

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成21年2月5日 (2009.2.5)

【公表番号】特表2008-526705(P2008-526705A)

【公表日】平成20年7月24日 (2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-029

【出願番号】特願2007-548770(P2007-548770)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

C 0 7 D 295/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

C 0 7 D 307/14 (2006.01)

C 0 7 D 295/12 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/12 E

C 0 7 D 295/14 C S P A

A 6 1 K 31/495

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/30

C 0 7 D 307/14

C 0 7 D 295/12 A

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年12月11日 (2008.12.11)

【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

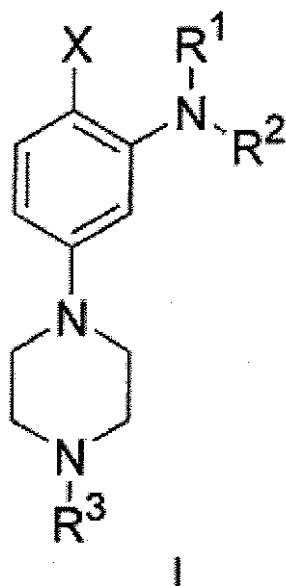
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I

【化 1】



(式中、

X は、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$ 、 $-\text{O}-\text{R}^5$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NR}^6$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^7$ もしくは $-\text{NH}-\text{R}^9$ を表し、

R^1 は、

水素原子；

未置換、またはオキソ ($=\text{O}$)、チオキソ ($=\text{S}$)、 C_{1-5} -アルキル、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{S}(=\text{O})_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つのヘテロ原子を含有してよく、そして

未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-\text{N}(\text{C}_{1-5}\text{-アルキル})_2$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されている、飽和もしくは不飽和の 3 ~ 9 員の脂環式ラジカル；または

未置換、または C_{1-5} -アルキル、 $-\text{O}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{S}-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}_{1-5}$ -アルキル、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-$

C_{1-5} - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、

鎖員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有してよい直鎖状もしくは分枝状 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されている、そして

未置換、またはF、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-NH(C_{1-5}$ - アルキル)および $-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよい5～10員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記ヘテロアリールラジカルは、環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有するヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、
または

R^1 および R^2 は、架橋窒素と一緒にニトロ(NO_2)-基、または

環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの追加のヘテロ原子を含有してよく、未置換、または C_{1-5} - アルキル、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、そして未置換、またはオキソ($=O$)、チオキソ($=S$)、 C_{1-5} - アルキル、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい単環式環系と縮合されてよい5もしくは6員のヘテロアリールラジカルを形成するが、

それにより前記環系の環は5、6もしくは7員であり、窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有してよく、

R^3 は、未置換、またはF、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-NH(C_{1-5}$ - アルキル)および $-N(C_{1-5}$ - アルキル) $_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^4 は、未置換、またはF、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキ

ル、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^5 は、未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカル、または

未置換、または $C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-C(=O)-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-O-C(=O)-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されてよい5～10員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記ヘテロアリールラジカルは環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有しているアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^6 は、水素原子；または

未置換、または $C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-C(=O)-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-O-C(=O)-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されてよい5～10員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記ヘテロアリールラジカルは環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有しているアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^7 は、未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ および $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^9 は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C₁₋₁₀ アルキルラジカル；または

未置換、または C₁₋₅-アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C₁₋₆ アルキレン、C₂₋₆ アルケニレンもしくは C₂₋₆ アルキニレン基を介して結合されてよい 5 ~ 10 員のアリールラジカルを表し、ならびに

R^{10} は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C₁₋₁₀ アルキルラジカルを表し、

ただし

R^1 および R^2 は、X が -NH₂ 基を表す場合は両方水素原子を表すことはない化合物であって、場合によりその立体異性体、好ましくはエナンチオマーもしくはジアステレオマーのうちの 1 つの形態、ラセミ化合物、もしくはその立体異性体（好ましくはエナンチオマーおよび / またはジアステレオマー）のうちの少なくとも 2 つの任意の混合比での混合物の形態にある置換フェニル - ピペラジン化合物、またはそれらの生理学的に許容される塩、またはそれらの対応する溶媒和物。

【請求項 2】

X は、-CN、-C(=O)-OH、-C(=O)-OR⁴、-O-R⁵、-NH₂、-NR⁶-C(=O)-R⁷ もしくは -NH-R⁹ を表し、

R^1 は、水素原子；

未置換、またはオキソ(=O)、チオキソ(=S)、C₁₋₅-アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つのヘテロ原子を含有してよく、そして未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置

換されてよい直鎖状もしくは分枝状 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されている、飽和もしくは不飽和の3～9員の脂環式ラジカル；または

未置換、または C_{1-5} - アルキル、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、鎖員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有してよい直鎖状もしくは分枝状 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されている、そして未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ および $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよい5～10員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有するアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、

または

R^1 および R^2 は、架橋窒素と一緒にニトロ(NO_2) - 基、または

環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの追加のヘテロ原子を含有してよく、未置換、または C_{1-5} - アルキル、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよく、そして未置換、またはオキソ($=O$)、チオキソ($=S$)、 C_{1-5} - アルキル、 $-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-S-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ - アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい単環式環系と縮合されてよい5もしくは6員のヘテロアリールラジカルを形成するが、それにより前記環系の環は5、6もしくは7員であり、窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つのヘテロ原子を含有してよく、

R^3 は、未置換、または F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ および $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ からなる群から

独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^4 は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^5 は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカル；または

未置換、または C_{1-5} -アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されてよい 5 ~ 10 員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記ヘテロアリールラジカルは前記環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つのヘテロ原子を含有しているアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^6 は、水素原子；または

未置換、または C_{1-5} -アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されてよい 5 ~ 10 員のアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記ヘテロアリールラジカルは環員としての窒素、酸素および硫黄からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つのヘテロ原子を含有しているアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^7 は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から

独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^9 は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカル；または

未置換、または C_{1-5} -アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよく、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレンもしくは C_{2-6} アルキニレン基を介して結合されてよい 5 ~ 10 員のアリールラジカルを表し、ならびに

R^{10} は、未置換、または F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-NH(C₁₋₅-アルキル) および -N(C₁₋₅-アルキル)₂ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の、飽和もしくは不飽和の C_{1-10} アルキルラジカルを表すが、

