

【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22年8月19日 (2010.8.19)

【公開番号】特開2008-201788(P2008-201788A)

【公開日】平成20年9月4日 (2008.9.4)

【年通号数】公開・登録公報2008-035

【出願番号】特願2008-76759(P2008-76759)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N

A 6 1 K 31/5377

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月7日 (2010.7.7)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

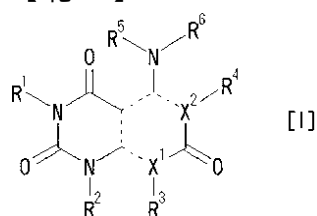
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 [I] で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、腫瘍治療剤。

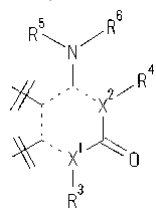
【化 1】



【式中、

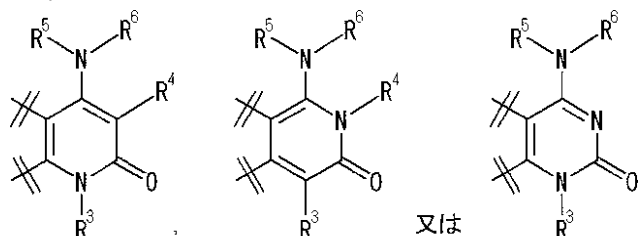
X¹ 及び X² は、同一又は異なって、それぞれ、炭素原子、又は、窒素原子を示し、

【化 2】



部分は、

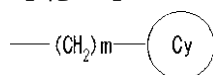
【化 3】



であり、

R^1 、 R^2 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、
 C_{1-6} アルキル基、
 C_{2-6} アルケニル基、
 (ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化 4】



{ 式中、 m は、0又は1乃至4の整数であり、

環 Cy は、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)}であり、

R^3 、 R^4 、及び、 R^5 は、同一又は異なって、それぞれ、

水素原子、

ヒドロキシ基、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、

C_{3-12} 炭素環基、又は、

複素環基であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。) 或いは

R^2 と R^3 とが一緒になって C_{1-4} アルキレン基を形成してもよく、または R^4 と R^5 とが一緒になって C_{1-4} アルキレン基を形成してもよい。

{ ここで、グループAは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-4} アルキル基、

5) $-OR^{A1}$ (ここで R^{A1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-SR^{A2}$ (ここで R^{A2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

7) $-NR^{A3}R^{A4}$ (ここで R^{A3} 及び R^{A4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-COOR^{A5}$ (ここで R^{A5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

、
 9) - $\text{NR}^{\text{A}6} \text{COR}^{\text{A}7}$ (ここで $\text{R}^{\text{A}6}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $\text{R}^{\text{A}7}$ は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、
 10) - $\text{NR}^{\text{A}8} \text{COOR}^{\text{A}9}$ (ここで $\text{R}^{\text{A}8}$ 及び $\text{R}^{\text{A}9}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

11) C_{3-12} 炭素環基、及び、

12) 複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記4)、 $\text{R}^{\text{A}1}$ 、 $\text{R}^{\text{A}2}$ 、 $\text{R}^{\text{A}3}$ 、 $\text{R}^{\text{A}4}$ 、 $\text{R}^{\text{A}5}$ 、 $\text{R}^{\text{A}6}$ 、 $\text{R}^{\text{A}7}$ 、 $\text{R}^{\text{A}8}$ 、及び、 $\text{R}^{\text{A}9}$ の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

また、上記11) 及び $\text{R}^{\text{A}7}$ の C_{3-12} 炭素環基、12) 及び $\text{R}^{\text{A}7}$ の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループBは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) - $\text{OR}^{\text{B}1}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}1}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) - $\text{SR}^{\text{B}2}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}2}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) - $\text{NR}^{\text{B}3} \text{R}^{\text{B}4}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}3}$ は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 $\text{R}^{\text{B}4}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) - $\text{NR}^{\text{B}5} \text{COR}^{\text{B}6}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}5}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $\text{R}^{\text{B}6}$ は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) - $\text{NR}^{\text{B}7} \text{COOR}^{\text{B}8}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}7}$ 及び $\text{R}^{\text{B}8}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) - $\text{NR}^{\text{B}9} \text{CONR}^{\text{B}10} \text{R}^{\text{B}11}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}9}$ 、 $\text{R}^{\text{B}10}$ 及び $\text{R}^{\text{B}11}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) - $\text{NR}^{\text{B}12} \text{CONR}^{\text{B}13} \text{OR}^{\text{B}14}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}12}$ 、 $\text{R}^{\text{B}13}$ 及び $\text{R}^{\text{B}14}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) - $\text{NR}^{\text{B}15} \text{SO}_2 \text{R}^{\text{B}16}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}15}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $\text{R}^{\text{B}16}$ は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) - $\text{SO}_2 - \text{R}^{\text{B}17}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}17}$ は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) - $\text{SO}_2 \text{NR}^{\text{B}18} \text{R}^{\text{B}19}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}18}$ 及び $\text{R}^{\text{B}19}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) - $\text{P}(=\text{O})(\text{R}^{\text{B}20})(\text{R}^{\text{B}21})$ (ここで $\text{R}^{\text{B}20}$ 及び $\text{R}^{\text{B}21}$ は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) - $\text{COOR}^{\text{B}22}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}22}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) - $\text{CONR}^{\text{B}23} \text{R}^{\text{B}24}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}23}$ 及び $\text{R}^{\text{B}24}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) - $\text{NR}^{\text{B}25} \text{SO}_2 \text{NR}^{\text{B}26} \text{R}^{\text{B}27}$ (ここで $\text{R}^{\text{B}25}$ 、 $\text{R}^{\text{B}26}$ 及び $\text{R}^{\text{B}27}$

は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）、
 21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ （ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

（ここで、上記4）の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

5）の C_{2-4} アルケニル基、及び、6）の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記22）、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記23）、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。）

グループCは、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^C1$ （ここで R^C1 は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）、

5) $-NR^C2R^C3$ （ここで R^C2 及び R^C3 は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）、

6) $-COOR^C4$ （ここで R^C4 は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）
 及び、

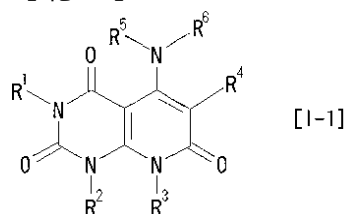
7) オキシ基

からなる群である。}]

【請求項2】

化合物が、下記一般式 [I - 1] で表される、請求項1記載の剤。

【化5】



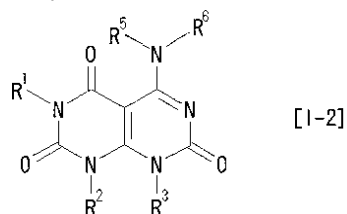
[I-1]

（式中の各記号は、請求項1記載の通りである。）

【請求項3】

化合物が、下記一般式 [I - 2] で表される、請求項1記載の剤。

【化6】



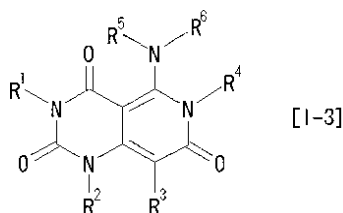
[I-2]

（式中の各記号は、請求項1記載の通りである。）

【請求項 4】

化合物が、下記一般式 [I - 3] で表される、請求項 1 記載の剤。

【化 7】



(式中の各記号は、請求項 1 記載の通りである。)

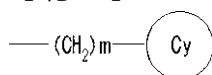
【請求項 5】

R^1 が、 C_{1-6} アルキル基である、請求項 1 記載の剤。

【請求項 6】

R^1 が、

【化 8】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基 (当該 C_{3-12} 炭素環基は、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい) である、請求項 1 又は 4 記載の剤。

【請求項 7】

R^1 が、 C_{3-8} シクロアルキル基である、請求項 1 又は 4 記載の剤。

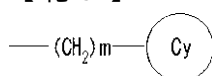
【請求項 8】

R^1 が、シクロプロピル基である、請求項 7 記載の剤。

【請求項 9】

R^2 が、

【化 9】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基 (当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい) である、請求項 1 又は 4 記載の剤。

【請求項 10】

環 Cy が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基である、請求項 9 記載の剤。

【請求項 11】

環 Cy が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 又は 2 個の置換基で置換されたフェニル基である、請求項 10 記載の剤。

【請求項 12】

環 Cy が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基である、請求項 11 記載の剤。

【請求項 13】

グループ B が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチル

アミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン-1-イルスルホニル基、モルホリン-4-イルスルホニル基、ピペリジン-4-イルスルホニル基、ピロリジン-4-イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィノイル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる、請求項 9 乃至 12 のいずれか一項に記載の剤。

【請求項 14】

R^3 が、 C_{1-6} アルキル基である、請求項 1 記載の剤。

【請求項 15】

R^3 が、 C_{1-6} アルキル基である、請求項 4 記載の剤。

【請求項 16】

R^3 が、メチル基である、請求項 15 記載の剤。

【請求項 17】

R^4 が、 C_{1-6} アルキル基である、請求項 4 記載の剤。

【請求項 18】

R^4 が、メチル基である、請求項 17 記載の剤。

【請求項 19】

R^4 が、水素原子である、請求項 1 記載の剤。

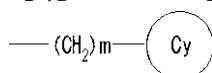
【請求項 20】

R^5 が、水素原子である、請求項 1 記載の剤。

【請求項 21】

R^6 が、

【化 10 - 1】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基（当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい）である、請求項 1 記載の剤。

