

【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4年5月26日(2022.5.26)

【国際公開番号】WO2019/160884

【公表番号】特表2021-513562(P2021-513562A)

【公表日】令和3年5月27日(2021.5.27)

【出願番号】特願2020-564814(P2020-564814)

【国際特許分類】

C 0 7 H 1 9 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 H 1 9 / 2 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 1 2 N 1 5 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 H 1 9 / 2 0

C 0 7 H 1 9 / 2 3 Z N A

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 5 / 0 2

A 6 1 P 3 7 / 0 4

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 U

A 6 1 K 4 5 / 0 0

C 1 2 N 1 5 / 1 2

20

【手続補正書】

30

【提出日】令和4年5月18日(2022.5.18)

【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】

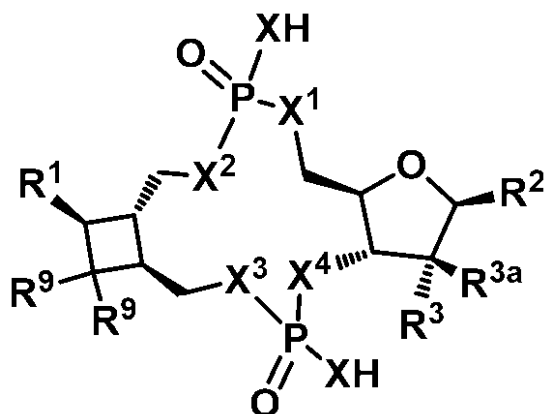
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)

40

【化1】



10

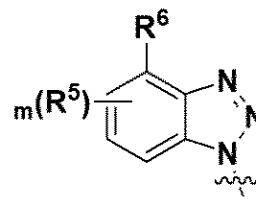
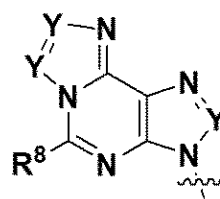
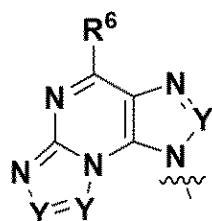
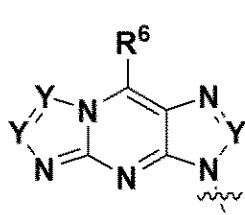
【式中、

Xは、独立して、OまたはSであり；

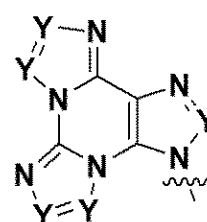
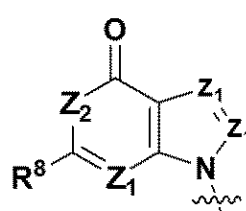
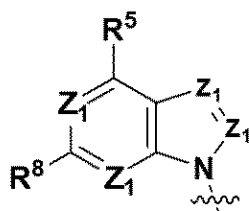
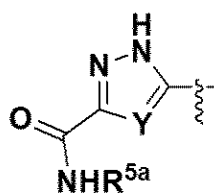
X1、X2、X3およびX4は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R1およびR2は、独立して、

【化2】

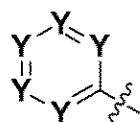


20



30

または

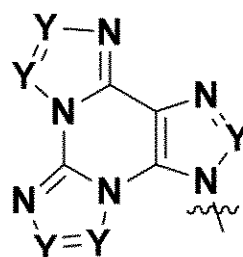
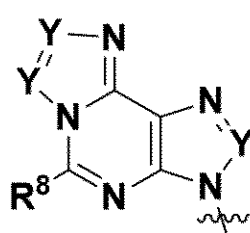
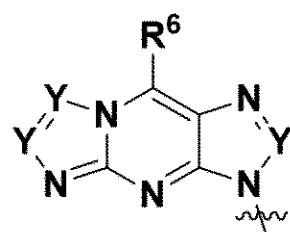


であり；

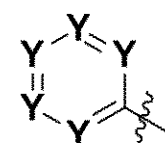
但し、R1およびR2の一方は

40

【化3】



または



50

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

10

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

20

R^{5a}は、HまたはC₁₋₃アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

30

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

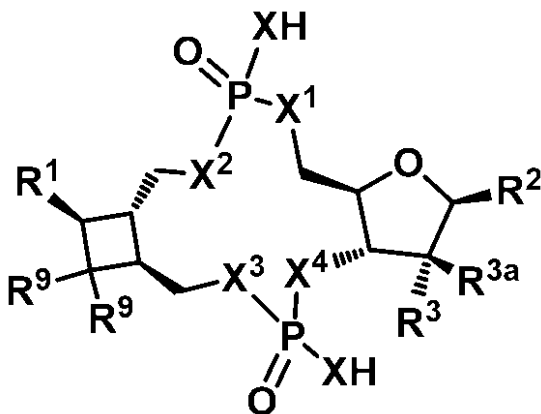
mは、0、1、2または3である]

の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項2】

式

【化4】



40

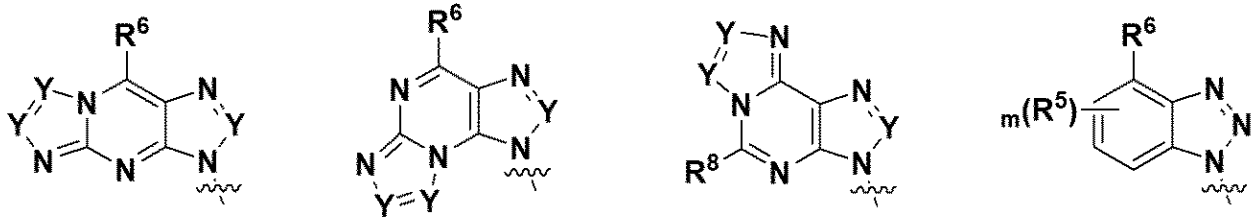
[式中、

Xは、Sであり；

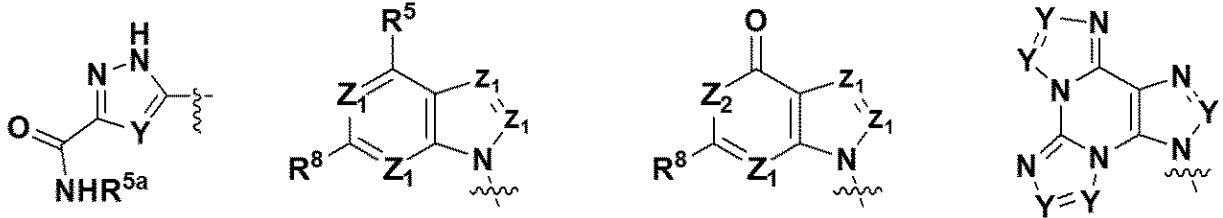
50

X1、X2、X3およびX4は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；
R1およびR2は、独立して、

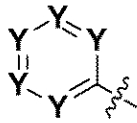
【化5】



10

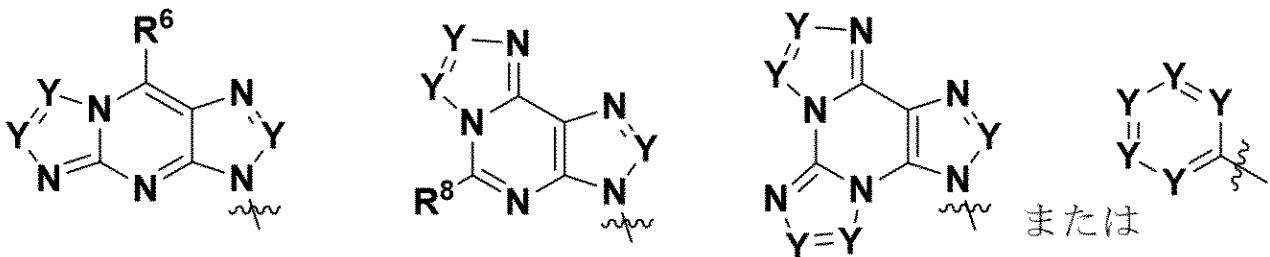


または



20

であり；
但し、R1およびR2の一方は
【化6】



30

でなければならず；

Z1は、NまたはCR^aであり；

Z2は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

50

R³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa₁、SRa₁、-C(O)NRa₁Ra₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa₁、SRa₁、-C(O)NRa₁Ra₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

10

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa₁、SRa₁、-C(O)NRa₁Ra₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CRaまたはNであり；

mは、0、1、2または3である]

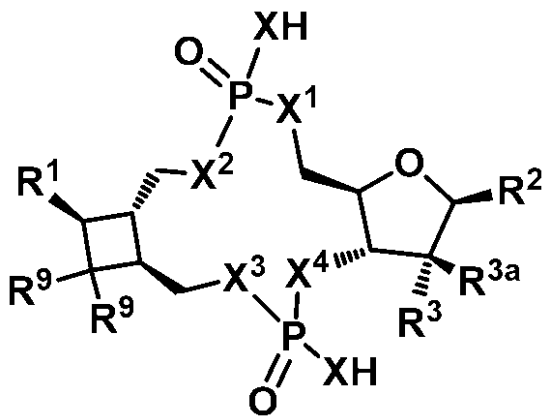
の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項3】

20

式

【化7】



30

[式中、

Xは、Oであり；

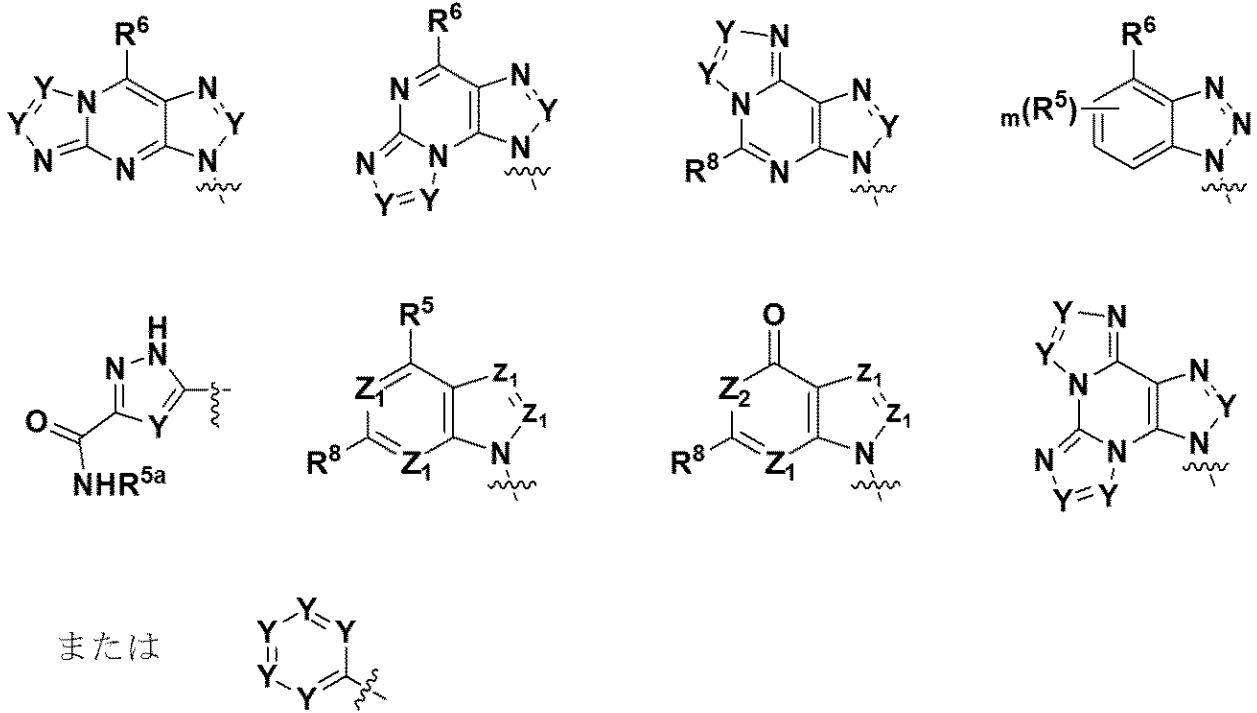
X¹、X²、X³およびX⁴は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R¹およびR²は、独立して、

40

50

【化8】



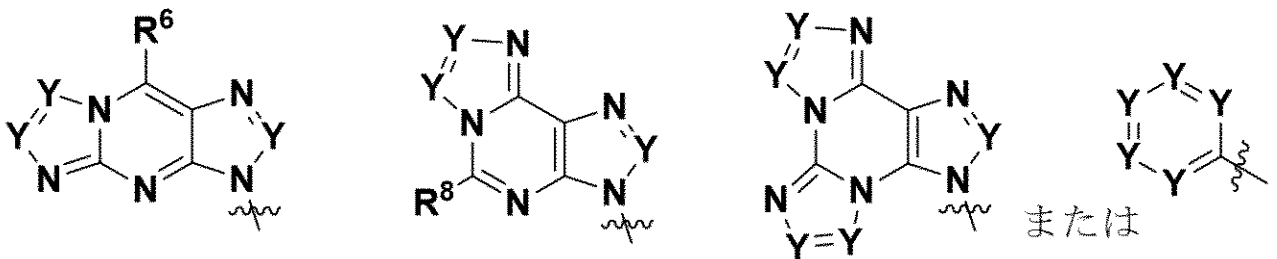
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化9】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa¹、SRA¹、-C(O)NRa¹Ra¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa¹、SRA¹、-C(O)NRa¹Ra¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CRAまたはNであり；

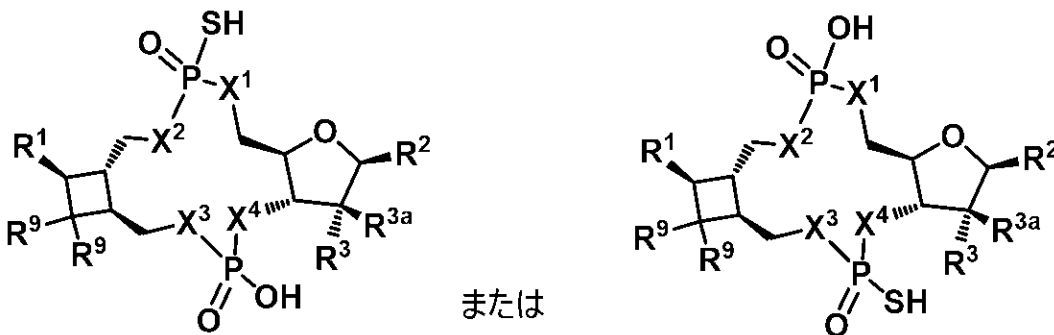
mは、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項4】