ただし

R^1 および R^2 は、X が -NH₂ 基を表す場合は両方水素原子を表すことはないことを条件とする化合物であって、場合によりその立体異性体、好ましくはエナンチオマーもしくはジアステレオマーのうちの 1 つの形態、ラセミ化合物、もしくはその立体異性体（好ましくはエナンチオマーおよび / またはジアステレオマー）のうちの少なくとも 2 つの任意の混合比での混合物の形態にあることを特徴とする、請求項 1 に記載の置換フェニル-ピペラジン化合物、またはそれらの生理学的に許容される塩、またはそれらの対応する溶媒和物。

【請求項 3】

R^1 は、

水素原子；

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、イミダゾリジニル、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピラゾリジニルおよびアゼパニルからなる群から選択される（ヘテロ）脂環式ラジカルであって、それにより前記（ヘテロ）脂環式ラジカルは、-(CH₂)_{1, 2 または 3}-基を介して結合されている、および / または、未置換もしくはオキソ(=O)、チオキソ(=S)、 C_{1-5} -アルキル、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OH、-SH、-NH₂、-NH(C₁₋₅-アルキル)、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NO₂、-CHO、-CF₂H、-CFH₂、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₅-アルキル)、-C(=O)-N(C₁₋

5 - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_1-5$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい (ヘテロ) 脂環式ラジカル; または

フェニル、ナフチル、フリル (フラニル)、チエニル (チオフェニル)、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ [b] フラニル、ベンゾ [b] チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ [2, 1-b] チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および / または、未置換もしくは C_1-5 - アルキル、 $-O-C_1-5$ - アルキル、 $-S-C_1-5$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_1-5$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_1-5$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_1-5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-5$ - アルキル)、 $-N(C_1-5$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1-5$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_1-5$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_1-5$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

好ましくは、 R^1 は、

水素原子;

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、イミダゾリジニル、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ペリリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピラゾリジニルおよびアゼパニルからなる群から選択される (ヘテロ) 脂環式ラジカルであって、それにより前記 (ヘテロ) 脂環式ラジカルは、 $-(CH_2)_1, 2$ または 3 - 基を介して結合されている、および / または、未置換もしくはオキソ ($=O$)、チオキソ ($=S$)、メチル、エチル、 n - プロピル、 iso - プロピル、 n - ブチル、 $tert$ - ブチル、 sec - ブチル、イソブチル、 n - ペンチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-S-C_2H_5$ 、 $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-S-CH(CH_3)_2$ 、 $-S-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-C(=O)-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-C(CH_3)_3$ 、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-CH_3$ 、 $-NH-C_2H_5$ 、 $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-NH-CH(CH_3)_2$ 、 $-NH-C(CH_3)_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(C_2H_5)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH-CH_3$ 、 $-C(=O)-NH-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$ および $-S(=O)_2-CH_3$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されている (ヘテロ) 脂環式ラジカル; または

フェニル、ナフチル、フリル (フラニル)、チエニル (チオフェニル)、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ [b] フラニル、ベンゾ [

b] チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2, 1-b]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*n*-ペンチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-S-C_2H_5$ 、 $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-S-CH(CH_3)_2$ 、 $-S-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-C(=O)-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-C(CH_3)_3$ 、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-CH_3$ 、 $-NH-C_2H_5$ 、 $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-NH-CH(CH_3)_2$ 、 $-NH-C(CH_3)_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(C_2H_5)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH-CH_3$ 、 $-C(=O)-NH-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$ および $-S(=O)_2-CH_3$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

より好ましくは、 R^1 は、

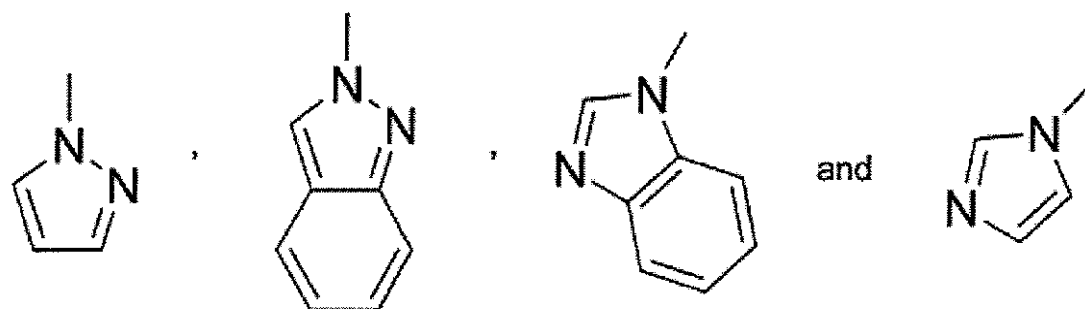
水素原子；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）およびチエニル（チオフェニル）からなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、F、Cl、Br、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表すことを特徴とする請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 および R^2 は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または

【化2】

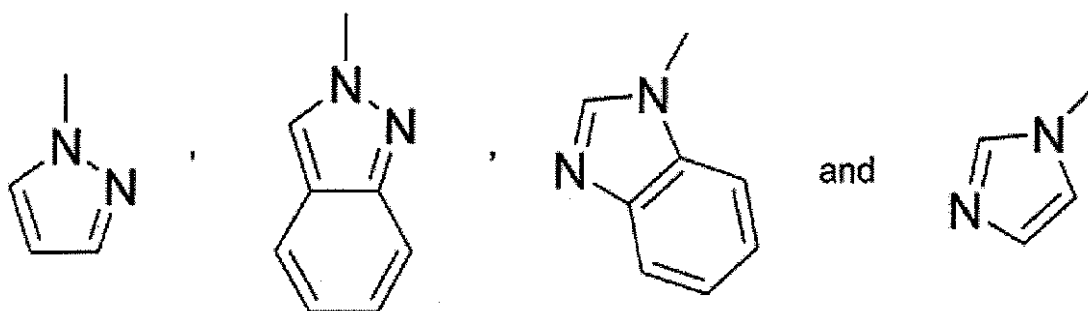


からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、または C_{1-5} -アルキル、 $-O$

- C₁ - 5 - アルキル、- S - C₁ - 5 - アルキル、- C(=O) - OH、- C(=O) - C₁ - 5 - アルキル、- C(=O) - O - C₁ - 5 - アルキル、- O - C(=O) - C₁ - 5 - アルキル、F、Cl、Br、I、- CN、- CF₃、- OCF₃、- SCF₃、- OH、- SH、- NH₂、- NH(C₁ - 5 - アルキル)、- N(C₁ - 5 - アルキル)₂、- NO₂、- CHO、- CF₂H、- CFH₂、- C(=O) - NH₂、- C(=O) - NH(C₁ - 5 - アルキル)、- C(=O) - N(C₁ - 5 - アルキル)₂、- S(=O)₂ - C₁ - 5 - アルキル、- S(=O)₂ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよく、

