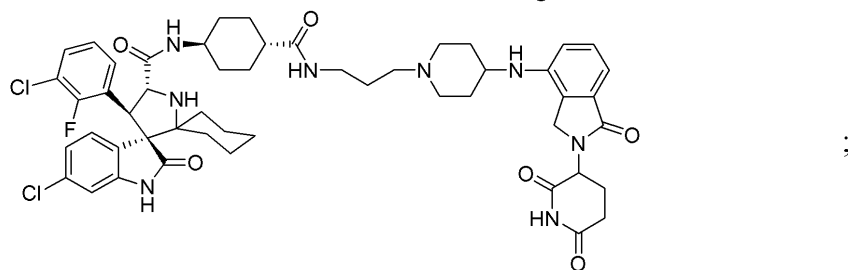
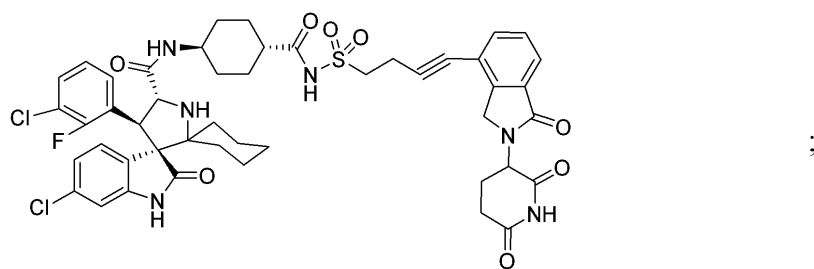
;

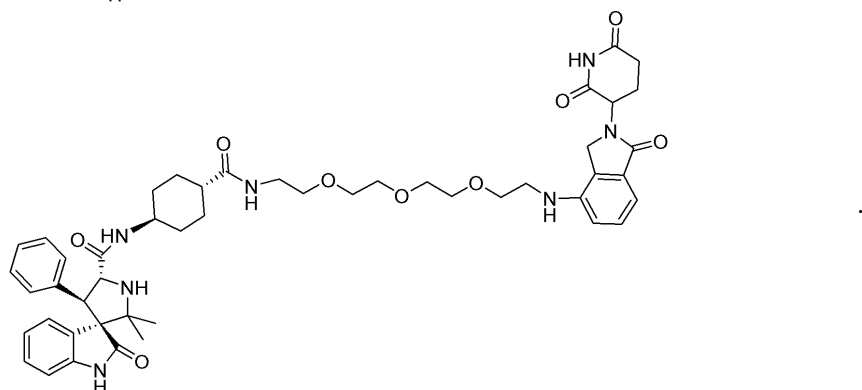
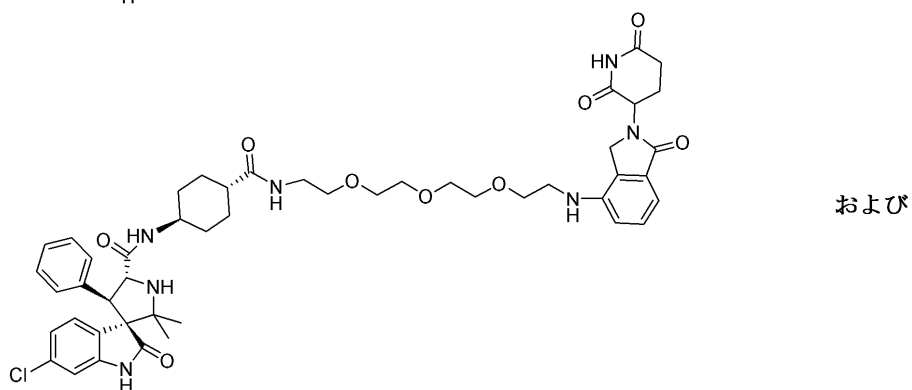
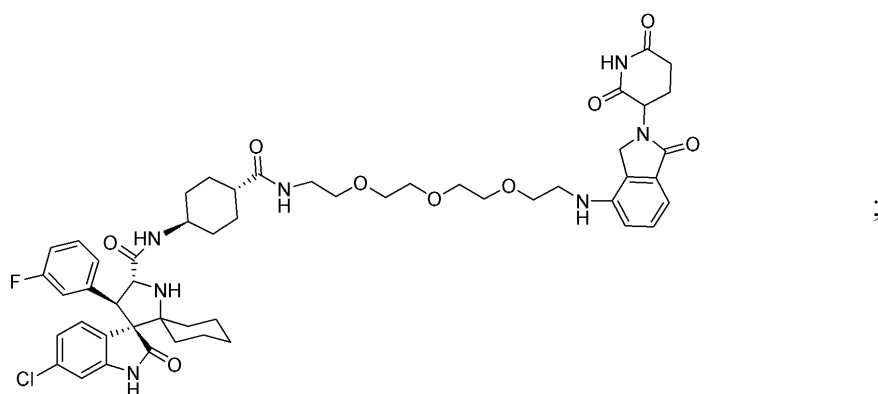


;









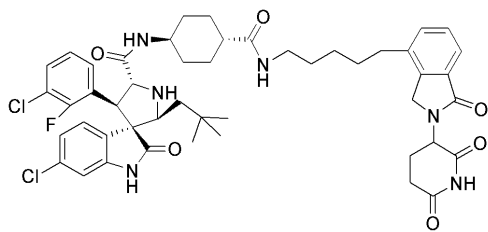
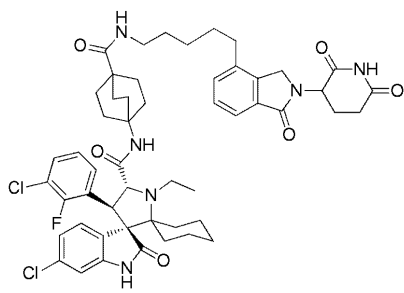
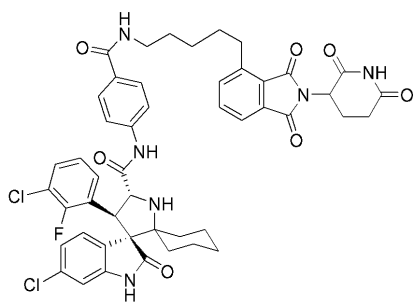
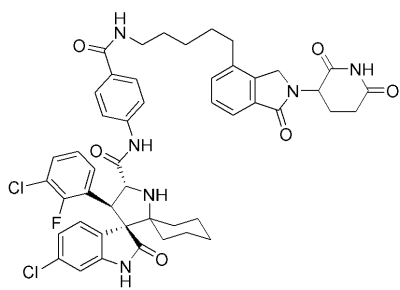
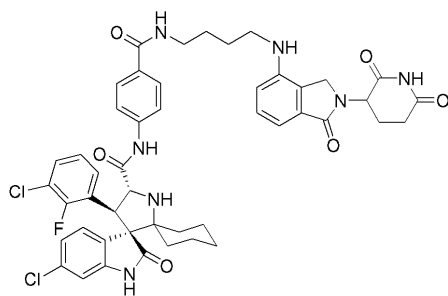
からなる群より選択される、請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 15】