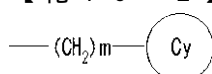
【請求項 22】

R^5 が、水素原子である、請求項 4 記載の剤。

【請求項 23】

R^6 が、

【化 10 - 2】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基（当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい）である、請求項 4 記載の剤。

【請求項 24】

環 Cy が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてい

てもよいフェニル基である、請求項 2 3 記載の剤。

【請求項 2 5】

環 C y が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 又は 2 個の置換基で置換されたフェニル基である、請求項 2 4 記載の剤。

【請求項 2 6】

環 C y が、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる置換基で 2 , 4 位がジ置換されたフェニル基である、請求項 2 5 記載の剤。

【請求項 2 7】

グループ B が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる、請求項 2 3 乃至 2 6 のいずれか一項に記載の剤。

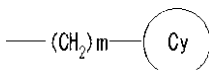
【請求項 2 8】

R⁶ が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、請求項 2 7 記載の剤。

【請求項 2 9】

R¹ が、シクロプロピル基であり、
R² が、

【化 1 0 - 3】



であり、

m が 0 であり、

環 C y が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モ

ルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィノイル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 4 記載の薬剤。

【請求項 30】

請求項 1 記載の一般式 [I] で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、抗腫瘍剤。

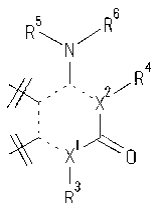
【請求項 31】

請求項 1 記載の一般式 [I] で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、MEK の阻害能を有する薬剤。

【請求項 32】

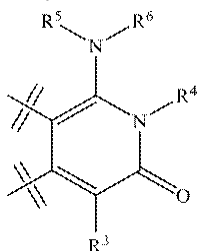
式

【化 10 - 4】



部分が、

【化 10 - 5】

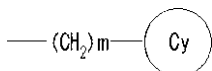


であり、

R^1 が、シクロプロピル基であり、

R^2 が、

【化 10 - 6】



であり、

m が 0 であり、

環 Cy が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1

- プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィノイル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で4位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 3 1 記載の薬剤。

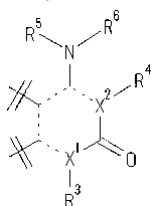
【請求項 3 3】

請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、p 1 5 蛋白の誘導能を有する薬剤。

【請求項 3 4】

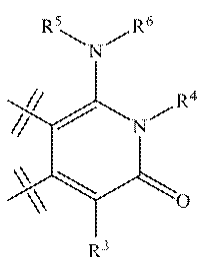
式

【化 1 0 - 7】



部分が、

【化 1 0 - 8】

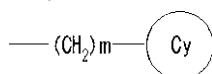


であり、

R^1 が、シクロプロピル基であり、

R^2 が、

【化 1 0 - 9】



であり、

m が 0 であり、

環 C y が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 33 記載の薬剤。

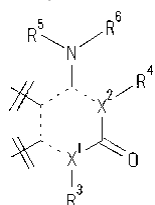
【請求項 35】

請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、望ましくない細胞増殖によって生じる疾患を治療するための薬剤。

【請求項 36】

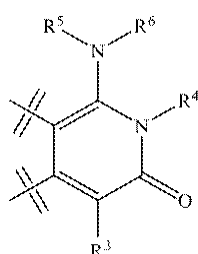
式

【化 10 - 10】



部分が、

【化 10 - 11】

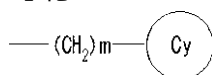


であり、

R^1 が、シクロプロピル基であり、

R^2 が、

【化 10 - 12】



であり、

m が 0 であり、

環 Cy が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロビニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 35 記載の薬剤。

【請求項 37】

望ましくない細胞増殖によって生じる疾患が、リウマチである、請求項 35 又は 36 記載の薬剤。

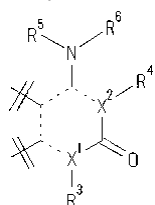
【請求項 38】

請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、望ましくない細胞増殖の阻害能を有する薬剤。

【請求項 39】

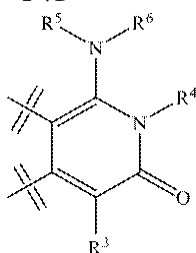
式

【化 10 - 13】



部分が、

【化 1 0 - 1 4】

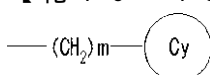


であり、

R^1 が、シクロプロピル基であり、

R^2 が、

【化 1 0 - 1 5】



であり、

m が 0 であり、

環 Cy が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロビニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 38 記載の薬剤。

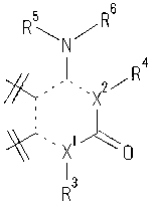
【請求項 40】

請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、細胞周期の調節能を有する薬剤。

【請求項 41】

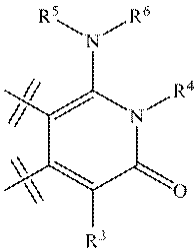
式

【化 10 - 16】



部分が、

【化 10 - 17】

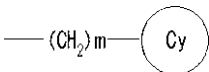


であり、

R^1 が、シクロプロピル基であり、

R^2 が、

【化 10 - 18】



であり、

m が 0 であり、

環 Cy が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R^3 が、メチル基であり、

R^4 が、メチル基であり、

R^5 が、水素原子であり、かつ

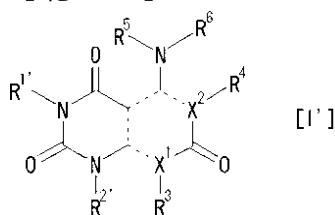
R^6 が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、

請求項 40 記載の薬剤。

【請求項 42】

下記一般式 [I'] で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【化 11】



[式中、

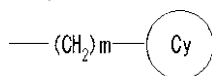
R^{1'}、R^{2'}、及び、R⁶は、同一又は異なって、それぞれ、

C₁ - 6 アルキル基、

C₂ - 6 アルケニル基、

(ここで、当該 C₁ - 6 アルキル基、及び、C₂ - 6 アルケニル基は、請求項 1 記載のグループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化 12】



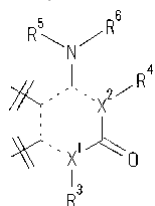
{ m は、0 又は 1 乃至 4 の整数であり、

環 Cy は、C₃ - 12 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和、又は、不飽和の環であって、当該 C₃ - 12 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 1 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)} であり、

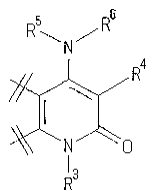
(ただし、

【化 13】



部分が、

【化 14】



のとき、

条件として、

R^{2'} はメチル基ではなく、

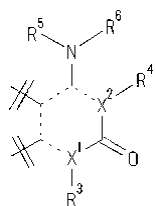
また、R^{2'} がフェニル基のとき、R^{1'} はフェニル基ではない。)

その他各記号は、請求項 1 記載の通りである。]

【請求項 43】

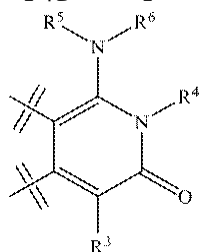
式

【化 15】



部分が、

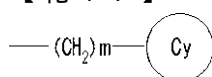
【化 16】



であり、

R¹ が、シクロプロピル基であり、R² が、

【化 17】



であり、

m が 0 であり、

環 Cy が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1-プロピニル基、1-ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン-1-イルスルホニル基、モルホリン-4-イルスルホニル基、ピペリジン-4-イルスルホニル基、ピロリジン-4-イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基であり、

R³ が、メチル基であり、R⁴ が、メチル基であり、

R⁵ が、水素原子であり、かつ

R⁶ が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、
請求項 4 2 記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

(b) 少なくとも 1 つの他の抗腫瘍化合物と併用される、(a) 請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、抗腫瘍剤。

【請求項 4 5】

(a) 有効成分として、請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物、及び (b) 少なくとも 1 つの他の抗腫瘍化合物を併用してなる、抗腫瘍剤。

【請求項 4 6】

有効成分として、(a) 請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物、及び (b) 少なくとも 1 つの他の抗腫瘍化合物、並びに製薬上許容される担体を組み合わせて含有する医薬組成物。

【請求項 4 7】

(a) 請求項 1 記載の一般式 [I] の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する医薬組成物、及び (b) 少なくとも 1 つの他の抗腫瘍剤を有効成分として含有する医薬組成物を組み合わせて含有する腫瘍の治療用キット。

【請求項 4 8】

N - { 3 - [3 - シクロプロピル - 5 - (2 - フルオロ - 4 - ヨードフェニルアミノ) - 6 , 8 - ジメチル - 2 , 4 , 7 - トリオキソ - 3 , 4 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 1 - イル] - フェニル } - アセトアミド、またはその製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、請求項 1 記載の剤。

【請求項 4 9】

ナトリウム塩である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 0】

水和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 1】

酢酸溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 2】

ジメチルスルホキシド溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 3】

エタノール溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 4】

ニトロメタン溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 5】

クロロベンゼン溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 6】

1 - ペンタノール溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 7】

イソプロピルアルコール溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 8】

エチレングリコール溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 5 9】

3 - メチル - 1 - ブタノール溶媒和物である、請求項 4 8 記載の剤。

【請求項 6 0】

N - { 3 - [3 - シクロプロピル - 5 - (4 - エチニル - 2 - フルオロフェニルアミノ)

)-6, 8-ジメチル-2, 4, 7-トリオキソ-3, 4, 6, 7-テトラヒドロ-2H-ピリド[4, 3-d]ピリミジン-1-イル}フェニル}アセトアミド、またはその製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、請求項1記載の剤。