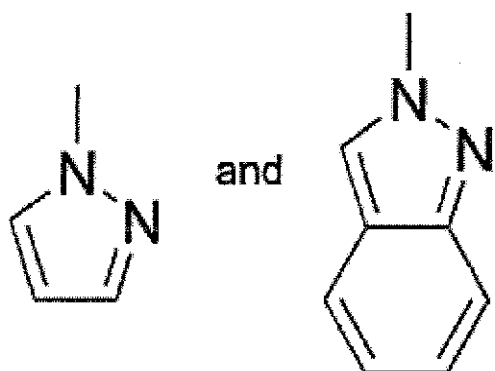
好ましくは、R¹ および R² は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または
【化 3】



からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、またはメチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、tert - ブチル、sec - ブチル、イソブチル、F、Cl、Br、I、- CN および - CF₃ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよく、

より好ましくは、R¹ および R² は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または
【化 4】



からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、またはメチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、tert - ブチル、sec - ブチル、イソブチル、F、Cl、Br、I、- CN および - CF₃ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよい、ことを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

R³ は、未置換、または、- O - C₁ - 5 - アルキル、- S - C₁ - 5 - アルキル、F、Cl、Br、I、- CF₃、- OCF₃、- SCF₃、- OH および - SH からなる群

から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

好ましくは、 R^3 は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび *tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

より好ましくは、 R^3 は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項 1～4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R^4 は、未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

好ましくは、 R^4 は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび *tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

より好ましくは、 R^4 は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項 1～5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

R^5 は、

未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）、チエニル（チオフェニル）、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[*b*]フラニル、ベンゾ[*b*]チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2,1-*b*]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または 3 - 基を介して結合されてよい、および / または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

好ましくは、 R^5 は、

メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび *tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）、チエニル（チオフェニル）、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[*b*]フラニル、ベンゾ[*b*]チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2,1-*b*]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または 3 - 基を介して

て結合されている、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

より好ましくは、 R^5 は、

メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）およびチエニル（チオフェニル）からなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O$ -基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 $tert$ -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表すことを特徴とする請求項1～6のいずれかに記載の化合物。

【請求項8】

R^6 は、

水素原子；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または 3 -基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

好ましくは、 R^6 は、

水素原子；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)$ -基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 $tert$ -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

より好ましくは R^6 は、水素原子；または

フェニルラジカルであって、それにより前記フェニルラジカルは、 $-(CH_2)$ -基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、 n -プロピル

、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいフェニルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

R^7 は、未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

好ましくは、 R^7 は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

より好ましくは、 R^7 は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】

R^9 は、

未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または3-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

好ましくは、 R^9 は、

メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または3-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

より好ましくは、 R^9 は、

メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリーールラジカルであって、それにより前記アリーールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、F、Cl、Br、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリーールラジカルを表すことを特徴とする請求項1～9のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

R^{10} は、未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

好ましくは、 R^{10} は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

より好ましくは、 R^{10} は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～10のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

Xは、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-OR^4$ 、 $-O-R^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^6-C(=O)-R^7$ もしくは $-NH-R^9$ を表し、

R^1 は、

水素原子；

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、イミダゾリジニル、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピラゾリジニルおよびアゼパニルからなる群から選択される(ヘテロ)脂環式ラジカルであって、それにより前記(ヘテロ)脂環式ラジカルは、 $-(CH_2)_1$ 、 2 または 3 -基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはオキソ($=O$)、チオオキソ($=S$)、 C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい(ヘテロ)脂環式ラジカル；または

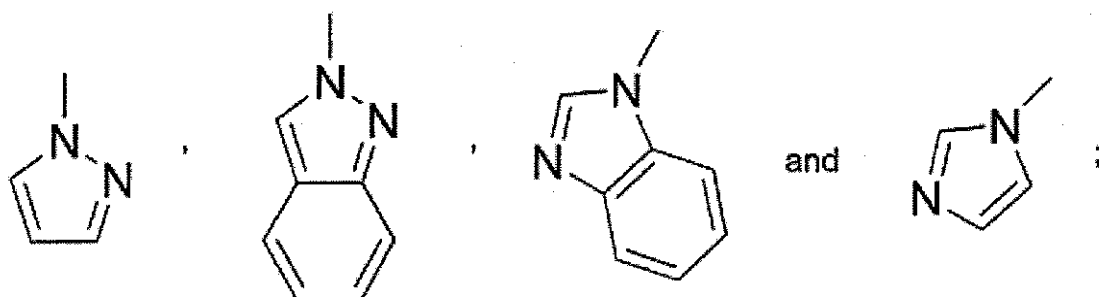
フェニル、ナフチル、フリル(フラニル)、チエニル(チオフェニル)、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2,1-b]チアゾリルからなる群から選択されるアリーールもしくはヘテロアリーールラジカルであって、それにより前記アリーールもしくはヘテロアリーールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C$

$C_1 - 5$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_1 - 5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 - 5$ - アルキル)、 $-N(C_1 - 5$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1 - 5$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_1 - 5$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、

R^1 および R^2 は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または

【化 5】



からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、または $C_1 - 5$ - アルキル、 $-O-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S-C_1 - 5$ - アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_1 - 5$ - アルキル、 $-C(=O)-O-C_1 - 5$ - アルキル、 $-O-C(=O)-C_1 - 5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 - 5$ - アルキル)、 $-N(C_1 - 5$ - アルキル) $_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1 - 5$ - アルキル)、 $-C(=O)-N(C_1 - 5$ - アルキル) $_2$ 、 $-S(=O)_2-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S(=O)_2$ - フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよく、

R^3 は、未置換、または、 $-O-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S-C_1 - 5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の $C_1 - 10$ アルキルラジカルを表し、

R^4 は、未置換、または、 $-O-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S-C_1 - 5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の $C_1 - 10$ アルキルラジカルを表し、