化合物19、31、32、50、56、147、173、175、194、195、220および222、すなわち以下

：





(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-(4-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-4-イル)ペンタ-4-イン-1-イル)カルバモイル)フェニル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-((1R,4R)-4-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-4-イル)ペンタ-4-イン-1-イル

)カルバモイル)シクロヘキシル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-(4-(4-((2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-4-イル)エチニル)ピペリジン-1-カルボニル)フェニル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-(4-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-5-イル)ペンタ-4-イン-1-イル)カルバモイル)フェニル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-(4-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-3-オキソイソインドリン-5-イル)ペンタ-4-イン-1-イル)カルバモイル)フェニル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(3-クロロ-2-フルオロフェニル)-N-(3-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-4-イル)ペンタ-4-イン-1-イル)カルバモイル)ビスクロ[1.1.1]ペンタン-1-イル)-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド、および

(3'R,4'S,5'R)-6''-クロロ-4'-(2-クロロ-3-フルオロピリジン-4-イル)-N-(4-((5-(2-(2,6-ジオキソピペリジン-3-イル)-1-オキソイソインドリン-4-イル)ペンタ-4-イン-1-イル)カルバモイル)フェニル)-4,4-ジメチル-2''-オキソジスピロ[シクロヘキサン-1,2'-ピロリジン-3',3''-インドリン]-5'-カルボキサミド

からなる群より選択される、請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 16】

請求項1～15のいずれか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物と、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項 17】

請求項1～15のいずれか一項記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む、がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症の処置に用いるための薬学的組成物。

【請求項 18】

がんの処置に用いるための、請求項17記載の薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

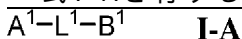
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0021】

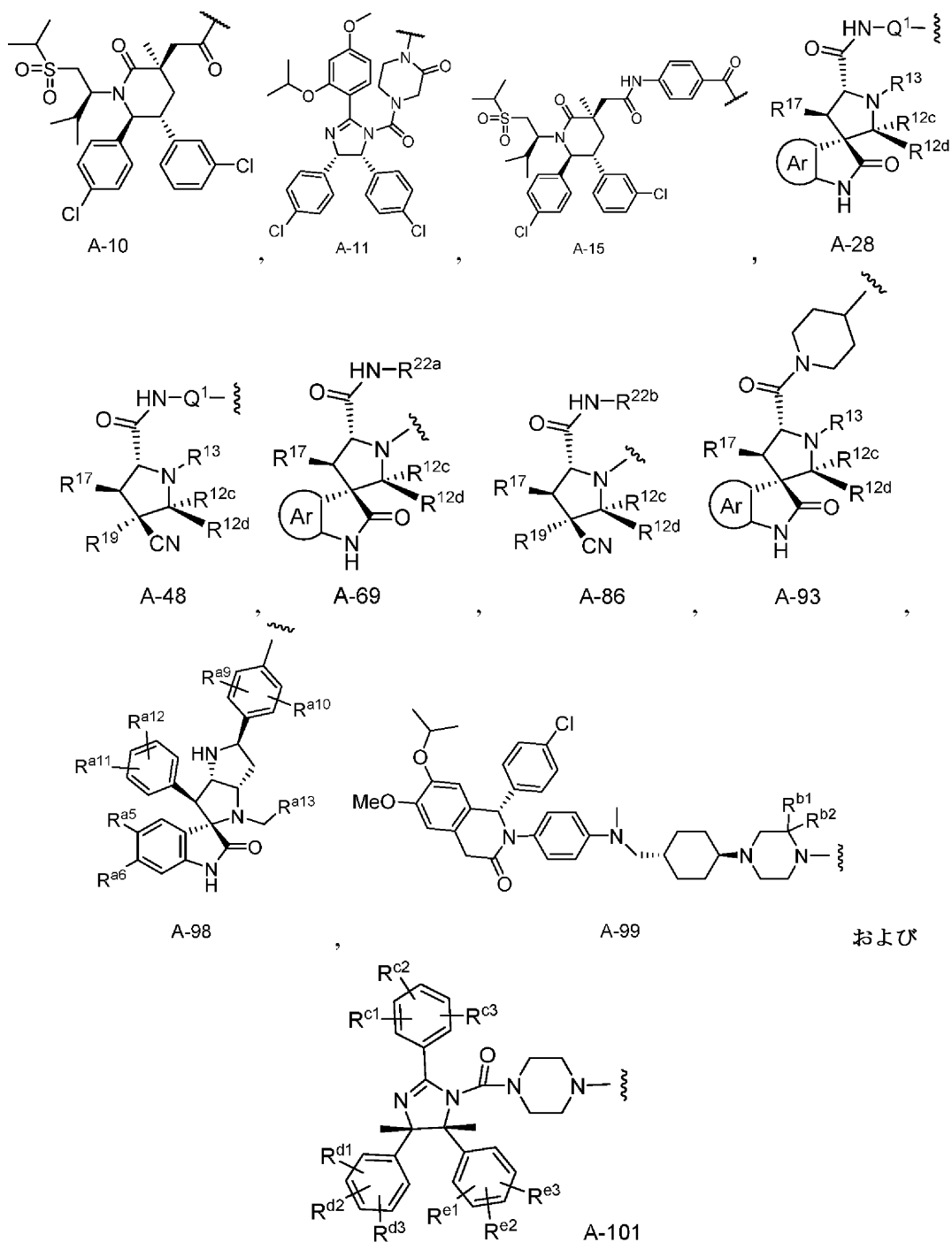
[本発明1001]

式I-Aを有する化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：



式中

A<sup>1</sup>は



からなる群より選択され；

$R^{12c}$  および  $R^{12d}$  は独立して水素および置換されていてもよい  $C_1 \sim 8$  アルキルからなる群より選択されるか；または

$R^{12c}$  および  $R^{12d}$  はそれらが結合している炭素原子と一緒に4～8員の置換されていてもよいシクロアルキルまたは4～8員の置換されていてもよいヘテロ環を形成し；

$R^{13}$  は水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル、およびヘテロアルキルからなる群より選択され；

$R^{17}$  は置換されていてもよいアリールおよび置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{19}$  は置換されていてもよいアリールおよび置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{22a}$  は置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロ環、置換されていてもよいアリール、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^{22b}$ は置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロ環、置換されていてもよいアリール、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され；

$Q^1$ はアルキレニル、フェニレニル、ヘテロアリーレニル、シクロアルキレニル、およびヘテロシクレニルからなる群より選択され；

Ar

は縮合した置換されていてもよいフェニル、縮合した置換されていてもよいチエニル、縮合した置換されていてもよいピリジル、または縮合した置換されていてもよいピリミジル基であり；

$R^{a5}$ 、 $R^{a6}$ 、 $R^{a11}$ 、および $R^{a12}$ はそれぞれ独立して水素およびハロからなる群より選択され；

$R^{a9}$ および $R^{a10}$ は独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択され；

$R^{a13}$ は水素、 $C_1 \sim 4$ アルキル、および $C_3 \sim 8$ シクロアルキルからなる群より選択され；

$R^{b1}$ および $R^{b2}$ はそれぞれ水素であるか；または

$R^{b1}$ および $R^{b2}$ は一緒になって $-C(=O)-$ 基を形成し；

$R^{c1}$ 、 $R^{c2}$ 、 $R^{c3}$ 、 $R^{d1}$ 、 $R^{d2}$ 、 $R^{d3}$ 、 $R^{e1}$ 、 $R^{e2}$ 、および $R^{e3}$ はそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択され；