式

【化10】



[式中、

X¹、X²、X³およびX⁴は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R¹およびR²は、それぞれ独立して、

10

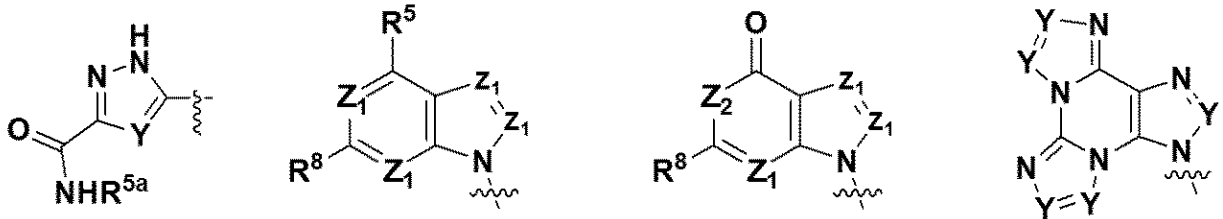
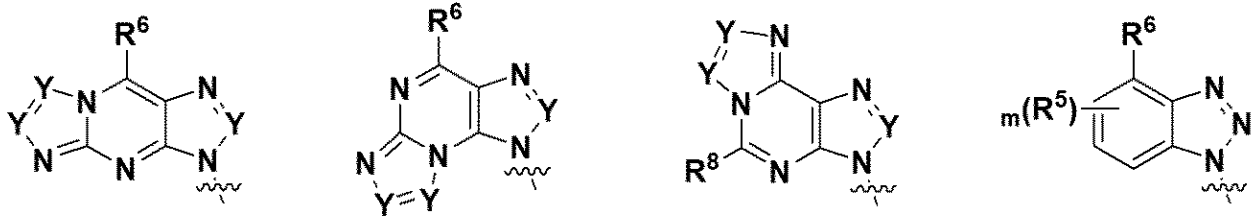
20

30

40

50

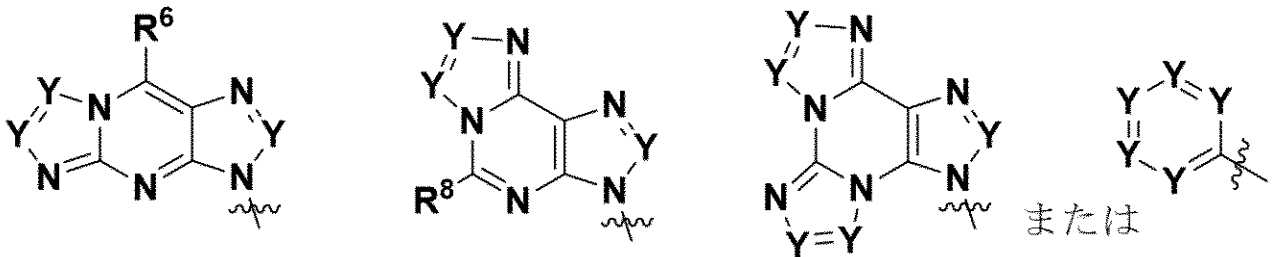
【化 1 1】



であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 1 2】



でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

10

20

30

40

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-3} アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CRA またはNであり；

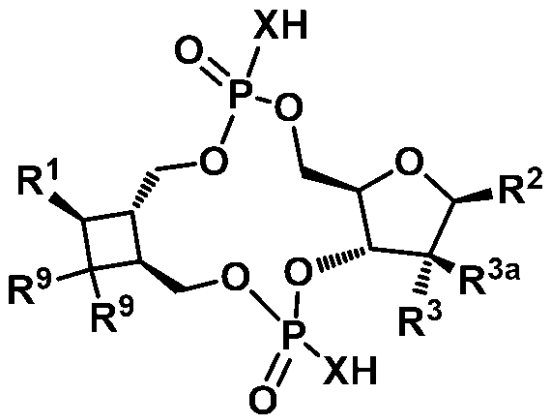
mは、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項5】

式

【化13】



[式中、

Xは、独立して、OまたはSであり；

R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、

10

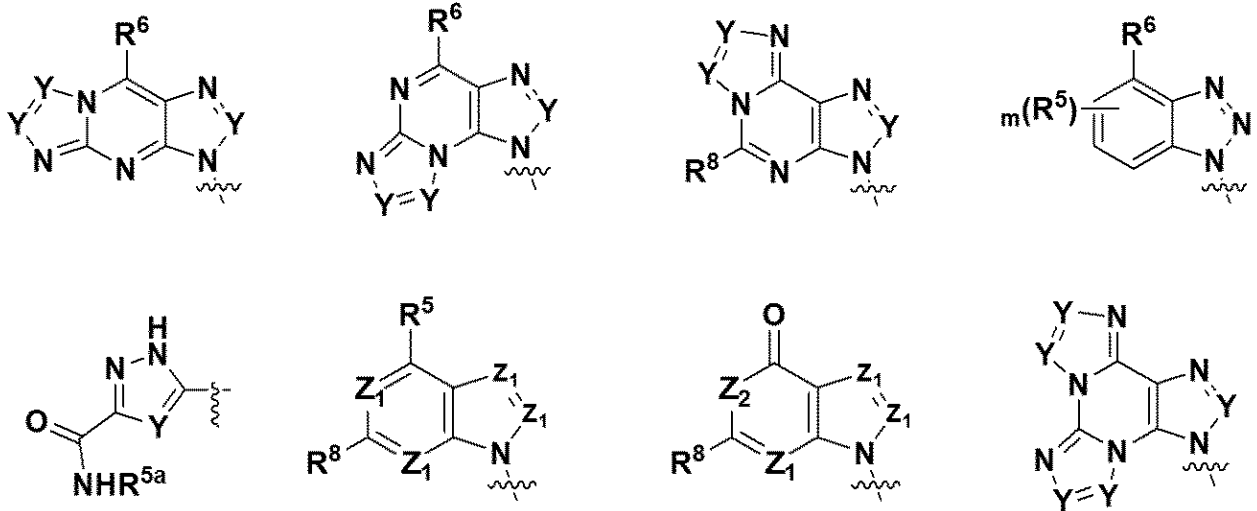
20

30

40

50

【化14】



10

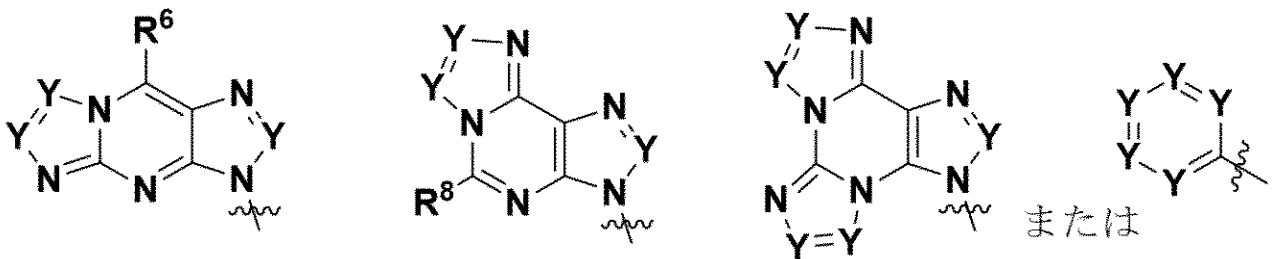


20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化15】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-3} アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CR^a またはNであり；

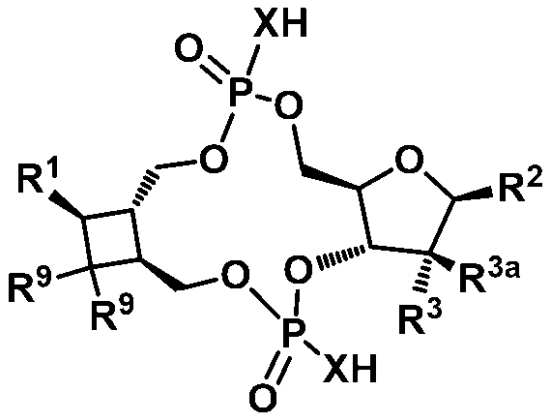
mは、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項6】

式

【化16】



[式中、

Xは、Sであり；

R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、

10

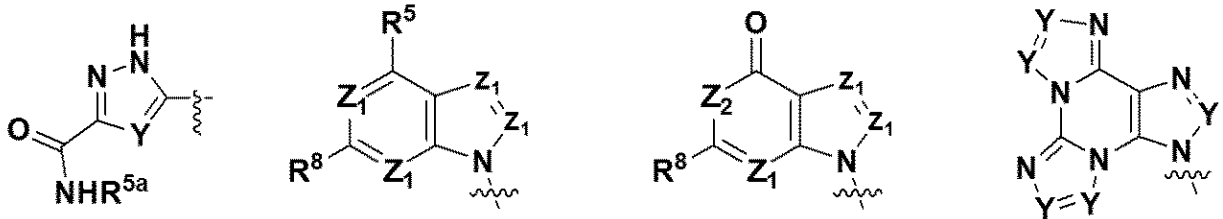
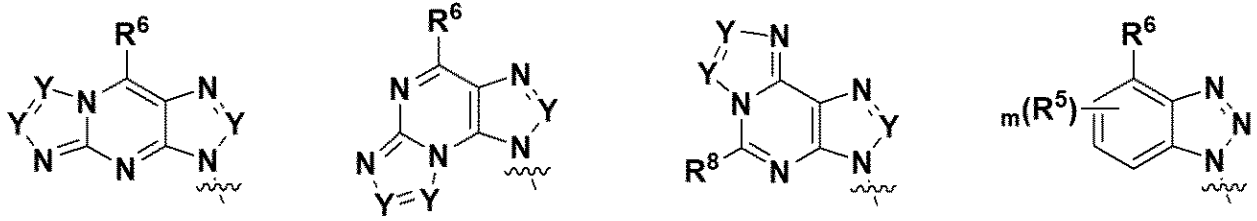
20

30

40

50

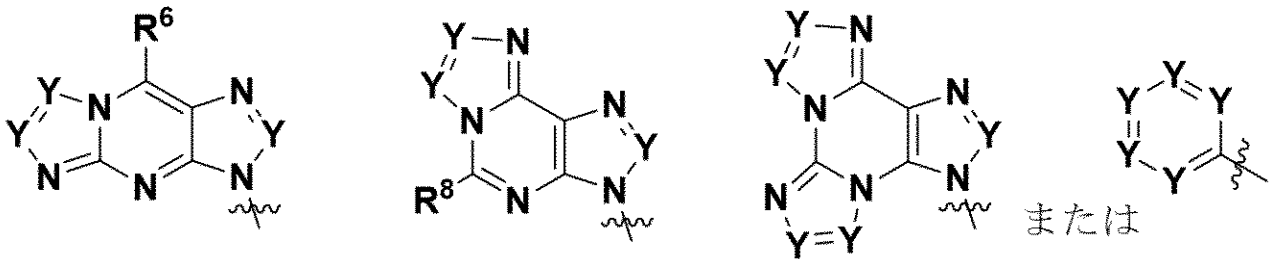
【化 17】



であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 18】



でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

10

20

30

40

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-3} アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CR^a またはNであり；

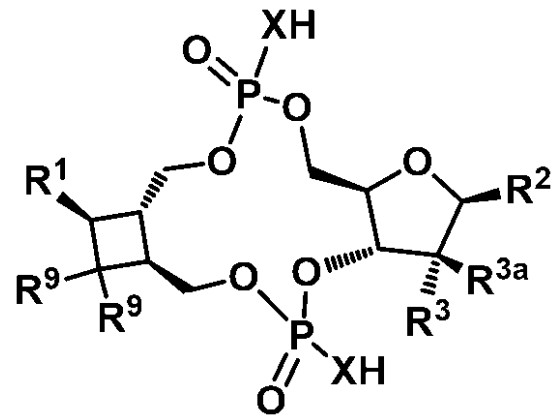
mは、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項7】

式

【化19】



[式中、

Xは、Oであり；

R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、

10

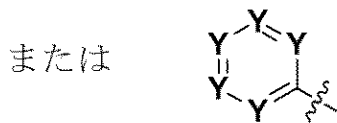
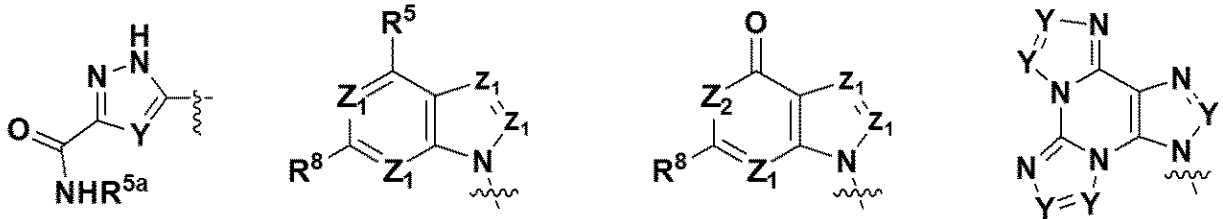
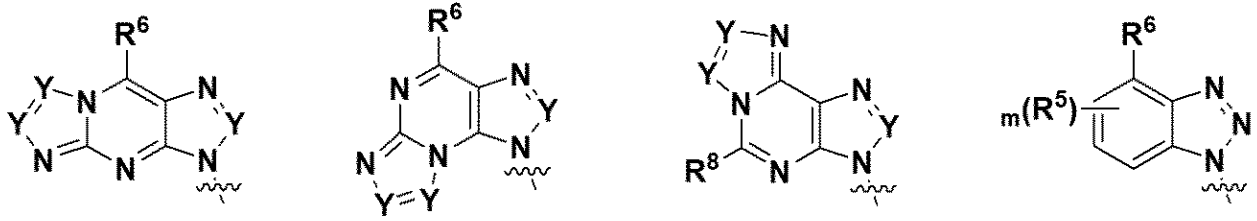
20