【請求項61】

酢酸溶媒和物である、請求項60記載の剤。

【請求項62】

N-{3-[5-(2-フルオロ-4-ヨードフェニルアミノ)-3, 6, 8-トリメチル-2, 4, 7-トリオキソ-3, 4, 6, 7-テトラヒドロ-2H-ピリド[4, 3-d]ピリミジン-1-イル}フェニル}メタンスルホンアミド、またはその製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、請求項1記載の剤。

【請求項63】

ナトリウム塩である、請求項62記載の剤。

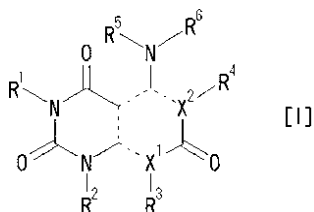
【請求項64】

N-{3-[3-シクロプロピル-5-(2-フルオロ-4-ヨードフェニルアミノ)-6, 8-ジメチル-2, 4, 7-トリオキソ-3, 4, 6, 7-テトラヒドロ-2H-ピリド[4, 3-d]ピリミジン-1-イル}フェニル}メタンスルホンアミド、またはその製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、請求項1記載の剤。

【請求項65】

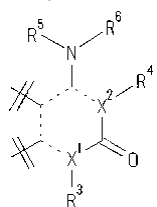
下記一般式[I]で表される化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【化18】



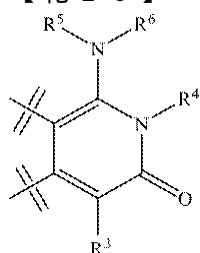
[式中、

【化19】



部分は、

【化20】



であり、

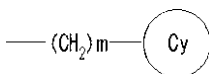
R^1 、 R^2 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化21】



{式中、mは、0又は1乃至4の整数であり、

環Cyは、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)}であり、

R^3 、 R^4 、及び、 R^5 は、同一又は異なって、それぞれ、

水素原子、

ヒドロキシ基、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、

C_{3-12} 炭素環基、又は、

複素環基であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)或いは

R^2 と R^3 とが一緒になって C_{1-4} アルキレン基を形成してもよく、または R^4 と R^5 とが一緒になって C_{1-4} アルキレン基を形成してもよい。

{ここで、グループAは、

1)ハロゲン原子、

2)ニトロ基、

3)シアノ基、

4) C_{1-4} アルキル基、

5)- $\text{OR}^{\text{A}1}$ (ここで $R^{\text{A}1}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6)- $\text{SR}^{\text{A}2}$ (ここで $R^{\text{A}2}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

7)- $\text{NR}^{\text{A}3}\text{R}^{\text{A}4}$ (ここで $R^{\text{A}3}$ 及び $R^{\text{A}4}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8)- $\text{COOR}^{\text{A}5}$ (ここで $R^{\text{A}5}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

9)- $\text{NR}^{\text{A}6}\text{COR}^{\text{A}7}$ (ここで $R^{\text{A}6}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $R^{\text{A}7}$ は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

10)- $\text{NR}^{\text{A}8}\text{COOR}^{\text{A}9}$ (ここで $R^{\text{A}8}$ 及び $R^{\text{A}9}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

11) C_{3-12} 炭素環基、及び、

12)複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記 4)、 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{A3} 、 R^{A4} 、 R^{A5} 、 R^{A6} 、 R^{A7} 、 R^{A8} 、及び、 R^{A9} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、

また、上記 11) 及び R^{A7} の C_{3-12} 炭素環基、12) 及び R^{A7} の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)

グループ B は、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) $-NR^{B9}CONR^{B10}R^{B11}$ (ここで R^{B9} 、 R^{B10} 及び R^{B11} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) $-NR^{B12}CONR^{B13}OR^{B14}$ (ここで R^{B12} 、 R^{B13} 及び R^{B14} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) $-NR^{B15}SO_2R^{B16}$ (ここで R^{B15} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B16} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) $-SO_2-R^{B17}$ (ここで R^{B17} は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) $-SO_2NR^{B18}R^{B19}$ (ここで R^{B18} 及び R^{B19} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) $-P(=O)(R^{B20})(R^{B21})$ (ここで R^{B20} 及び R^{B21} は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) $-COOR^{B22}$ (ここで R^{B22} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) $-CONR^{B23}R^{B24}$ (ここで R^{B23} 及び R^{B24} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) $-NR^{B25}SO_2NR^{B26}R^{B27}$ (ここで R^{B25} 、 R^{B26} 及び R^{B27} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ (ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

(ここで、上記 4) の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置

換されてもよく、

5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記 2 2)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記 2 3)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。))

グループ C は、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^{C1}$ (ここで R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

5) $-NR^{C2}R^{C3}$ (ここで R^{C2} 及び R^{C3} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-COOR^{C4}$ (ここで R^{C4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

及び、

7) オキシ基

からなる群である。}

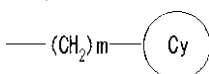
ただし、 R^2 がフェニル基のとき、 R^1 はフェニル基ではない。]

(ここで、該化合物は、 $-CO-$ アルキル、 $-CO_2-$ アルキル、 $-CO-$ アルケニル、 $-CO_2-$ アルケニル、 $-CO_2-$ アリール、 $-CO-$ アリール、 $-CO-$ 複素環、 $-CO_2-$ 複素環、および $-PO_3H_2$ (ここで、アルキル、アルケニル、アリール及び複素環はハロゲン原子、アルキル基、ヒドロキシ基、アルコキシ基、カルボキシ基、アミノ基、アミノ酸残基、 $-PO_3H_2$ 、 $-SO_3H$ 、 $-OPO_3H_2$ 、又は $-OSO_3H$ で置換されてもよい。) から選ばれる置換基で置換された、少なくとも一つの $-NH_2$ 基を有する。)

【請求項 6 6】

R^1 が、

【化 2 2】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基 (当該 C_{3-12} 炭素環基は、請求項 6 5 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい) である、請求項 6 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 6 7】

R^1 が、 C_{3-8} シクロアルキル基である、請求項 6 6 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

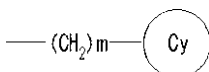
【請求項 6 8】

R^1 が、シクロプロピル基である、請求項 6 7 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 6 9】

R^2 が、

【化 2 3】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基 (当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 6 5 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置

換基で置換されてもよい)である、請求項 6 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 0】

環 C y が、請求項 6 5 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基である、請求項 6 9 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 1】

環 C y が、請求項 6 5 記載のグループ B から選ばれる 1 又は 2 個の置換基で置換されたフェニル基である、請求項 7 0 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 2】

環 C y が、請求項 6 5 記載のグループ B から選ばれる置換基で 4 位がモノ置換されたフェニル基である、請求項 7 1 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 3】

グループ B が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1 - エチルプロピル基、1 - プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1 - プロピニル基、1 - ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、(メチルカルボニル)(メチル)アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、(メチルスルホニル)(メチル)アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン - 1 - イルスルホニル基、モルホリン - 4 - イルスルホニル基、ピペリジン - 4 - イルスルホニル基、ピロリジン - 4 - イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる、請求項 6 9 乃至 7 2 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 4】

グループ B が、アミノ基、アミノスルホニル基及びカルバモイル基から選ばれる、請求項 7 3 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 5】

R³ が、C₁ - ₆ アルキル基である、請求項 6 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 6】

R³ が、メチル基である、請求項 7 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 7】

R⁴ が、C₁ - ₆ アルキル基である、請求項 6 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7 8】

R⁴ が、メチル基である、請求項 7 7 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

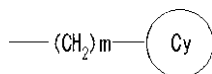
【請求項 79】

R^5 が、水素原子である、請求項 65 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 80】

R^6 が、

【化 24】



であり、 m が 0 であり、環 Cy が C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基（当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、請求項 65 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい）である、請求項 65 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 81】

環 Cy が、請求項 65 記載のグループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されていてもよいフェニル基である、請求項 80 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 82】

環 Cy が、請求項 65 記載のグループ B から選ばれる 1 又は 2 個の置換基で置換されたフェニル基である、請求項 81 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 83】

環 Cy が、請求項 65 記載のグループ B から選ばれる置換基で 2, 4 位がジ置換されたフェニル基である、請求項 82 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 84】

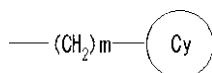
グループ B が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ニトロ基、シアノ基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、1-エチルプロピル基、1-プロピルブチル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、ビニル基、エチニル基、1-プロピニル基、1-ブチニル基、ヒドロキシ基、メトキシ基、プロボキシ基、イソプロボキシ基、メチルチオ基、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、メチルカルボニルアミノ基、エチルカルボニルアミノ基、プロピルカルボニルアミノ基、イソプロピルカルボニルアミノ基、（メチルカルボニル）（メチル）アミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、メチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノカルボニルアミノ基、メトキシアミノカルボニルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、エチルスルホニルアミノ基、プロピルスルホニルアミノ基、イソプロピルスルホニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、（メチルスルホニル）（メチル）アミノ基、メチルスルホニル基、ピペラジン-1-イルスルホニル基、モルホリン-4-イルスルホニル基、ピペリジン-4-イルスルホニル基、ピロリジン-4-イルスルホニル基、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジメチルホスフィニル基、カルボキシ基、メトキシカルボニル基、カルバモイル基、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニルアミノ基、ジメチルアミノスルホニルアミノ基、シクロプロピル基、フェニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基及びモルホリニル基から選ばれる、請求項 80 乃至 83 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 85】

R^6 が、4-シクロプロピル-2-フルオロフェニル基である、請求項 84 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 86】