$L^1$ は $-X^1-L^2-Y^1-$ であり；

$X^1$ は $X^2$ であるか；または

$X^1$ は存在せず；

$X^2$ は $-N(H)C(=O)-$ 、 $-C(=O)N(H)-$ 、 $-C(=O)N(H)S(O)_2-$ 、 $-N(H)C(=O)N(H)-$ 、 $-N(H)C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)N(H)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-N(H)-$ 、 $-SO_2N(H)-$ 、 $-N(H)SO_2-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、および $-C-C-$ からなる群より選択され；

$L^2$ はアルキレニル、ヘテロアルキレニル、 $-A^4-(CH_2)_m-W-(CH_2)_n-$ および $-(CH_2)_m-W-(CH_2)_u-O-(CH_2)_v-$ からなる群より選択されるか；または

$L^2$ は存在せず；

$A^4$ は5員ヘテロアリーレニルおよび6員ヘテロアリーレニルからなる群より選択されるか；または

$A^4$ は存在せず；

Wはフェニレニル、5員ヘテロアリーレニル、6員ヘテロアリーレニル、ヘテロシクレニル、およびシクロアルキレニルからなる群より選択され；

mは0、1、2、3、4、5、6、または7であり；

nは0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

uは0、1、2、または3であり；

vは1、2、3、または4であり；

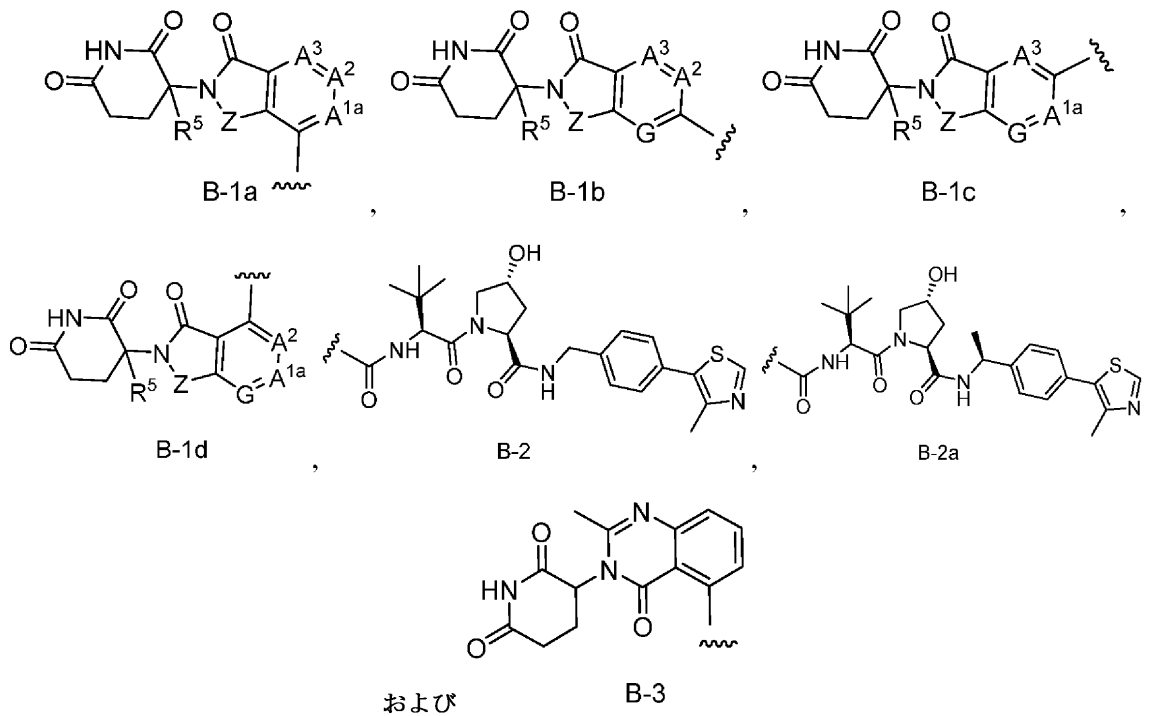
$Y^1$ は $-C-C-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^{2b})-$ 、 $-C(=O)N(R^{2c})-$ 、 $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ 、および $-N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$ からなる群より選択されるか；または

$Y^1$ は存在せず；

ここで $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ および $-N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$ のカルボキサミド窒素原子ならびに $-C(=O)N(R^{2c})-$ の炭素原子は $L^2$ に結合し；

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{2c}$ 、 $R^{2d}$ 、 $R^{2e}$ 、および $R^{2f}$ はそれぞれ独立して水素および $C_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択され；

$B^1$ は



からなる群より選択され；

$A^{1a}$ は $-C(R^{16a})=$ および $-N=$ からなる群より選択され；

$A^2$ は $-C(R^{16b})=$ および $-N=$ からなる群より選択され；

$A^3$ は $-C(R^{16c})=$ および $-N=$ からなる群より選択され；

$G$ は $-C(R^{16d})=$ および $-N=$ からなる群より選択され；

$Z$ は $-\text{CH}_2$ および $-\text{C}(=\text{O})-$ からなる群より選択され；

$R^5$ は水素、メチル、およびフルオロからなる群より選択され；

$R^{16a}$ は水素、ハロ、および $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択され；

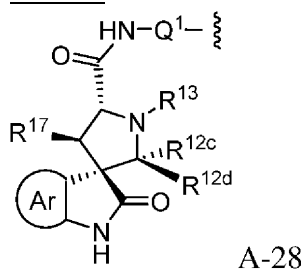
$R^{16b}$ は水素、ハロ、および $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択され；

$R^{16c}$ は水素、ハロ、および $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択され；かつ

$R^{16d}$ は水素、ハロ、および $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択される。

[本発明1002]

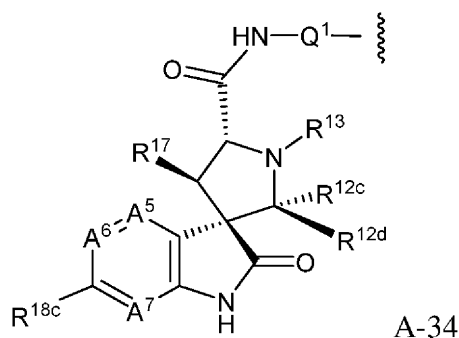
$A^1$ が



である、本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1003]

$A^1$ が



であり；

$A^5$  が  $-C(R^{18a})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；

$A^6$  が  $-C(R^{18b})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；

$A^7$  が  $-C(R^{18d})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；かつ

$R^{18a}$ 、 $R^{18b}$ 、 $R^{18c}$ 、および  $R^{18d}$  がそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、本発明1002の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1004]

$A^5$  が  $-N=$  であり、 $A^6$  が  $-C(R^{18b})=$  であり、かつ  $A^7$  が  $-C(R^{18d})=$  である、本発明1003の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1005]

$A^5$  が  $-C(R^{18a})=$  であり、 $A^6$  が  $-N=$  であり、かつ  $A^7$  が  $-C(R^{18d})=$  である、本発明1003の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1006]