30

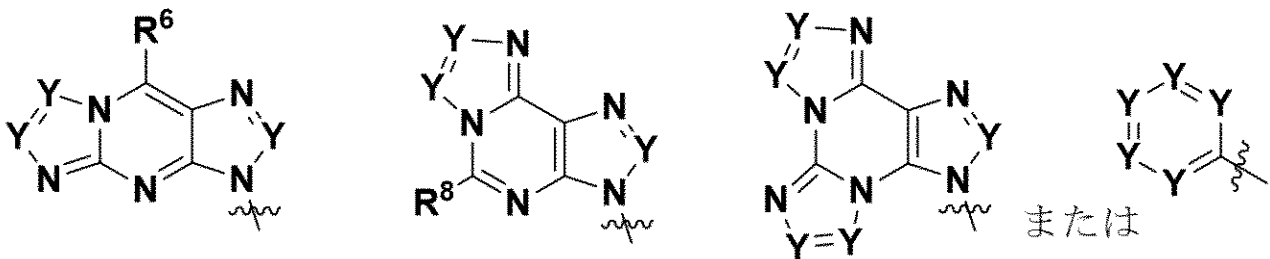
40

50

【化20】



であり；
但し、R¹およびR²の一方は
【化21】



でなければならず；
Z₁は、NまたはCR^aであり；
Z₂は、NR^bであり；
R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；
R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；
R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；
R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；
R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または
R³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または
R³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；
R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

10

20

30

40

50

a¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa¹、SRa¹、-C(O)NRa¹Ra¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa¹、SRa¹、-C(O)NRa¹Ra¹、-COORa¹、-OC(O)Ra¹、-OC(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹Ra¹、-NRa¹C(O)Ra¹、-NRa¹COORa¹、-NRa¹C(O)NRa¹Ra¹、-NRa¹S(O)₂Ra¹、-NRa¹S(O)₂NRa¹Ra¹、-S(O)Ra¹、-S(O)NRa¹Ra¹、-S(O)₂Ra¹またはS(O)₂NRa¹Ra¹であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

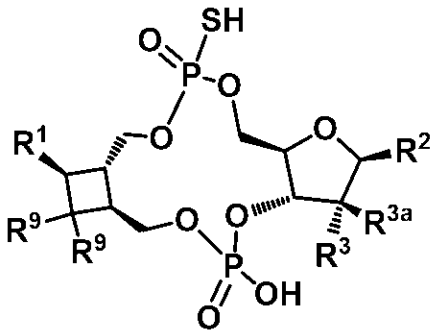
mは、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

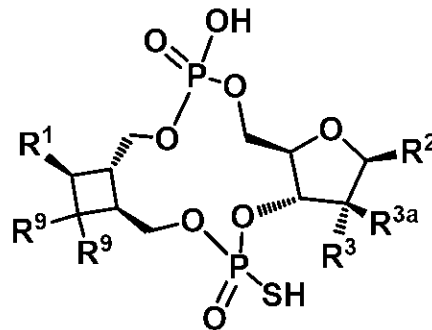
【請求項8】

式

【化22】



または



[式中、

R¹およびR²は、それぞれ独立して、

10

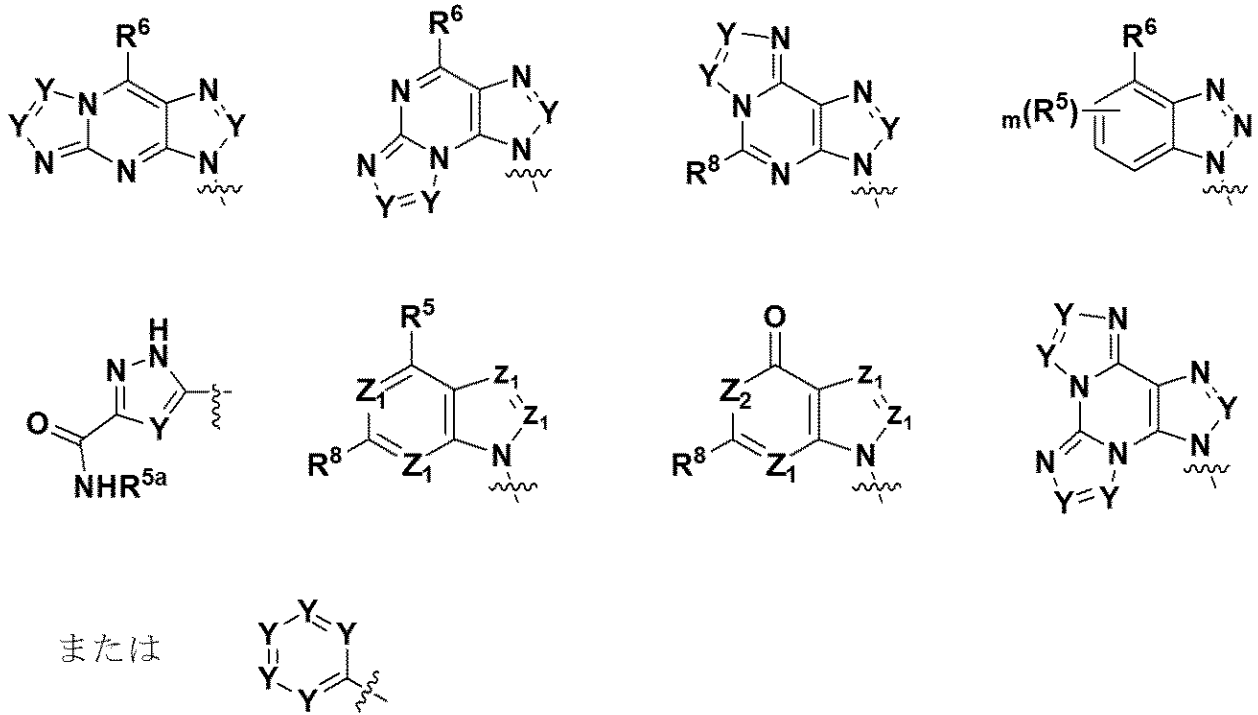
20

30

40

50

【化 2 3】



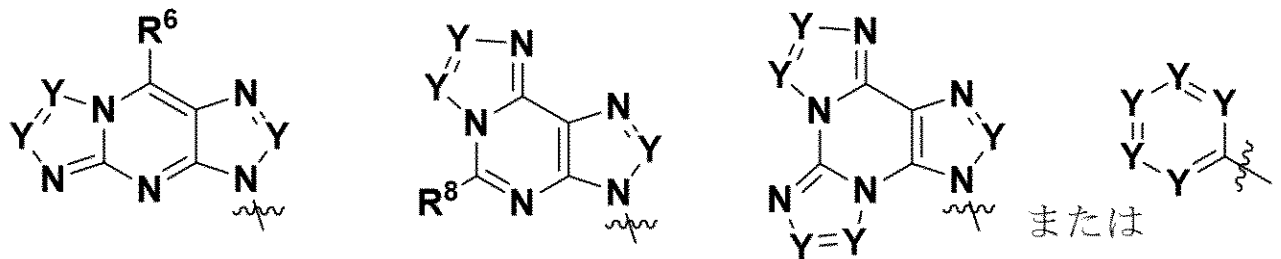
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 2 4】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁-6アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃-6シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁-6アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃-6シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁-3アルキルまたはC₃-6シクロアルキルであり；R³は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{3a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR³およびR^{3a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR³およびR^{3a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a^1 、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-3} アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 OR^{a1} 、 SR^{a1} 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 OR^{a1} 、 SR^{a1} 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{COOR}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{NR}^{a1}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{a1}$ または $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{a1}\text{R}^{a1}$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Y は、 CR^a またはNであり；

m は、0、1、2または3である]