R^5 は、

未置換、または、 $-O-C_1 - 5$ - アルキル、 $-S-C_1 - 5$ - アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の $C_1 - 10$ アルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）、チエニル（チオフェニル）、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[*b*]フラニル、ベンゾ[

b] チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2, 1-b]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1, 2}$ または3-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^6 は、

水素原子；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1, 2}$ または3-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

R^7 は、未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカルを表し、

R^9 は、

未置換、または、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状の C_{1-10} アルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1, 2}$ または3-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、F、Cl、Br、I、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}\text{-アルキル})$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}\text{-アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}\text{-アルキル}$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを

R¹⁰は、未置換、または、-O-C₁₋₅-アルキル、-S-C₁₋₅-アルキル、F、Cl、Br、I、-CF₃、-OCF₃、-SCF₃、-OHおよび-SHからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基と置換されてよい直鎖状もしくは分枝状のC₁₋₁₀アルキルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～11のいずれかに記載の化合物。

Xは、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$ 、 $-\text{O}-\text{R}^5$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NR}^6$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^7$ もしくは $-\text{NH}-\text{R}^9$ を表し、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、イミダゾリジニル、アジリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピラゾリジニルおよびアゼパニルからなる群から選択される（ヘテロ）脂環式ラジカルであって、それにより前記（ヘテロ）脂環式ラジカルは、 $-(CH_2)_1, 2$ または 3 - 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはオキソ（ $=O$ ）、チオキソ（ $=S$ ）、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、 n -ペンチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-S-C_2H_5$ 、 $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-S-CH(CH_3)_2$ 、 $-S-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-C(=O)-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-C(CH_3)_3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-CH_3$ 、 $-NH-C_2H_5$ 、 $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-NH-CH(CH_3)_2$ 、 $-NH-C(CH_3)_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(C_2H_5)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH-CH_3$ 、 $-C(=O)-NH-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$ および $-S(=O)_2-CH_3$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されている（ヘテロ）脂環式ラジカル；または

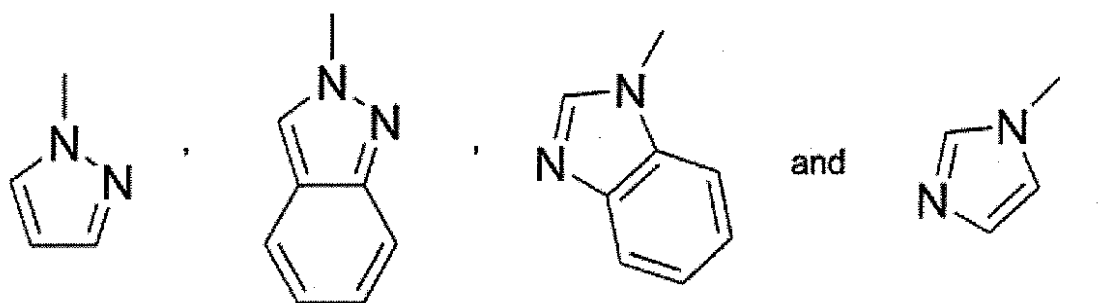
フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）、チエニル（チオフェニル）、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[*b*]フラニル、ベンゾ[*b*]チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2, 1-*b*]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)- (CH_2)-$ 、 $-(CH_2)- (CH_2)- (CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)- (CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)- (CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*n*-ペンチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 $-S-CH_3$ 、 $-S-C_2H_5$ 、 $-S-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-S-CH(CH_3)_2$ 、 $-S-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-O-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-O-C(CH_3)_3$ 、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-C(=O)-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-C(=O)-CH(CH_3)_2$ 、

$_2$ 、 $-C(=O)-C(CH_3)_3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-CH_3$ 、 $-NH-C_2H_5$ 、 $-NH-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-NH-CH(CH_3)_2$ 、 $-NH-C(CH_3)_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(C_2H_5)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH-CH_3$ 、 $-C(=O)-NH-C_2H_5$ 、 $-C(=O)-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)-N(C_2H_5)_2$ および $-S(=O)_2-CH_3$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、

好ましくは、 R^1 および R^2 は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または

【化 6】



からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、またはメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 $tert$ -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ および $-CF_3$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよく、

R^3 は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

R^4 は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

R^5 は、

メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）、チエニル（チオフェニル）、ピロリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、ベンゾチアジアゾリルおよびイミダゾ[2,1- b]チアゾリルからなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)_1, 2$ または 3 - 基を介して結合されてよい、および / または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2-フェニル$ 、フェニル、フェノキシおよびベン

ジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基と置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^6 は、

水素原子；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 $tert$ -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

R^7 は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表し、

R^9 は、

メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、 $-(CH_2)_{1,2}$ または 3 - 基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくは C_{1-5} -アルキル、 $-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-S-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-5}$ -アルキル、 $-O-C(=O)-C_{1-5}$ -アルキル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_{1-5}-アルキル)$ 、 $-C(=O)-N(C_{1-5}-アルキル)_2$ 、 $-S(=O)_2-C_{1-5}-アルキル$ 、 $-S(=O)_2$ -フェニル、フェニル、フェノキシおよびベンジルからなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

R^{10} は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカルを表すことを特徴とする請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 14】

X は、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-OR^4$ 、 $-O-R^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^6-C(=O)-R^7$ もしくは $-NH-R^9$ を表し、

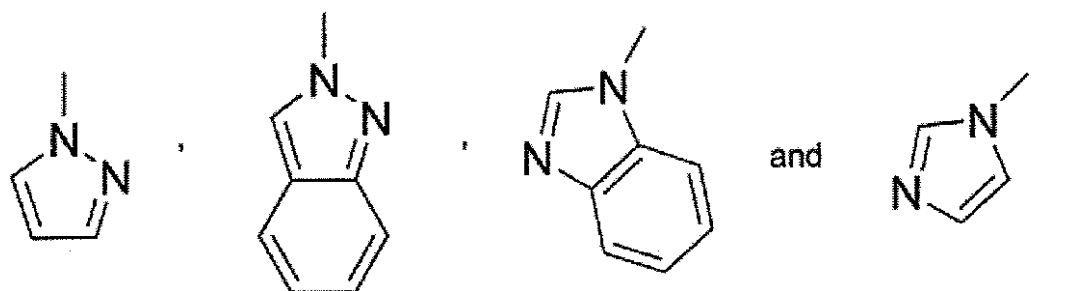
R^1 は、水素原子；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）およびチエニル（チオフェニル）からなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 $tert$ -ブチル、 sec -ブチル、イソブチル、 $-O-CH_3$ 、 $-O-C_2H_5$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_3$ 、 $-O-CH(CH_3)_2$ 、 $-O-C(CH_3)_3$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される 1、2 もしくは 3 つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、