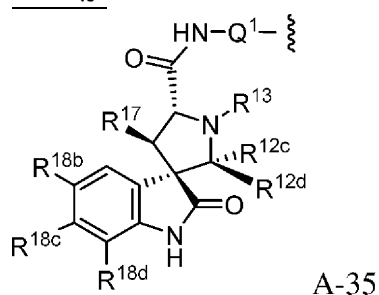
$A^5$  が  $-C(R^{18a})=$  であり、 $A^6$  が  $-C(R^{18b})=$  であり、かつ  $A^7$  が  $-N=$  である、本発明1003の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1007]

$A^5$  が  $-C(R^{18a})=$  であり、 $A^6$  が  $-N=$  であり、かつ  $A^7$  が  $-N=$  である、本発明1003の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1008]

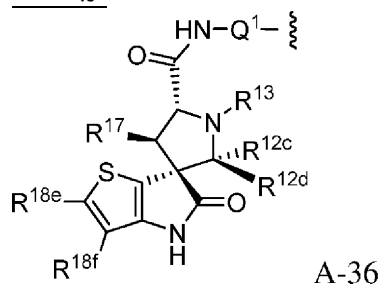
$A^1$  が



である、本発明1003の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1009]

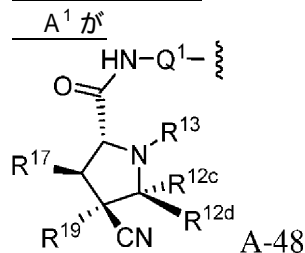
$A^1$  が



であり；かつ

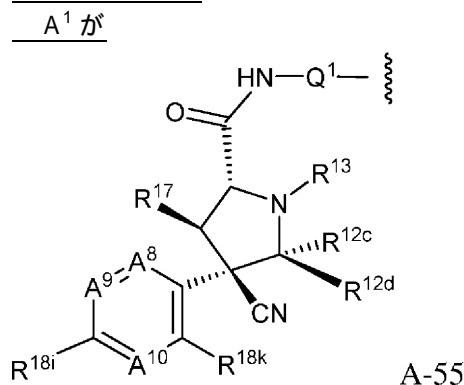
$R^{18e}$  および  $R^{18f}$  が独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、本発明1002の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1010]



である、本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1011]



であり；

$A^8$  が  $-C(R^{18g})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；

$A^9$  が  $-C(R^{18h})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；

$A^{10}$  が  $-C(R^{18j})=$  および  $-N=$  からなる群より選択され；かつ

$R^{18g}$ 、 $R^{18h}$ 、 $R^{18i}$ 、 $R^{18j}$ 、および  $R^{18k}$  がそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、本発明1010の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1012]

$A^8$  が  $-N=$  であり、 $A^9$  が  $-C(R^{18h})=$  であり、かつ  $A^{10}$  が  $-C(R^{18j})=$  である、本発明1011の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1013]

$A^8$  が  $C(R^{18g})=$  であり、 $A^9$  が  $-N=$  であり、かつ  $A^{10}$  が  $-C(R^{18j})=$  である、本発明1011の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1014]

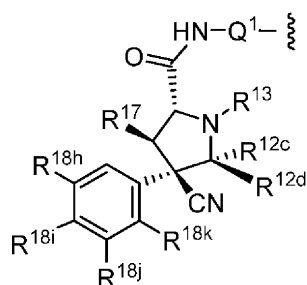
$A^8$  が  $-C(R^{18g})=$  であり、 $A^9$  が  $-C(R^{18h})=$  であり、かつ  $A^{10}$  が  $-N=$  である、本発明1011の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1015]

$A^8$  が  $-C(R^{18g})=$  であり、 $A^9$  が  $-N=$  であり、かつ  $A^{10}$  が  $-N=$  である、本発明1011の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1016]

$A^1$  が

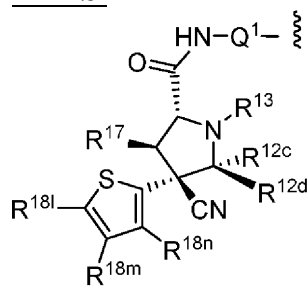


A-56

である、本発明1011の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1017]

A<sup>1</sup>が



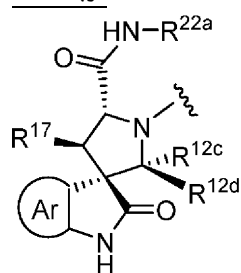
A-57

であり、かつ

R<sup>18l</sup>、R<sup>18m</sup>、およびR<sup>18n</sup>がそれぞれ独立して水素、ハロ、C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、本発明1010の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1018]

A<sup>1</sup>が

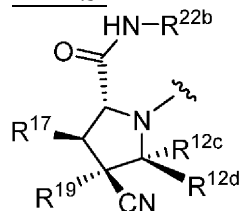


A-69

である、本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1019]

A<sup>1</sup>が



A-86

である、本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1020]

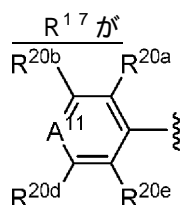
R<sup>17</sup>が、置換されていてもよいアリールである、本発明1001~1019のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1021]

R<sup>17</sup>が、置換されていてもよいヘテロアリールである、本発明1001~1019のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1022]





であり；

$A^{11}$ が $-C(R^{20c})=$ および $-N=$ からなる群より選択され；かつ

$R^{20a}$ 、 $R^{20b}$ 、 $R^{20c}$ 、 $R^{20d}$ 、および $R^{20e}$ がそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、本発明1001～1019のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1023]

$A^{11}$ が $-C(R^{20c})=$ である、本発明1022の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1024]

$A^{11}$ が $-N=$ である、本発明1022の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1025]

$R^{12c}$ が水素であり、かつ $R^{12d}$ が $C_1 \sim 8$ アルキルである、本発明1001～1024のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1026]

$R^{12c}$ および $R^{12d}$ が独立して $C_1 \sim 8$ アルキルより選択される、本発明1001～1024のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1027]

$R^{12c}$ および $R^{12d}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に4～8員の置換されていてもよいシクロアルキルを形成する、本発明1001～1024のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1028]

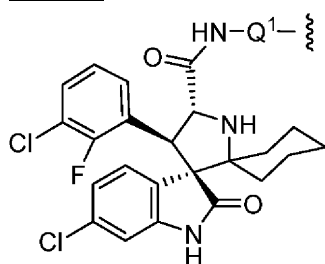
$R^{12c}$ および $R^{12d}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に4～8員の置換されていてもよいヘテロ環を形成する、本発明1001～1024のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1029]

$R^{13}$ が水素である、本発明1001～1017もしくは1020～1028のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1030]

$A^1$ が



A-100

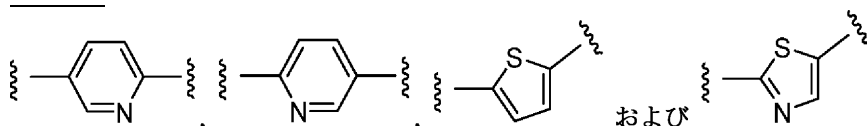
である、本発明1008の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1031]

$Q^1$ がフェニルである、本発明1001～1017もしくは1020～1030のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1032]