の請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項9】

式

10

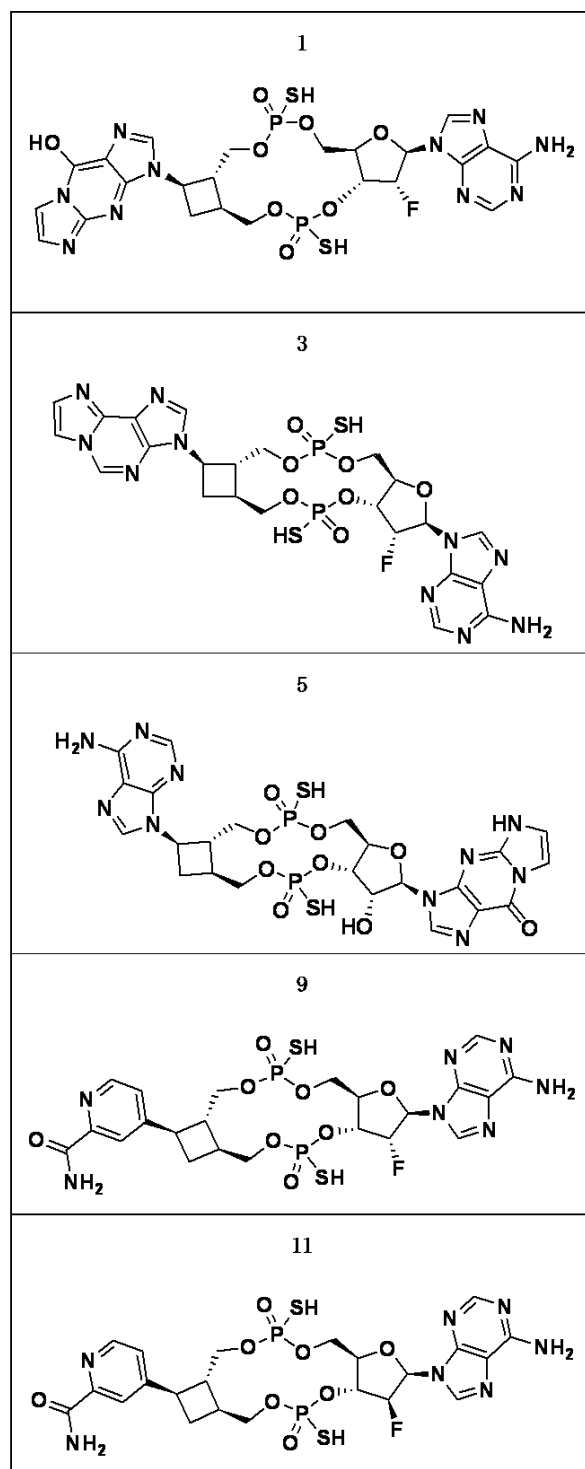
20

30

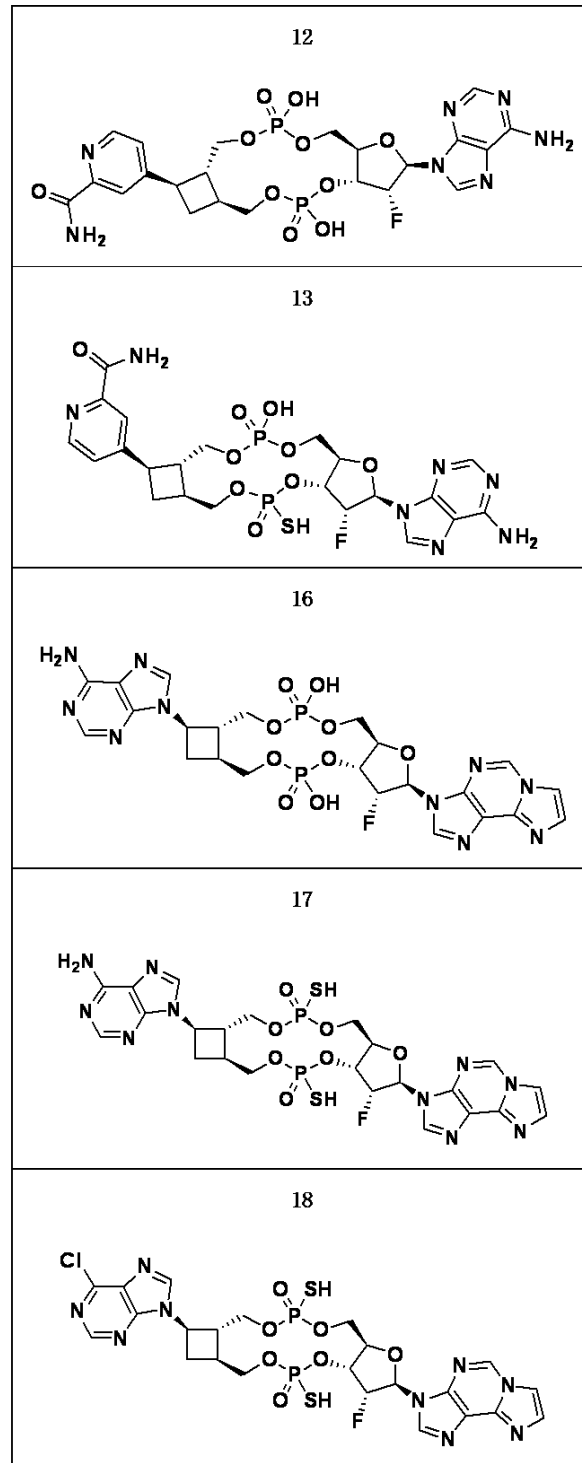
40

50

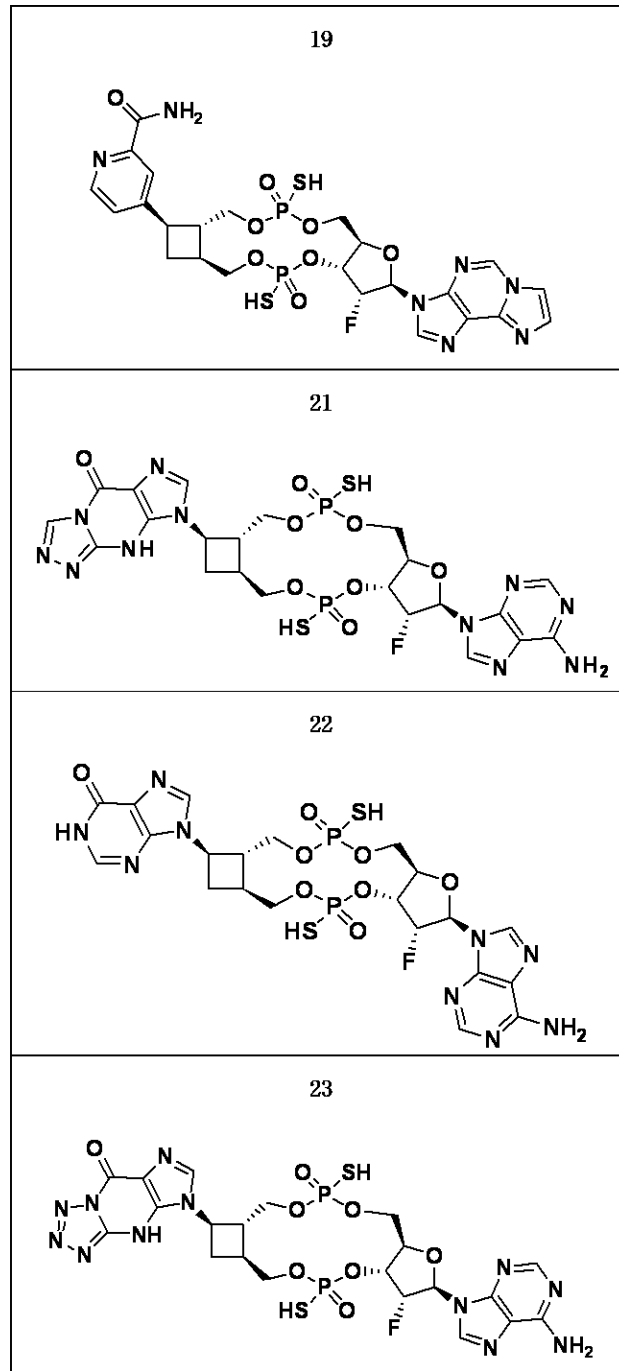
【表 1】



【表 2】



【表 3】

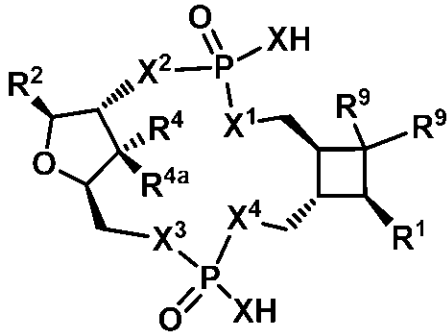


で示される請求項1の化合物、またはその互変異性体または立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項10】

式(II)

【化 2 5】



10

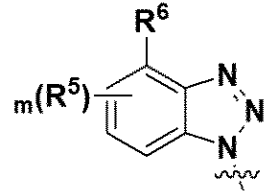
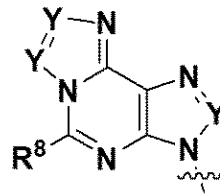
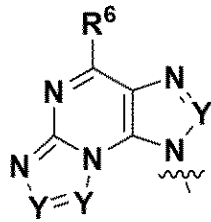
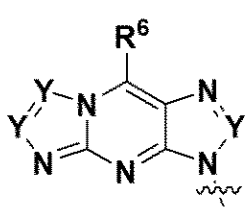
[式中、

Xは、独立して、OまたはSであり；

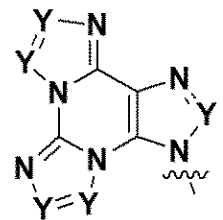
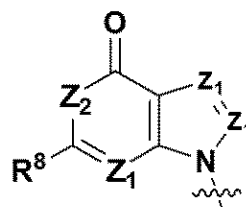
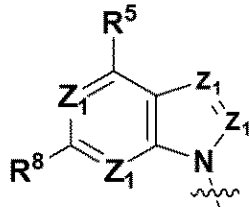
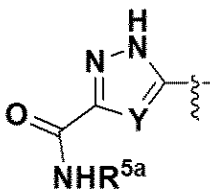
X1、X2、X3およびX4は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R1およびR2は、それぞれ独立して、

【化 2 6】

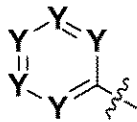


20



30

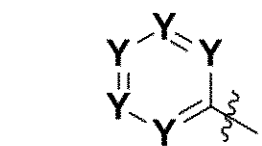
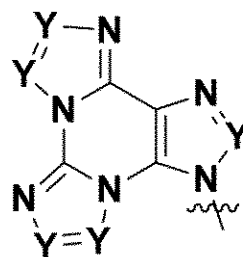
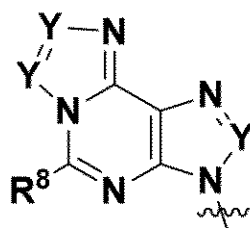
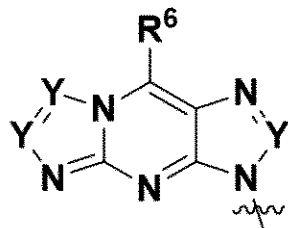
または



であり；

但し、R1およびR2の一方は

【化 2 7】



または

40

でなければならず；

Z1は、NまたはCR^aであり；

50

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁-6アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃-6シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁-6アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃-6シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁-3アルキルまたはC₃-6シクロアルキルであり；

10

R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

20

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

mは、0、1、2または3である]

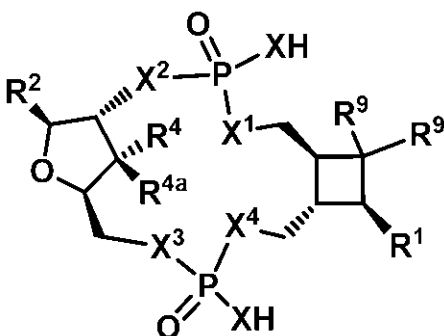
30

の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項11】

式

【化28】



40

[式中、

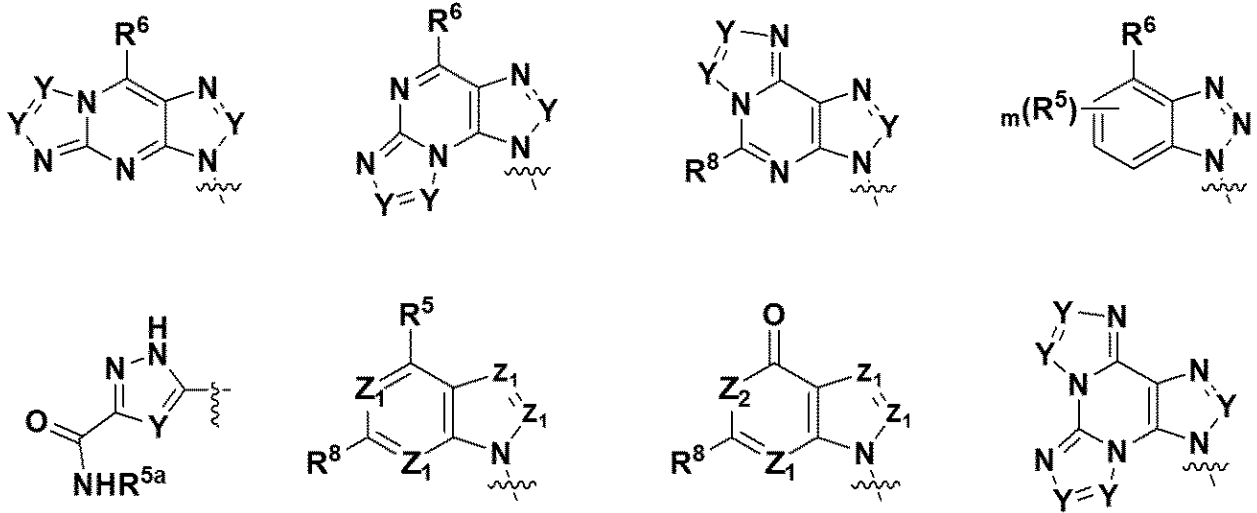
Xは、Sであり；

X₁、X₂、X₃およびX₄は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R₁およびR₂は、それぞれ独立して、

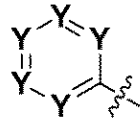
50

【化 2 9】



10

または

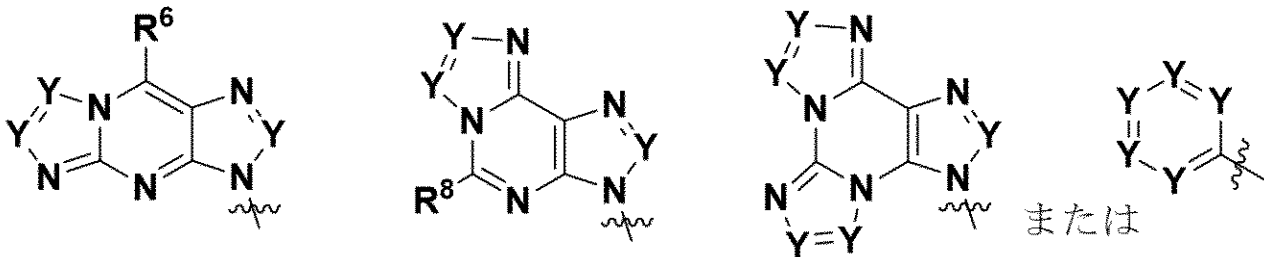


20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 3 0】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa₁、SRa₁、-C(O)NRa₁Ra₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa₁、SRa₁、-C(O)NRa₁Ra₁、-COORa₁、-OC(O)Ra₁、-OC(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁Ra₁、-NRa₁C(O)Ra₁、-NRa₁COORa₁、-NRa₁C(O)NRa₁Ra₁、-NRa₁S(O)₂Ra₁、-NRa₁S(O)₂NRa₁Ra₁、-S(O)Ra₁、-S(O)NRa₁Ra₁、-S(O)₂Ra₁またはS(O)₂NRa₁Ra₁であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

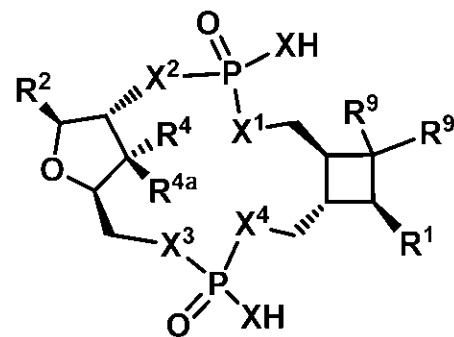
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項12】

式

【化31】



[式中、

Xは、Oであり；

X₁、X₂、X₃およびX₄は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R₁およびR₂は、それぞれ独立して、

10

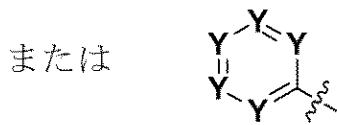
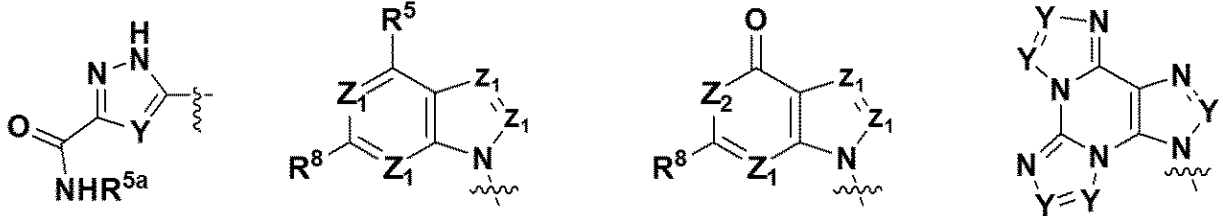
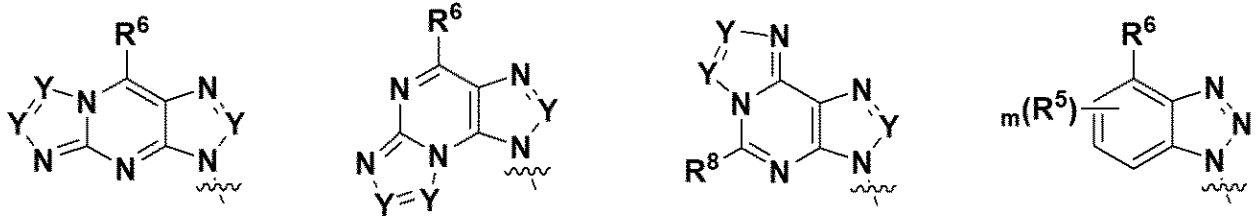
20

30

40

50

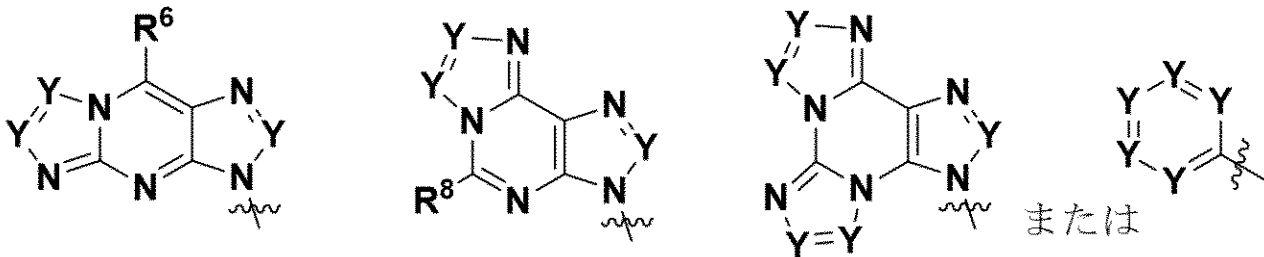
【化 3 2】



であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 3 3】



でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

10

20

30

40

50

a1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)Nra1Ra1、-Nra1Ra1、-Nra1C(O)Ra1、-Nra1COORa1、-Nra1C(O)Nra1Ra1、-Nra1S(O)₂Ra1、-Nra1S(O)₂Nra1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)Nra1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂Nra1Ra1であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa1、SRa1、-C(O)Nra1Ra1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)Nra1Ra1、-Nra1Ra1、-Nra1C(O)Ra1、-Nra1COORa1、-Nra1C(O)Nra1Ra1、-Nra1S(O)₂Ra1、-Nra1S(O)₂Nra1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)Nra1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂Nra1Ra1であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa1、SRa1、-C(O)Nra1Ra1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)Nra1Ra1、-Nra1Ra1、-Nra1C(O)Ra1、-Nra1COORa1、-Nra1C(O)Nra1Ra1、-Nra1S(O)₂Ra1、-Nra1S(O)₂Nra1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)Nra1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂Nra1Ra1であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