R^1 および R^2 は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または

【化 7】



からなる群から選択される部分を形成し、

それによりこれらの上記の環式部分各々は、未置換、またはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、F、Cl、Br、I、-CNおよび-CF₃からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよく、

R³は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R⁴は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R⁵は、

メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニル、ナフチル、フリル（フラニル）およびチエニル（チオフェニル）からなる群から選択されるアリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、-(CH₂)-、-(CH₂)-(CH₂)-、もしくは-(CH₂)-(CH₂)-(CH₂)-基を介して結合されている、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、-O-CH₂-CH₂-CH₃、-O-CH(CH₃)₂、-O-C(CH₃)₃、F、Cl、Br、-CN、-CF₃、-OCF₃、-OHおよび-SHからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R⁶は、水素原子；または

フェニルラジカルであって、それにより前記フェニルラジカルは、-(CH₂)-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、F、Cl、Br、-CF₃、-OCF₃、-OHおよび-SHからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいフェニルラジカルを表し、

R⁷は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R⁹は、

メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチルおよび*tert*-ブチルからなる群から選択されるアルキルラジカル；または

フェニルおよびナフチルからなる群から選択されるアリールラジカルであって、それにより前記アリールラジカルは、-(CH₂)-、-(CH₂)-(CH₂)-、もしくは-(CH₂)-(CH₂)-(CH₂)-基を介して結合されてよい、および/または、未置換もしくはメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*tert*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、-O-CH₂-CH₂-CH₃、-O-CH(CH₃)₂、-O-C(CH₃)₃、F、Cl、Br、-

CN、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OH$ および $-SH$ からなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよいアリールラジカルを表し、

R^{10} は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～13のいずれかに記載の化合物。

【請求項15】

Xは、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-OR^4$ 、 $-O-R^5$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^6-C(=O)-R^7$ もしくは $-NH-R^9$ を表し、

R^1 は、

水素原子；または

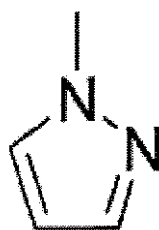
フェニル、フリル（フラニル）およびチエニル（チオフェニル）からなる群から選択される未置換アリールもしくはヘテロアリールラジカルであって、それにより前記アリールもしくはヘテロアリールラジカルは、 $-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)-(CH_2)-(CH_2)-$ 、 $-O-(CH_2)-(CH_2)-$ 、もしくは $-(CH_2)-(CH_2)-O-$ 基を介して結合されている未置換アリールもしくはヘテロアリールラジカルを表し、

R^2 は、水素原子もしくは $-C(=O)-R^{10}$ 部分を表すか、

または

R^1 および R^2 は、架橋窒素原子と一緒にニトロ基；または以下の式：

【化8】



の環状部分であって、それにより前記環式部分は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、イソブチルおよび $tert$ -ブチルからなる群から独立して選択される1、2もしくは3つの置換基で置換されてよい環状部分を形成し、

R^3 は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R^4 は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R^5 は、メチルラジカル、エチルラジカル；または $-(CH_2)-$ 基を介して結合されてよい未置換フェニルラジカルを表し、

R^6 は、水素原子もしくは未置換ベンジルラジカルを表し、

R^7 は、メチルもしくはエチルラジカルを表し、

R^9 は、未置換ベンジルラジカルを表し、
ならびに

R^{10} は、メチルもしくはエチルラジカルを表すことを特徴とする請求項1～14のいずれかに記載の化合物。

【請求項16】

[1] 4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-2-フェネチルアミノ-安息香酸、

[2] 2-[(フラン-2-イルメチル)-アミノ]-4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-ベンゾニトリル、

[3] 2-[(フラン-2-イルメチル)-アミノ]-4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-安息香酸、

[4] 2-ベンジルアミノ-4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-安息香酸メチ

ルエステル、

[5] 2 - ベンジルアミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゾニトリル、

[6] 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - フェネチルアミノ - 安息香酸メチルエステル、

[7] 2 - [(フラン - 2 - イルメチル) - アミノ] - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 安息香酸メチルエステル、

[8] 2 - ベンジルアミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 安息香酸、

[9] [2 - ベンジルオキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - フェネチル - アミン、

[10] [2 - ベンジルオキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - フラン - 2 - イル - メチルアミン、

[11] ベンジル - [2 - メトキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン、

[12] [2 - メトキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - フェネチル - アミン、

[13] フラン - 2 - イルメチル - [2 - メトキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン、

[14] ベンジル - [2 - ベンジルオキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン、

[15] N - [2 - アセチル - (2 - フェノキシエチル) - アミノ] - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アセトアミド、

[16] N - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - (2 - フェノキシ - エチルアミノ) - フェニル] - アセトアミド、

[17] N - [2 - (アセチル - アミノ) - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - N - ベンジル - アセトアミド、

[18] N - [2 - (3 , 5 - ジメチル - ピラゾール - 1 - イル) - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アセトアミド、

[19] N - [2 - (アセチル - フラン - 2 - イルメチル - アミノ) - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アセトアミド、

[20] N - [2 - ベンジルアミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アセトアミド、

[21] N - [2 - [フラン - 2 - イルメチル) - アミノ] - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アセトアミド、

[22] N - [2 - アミノ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - N - フラン - 2 - イルメチル - アセトアミド、

[23] N - [2 - アミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - N - ベンジル - アセトアミド、

[24] N - [2 - ベンジルアミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - ベンゼンスルホンアミド、

[25] N - [2 - ベンジルアミノ - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - メタンスルホンアミド、

[26] 2 - ベンジルオキシ - 5 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミン、

[27] ベンジル - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - ニトロ - フェニル] - アミン、および