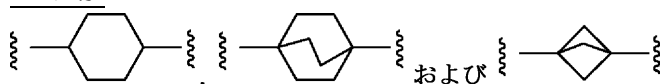
$Q^1$ がヘテロアリーレニルである、本発明1001～1017もしくは1020～1030のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1033]Q<sup>1</sup>が

からなる群より選択されるヘテロアリーレニルである、本発明1032の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1034]

Q<sup>1</sup>がシクロアルキレニルである、本発明1001～1017もしくは1020～1030のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1035]Q<sup>1</sup>が

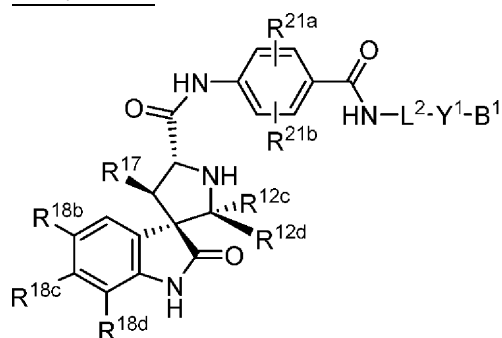
からなる群より選択されるシクロアルキレニルである、本発明1034の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1036]

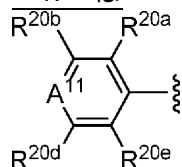
Q<sup>1</sup>がヘテロシクレニルである、本発明1001～1017もしくは1020～1030のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1037]X<sup>1</sup>がX<sup>2</sup>であり；かつ

X<sup>2</sup>が-N(H)C(=O)-、-C(=O)N(H)-、-N(H)C(=O)N(H)-、-N(H)C(=O)O-、-OC(=O)N(H)-、-SO<sub>2</sub>-、-O-、-N(H)-、-SO<sub>2</sub>N(H)-、-N(H)SO<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-、-CH=CH-、および-C C-からなる群より選択される、本発明1001～1036のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1038]式VII：**VII**を有し、式中

R<sup>12c</sup>およびR<sup>12d</sup>はそれらが結合している炭素原子と一緒になって4員シクロアルキルまたは6員の置換されていてもよいシクロアルキルを形成し；

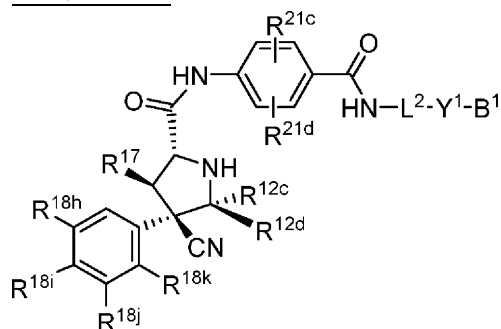
R<sup>17</sup>はであり；A<sup>11</sup>は-C(R<sup>20c</sup>)=であり；R<sup>20a</sup>、R<sup>20b</sup>、およびR<sup>20c</sup>はそれぞれ水素であり；R<sup>20d</sup>およびR<sup>20e</sup>は独立して水素およびハロからなる群より選択され；

$R^{18b}$ 、 $R^{18c}$ 、および $R^{18d}$ はそれぞれ独立して水素およびハロからなる群より選択され；  
かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、  
本発明1008の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1039]

式VIII：



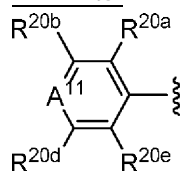
VIII

を有し、式中

$R^{12c}$ および $R^{12d}$ は独立して水素および置換されていてもよい $C_1 \sim 8$ アルキルからなる群より選択されるか；または

$R^{12c}$ および $R^{12d}$ はそれらが結合している炭素原子と一緒に4員シクロアルキルまたは6員の置換されていてもよいシクロアルキルを形成し；

$R^{17}$ は



であり；

$A^{11}$ は $-C(R^{20c})=$ であり；

$R^{20a}$ 、 $R^{20b}$ 、および $R^{20c}$ はそれぞれ水素であり；

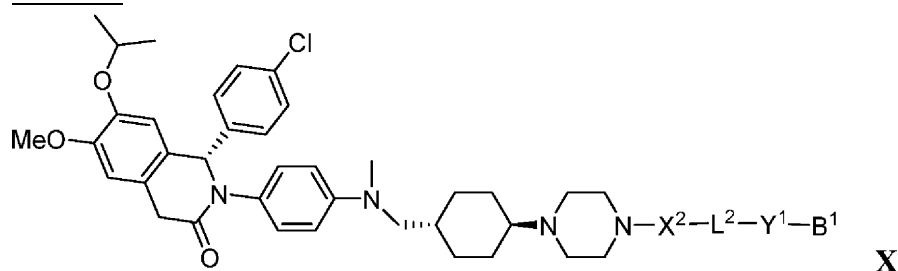
$R^{20d}$ および $R^{20e}$ は独立して水素およびハロからなる群より選択され；

$R^{18h}$ 、 $R^{18i}$ 、 $R^{18j}$ 、および $R^{18k}$ はそれぞれ独立して水素およびハロからなる群より選択され；かつ

$R^{21c}$ および $R^{21d}$ はそれぞれ独立して水素、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、およびハロアルコキシからなる群より選択される、  
本発明1016の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1040]

式X：



X

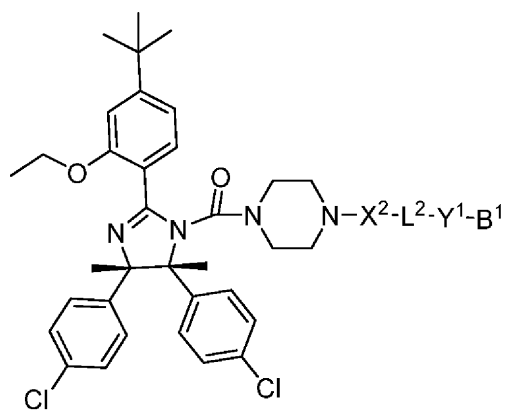
を有し、式中

$X^2$ は $-C(=O)-$ および $-CH_2-$ からなる群より選択される、

本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1041]

式XI：



XI

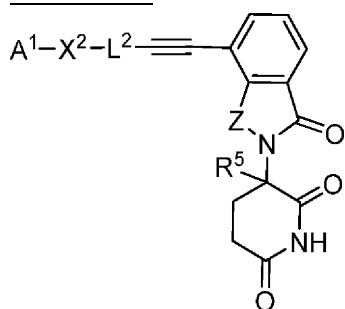
を有し、式中

$X^2$  は  $-C(=O)-$  および  $-CH_2-$  からなる群より選択される、

本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1042]

式XII：



XII

を有し、式中

Z は  $-CH_2-$  および  $-C(=O)-$  からなる群より選択され；

$R^5$  は水素、メチル、およびフルオロからなる群より選択され；

$X^2$  は  $-N(H)C(=O)-$ 、 $-C(=O)N(H)-$ 、 $-C(=O)N(H)S(O)_2-$ 、 $-N(H)C(=O)N(H)-$ 、 $-N(H)C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)N(H)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-N(H)-$ 、 $-SO_2N(H)-$ 、 $-N(H)SO_2-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、および  $-C-C-$  からなる群より選択され；かつ