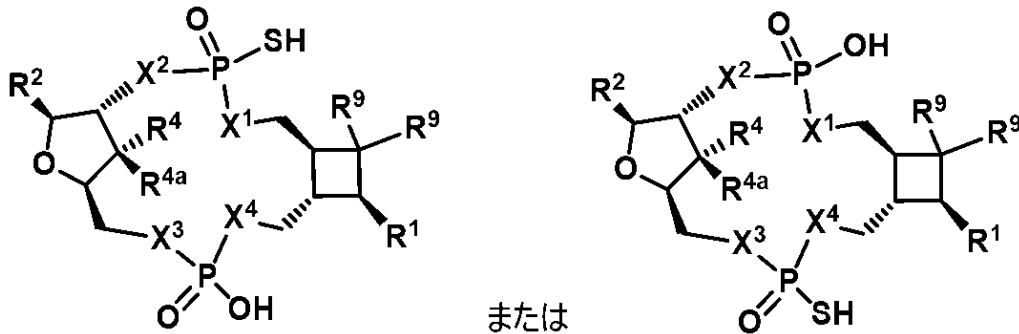
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項13】

式

【化34】



[式中、

X¹、X²、X³およびX⁴は、それぞれ独立して、OまたはNHであり；

R¹およびR²は、それぞれ独立して、

10

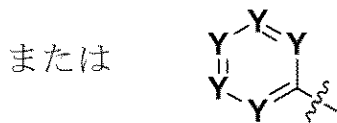
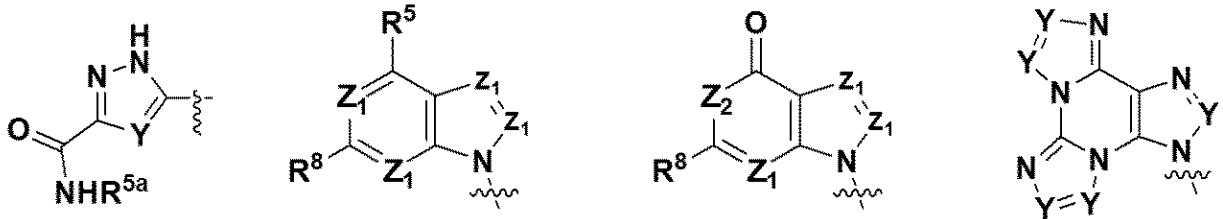
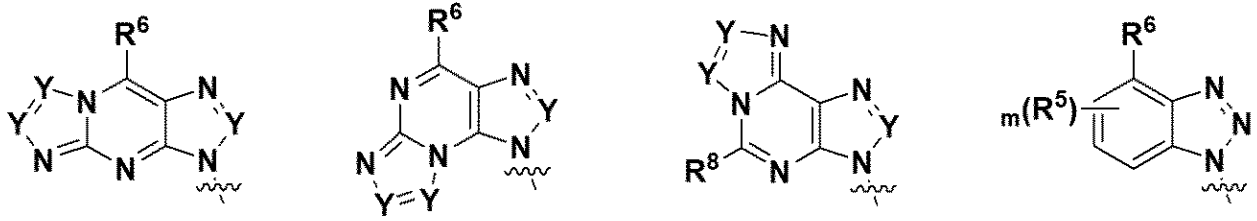
20

30

40

50

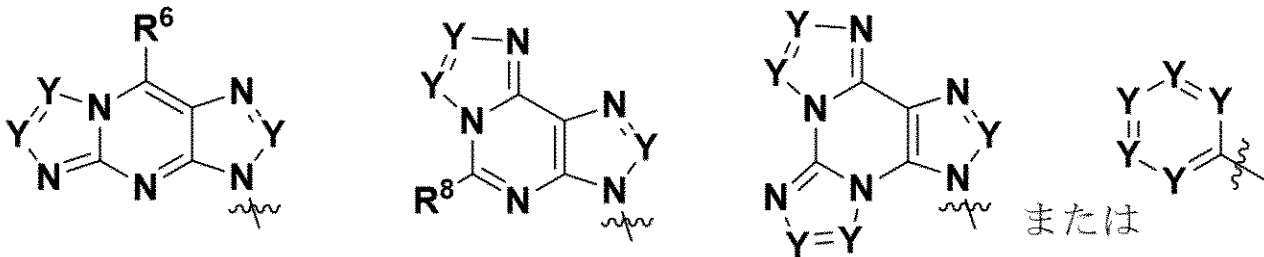
【化 3 5】



であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 3 6】



でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；

R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；または

R⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

10

20

30

40

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_1 -3アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CRa またはNであり；

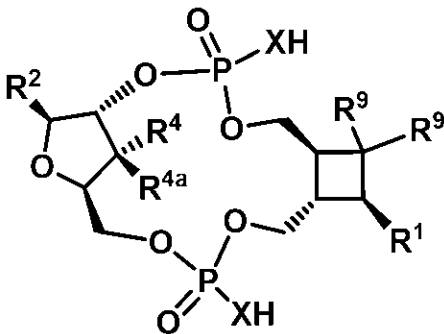
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項14】

式

【化37】



[式中、

Xは、独立して、OまたはSであり；

R1およびR2は、それぞれ独立して、

10

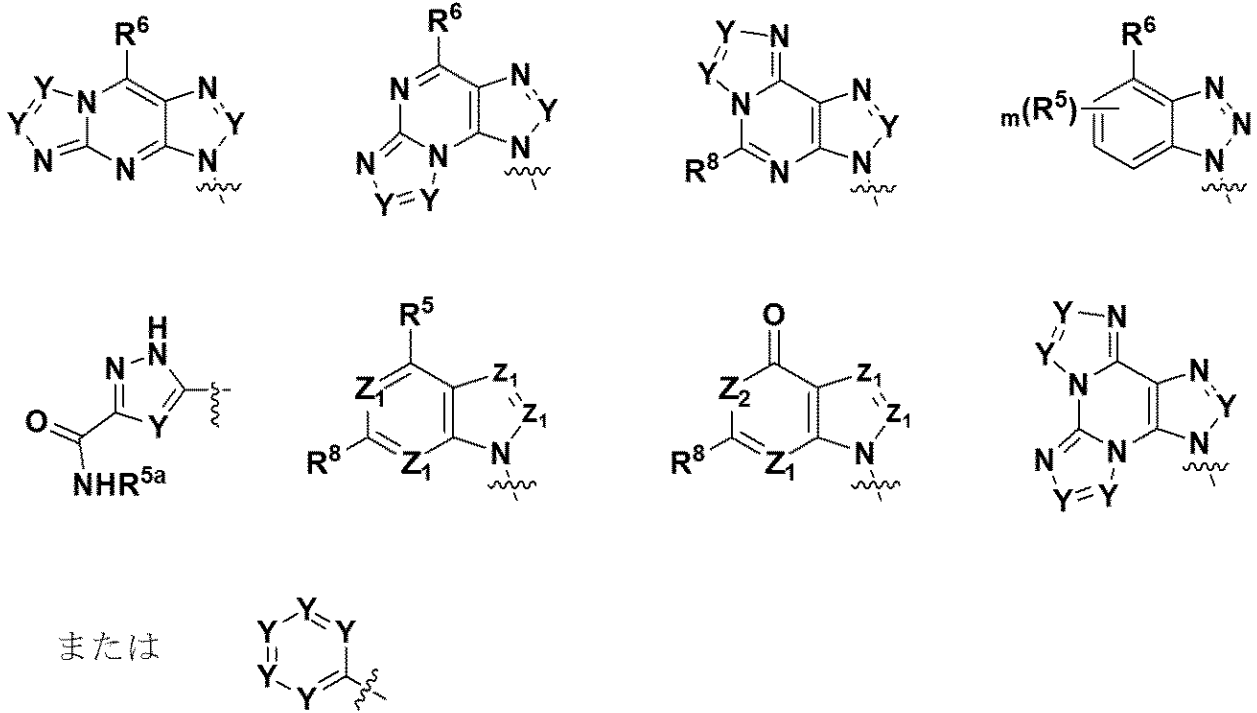
20

30

40

50

【化 3 8】



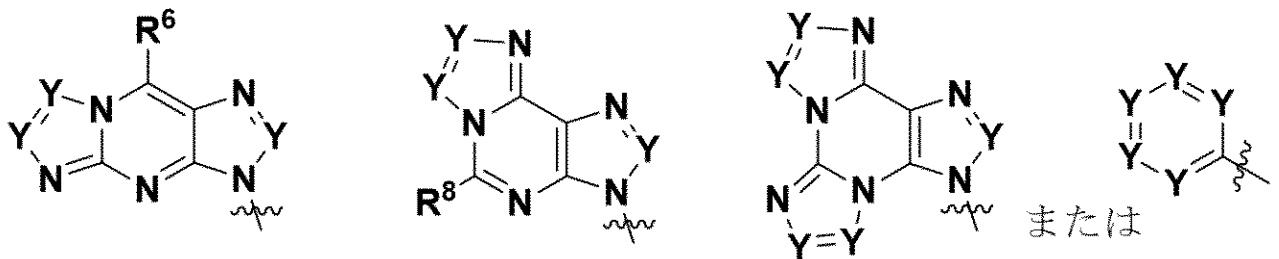
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 3 9】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_1 -3アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CR^a またはNであり；

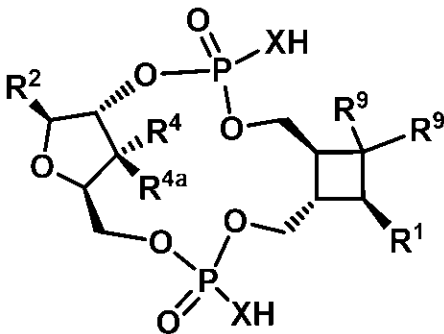
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項15】

式

【化40】



[式中、

Xは、Sであり；

R¹およびR²は、それぞれ独立して、

10

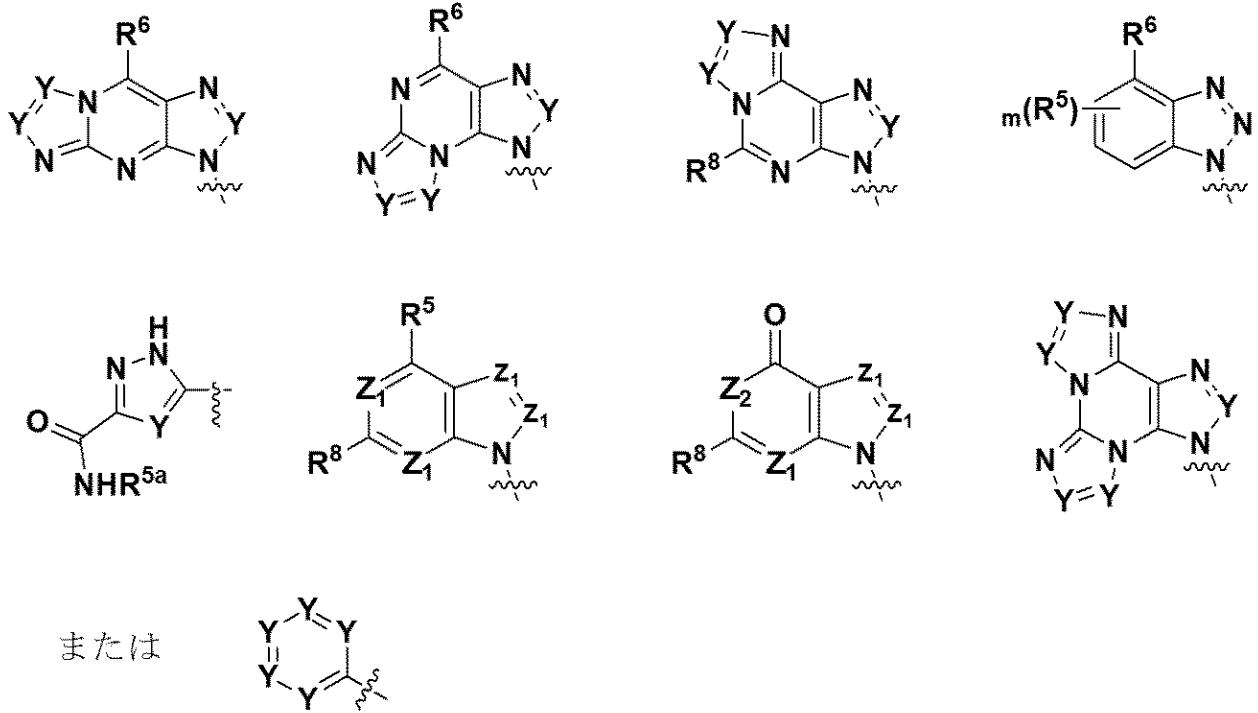
20

30

40

50

【化 4 1】



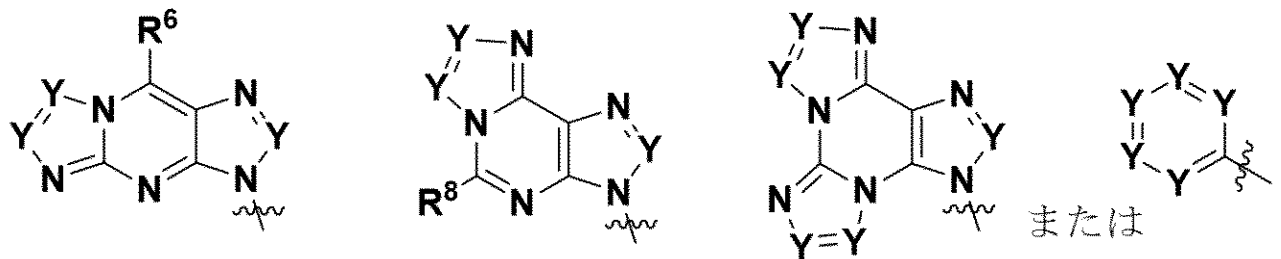
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 4 2】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)NRa1Ra1、-NRa1Ra1、-NRa1C(O)Ra1、-NRa1COORa1、-NRa1C(O)NRa1Ra1、-NRa1S(O)₂Ra1、-NRa1S(O)₂NRa1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)NRa1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂NRa1Ra1であり；