R¹ が、シクロプロピル基であり、
R² が、
【化 2 5】



であり、
m が 0 であり、
環 Cy が、アミノ基、アミノスルホニル基及びカルバモイル基から選ばれる置換基で 4 位
がモノ置換されたフェニル基であり、
R³ が、メチル基であり、
R⁴ が、メチル基であり、
R⁵ が、水素原子であり、かつ
R⁶ が、4 - シクロプロピル - 2 - フルオロフェニル基である、
請求項 6 5 記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又はその水和物もしくは溶媒和物

【請求項 8 7】

請求項 6 5 乃至 8 6 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又は
その水和物もしくは溶媒和物、及び製薬上許容される担体を含有する医薬組成物。

【請求項 8 8】

請求項 6 5 乃至 8 6 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又は
その水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、望ましくない細胞増殖によって
生じる疾患を治療するための薬剤。

【請求項 8 9】

請求項 6 5 乃至 8 6 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又は
その水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、MEK の阻害能を有する薬剤。

【請求項 9 0】

請求項 6 5 乃至 8 6 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又は
その水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、p 1 5 蛋白の誘導能を有する薬
剤。

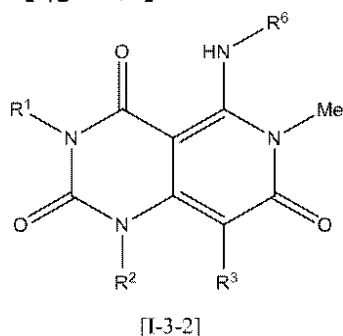
【請求項 9 1】

請求項 6 5 乃至 8 6 のいずれか一項に記載の化合物又は製薬上許容されるその塩、又は
その水和物もしくは溶媒和物を有効成分として含有する、細胞周期の調節能を有する薬剤

【請求項 9 2】

下記一般式 [I - 3 - 2]

【化 2 6】



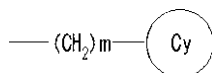
[式中、

R¹、R²、及び、R⁶ は、同一又は異なって、それぞれ、
C₁ - 6 アルキル基、

C₂₋₆ アルケニル基、

(ここで、当該 C₁₋₆ アルキル基、及び、C₂₋₆ アルケニル基は、下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化 27】



{ 式中、m は、0 又は 1 乃至 4 の整数であり、

環 Cy は、C₃₋₁₂ 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C₃₋₁₂ 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)} であり、

R³ は、

水素原子、

ヒドロキシ基、

C₁₋₆ アルキル基、

C₂₋₆ アルケニル基、

(ここで、当該 C₁₋₆ アルキル基、及び、C₂₋₆ アルケニル基は、下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。)、

C₃₋₁₂ 炭素環基、又は、

複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C₃₋₁₂ 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)

{ ここで、グループ A は、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C₁₋₄ アルキル基、

5) -OR^{A1} (ここで R^{A1} は、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基である。)、

6) -SR^{A2} (ここで R^{A2} は、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基である。)、

7) -NR^{A3}R^{A4} (ここで R^{A3} 及び R^{A4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基である。)、

8) -COOR^{A5} (ここで R^{A5} は、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基である。)

、

9) -NR^{A6}COR^{A7} (ここで R^{A6} は、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基であり、R^{A7} は、C₁₋₄ アルキル基、C₃₋₁₂ 炭素環基、又は、複素環基である。)、

10) -NR^{A8}COOR^{A9} (ここで R^{A8} 及び R^{A9} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、C₁₋₄ アルキル基である。)、

11) C₃₋₁₂ 炭素環基、及び、

12) 複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記 4)、R^{A1}、R^{A2}、R^{A3}、R^{A4}、R^{A5}、R^{A6}、R^{A7}、R^{A8}、及び、R^{A9} の C₁₋₄ アルキル基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、

また、上記 11) 及び R^{A7} の C₃₋₁₂ 炭素環基、12) 及び R^{A7} の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換され

てもよい。)

グループ B は、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) $-NR^{B9}CONR^{B10}R^{B11}$ (ここで R^{B9} 、 R^{B10} 及び R^{B11} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) $-NR^{B12}CONR^{B13}OR^{B14}$ (ここで R^{B12} 、 R^{B13} 及び R^{B14} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) $-NR^{B15}SO_2R^{B16}$ (ここで R^{B15} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B16} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) $-SO_2-R^{B17}$ (ここで R^{B17} は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) $-SO_2NR^{B18}R^{B19}$ (ここで R^{B18} 及び R^{B19} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) $-P(=O)(R^{B20})(R^{B21})$ (ここで R^{B20} 及び R^{B21} は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) $-COOR^{B22}$ (ここで R^{B22} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) $-CONR^{B23}R^{B24}$ (ここで R^{B23} 及び R^{B24} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) $-NR^{B25}SO_2NR^{B26}R^{B27}$ (ここで R^{B25} 、 R^{B26} 及び R^{B27} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ (ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

(ここで、上記 4) の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、

5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記 2 2)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記 2 3)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)

グループ C は、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^{C1}$ (ここで R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

5) $-NR^{C2}R^{C3}$ (ここで R^{C2} 及び R^{C3} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-COOR^{C4}$ (ここで R^{C4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

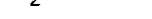
及び、

7) オキシ基

からなる群である。}] で表される化合物の製造方法であって、

(a) 一般式 [4 5]

【化 2 8】

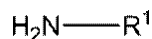


[45]

(式中、 R^6 は前述の通りである。)

で表される化合物を一般式 [1]

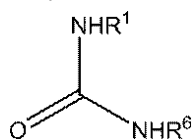
【化 2 9】



[1]

(式中、 R^1 は前述の通りである。) で表される化合物と反応させて、一般式 [2 8]

【化 3 0】

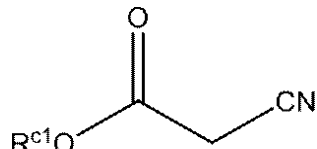


[28]

(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；

(b) 一般式 [2 8] で表される化合物を一般式 [3 8]

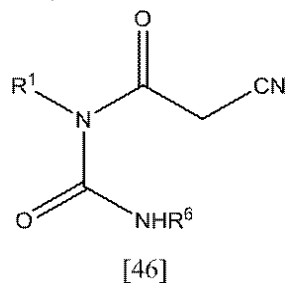
【化 3 1】



[38]

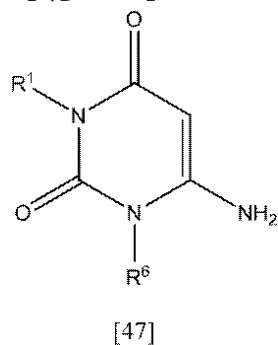
(式中、 R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-6} アルキル基である。) で表される化合物と反応させて、一般式 [4 6]

【化 3 2】



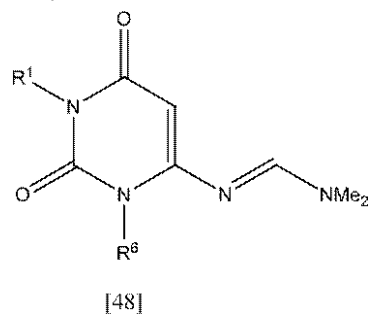
(式中、R¹ および R⁶ は前述の通りである。) で表される化合物を得；
 (c) 一般式 [4 6] で表される化合物を一般式 [4 7]

【化 3 3】



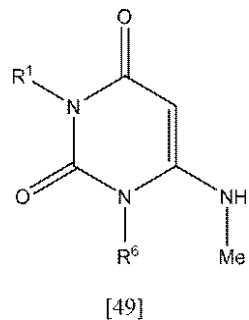
(式中、R¹ および R⁶ は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；
 (d) 一般式 [4 7] で表される化合物を一般式 [4 8]

【化 3 4】



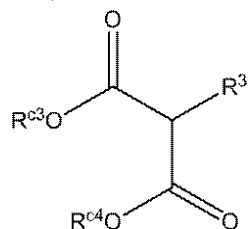
(式中、R¹ および R⁶ は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；
 (e) 一般式 [4 8] で表される化合物を一般式 [4 9]

【化 3 5】



(式中、R¹ および R⁶ は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；
 (f) 一般式 [4 9] で表される化合物を一般式 [3 3]

【化 3 6】

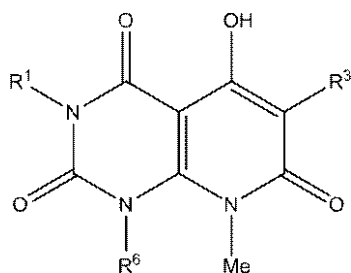


[33]

(式中、 R^3 は前述の通りであり、

R^{c3} および R^{c4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-6} アルキル基である。) で表される化合物と反応させて、一般式 [5 0]

【化 3 7】

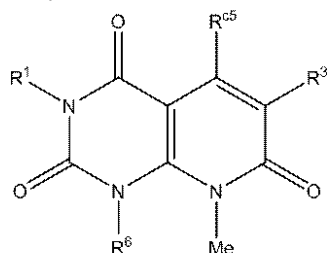


[50]

(式中、 R^1 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；

(g) 一般式 [5 0] で表される化合物を一般式 [5 1]

【化 3 8】



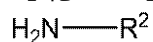
[51]

(式中、 R^1 、 R^3 および R^6 は前述の通りであり、

R^{c5} は、脱離基である。) で表される化合物に変換し；

(h) 一般式 [5 1] で表される化合物を一般式 [3 6]