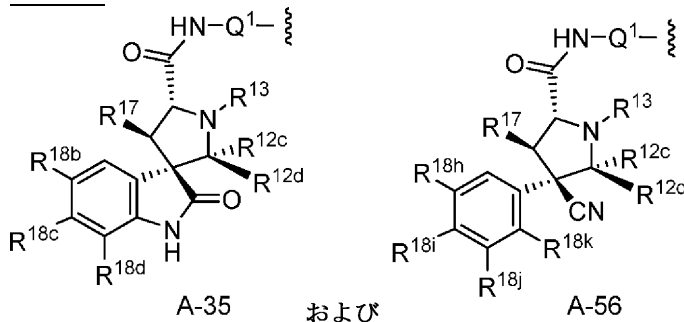
$L^2$  はアルキレニルおよびヘテロアルキレニルからなる群より選択されるか；または

$L^2$  は存在しない、

本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1043]

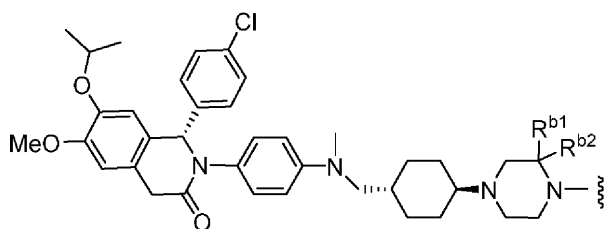
$A^1$  が



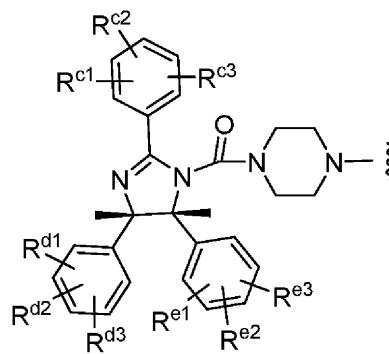
からなる群より選択される、本発明1042の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1044]

$A^1$  が



A-99

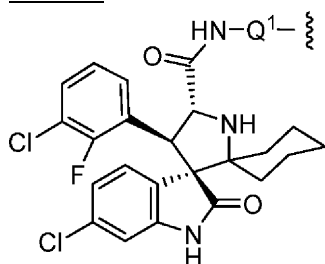


A-101

からなる群より選択される、本発明1042の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1045]

A<sup>1</sup>が



A-100

である、本発明1043の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1046]

L<sup>2</sup>がC<sub>1</sub>~<sub>12</sub>アルキレニルである、本発明1001~1045のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1047]

L<sup>2</sup>が-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>-、および-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>CH<sub>2</sub>-からなる群より選択される、本発明1046の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1048]

L<sup>2</sup>が-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、および-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-からなる群より選択される、本発明1047の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1049]

L<sup>2</sup>が3~12員ヘテロアルキレニルである、本発明1001~1045のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1050]

L<sup>2</sup>が-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>O-(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-であり；

oが1、2、または3であり；

pが0、1、2、3、4、または5であり；かつ

qが1、2、または3である、本発明1049の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1051]

L<sup>2</sup>が

-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

[ 本 発 明 1052 ]

[ 本 発 明 1053 ]

[ 本 発 明 1054 ]

[ 本 発 明 1055 ]

 $1^2_{-1}$  $L^2_2$ 

[ 本 発 明 1056 ]

[ 本 発 明 1057 ]

L-3

L-4

L-5

L-6

L-7

L-8

L-9

[ 本 発 明 1058 ]

L<sup>2</sup>がL-7またはL-9である、本発明1057の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは

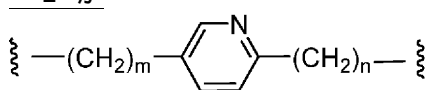
は溶媒和物。

[本発明1059]

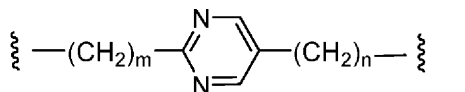
Wが6員ヘテロアリーレニルである、本発明1001～1041、1052、もしくは1053の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1060]

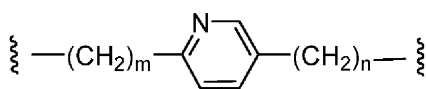
$L^2$ が



L-10

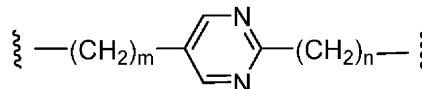


L-11



L-12

および



L-13

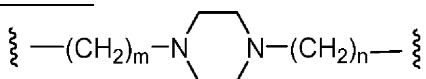
からなる群より選択される6員ヘテロアリーレニルである、本発明1059の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1061]

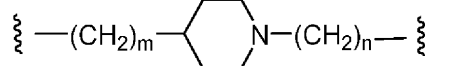
Wがヘテロシクレニルである、本発明1001～1041、1052、もしくは1053の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1062]

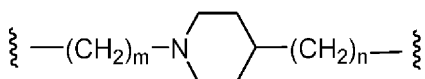
$L^2$ が



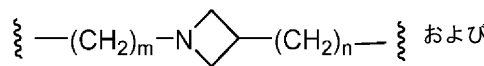
L<sup>2</sup>-14



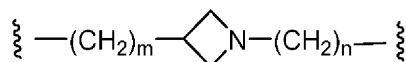
L<sup>2</sup>-15



L<sup>2</sup>-16



L<sup>2</sup>-17



L<sup>2</sup>-18

からなる群より選択される、本発明1061の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1063]

$L^2$ がL<sup>2</sup>-16またはL<sup>2</sup>-17である、本発明1062の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1064]

mが0であり、かつnが0または1である、本発明1063の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1065]

mが1、2、または3であり、かつnが0または1である、本発明1063の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1066]

Y<sup>1</sup>が-C C-、-CH=CH-CH<sub>2</sub>-、-O-、および-N(H)-からなる群より選択されるかまたはY<sup>1</sup>が

存在しない、本発明1001～1041もしくは1046～1065のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1067]

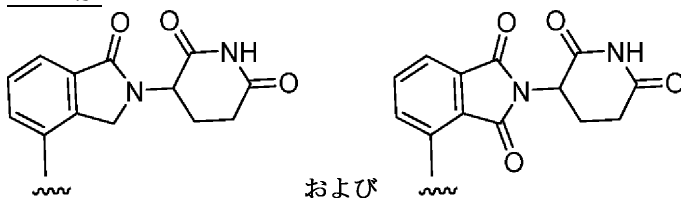
$Y^1$ が-C C-、-CH<sub>2</sub>-、および-N(H)-からなる群より選択される、本発明1066の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1068]

$Y^1$ が-C C-である、本発明1067の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1069]

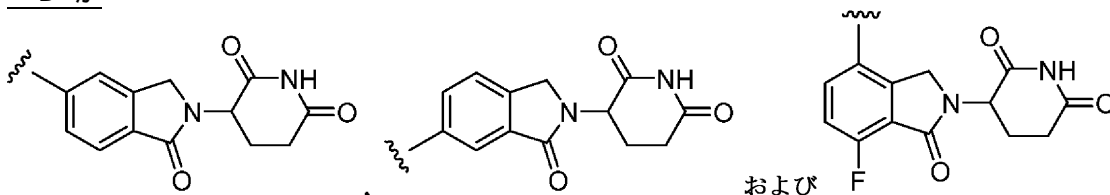
$B^1$ が



からなる群より選択される、本発明1001～1068のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1070]