R^{5a}は、HまたはC₁-3アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa1、SRa1、-C(O)NRa1Ra1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)NRa1Ra1、-NRa1Ra1、-NRa1C(O)Ra1、-NRa1COORa1、-NRa1C(O)NRa1Ra1、-NRa1S(O)₂Ra1、-NRa1S(O)₂NRa1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)NRa1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂NRa1Ra1であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁-3アルキル、CN、NO₂、OH、ORa1、SRa1、-C(O)NRa1Ra1、-COORa1、-OC(O)Ra1、-OC(O)NRa1Ra1、-NRa1Ra1、-NRa1C(O)Ra1、-NRa1COORa1、-NRa1C(O)NRa1Ra1、-NRa1S(O)₂Ra1、-NRa1S(O)₂NRa1Ra1、-S(O)Ra1、-S(O)NRa1Ra1、-S(O)₂Ra1またはS(O)₂NRa1Ra1であり；

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

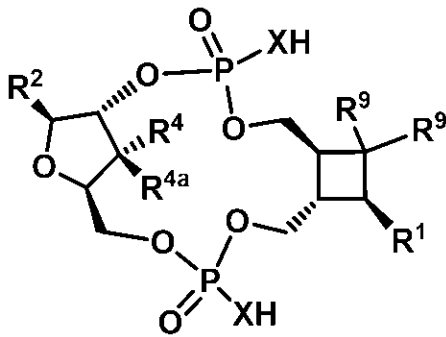
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項16】

式

【化43】



[式中、

Xは、Oであり；

R¹およびR²は、それぞれ独立して、

10

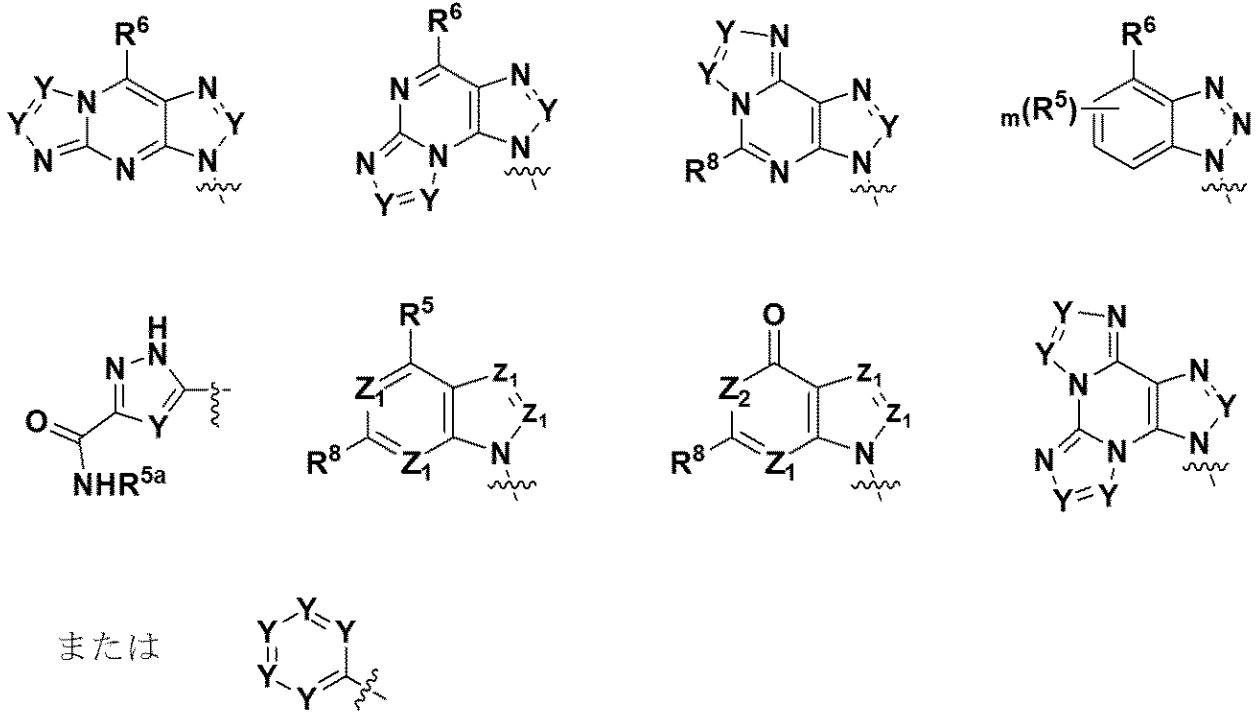
20

30

40

50

【化44】



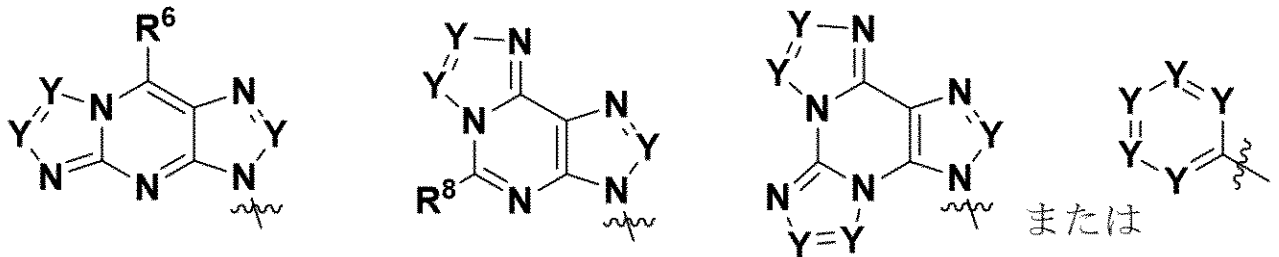
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化45】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_1 -3アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_1 -3アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{C(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{Nra}_1\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Nra}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{Nra}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CRA またはNであり；

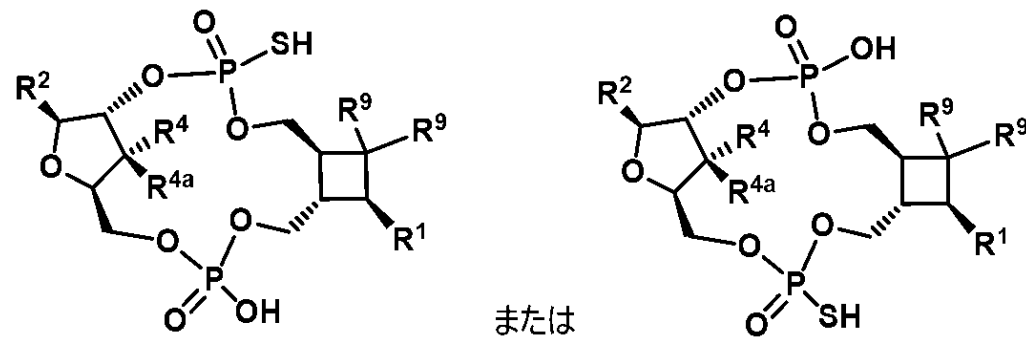
mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項17】

式

【化46】



[式中、
 R^1 および R^2 は、それぞれ独立して、

10

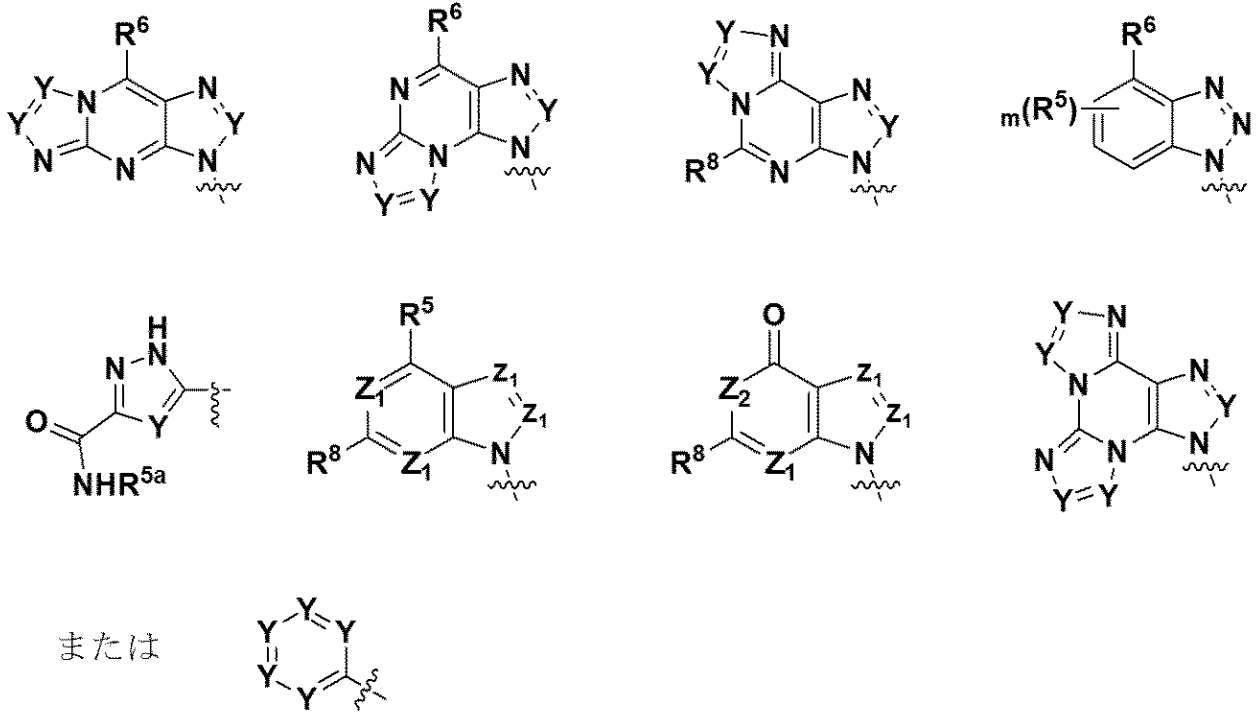
20

30

40

50

【化 4 7】



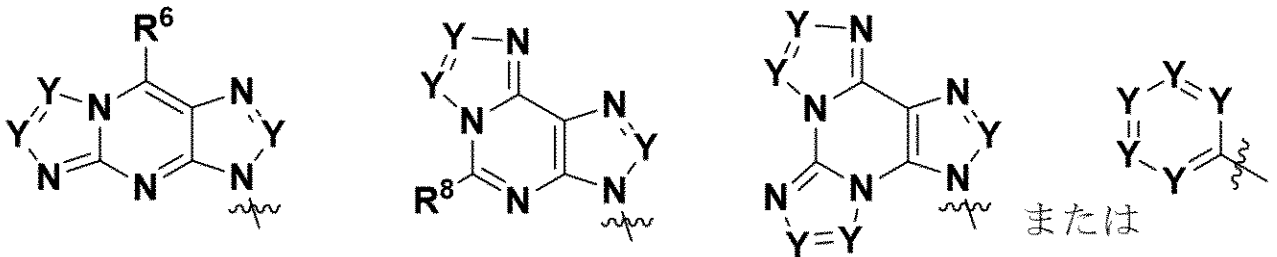
10

20

であり；

但し、R¹およびR²の一方は

【化 4 8】



30

でなければならず；

Z₁は、NまたはCR^aであり；Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

40

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；R⁴は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であり；R^{4a}は、H、CH₃、ハロゲン、-NR^{a1}R^{a1}またはOR^{a1}であるか；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になって3～4員の炭素環を形成してもよく；またはR⁴およびR^{4a}は、一体になってC=CH₂置換基を形成してもよく；R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R

50

a_1 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^{5a} は、Hまたは C_{1-3} アルキルであり；

R^6 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^8 は、H、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、CN、 NO_2 、OH、 ORa_1 、 SRa_1 、 $-\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{COORa}_1$ 、 $-\text{OC(O)Ra}_1$ 、 $-\text{OC(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{COORa}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{C(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ 、 $-\text{NRa}_1\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)NRa}_1\text{Ra}_1$ 、 $-\text{S(O)}_2\text{Ra}_1$ または $\text{S(O)}_2\text{NRa}_1\text{Ra}_1$ であり；

R^9 は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、 CRa またはNであり；

mは、0、1、2または3である]