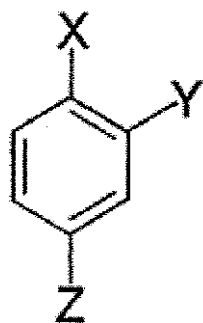
[28] 2 - シアノ - (5 - ピペラジン - 1 - イル - メチル) - 2 - フェノキシ - エチルアミンからなる群から選択される化合物であって、場合によりその立体異性体、好ましくはエナンチオマーもしくはジアステレオマーのうちの1つの形態、ラセミ化合物、もしくはその立体異性体（好ましくはエナンチオマーおよび/またはジアステレオマー）のうち

の少なくとも2つの任意の混合比での混合物の形態にある請求項1～15のいずれかに記載の化合物、またはそれらの生理学的に許容される塩、またはそれらの対応する溶媒和物。

【請求項17】

一般式II

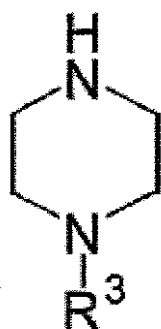
【化9】



II

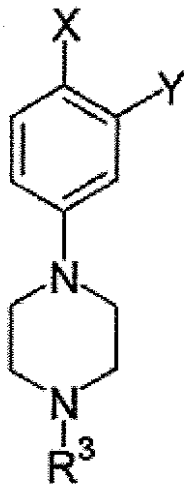
(式中、Xは $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$ 、 $-\text{O}-\text{R}^5$ もしくは $-\text{NO}_2$ を表し R^4 および R^5 は請求項1～16のいずれかに記載の意味を有し、Yは塩素原子を表し、そしてZは臭素もしくはヨウ素原子を表す)の少なくとも1つの置換ベンゼン化合物は、一般式II

【化10】



(式中、 R^3 は請求項1～16のいずれかに記載の意味を有する)の少なくとも1つのピペラジン化合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも1つの触媒および/または少なくとも1つの補助剤および/または少なくとも1つの塩基の存在下で反応させられると、一般式IV

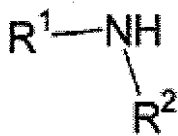
【化 1 1】



IV

(式中、Xは - CN、- C(=O) - OR⁴、- O - R⁵ もしくは - NO₂ を表し、R³、R⁴ および R⁵ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、そして Y は塩素原子を表す) の化合物が生成されるが、これは任意で精製および / または単離され、そして一般式 IV の化合物は、一般式 V

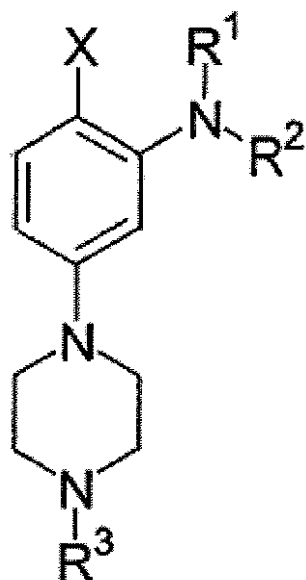
【化 1 2】



V

(式中、R¹ および R² は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは - C(=O) - O - C(CH₃)₃ 基を表す) の少なくとも 1 つの化合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも 1 つの触媒および / または少なくとも 1 つの補助剤および / または少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると、一般式 VI

【化 1 3】

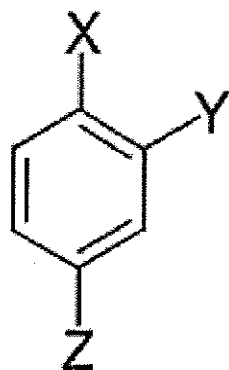


VI

(式中、Xは-CN、-C(=O)-OR⁴、-O-R⁵もしくは-NO₂を表し、R¹およびR²は請求項1～16のいずれかに記載の意味を表す、またはそれらの一方は保護基、好ましくは-C(=O)-O-C(CH₃)₃を表し、R³、R⁴およびR⁵は請求項1～16のいずれかに記載の意味を表す)の化合物が生成されるが、前記一般式VIの化合物は任意で精製および/または単離される、または

一般式IIa

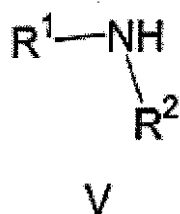
【化 1 4】



IIa

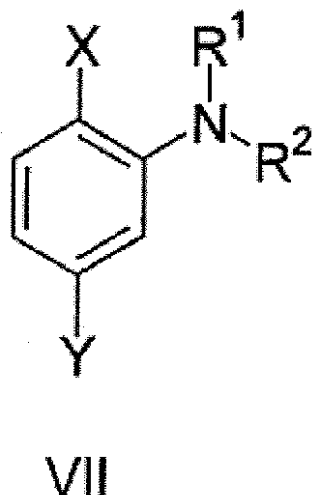
(式中、Xは-CN、-C(=O)-OR⁴、-O-R⁵もしくは-NO₂を表しR⁴およびR⁵は請求項1～16のいずれかに記載の意味を有し、Zは塩素原子を表し、そしてYは臭素もしくはヨウ素原子を表す)の少なくとも1つの置換ベンゼン化合物は、一般式V

【化 1 5】



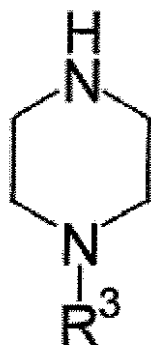
(式中、 R^1 および R^2 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 基を表す)の少なくとも 1 つ化合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも 1 つの触媒および / または少なくとも 1 つの補助剤および / または少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると、一般式 V I I

【化 1 6】



(式中、 X は $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}^4$ 、 $-\text{O}-\text{R}^5$ もしくは $-\text{NO}_2$ を表し、 R^1 および R^2 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を表す、またはそれらの一方は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 基を表し、 R^4 および R^5 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を表し、そして Y は塩素原子を表す)の化合物が生成されるが、前記一般式の化合物は任意で精製および / または単離され、そして一般式 V I I の化合物は、一般式 I I I

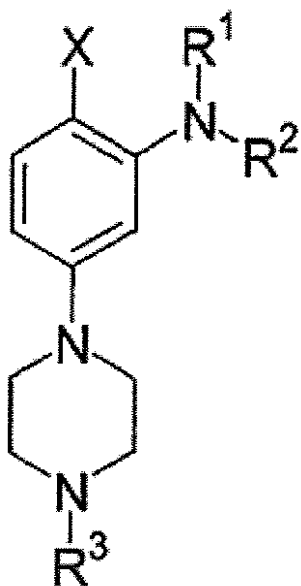
【化 1 7】



(式中、 R^3 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する)の少なくとも 1 つの化合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも 1 つの触媒および / または少なくとも 1 つの補助剤および / または少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると

、一般式 V I

【化 1 8】

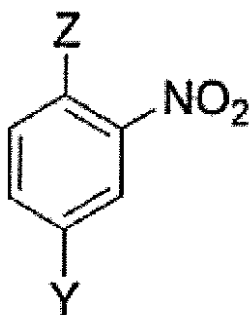


VI

(式中、Xは -CN、-C(=O)-OR⁴、-O-R⁵もしくは -NO₂を表し、R¹およびR²は請求項1～16のいずれかに記載の意味を表す、またはそれらの一方は保護基、好ましくは -C(=O)-O-C(CH₃)₃基を表し、R³、R⁴およびR⁵は請求項1～16のいずれかに記載の意味を表す)の化合物が生成されるが、前記一般式 V I の化合物は任意で精製および/または単離される、または

一般式 V I I I

【化 1 9】



VIII

(式中、Zは臭素もしくはヨウ素を表し、Yは塩素を表す)の少なくとも1つの置換ベンゼン化合物は、一般式 I X

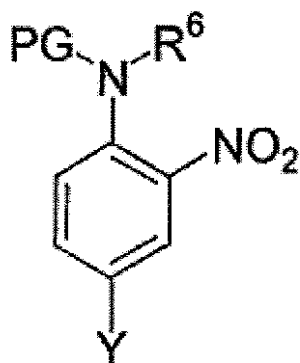
【化 2 0】



IX

(式中、 R_6 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、および PG は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 基を表す)の少なくとも 1 つの化合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも 1 つの触媒および / または少なくとも 1 つの補助剤および / または少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると、一般式 XI

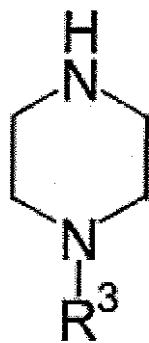
【化 2 1】



XI

(式中、 R_6 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有しており、PG は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 基を表し、Y は塩素を表す)の化合物が生成されるが、これは任意で精製および / または単離され、そして一般式 XI の化合物は、一般式 III

【化 2 2】

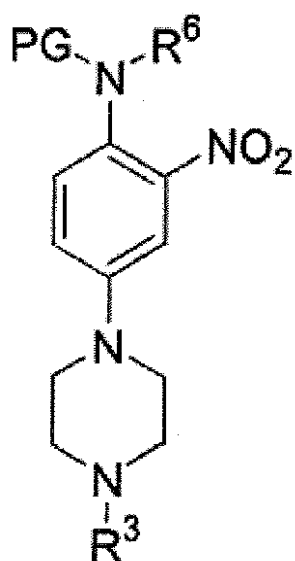


III

(式中、 R_3 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する)の少なくとも 1 つの化

合物と、適切な反応媒体中において、好ましくは少なくとも１つの触媒および／または少なくとも１つの補助剤および／または少なくとも１つの塩基の存在下で反応させられると一般式 X I I

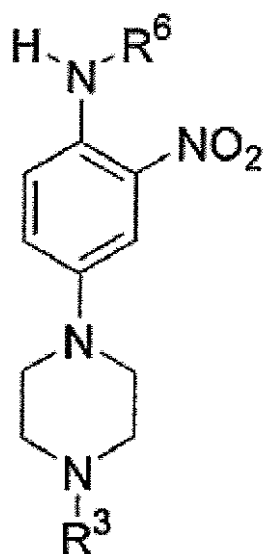
【化 2 3】



XII

(式中、R³ および R⁶ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有しており、PG は保護基、好ましくは -C(=O)-O-C(CH₃)₃ 基を表す)の化合物が生成されるが、これは任意で精製および／または単離され、そして一般式 X I I の化合物は適切な反応媒体中において、少なくとも１つの酸と反応させられると一般式 X I I I

【化 2 4】

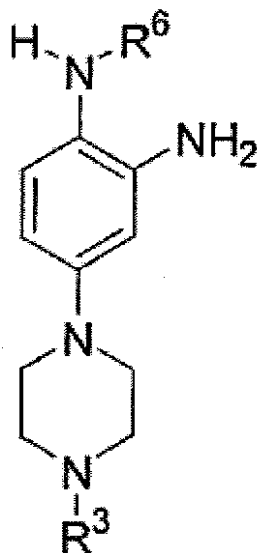


XIII

(式中、R³ および R⁶ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する)の化合物が生成されるが、これは任意で精製および／または単離され、そして一般式 X I I I の化合

物は少なくとも１つの塩基の存在下で水素と反応させられると一般式 X I V

【化 2 5】



XIV

(式中、 R^3 および R^6 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の化合物が生成されるが、これは任意で精製および / または単離され、そして一般式 X I V の化合物は、一般式 $\text{R}^7 - \text{C}(=\text{O}) - \text{O} - \text{C}(=\text{O}) - \text{R}^7$ (式中、 R^7 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) および / または一般式 $\text{R}^{10} - \text{C}(=\text{O}) - \text{O} - \text{C}(=\text{O}) - \text{R}^{10}$ (式中、 R^{10} は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の少なくとも 1 つの化合物と、適切な反応媒体中において、任意で少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 I (式中、 X は $-\text{NR}^6 - \text{C}(=\text{O})\text{R}^7$ を表し、 R^1 は水素原子を表し、 R^2 は水素原子もしくは $-\text{C}(=\text{O}) - \text{R}^{10}$ - 部分を表し、そして R^3 、 R^6 、 R^7 および R^{10} は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の化合物が生成される、

または

一般式 V I (式中、 X は $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^4$ もしくは $-\text{O} - \text{R}^5$ を表し、 R^1 および R^2 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を表す、またはそれらの一方は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O}) - \text{O} - \text{C}(\text{CH}_3)_3$ 基を表し、 R^3 、 R^4 および R^5 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を表す) の少なくとも 1 つの化合物は、少なくとも 1 つの酸と適切な反応媒体中において反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 I (X は $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^4$ もしくは $-\text{O} - \text{R}^5$ を表し、 R^1 および $\text{R}^3 \sim \text{R}^5$ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を表し、そして R^2 は水素を表す) の化合物が生成される、