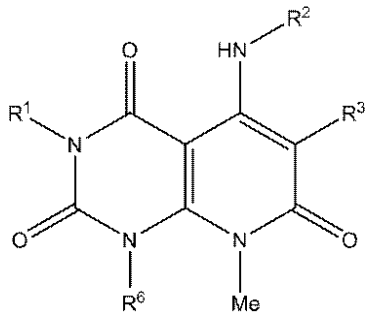
【化 3 9】



[36]

(式中、 R^2 は前述の通りである。) で表される化合物と反応させて、一般式 [5 2]

【化 4 0】

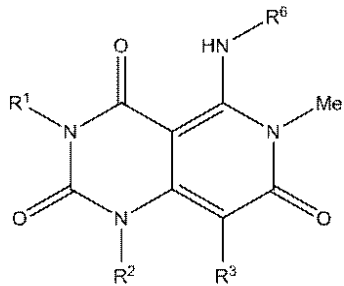


[52]

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；及
び

(i) 一般式 [5 2] で表される化合物を一般式 [I - 3 - 2]

【化 4 1】



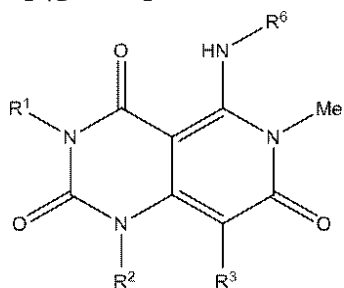
[I-3-2]

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物に変換する工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 3】

下記一般式 [I - 3 - 2]

【化 4 2】



[I-3-2]

[式中、

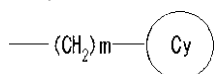
R^1 、 R^2 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化 4 3】



{ 式中、 m は、0又は1乃至4の整数であり、

環 C_y は、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。) } であり、

R^3 は、

水素原子、

ヒドロキシ基、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、

C_{3-12} 炭素環基、又は、

複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

{ ここで、グループAは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-4} アルキル基、

5) $-OR^{A1}$ (ここで R^{A1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-SR^{A2}$ (ここで R^{A2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

7) $-NR^{A3}R^{A4}$ (ここで R^{A3} 及び R^{A4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-COOR^{A5}$ (ここで R^{A5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

、

9) $-NR^{A6}COR^{A7}$ (ここで R^{A6} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{A7} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

10) $-NR^{A8}COOR^{A9}$ (ここで R^{A8} 及び R^{A9} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

11) C_{3-12} 炭素環基、及び、

12) 複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記4)、 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{A3} 、 R^{A4} 、 R^{A5} 、 R^{A6} 、 R^{A7} 、 R^{A8} 、及び、 R^{A9} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

また、上記11) 及び R^{A7} の C_{3-12} 炭素環基、12) 及び R^{A7} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループBは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) $-NR^{B9}CONR^{B10}R^{B11}$ (ここで R^{B9} 、 R^{B10} 及び R^{B11} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) $-NR^{B12}CONR^{B13}OR^{B14}$ (ここで R^{B12} 、 R^{B13} 及び R^{B14} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) $-NR^{B15}SO_2R^{B16}$ (ここで R^{B15} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B16} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) $-SO_2-R^{B17}$ (ここで R^{B17} は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) $-SO_2NR^{B18}R^{B19}$ (ここで R^{B18} 及び R^{B19} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) $-P(=O)(R^{B20})(R^{B21})$ (ここで R^{B20} 及び R^{B21} は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) $-COOR^{B22}$ (ここで R^{B22} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) $-CONR^{B23}R^{B24}$ (ここで R^{B23} 及び R^{B24} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) $-NR^{B25}SO_2NR^{B26}R^{B27}$ (ここで R^{B25} 、 R^{B26} 及び R^{B27} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ (ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

(ここで、上記4)の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記22)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記23)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループCは、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^{C1}$ (ここで R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

5) $-NR^{C2}R^{C3}$ (ここで R^{C2} 及び R^{C3} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

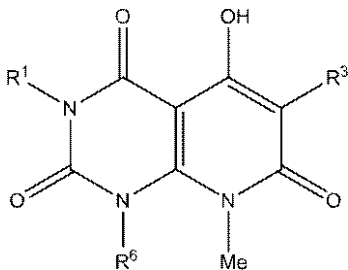
6) $-COOR^{C4}$ (ここで R^{C4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)
及び、

7) オキソ基

からなる群である。}] で表される化合物の製造方法であって、

(a) 一般式 [5 0]

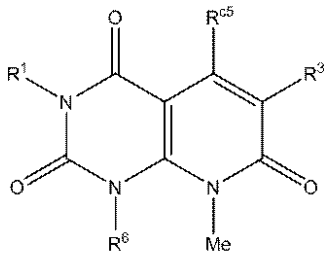
【化 4 4】



[50]

(式中、 R^1 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を一般式 [5 1]

【化 4 5】

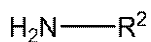


[51]

(式中、 R^1 、 R^3 および R^6 は前述の通りであり、 R^{C5} は、脱離基である。) で表される化合物に変換し；

(b) 一般式 [5 1] で表される化合物を一般式 [3 6]

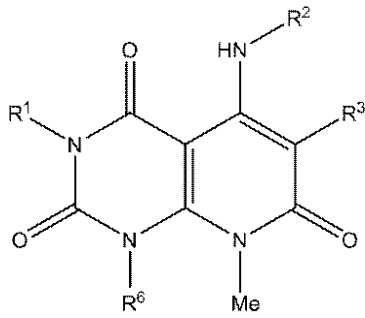
【化 4 6】



[36]

(式中、 R^2 は前述の通りである。) で表される化合物と反応させて、一般式 [5 2]

【化 4 7】

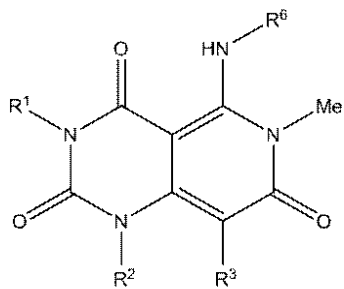


[52]

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；及
び

(c) 一般式 [5 2] で表される化合物を一般式 [I - 3 - 2]

【化 4 8】



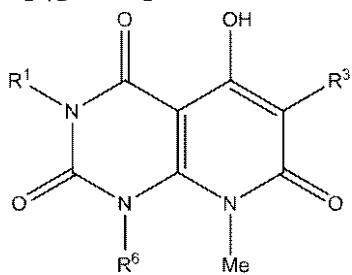
[I-3-2]

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物に変換する工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 4】

下記一般式 [5 0]

【化 4 9】



[50]

[式中、

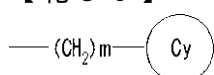
R^1 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループ A から選ばれる 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよい。)、又は、

【化 5 0】



{ 式中、 m は、0又は1乃至4の整数であり、

環 C_y は、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。) } であり、

R^3 は、

水素原子、

ヒドロキシ基、

C_{1-6} アルキル基、

C_{2-6} アルケニル基、

(ここで、当該 C_{1-6} アルキル基、及び、 C_{2-6} アルケニル基は、下記グループAから選ばれる1乃至3個の置換基で置換されてもよい。)、

C_{3-12} 炭素環基、又は、

複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

{ ここで、グループAは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-4} アルキル基、

5) $-OR^{A1}$ (ここで R^{A1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-SR^{A2}$ (ここで R^{A2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

7) $-NR^{A3}R^{A4}$ (ここで R^{A3} 及び R^{A4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-COOR^{A5}$ (ここで R^{A5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

、

9) $-NR^{A6}COR^{A7}$ (ここで R^{A6} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{A7} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

10) $-NR^{A8}COOR^{A9}$ (ここで R^{A8} 及び R^{A9} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

11) C_{3-12} 炭素環基、及び、

12) 複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記4)、 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{A3} 、 R^{A4} 、 R^{A5} 、 R^{A6} 、 R^{A7} 、 R^{A8} 、及び、 R^{A9} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

また、上記11) 及び R^{A7} の C_{3-12} 炭素環基、12) 及び R^{A7} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループBは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) $-NR^{B9}CONR^{B10}R^{B11}$ (ここで R^{B9} 、 R^{B10} 及び R^{B11} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) $-NR^{B12}CONR^{B13}OR^{B14}$ (ここで R^{B12} 、 R^{B13} 及び R^{B14} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) $-NR^{B15}SO_2R^{B16}$ (ここで R^{B15} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B16} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) $-SO_2-R^{B17}$ (ここで R^{B17} は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) $-SO_2NR^{B18}R^{B19}$ (ここで R^{B18} 及び R^{B19} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) $-P(=O)(R^{B20})(R^{B21})$ (ここで R^{B20} 及び R^{B21} は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) $-COOR^{B22}$ (ここで R^{B22} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) $-CONR^{B23}R^{B24}$ (ここで R^{B23} 及び R^{B24} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) $-NR^{B25}SO_2NR^{B26}R^{B27}$ (ここで R^{B25} 、 R^{B26} 及び R^{B27} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ (ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

(ここで、上記4)の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記22)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記23)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループCは、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^{C1}$ (ここで R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

5) $-NR^{C2}R^{C3}$ (ここで R^{C2} 及び R^{C3} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

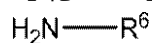
6) $-COOR^{C4}$ (ここで R^{C4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)
及び、

7) オキシ基

からなる群である。}] で表される化合物の製造方法であって、

(a) 一般式 [45]

【化 5 1】

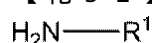


[45]

(式中、 R^6 は前述の通りである。)

で表される化合物を一般式 [1]

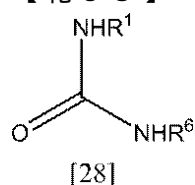
【化 5 2】



[1]