の請求項10に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項18】

式

10

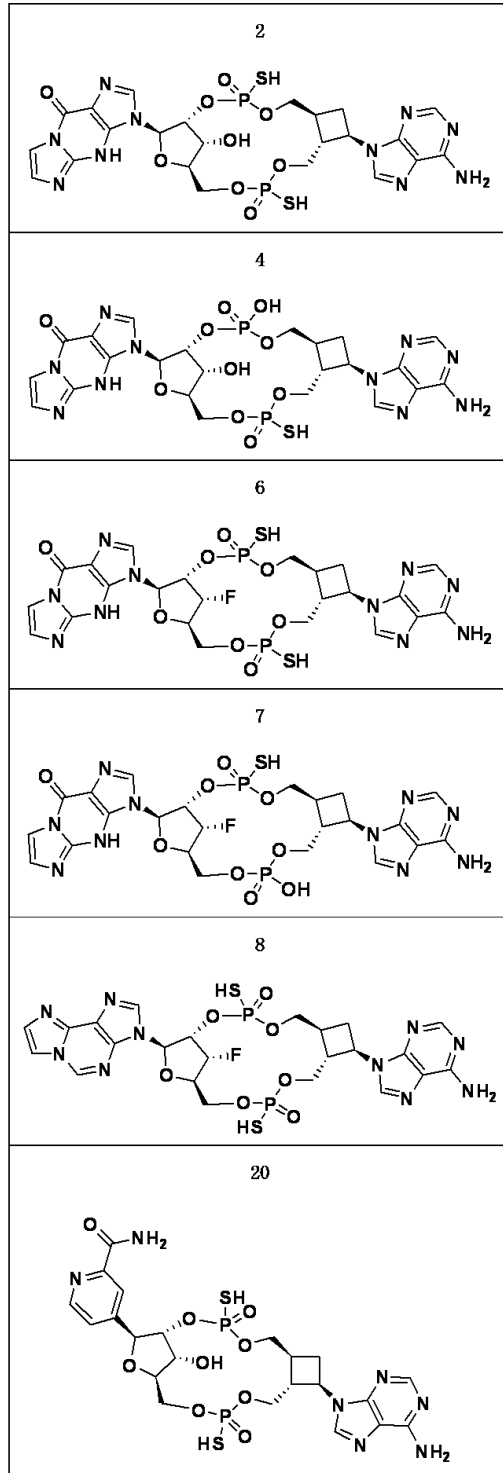
20

30

40

50

【表 4】



10

20

30

40

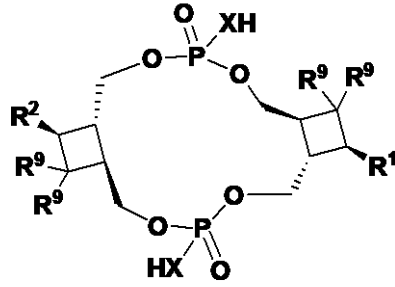
で示される請求項10の化合物、またはその互変異性体または立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 19】

式(III)

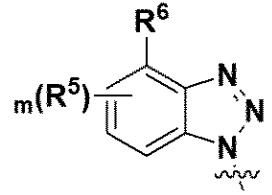
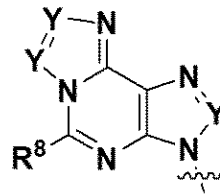
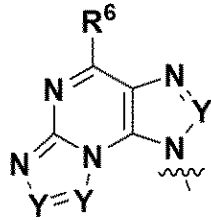
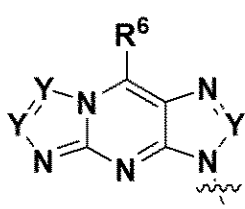
50

【化 4 9】

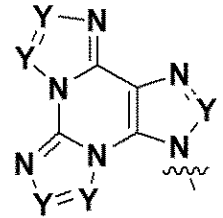
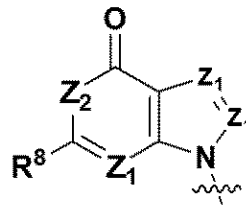
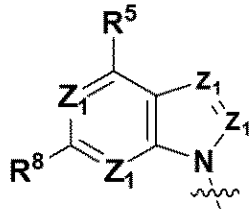
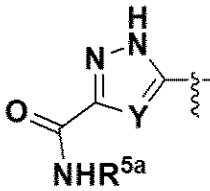


10

[式中、
 Xは、独立して、OまたはSであり；
 R1およびR2は、それぞれ独立して、
 【化 5 0】

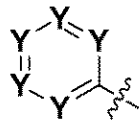


20



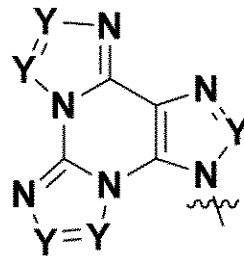
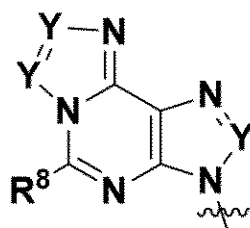
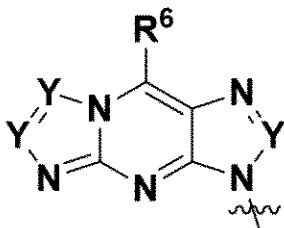
30

または

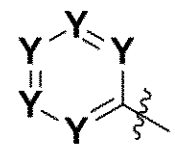


であり；
 但し、R1およびR2の一方は
 【化 5 1】

40



または



でなければならず；
 Z1は、NまたはCR^aであり；

50

Z₂は、NR^bであり；

R^aは、H、ハロゲン、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^bは、H、0～6個のR⁵で置換されたC₁₋₆アルキル、0～6個のR⁵で置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(O)R^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{a1}は、H、C₁₋₃アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルであり；

10

R⁵は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R^{5a}は、HまたはC₁₋₃アルキルであり；

R⁶は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

R⁸は、H、ハロゲン、C₁₋₃アルキル、CN、NO₂、OH、OR^{a1}、SR^{a1}、-C(O)NR^{a1}R^{a1}、-COOR^{a1}、-OC(O)R^{a1}、-OC(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}C(O)R^{a1}、-NR^{a1}COOR^{a1}、-NR^{a1}C(O)NR^{a1}R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂R^{a1}、-NR^{a1}S(O)₂NR^{a1}R^{a1}、-S(O)R^{a1}、-S(O)NR^{a1}R^{a1}、-S(O)₂R^{a1}またはS(O)₂NR^{a1}R^{a1}であり；

20

R⁹は、H、ハロゲンまたはメチルであり；

Yは、CR^aまたはNであり；

mは、0、1、2または3である]

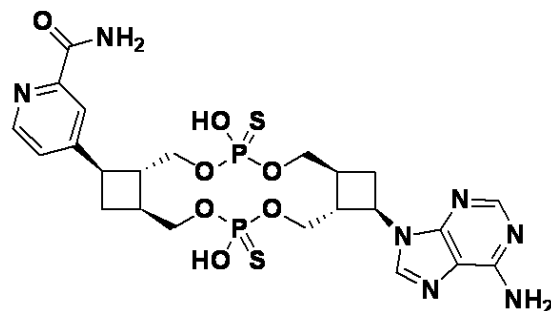
の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項 20】

式

【化 5 2】

30



40

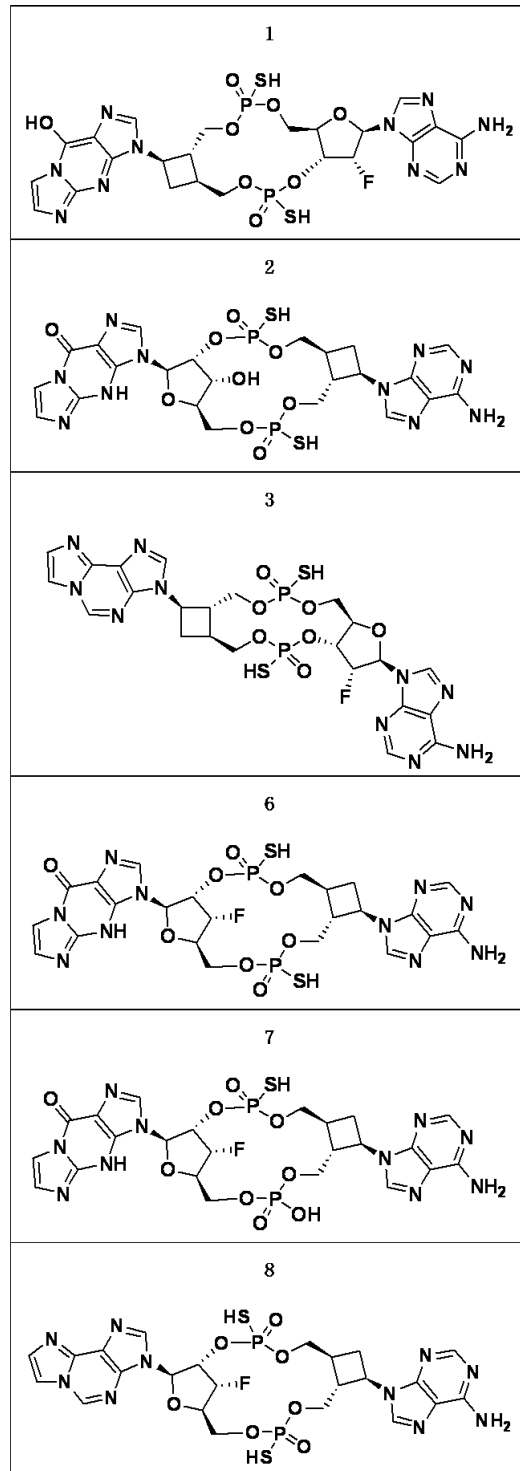
の請求項 19 に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。