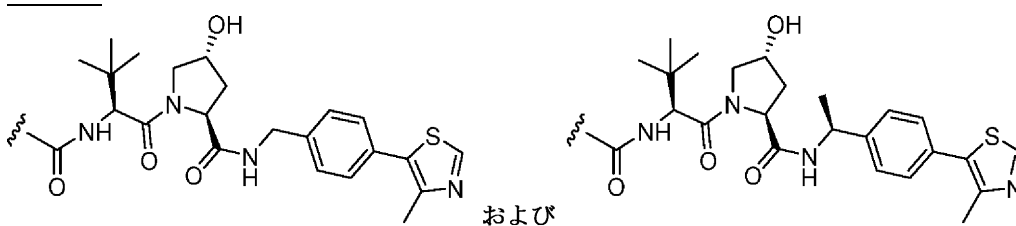
$B^1$ が



からなる群より選択される、本発明1001～1041もしくは1046～1068のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1071]

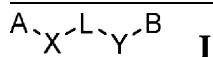
$B^1$ が



からなる群より選択される、本発明1001～1041もしくは1046～1068のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1072]

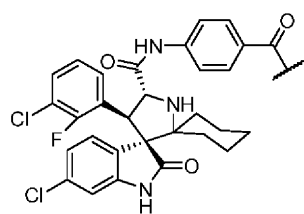
式Iを有する化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物：



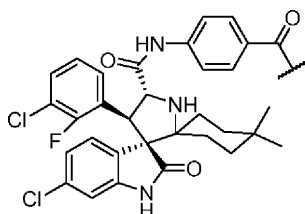
式中

Aは

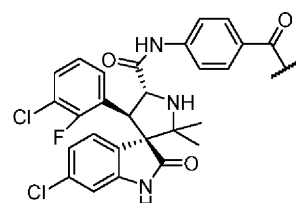




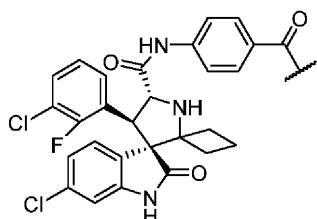
A-1



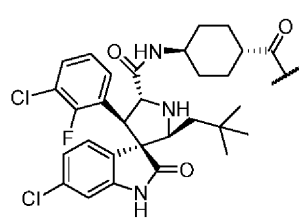
A-2



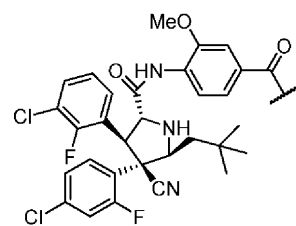
A-3



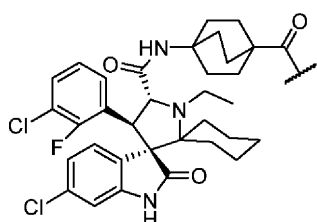
A-4



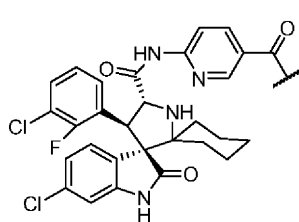
A-5



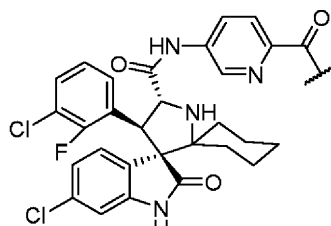
A-6



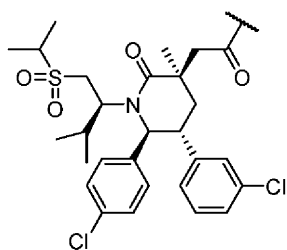
A-7



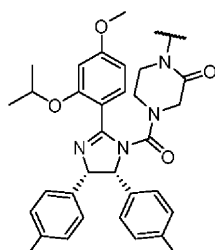
A-8



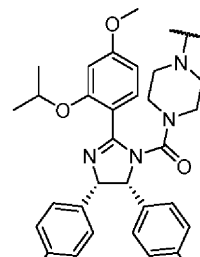
A-9



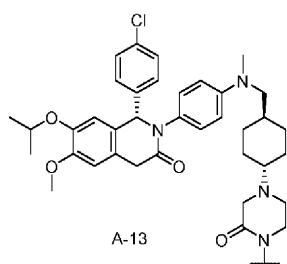
A-10



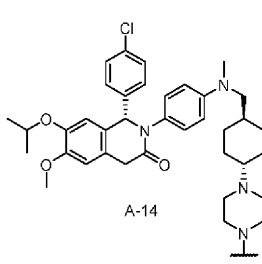
A-11



A-12

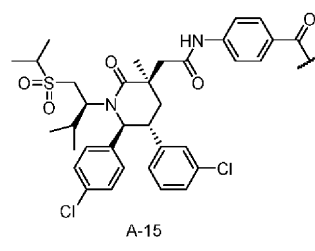


A-13



A-14

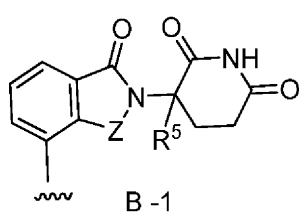
および



A-15

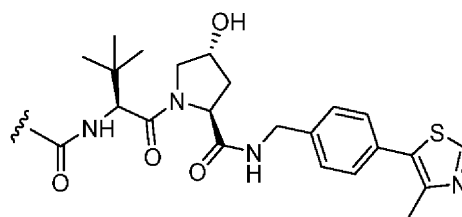
からなる群より選択され；

Bは



B-1

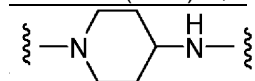
および



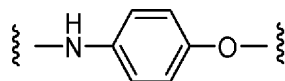
B-2

からなる群より選択され；

Xは  $-N(R^{2a})-$ 、



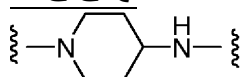
、および



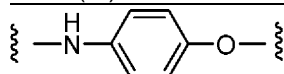
からなる群より選択されるか；または

Xは存在せず；

ここで



の-N(H)-はLに結合し、かつ



の-O-はLに結合し；

Lはアルキレニル、ヘテロアルキレニル、および $-(CH_2)_m-W-(CH_2)_n-$ からなる群より選択され；

Wは置換されていてもよいフェニレニル、置換されていてもよい5員ヘテロアリーレニル、および置換されていてもよい6員ヘテロアリーレニルからなる群より選択され；

mは0、1、2、3、4、5、6、または7であり；

nは0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Yは $-C$   $C-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^{2b})-$ 、 $-C(=O)N(R^{2c})-$ 、 $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ 、および $-N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$ からなる群より選択されるか；または

Yは存在せず；

ここで $-N(R^{2d})C(=O)CH_2O-$ および $-N(R^{2e})C(=O)CH_2N(R^{2f})-$ のカルボキサミド窒素原子ならびに $-C(=O)N(R^{2c})-$ の炭素原子はLに結合し；

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{2c}$ 、 $R^{2d}$ 、 $R^{2e}$ 、および $R^{2f}$ はそれぞれ独立して水素および $C_1 \sim 4$ アルキルからなる群より選択され；