(式中、 R^1 は前述の通りである。) で表される化合物と反応させて、一般式 [28]

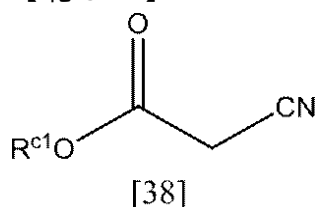
【化 5 3】



(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；

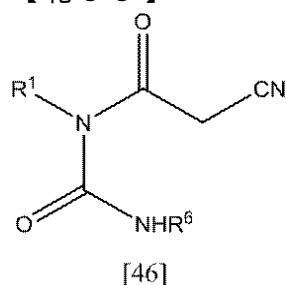
(b) 一般式 [28] で表される化合物を一般式 [38]

【化 5 4】



(式中、 R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-6} アルキル基である。) で表される化合物と反応させて、一般式 [46]

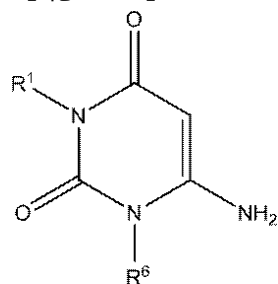
【化 5 5】



(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得；

(c) 一般式 [4 6] で表される化合物を一般式 [4 7]

【化 5 6】

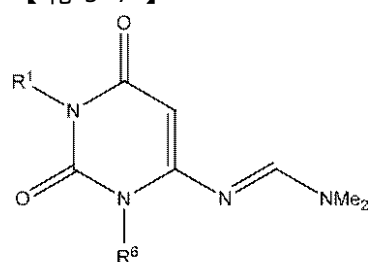


[47]

(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；

(d) 一般式 [4 7] で表される化合物を一般式 [4 8]

【化 5 7】

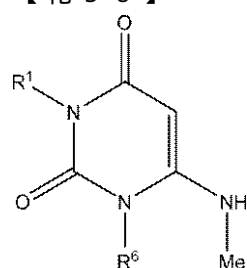


[48]

(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；

(e) 一般式 [4 8] で表される化合物を一般式 [4 9]

【化 5 8】

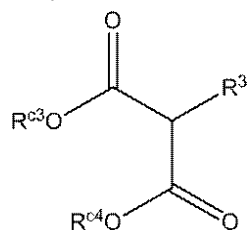


[49]

(式中、 R^1 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物に変換し；及び

(f) 一般式 [4 9] で表される化合物を一般式 [3 3]

【化 5 9】

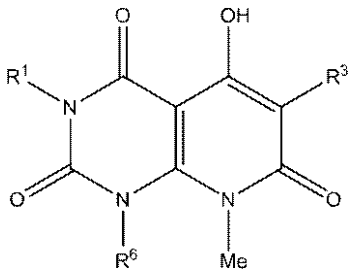


[33]

(式中、 R^3 は前述の通りであり、

R^{c3} および R^{c4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-6} アルキル基である。) で表される化合物と反応させて、一般式 [5 0]

【化 6 0】



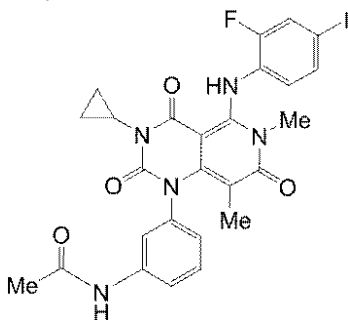
[50]

(式中、 R^1 、 R^3 および R^6 は前述の通りである。) で表される化合物を得る工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 5】

式

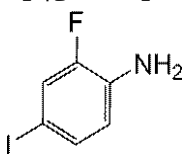
【化 6 1】



で表される化合物、その塩、又はその溶媒和物の製造方法であって、

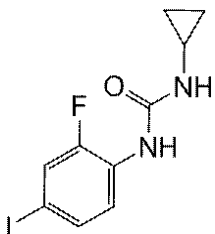
(a) 式

【化 6 2】



で表される化合物をシクロプロピルアミンと反応させて、式

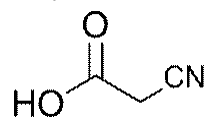
【化 6 3】



で表される化合物を得；

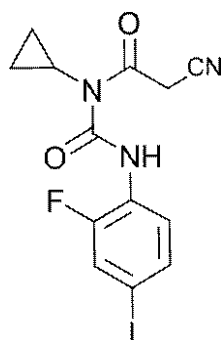
(b) 工程 (a) の生成物を式

【化 6 4】



で表される化合物と反応させて、式

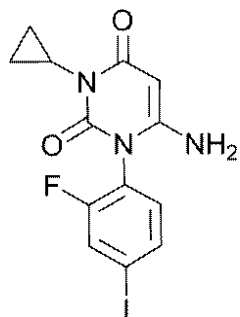
【化 6 5】



で表される化合物を得；

(c) 工程 (b) の生成物を式

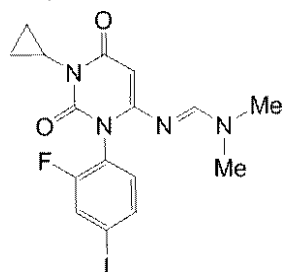
【化 6 6】



で表される化合物に変換し；

(d) 工程 (c) の生成物を式

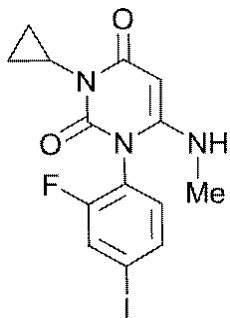
【化 6 7】



で表される化合物に変換し；

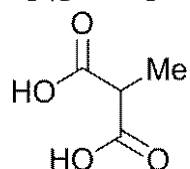
(e) 工程 (d) の生成物を式

【化 6 8】



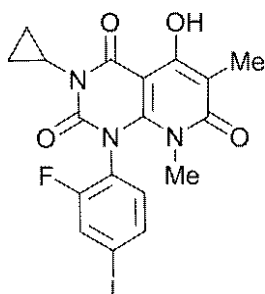
で表される化合物に変換し；
 (f) 工程 (e) の生成物を式

【化 6 9】



で表される化合物と反応させて、式

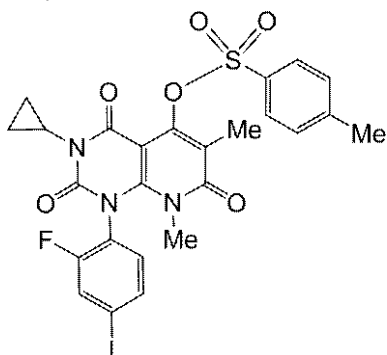
【化 7 0】



で表される化合物を得；

(g) 工程 (f) の生成物を式

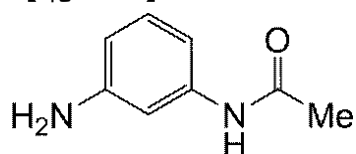
【化 7 1】



で表される化合物に変換し；

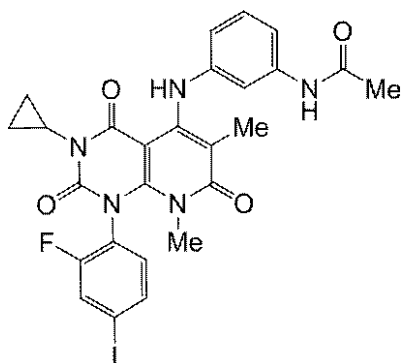
(h) 工程 (g) の生成物を式

【化 7 2】



で表される化合物と反応させて、式

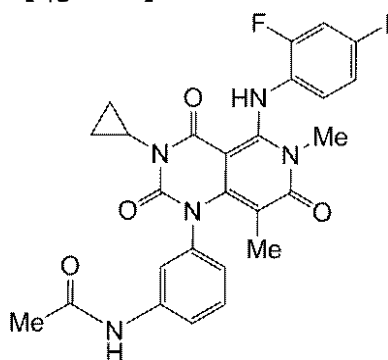
【化 7 3】



で表される化合物を得；

(i) 工程 (h) の生成物を式

【化 7 4】



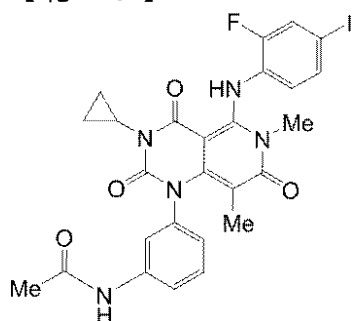
で表される化合物に変換し；及び

(j) 任意に、工程 (i) の生成物を塩または溶媒和物に変換する工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 6】