【請求項 21】

式

50

【表 5】



10

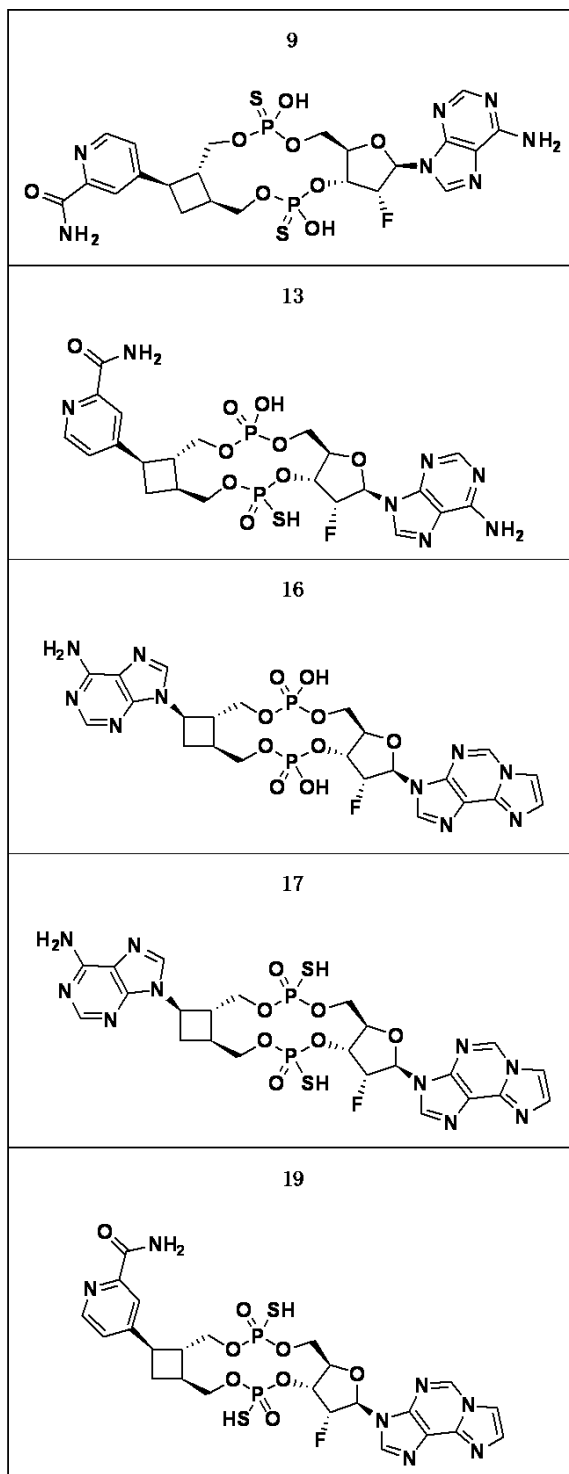
20

30

40

50

【表 6】



10

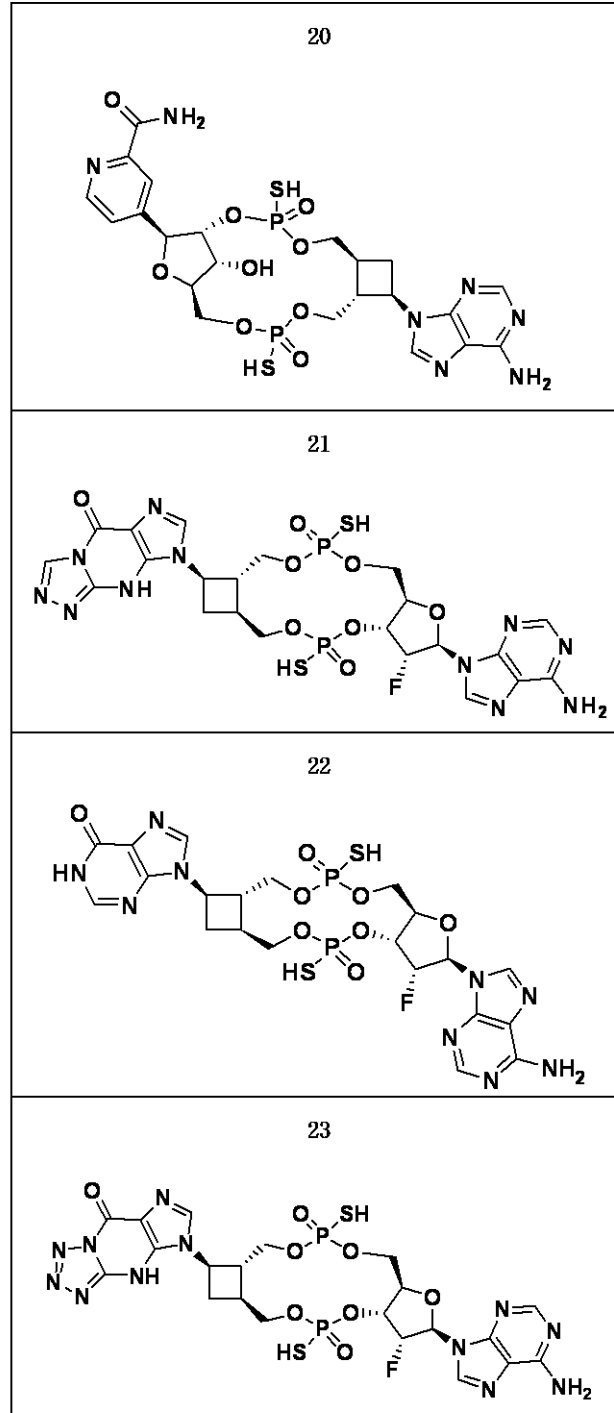
20

30

40

50

【表 7】



で示される、請求項1、10または19に記載の化合物、またはその互変異性体または立体異性体または医薬的に許容される塩。

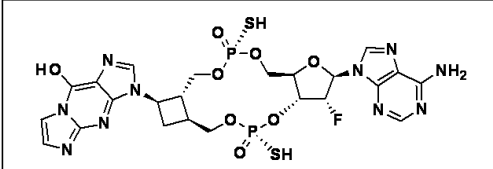
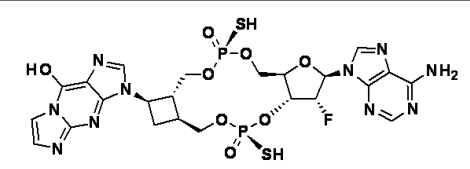
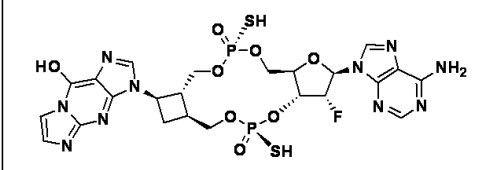
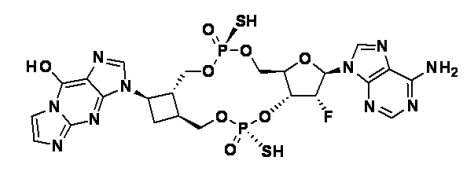
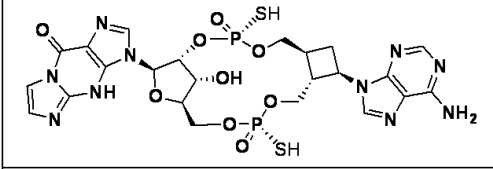
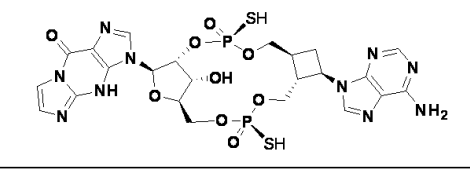
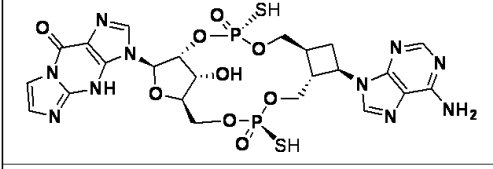
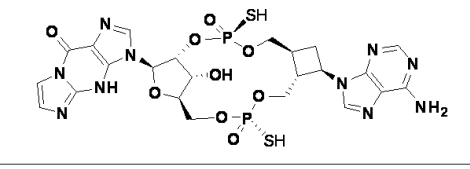
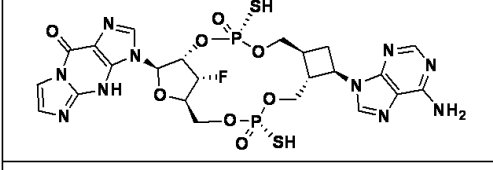
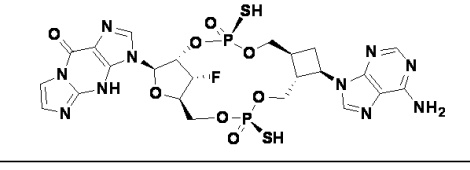
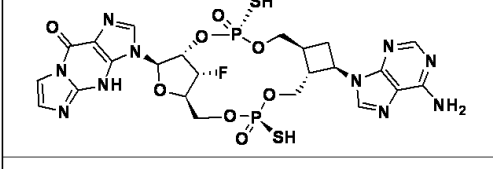
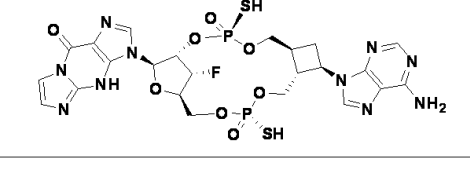
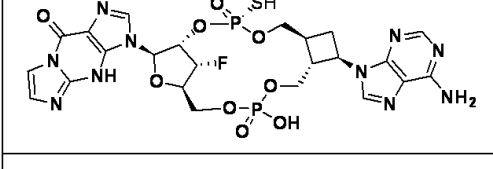
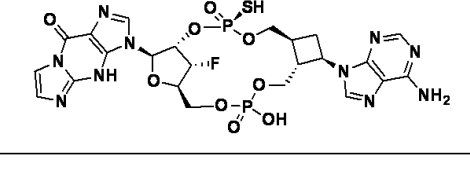
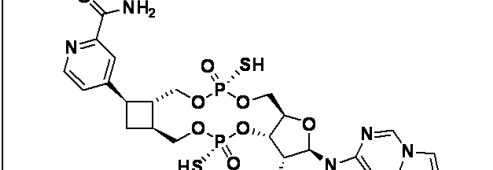
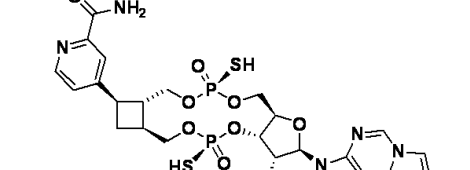


【請求項 2 2】

式

40

50

【表 8】

10

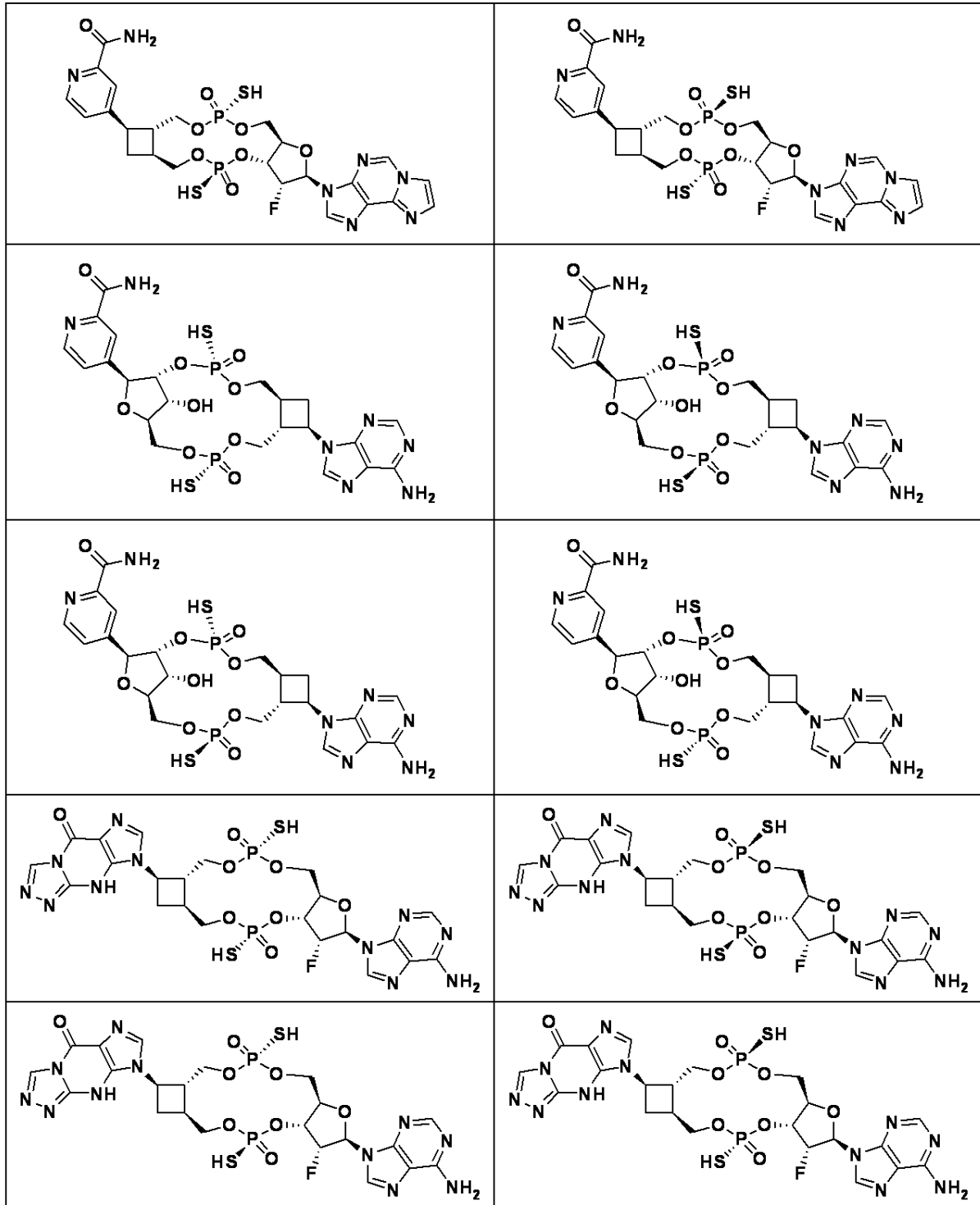
20

30

40

50

【表 9】



10

20

30

40

で示される、請求項1、10または19に記載の化合物、またはその互変異性体または立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 2 3】

(1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-8-{9-ヒドロキシ-3H-イミダゾ[1,2-a]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3,5,12,5'-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、

(1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-ヒドロキシ-17-{9-オキソ-3H,4H,9H-イミダゾ[1,2-a]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,1

50

1,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-8-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12ジオン、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-3,18-ジヒドロキシ-17-{9-オキソ-3H,4H,9H-イミダゾ[1,2-a]プリン-3-イル}-12-スルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1S,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-ヒドロキシ-17-{9-オキソ-3H,5H,9H-イミダゾ[1,2-a]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1S,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-17-{9-オキソ-3H,4H,9H-イミダゾ[1,2-a]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1S,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1S,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 4-[(1R,6S,8R,9S,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-3,12-ジオキソ-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 4-[(1R,6S,8R,9S,15R,17R,18S)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-3,12-ジオキソ-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 4-[(1R,6S,8R,9S,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-3,12-ジヒドロキシ-3,12-ジオキソ-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 4-[(1R,6S,8R,9S,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-12-ヒドロキシ-3,12-ジオキソ-3-スルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 4-[(1S,7S,8R,10S,16R,17R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-4,13-ジオキソ-4,13-ジスルファニル-3,5,12,14-テトラオキサ-4 5,13 5-ジホスファトリシクロ[14.2.0.0^{7,10}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-3,12-ジヒドロキシ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-8-(6-クロロ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 4-[(1R,6S,8R,9S,15R,17R,18R)-18-フルオロ-17-{3H-イミダゾ[2,1-f]プリン-3-イル}-3,12-ジオキソ-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3 5,12

10
20
30
40
50

- 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-8-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 4-[(1R,6S,8R,9R,15R,17S,18R)-8-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-ヒドロキシ-3,12-ジオキソ-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3^{5,12} 5-ジホスファトリシクロ[13.2.1.0^{6,9}]オクタデカン-17-イル]ピリジン-2-カルボキサミド、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-8-{5-オキソ-5H,8H,9H-[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]プリン-8-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3^{5,12} 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-8-(6-オキソ-6,9-ジヒドロ-1H-プリン-9-イル)-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3^{5,12} 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、または
 (1R,6S,8R,9R,15R,17R,18R)-17-(6-アミノ-9H-プリン-9-イル)-18-フルオロ-8-{8-オキソ-4H,5H,8H-[1,2,3,4]テトラゾロ[1,5-a]プリン-5-イル}-3,12-ジスルファニル-2,4,11,13,16-ペンタオキサ-3^{5,12} 5-ジホスファトリシクロ[13.3.0.0^{6,9}]オクタデカン-3,12-ジオン、
 である化合物、またはその医薬的に許容される塩、互変異性体または立体異性体。
 【請求項 2 4】
 請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、および 1 つ以上の医薬的に許容される担体、希釈剤または賦形剤を含む、医薬組成物。
 【請求項 2 5】
 1 つ以上のその他の治療活性剤と共に用いる、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、組み合わせ医薬品。
 【請求項 2 6】
 治療で用いるための、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。
 【請求項 2 7】
 STING 経路を經由した免疫応答の誘導により軽減され得る疾患または病状であって、その疾患または病状が、がんである場合の治療に用いるための、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。
 【請求項 2 8】
 前記がんが、小細胞肺がん、非小細胞肺がん、大腸癌、黒色腫、腎細胞がん、頭頸部癌、ホジキンリンパ腫、膀胱癌、食道癌、胃癌、卵巣癌、子宮頸癌、膵臓癌、前立腺癌、乳癌、泌尿器癌、脳腫瘍(例えば、グリア芽)、非ホジキンリンパ腫、急性リンパ性白血病(ALL)、慢性リンパ性白血病(CLL)、急性骨髄性白血病(AML)、慢性骨髄性白血病(CML)、肝細胞がん、多発性骨髄腫、消化管間質腫瘍、中皮腫、およびその他固形腫瘍またはその他血液がんである、請求項 27 に記載の医薬組成物。
 【請求項 2 9】
 がんの治療に用いるための、治療上の有効量の 1 つ以上の免疫腫瘍薬剤と組み合わせる、請求項 1 ~ 23 に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。
 【請求項 3 0】
 前記免疫腫瘍薬剤が、イピリムマブまたは PD-L1 アンタゴニストである、請求項 29 に記載の医薬組成物。
 【請求項 3 1】
 がんの治療に用いるための、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、および Programmed Death-1 (PD-1) 受容体に特異的に結合し、PD-1 活性を阻害する抗体またはその抗原結合部位である抗がん剤を含む、医薬組成物。
 【請求項 3 2】
 前記抗 PD-1 抗体が、ニボルマブまたは ペムブロリズマブである、請求項 31 に記載の医薬

組成物。

10

20

30

40

50