および任意で一般式 I (式中、 X は $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^4$ もしくは $-\text{O} - \text{R}^5$ を表し、 R^1 および $\text{R}^3 \sim \text{R}^5$ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、 R^2 は水素を表す) の少なくとも 1 つの化合物は、適切な反応媒体中において、少なくとも 1 つの触媒の存在下で水素と反応させられると、一般式 I (式中、 X は $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^4$ もしくは $-\text{O} - \text{R}^5$ を表し、 $\text{R}^3 \sim \text{R}^5$ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、 R^1 および R^2 は各々水素を表す) の化合物が生成される、

または

一般式 V I (X は $-\text{C}(=\text{O}) - \text{OR}^4$ を表し、 R^1 および R^2 は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは $-\text{C}(=\text{O}) -$

O - C (C H ₃) ₃ - 基を表し、R³ および R⁴ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の少なくとも 1 つの化合物は、適切な反応媒体中において、少なくとも 1 つの塩基と反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 XV (式中、X は - C (= O) - O H を表し、R¹ および R² は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは - C (= O) - O - C (C H ₃) ₃ - 基を表し、R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の化合物が生成される、および一般式 XV の少なくとも 1 つの化合物は適切な反応媒体中において少なくとも 1 つの酸と反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 I (X は - C (= O) - O H を表し、R¹ および R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、R² は水素を表す) の化合物が生成される、

または

一般式 VI (X は - N O ₂ を表し、R¹ および R² は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは - C (= O) - O - C (C H ₃) ₃ - 基を表し、R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の少なくとも 1 つの化合物は、適切な反応媒体中において少なくとも 1 つの触媒の存在下で水素と反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 XVI (式中、X は - N H ₂ を表し、R¹ および R² は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する、またはそれらの一方は保護基、好ましくは - C (= O) - O - C (C H ₃) ₃ - 基を表し、R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の化合物が生成され、および一般式 XVI の少なくとも 1 つの化合物は適切な反応媒体中において少なくとも 1 つの酸と反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 I (X は - N H ₂ を表し、R¹ および R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、R² は水素を表す) の化合物が生成される、

および

任意で一般式 I (式中、X は - N H ₂ を表し、R¹ および R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有し、そして R² は水素を表す) の少なくとも 1 つの化合物は、一般式 R⁷ - C (= O) - O - C (= O) - R⁷ の少なくとも 1 つの化合物および / または一般式 R¹⁰ - C (= O) - O - C (= O) - R¹⁰ (式中、R⁷ および R¹⁰ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の少なくとも 1 つの化合物と、適切な反応媒体中において、任意で少なくとも 1 つの塩基の存在下で反応させられると、任意で精製および / または単離される一般式 I (式中、X は - N H - C (= O) - R⁷ を表し、R¹ ~ R³ は請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の意味を有する) の化合物が生成される

ことを特徴とする、請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物を調製するためのプロセス。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの置換フェニル - ピペラジン化合物および任意で少なくとも 1 つの生理学的に許容される補助剤を含む薬剤。

【請求項 19】

食物摂取に関連する障害もしくは疾患の予防および / または治療のため、好ましくは食欲の調節のため、体重の維持、増加もしくは減量のため、肥満症、過食症、食欲不振、悪液質、II 型糖尿病 (非インスリン依存型糖尿病)、好ましくは肥満症によって惹起される II 型糖尿病の予防および / または治療のため；脳卒中；偏頭痛、頭部外傷；てんかん；過敏性結腸症候群；過敏性腸症候群；中枢神経系障害；不安；パニック発作；抑うつ；双極性障害；強迫性障害；認知障害；精神病に関連する認知機能障害；記憶障害；老年性認知症；気分障害；睡眠障害；精神病；好ましくはアルツハイマー病 (Morbus Alzheimer)、パーキンソン病 (Morbus Parkinson)、ハンチントン病 (Morbus Huntington) および多発性硬化症からなる群から選択される神経変性障害；統合失調症；慢性間欠性低酸素症；痙攣；もしくは多動性障害 (ADHD、注意欠陥・多動性障害) の予防および / または治療のため；認知 (認知の強化)

もしくは認知記憶（認知記憶の強化）の改善のため；薬物嗜癖および／または離脱症状の予防および／または治療のため；アルコール嗜癖および／または禁断症状の予防および／または治療のため、ニコチン嗜癖および／または禁断症状の予防および／または治療のための、請求項 18 に記載の薬剤。

【請求項 20】

請求項 1～16 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの置換フェニル - ピペラジン化合物を含む薬剤であって、食物摂取に関連する障害もしくは疾患の予防および／または治療のため、好ましくは食欲の調節のため、体重の維持、増加もしくは減量のため、肥満症、過食症、食欲不振、悪液質もしくはⅠⅠ型糖尿病（非インスリン依存型糖尿病）、より好ましくは肥満症の予防および／または治療のための薬剤。

【請求項 21】

請求項 1～16 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの置換フェニル - ピペラジン化合物を含む薬剤であって、脳卒中；偏頭痛；頭部外傷；てんかん；過敏性結腸症候群；過敏性腸症候群；中枢神経系の障害；不安；パニック発作；抑うつ；双極性障害；強迫性障害；認知障害；精神病に関連する認知機能障害；記憶障害；老年性認知症；気分障害；睡眠障害；精神病；好ましくはアルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン病および多発性硬化症からなる群から選択される神経変性障害；統合失調症；慢性間欠性低酸素症；痙攣；もしくは過活動障害（ADHD：注意欠陥・多動性障害）の予防および／または治療のための薬剤。

【請求項 22】

請求項 1～16 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの置換フェニル - ピペラジン化合物を含む薬剤であって、認知の改善（認知の強化）のため、および／または認知記憶の改善（認知記憶の強化）のための薬剤。

【請求項 23】

請求項 1～16 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの置換フェニル - ピペラジン化合物を含む薬剤であって、薬物嗜癖および／または離脱症状の予防および／または治療のため、好ましくはベンゾジアゼピン系、例えばコカイン、エタノールおよび／またはニコチンのような天然、半合成または合成オピオイドからなる群から選択される 1 つまたは複数の薬剤に関連する嗜癖および／または離脱症状の予防および／または治療のための薬剤。