式

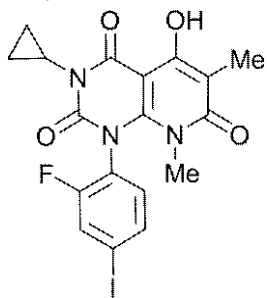
【化 7 5】



で表される化合物、その塩、又はその溶媒和物の製造方法であって、

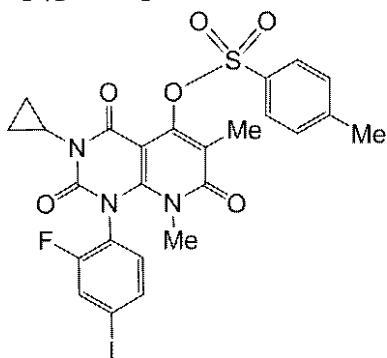
(a) 式

【化 7 6】



で表される化合物を式

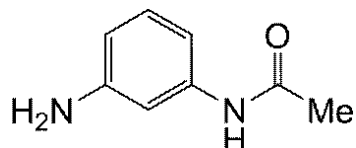
【化 7 7】



で表される化合物に変換し；

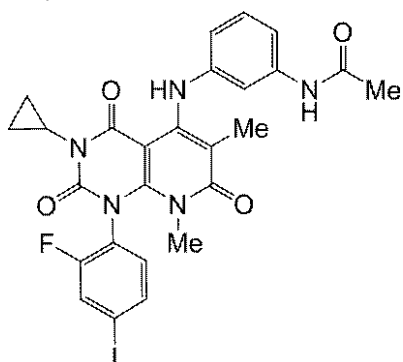
(b) 工程 (a) の生成物を式

【化 7 8】



で表される化合物と反応させて、式

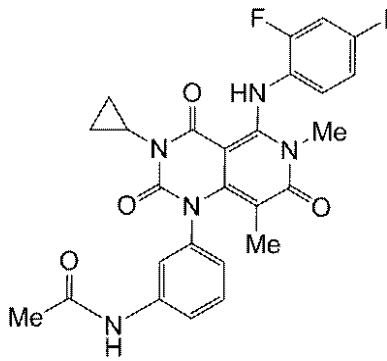
【化 7 9】



で表される化合物を得；

(c) 工程 (b) の生成物を式

【化 8 0】



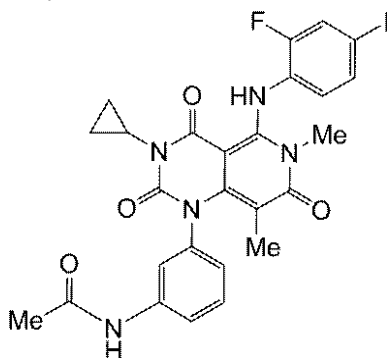
で表される化合物に変換し；及び

(d) 任意に、工程(c)の生成物を塩または溶媒和物に変換する工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 7】

さらに、式

【化 8 1】

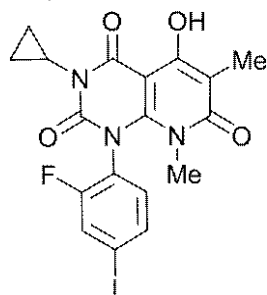


で表される化合物を溶媒和物に変換することを特徴とする、請求項 9 5 又は 9 6 記載の製造方法。

【請求項 9 8】

式

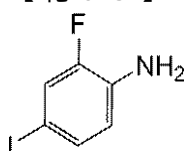
【化 8 2】



で表される化合物の製造方法であって、

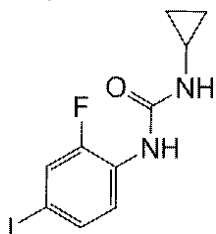
(a) 式

【化 8 3】



で表される化合物をシクロプロピルアミンと反応させて、式

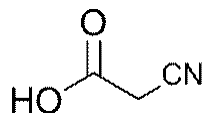
【化 8 4】



で表される化合物を得；

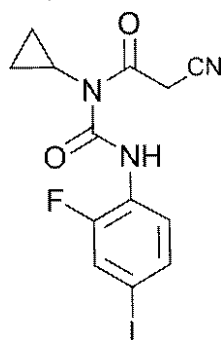
(b) 工程 (a) の生成物を式

【化 8 5】



で表される化合物と反応させて、式

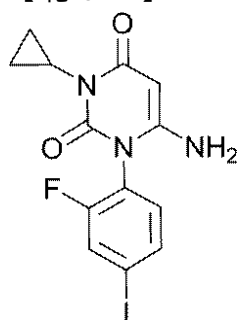
【化 8 6】



で表される化合物を得；

(c) 工程 (b) の生成物を式

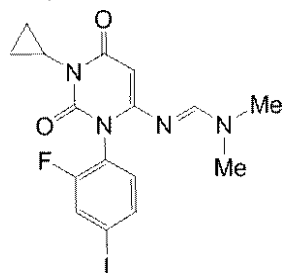
【化 8 7】



で表される化合物に変換し；

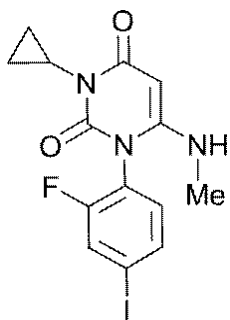
(d) 工程 (c) の生成物を式

【化 8 8】



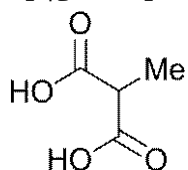
で表される化合物に変換し；
 (e) 工程 (d) の生成物を式

【化 8 9】



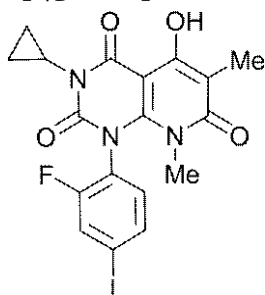
で表される化合物に変換し；
 (f) 工程 (e) の生成物を式

【化 9 0】



で表される化合物と反応させて、式

【化 9 1】

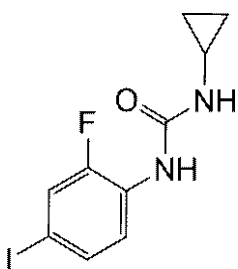


で表される化合物を得る工程を含むことを特徴とする当該方法。

【請求項 9 9】

式

【化 9 2】

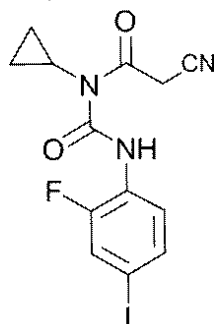


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 1 0 0】

式

【化 9 3】

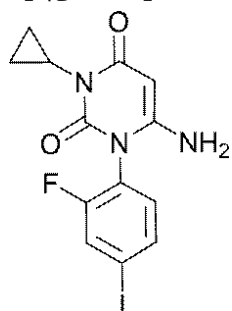


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 1 0 1】

式

【化 9 4】

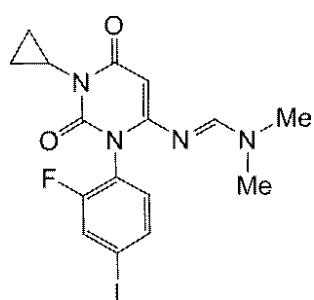


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 1 0 2】

式

【化 9 5】

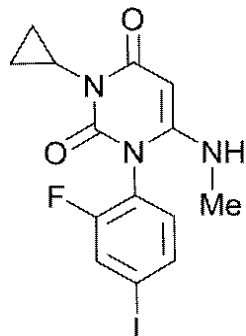


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 1 0 3】

式

【化 9 6】

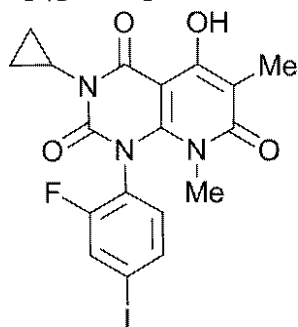


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 104】

式

【化 97】

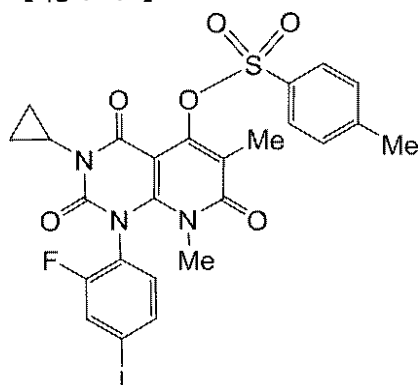


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 105】

式

【化 98】

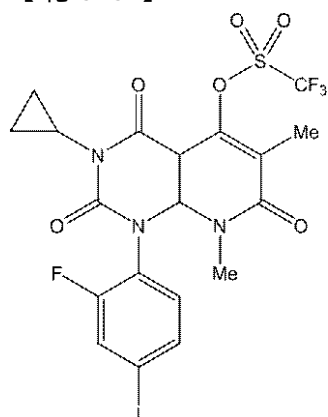


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 106】

式

【化 99】

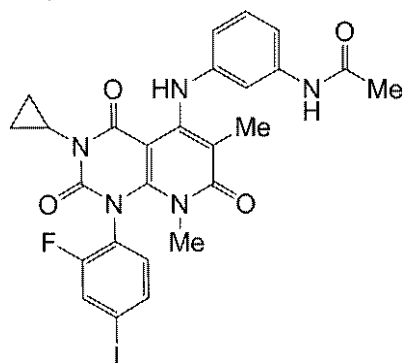


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 107】

式

【化 1 0 0】

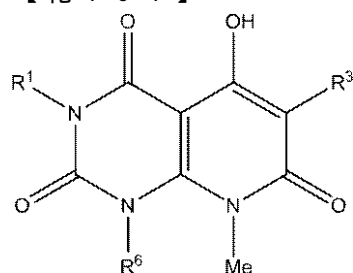


で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【請求項 1 0 8】

下記一般式 [5 0] で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【化 1 0 1】



[50]