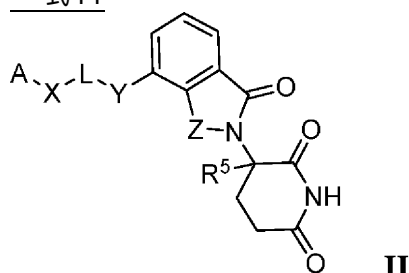
Zは $-CH_2-$ および $-C(=O)-$ からなる群より選択され；かつ

$R^5$ は水素およびフルオロからなる群より選択されるが、

但し、BがB-2である場合にはYは存在しない。

[本発明1073]

式II



II

を有する、本発明1072の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1074]

$R^5$ が水素である、本発明1072もしくは1073の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1075]

Zが $-CH_2-$ である、本発明1072～1074のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1076]

Zが $-C(=O)-$ である、本発明1072～1074のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1077]

Yが $-C$   $C-$ 、 $-O-$ 、 $-N(H)-$ 、 $-C(=O)N(H)-$ 、 $-N(H)C(=O)CH_2O-$ 、および $-N(H)C(=O)CH_2N(H)-$ からなる群より選択される、本発明1072～1076のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

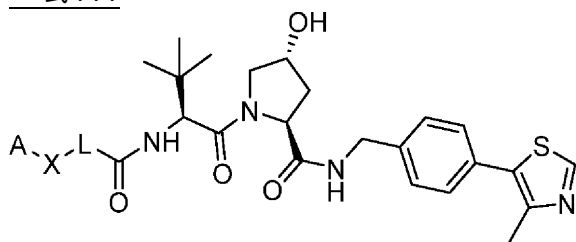
[本発明1078]

Yが存在しない、本発明1072～1076のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される

塩もしくは溶媒和物。

[本発明1079]

式III

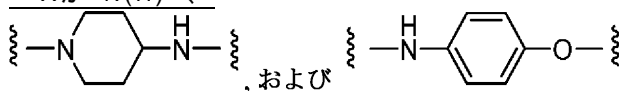


III

を有する、本発明1072の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1080]

Xが-N(H)-、



, および

からなる群より選択される、本発明1072～1079のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1081]

LがC<sub>1</sub>～<sub>12</sub>アルキレニルである、本発明1072～1080のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1082]

Lが-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>-、および-CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>CH<sub>2</sub>-からなる群より選択される、本発明1081の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1083]

Lが3～20員ヘテロアルキレニルである、本発明1072～1080のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1084]

Lが-(CH<sub>2</sub>)<sub>o</sub>O-(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-および-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>O-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-O(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-からなる群より選択され；

oが2または3であり；

pが0、1、2、3、4、5、6、または7であり；

qが2または3であり；

rが2、3、または4であり；

sが3、4、または5であり；かつ

tが2または3である、本発明1083の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1085]

Lが

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>4</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>6</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>6</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、および

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-からなる群より選択される、本発明1084の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

「それが」



1-2

「Lが」



-4

L-5

L-6

L-7

Lが



1-9

[ 本 発 明 1094 ]

AがA-10およびA-15からなる群より選択される、本発明1072～1092のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1095]

AがA-11およびA-12からなる群より選択される、本発明1072～1092のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1096]

AがA-13およびA-14からなる群より選択される、本発明1072～1092のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1097]

表1の化合物のうちの1つまたは複数より選択される、本発明1072の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1098]

表1A、表1B、または表1Cの化合物のうちの1つまたは複数より選択される、本発明1001の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1099]

本発明1001～1098のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物と、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

[本発明1100]

がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症を有する患者を処置する方法であって、該患者に、本発明1001～1098のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の治療有効量を投与する段階を含む、方法。

[本発明1101]

患者ががんを有する、本発明1100の方法。

[本発明1102]

がんが、表9のがんのうち任意の1種または複数種である、本発明1101の方法。

[本発明1103]

がんが、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、混合型白血病、NUT正中線がん、多発性骨髄腫、小細胞肺癌(SCLC)、神経芽細胞腫、パーキットリンパ腫、子宮頸がん、食道がん、卵巣がん、結腸直腸がん、前立腺がん、および乳がんからなる群より選択される、本発明1101の方法。

[本発明1104]

疾患または状態の処置において有用な第2の治療剤の治療有効量を投与する段階をさらに含む、本発明1100～1103のいずれかの方法。

[本発明1105]

がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症の処置における使用のための、本発明1099の薬学的組成物。

[本発明1106]

がんの処置における使用のための、本発明1105の薬学的組成物。

[本発明1107]

がんが、表9のがんのうち任意の1種または複数種である、本発明1106の薬学的組成物。

[本発明1108]

がんが、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、混合型白血病、NUT正中線がん、多発性骨髄腫、小細胞肺癌(SCLC)、神経芽細胞腫、パーキットリンパ腫、子宮頸がん、食道がん、卵巣がん、結腸直腸がん、前立腺がん、および乳がんからなる群より選択される、本発明1106の薬学的組成物。

[本発明1109]

がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症の処置における使用のための、本発明1001～1098のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

[本発明1110]

がんの処置における使用のための、本発明1109の化合物。

[本発明1111]

がんが、表9のがんのうち任意の1種または複数種である、本発明1110の化合物。

[本発明1112]

がんが、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、混合型白血病、NUT正中線がん、多発性骨髄腫、小細胞肺がん(SCLC)、神経芽細胞腫、パーキットリンパ腫、子宮頸がん、食道がん、卵巣がん、結腸直腸がん、前立腺がん、および乳がんからなる群より選択される、本発明1110の化合物。

[本発明1113]

がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症の処置用の医薬の製造のための、本発明1001～1098のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の使用。

[本発明1114]

がんの処置のための、本発明1113の使用。

[本発明1115]

がんが、表9のがんのうち任意の1種または複数種である、本発明1114の使用。

[本発明1116]

がんが、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、混合型白血病、NUT正中線がん、多発性骨髄腫、小細胞肺がん(SCLC)、神経芽細胞腫、パーキットリンパ腫、子宮頸がん、食道がん、卵巣がん、結腸直腸がん、前立腺がん、および乳がんからなる群より選択される、本発明1114の使用。

[本発明1117]

本発明1001～1098のいずれかの化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物と、がん、慢性自己免疫障害、炎症性状態、増殖性障害、敗血症、またはウイルス感染症を有する患者に、該化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を投与するための説明書とを含む、キット。

[本発明1118]

患者ががんを有する、本発明1117のキット。

[本発明1119]

がんが、表9のがんのうち任意の1種または複数種である、本発明1118のキット。

[本発明1120]

がんが、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、混合型白血病、NUT正中線がん、多発性骨髄腫、小細胞肺がん(SCLC)、神経芽細胞腫、パーキットリンパ腫、子宮頸がん、食道がん、卵巣がん、結腸直腸がん、前立腺がん、および乳がんからなる群より選択される、本発明1118のキット。

[本発明1121]

1つまたは複数のさらなる治療剤をさらに含む、本発明1117～1120のいずれかのキット

。

上記の概要および以下の詳細な説明はいずれも例示的および説明的なものに過ぎず、請求項に係る発明の限定ではないと理解されたい。