[式中、

R^3 は、メチル基であり、

R^1 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。) }

{ ここで、グループ B は、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞ

れ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $12) - NR^{B^9} CONR^{B^{10}} R^{B^{11}}$ (ここで R^{B^9} 、 $R^{B^{10}}$ 及び $R^{B^{11}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $13) - NR^{B^{12}} CONR^{B^{13}} OR^{B^{14}}$ (ここで $R^{B^{12}}$ 、 $R^{B^{13}}$ 及び $R^{B^{14}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $14) - NR^{B^{15}} SO_2 R^{B^{16}}$ (ここで $R^{B^{15}}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $R^{B^{16}}$ は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、
 $15) - SO_2 - R^{B^{17}}$ (ここで $R^{B^{17}}$ は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、
 $16) - SO_2 NR^{B^{18}} R^{B^{19}}$ (ここで $R^{B^{18}}$ 及び $R^{B^{19}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $17) - P(=O)(R^{B^{20}})(R^{B^{21}})$ (ここで $R^{B^{20}}$ 及び $R^{B^{21}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $18) - COOR^{B^{22}}$ (ここで $R^{B^{22}}$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $19) - CONR^{B^{23}} R^{B^{24}}$ (ここで $R^{B^{23}}$ 及び $R^{B^{24}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $20) - NR^{B^{25}} SO_2 NR^{B^{26}} R^{B^{27}}$ (ここで $R^{B^{25}}$ 、 $R^{B^{26}}$ 及び $R^{B^{27}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $21) - NR^{B^{28}} SO_2 NR^{B^{29}} CONR^{B^{30}} R^{B^{31}}$ (ここで $R^{B^{28}}$ 、 $R^{B^{29}}$ 、 $R^{B^{30}}$ 及び $R^{B^{31}}$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $22) C_{3-12}$ 炭素環基、及び、
 $23)$ 複素環基
 からなる群であり、
 (ここで、上記 4) の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B^1} 乃至 $R^{B^{31}}$ の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、
 5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループ A から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、
 当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、
 また、上記 22)、 R^{B^3} 、 R^{B^6} 、及び、 $R^{B^{16}}$ の C_{3-12} 炭素環基、上記 23)、 R^{B^3} 、 R^{B^6} 、 $R^{B^{16}}$ 、及び、 $R^{B^{17}}$ の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)
 グループ A は、
 1) ハロゲン原子、
 2) ニトロ基、
 3) シアノ基、
 4) C_{1-4} アルキル基、
 $5) - OR^{A^1}$ (ここで R^{A^1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $6) - SR^{A^2}$ (ここで R^{A^2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $7) - NR^{A^3} R^{A^4}$ (ここで R^{A^3} 及び R^{A^4} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $8) - COOR^{A^5}$ (ここで R^{A^5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 $9) - NR^{A^6} COR^{A^7}$ (ここで R^{A^6} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{A^7} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、
 $10) - NR^{A^8} COOR^{A^9}$ (ここで R^{A^8} 及び R^{A^9} は、同一又は異なって、それぞ

れ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。）、

11) C_{3-12} 炭素環基、及び、

12) 複素環基からなる群であり、

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

上記4)、 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{A3} 、 R^{A4} 、 R^{A5} 、 R^{A6} 、 R^{A7} 、 R^{A8} 、及び、 R^{A9} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

また、上記11)及び R^{A7} の C_{3-12} 炭素環基、12)及び R^{A7} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループCは、

1) ハロゲン原子、

2) シアノ基、

3) C_{1-4} アルキル基、

4) $-OR^{C1}$ (ここで R^{C1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

5) $-NR^{C2}R^{C3}$ (ここで R^{C2} 及び R^{C3} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

6) $-COOR^{C4}$ (ここで R^{C4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)

及び、

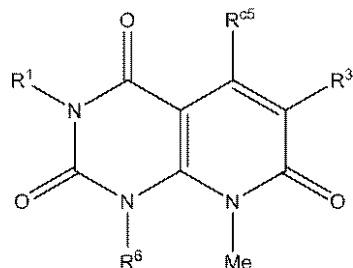
7) オキソ基

からなる群である。}]]

【請求項109】

下記一般式[51]で表される化合物、又はその塩、又はその溶媒和物。

【化102】



[51]

[式中、

R^3 は、メチル基であり、

R^1 、及び、 R^6 は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。

(ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であって、当該 C_{3-12} 炭素環基、及び、複素環基は、下記グループBから選ばれる1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)}]

R^{C5} は、脱離基である。

{ここで、グループBは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

4) C_{1-8} アルキル基、

5) C_{2-4} アルケニル基、

6) C_{2-4} アルキニル基、

7) $-OR^{B1}$ (ここで R^{B1} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

8) $-SR^{B2}$ (ここで R^{B2} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

9) $-NR^{B3}R^{B4}$ (ここで R^{B3} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基であり、 R^{B4} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

10) $-NR^{B5}COR^{B6}$ (ここで R^{B5} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B6} は、水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

11) $-NR^{B7}COOR^{B8}$ (ここで R^{B7} 及び R^{B8} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

12) $-NR^{B9}CONR^{B10}R^{B11}$ (ここで R^{B9} 、 R^{B10} 及び R^{B11} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

13) $-NR^{B12}CONR^{B13}OR^{B14}$ (ここで R^{B12} 、 R^{B13} 及び R^{B14} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

14) $-NR^{B15}SO_2R^{B16}$ (ここで R^{B15} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 R^{B16} は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、

15) $-SO_2-R^{B17}$ (ここで R^{B17} は、 C_{1-4} アルキル基、又は、複素環基である。)、

16) $-SO_2NR^{B18}R^{B19}$ (ここで R^{B18} 及び R^{B19} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

17) $-P(=O)(R^{B20})(R^{B21})$ (ここで R^{B20} 及び R^{B21} は、同一又は異なって、それぞれ、 C_{1-4} アルキル基である。)、

18) $-COOR^{B22}$ (ここで R^{B22} は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

19) $-CONR^{B23}R^{B24}$ (ここで R^{B23} 及び R^{B24} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

20) $-NR^{B25}SO_2NR^{B26}R^{B27}$ (ここで R^{B25} 、 R^{B26} 及び R^{B27} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

21) $-NR^{B28}SO_2NR^{B29}CONR^{B30}R^{B31}$ (ここで R^{B28} 、 R^{B29} 、 R^{B30} 及び R^{B31} は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、

22) C_{3-12} 炭素環基、及び、

23) 複素環基

からなる群であり、

(ここで、上記4)の「 C_{1-8} アルキル基」、 R^{B1} 乃至 R^{B31} の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

5) の C_{2-4} アルケニル基、及び、6) の C_{2-4} アルキニル基は、それぞれ、上記グループAから選ばれる同一又は異なった1乃至3個の置換基で置換されてもよく、

当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる1乃至4個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、

また、上記22)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、及び、 R^{B16} の C_{3-12} 炭素環基、上記23)、 R^{B3} 、 R^{B6} 、 R^{B16} 、及び、 R^{B17} の複素環基は、それぞれ、下記グループCから選ばれる同一又は異なった1乃至5個の置換基で置換されてもよい。)

グループAは、

1) ハロゲン原子、

2) ニトロ基、

3) シアノ基、

- 4) C_{1-4} アルキル基、
 5) $-OR^A 1$ (ここで $R^A 1$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 6) $-SR^A 2$ (ここで $R^A 2$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 7) $-NR^A 3 R^A 4$ (ここで $R^A 3$ 及び $R^A 4$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 8) $-COOR^A 5$ (ここで $R^A 5$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 9) $-NR^A 6 COR^A 7$ (ここで $R^A 6$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基であり、 $R^A 7$ は、 C_{1-4} アルキル基、 C_{3-12} 炭素環基、又は、複素環基である。)、
 10) $-NR^A 8 COOR^A 9$ (ここで $R^A 8$ 及び $R^A 9$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 11) C_{3-12} 炭素環基、及び、
 12) 複素環基からなる群であり、
 (ここで、当該複素環基は、炭素原子の他に、酸素原子、窒素原子、及び、硫黄原子から選ばれる 1 乃至 4 個のヘテロ原子を有する、飽和又は不飽和の環の基であり、
 上記 4)、 $R^A 1$ 、 $R^A 2$ 、 $R^A 3$ 、 $R^A 4$ 、 $R^A 5$ 、 $R^A 6$ 、 $R^A 7$ 、 $R^A 8$ 、及び、 $R^A 9$ の C_{1-4} アルキル基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 3 個の置換基で置換されてもよく、
 また、上記 11) 及び $R^A 7$ の C_{3-12} 炭素環基、12) 及び $R^A 7$ の複素環基は、それぞれ、下記グループ C から選ばれる同一又は異なった 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。)
 グループ C は、
 1) ハロゲン原子、
 2) シアノ基、
 3) C_{1-4} アルキル基、
 4) $-OR^C 1$ (ここで $R^C 1$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 5) $-NR^C 2 R^C 3$ (ここで $R^C 2$ 及び $R^C 3$ は、同一又は異なって、それぞれ、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)、
 6) $-COOR^C 4$ (ここで $R^C 4$ は、水素原子、又は、 C_{1-4} アルキル基である。)
 及び、
 7) オキシ基
 からなる群である。}]

【請求項 110】

R^1 が、 C_{3-12} 炭素環基 (ここで、当該 C_{3-12} 炭素環基は、グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよい。) である、請求項 108 又は 109 記載の化合物。

【請求項 111】

R^1 が、シクロプロピルである、請求項 110 記載の化合物。

【請求項 112】

R^6 が、グループ B から選ばれる 1 乃至 5 個の置換基で置換されてもよいフェニル基である、請求項 108 又は 109 記載の化合物。

【請求項 113】

R^6 が、2, 4 位でジ置換されたフェニル基である、請求項 112 記載の化合物。

【請求項 114】

$R^C 5$ が、ハロゲン、p-トルエンスルホニルオキシ、メタンスルホニルオキシ、及びトリフルオロメタンスルホニルオキシから選ばれる脱離基である、請求項 109 記載の化合物。