

【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27年6月11日 (2015.6.11)

【公表番号】特表2014-514323(P2014-514323A)

【公表日】平成26年6月19日 (2014.6.19)

【年通号数】公開・登録公報2014-032

【出願番号】特願2014-506609(P2014-506609)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/62 (2006.01)

C 0 7 D 277/66 (2006.01)

C 0 7 D 277/82 (2006.01)

C 0 7 D 491/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 277/68 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/4741 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/62 C S P

C 0 7 D 277/66

C 0 7 D 277/82

C 0 7 D 491/06

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 277/68

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/4741

A 6 1 K 31/538

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年4月17日 (2015.4.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

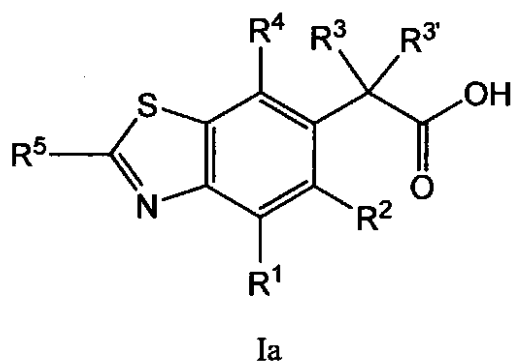
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I_a :

【化 1 3 2】



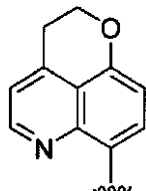
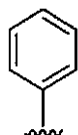
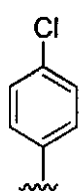
(式中、

R¹ は R^{1a} または R^{1b} であり、R⁵ は R^{5a} または R^{5b} であり、R^{1a} は、a) ハロ；またはb) H

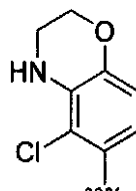
であり、

R^{1b} は、シアノであり、R² は、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、R³ は、-O(C₁ ~ C₆) アルキルであり、R^{3'} は H であり、R⁴ は、

【化 1 3 3】



または



であり、

R^{5a} は、

a) H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₆ ~ C₂₀) アリール、複素環、ヘテロアリール、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)-O-R¹¹、-O-R¹¹、または -(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹¹ (ここで、各 R¹¹ は独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₆ ~ C₂₀) アリール、複素環、またはヘテロアリールであり、ここで、アリール、(C₆ ~ C₂₀) 複素環、およびヘテロアリールは、1 個 ~ 3 個の Z¹¹ 基でそれぞれ必要に応じて置換される)；あるいは

b) -N(R⁹)R¹⁰ または -C(=O)-N(R⁹)R¹⁰ (ここで、各 R⁹ は独立して、H または (C₁ ~ C₆) アルキルであり、各 R¹⁰ は独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、複素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹¹、または -C(=O)-R¹¹ であり、ここで、各 R¹¹ は独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、または複素環である)

であり、

R^{5b} は、a) -(C₂ ~ C₆) アルキニル-(C₃ ~ C₇) 炭素環；または

b) $-NR_eR_f$

であり、

各 Z^{11} は独立して、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、複素環、またはヘテロアリール（前記 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、複素環、およびヘテロアリールはそれぞれ、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、または $COOH$ で必要に応じて置換される）

であり、

各 R_e は独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

各 R_f は独立して、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^6 であり、

各 Z^6 は独立して、 $-NR_aR_a$ または $-C(O)NR_cR_d$ であり、

各 R_a は独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、そして

R_c および R_d は各々独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

ここで各ヘテロアリールは、1個～6個の炭素原子ならびに酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個～4個のヘテロ原子を有し、そして各複素環は、1個～6個の炭素原子ならびに酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個～3個のヘテロ原子を有する）

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項2】

R^{5a} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- R^{11} 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、複素環またはヘテロアリールであり、ここでヘテロアリールは、1個～3個の Z^{11} 基で必要に応じて置換されているか、あるいは R^{5b} は、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環である、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

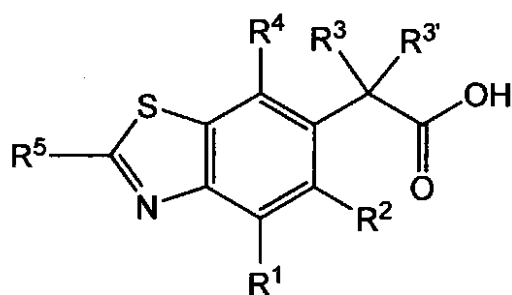
【請求項3】

R^5 は R^{5a} である、請求項2に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項4】

式 Ia :

【化134】



Ia

(式中、

R^1 は R^{1a} または R^{1b} であり、

R^5 は R^{5a} または R^{5b} であり、

R^{1a} は、

a) ハロ；または

b) H

であり、

R^{1b} は、シアノであり、

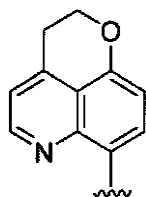
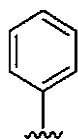
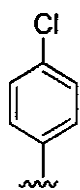
R^2 は、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

R^3 は、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

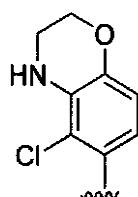
$R^{3'}$ は H であり、

R^4 は、

【化 135】



または



であり、

R^{5a} は、

a) H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、単環複素環、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、または $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ (ここで、各 R^{11} は独立して、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、または単環複素環であり、ここで、単環複素環は、1個～3個の Z^{11} 基で必要に応じて置換される)；あるいは

b) $-N(R^9)R^{10}$ 、または $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は独立して、H または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、各 R^{10} は独立して、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、単環複素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ 、または $-C(=O)-R^{11}$ であり、ここで、各 R^{11} は独立して、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、または単環複素環である)

であり、

R^{5b} は、

a) $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環；または

b) $-NR_e R_f$

であり、

各 Z^{11} は独立して、ハロ、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

各 R_e は独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

各 R_f は独立して、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-Z^6$ であり、

各 Z^6 は独立して、 $-NR_a R_a$ または $-C(O)NR_c R_d$ であり、

各 R_a は独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、そして

R_c および R_d は各々独立して、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、

ここで各単環複素環は、1個～6個の炭素原子ならびに酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個～3個のヘテロ原子を有する)

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 5】

R^{5a} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、または単環複素環であるか、あるいは R^{5b} は、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環である、請求項 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

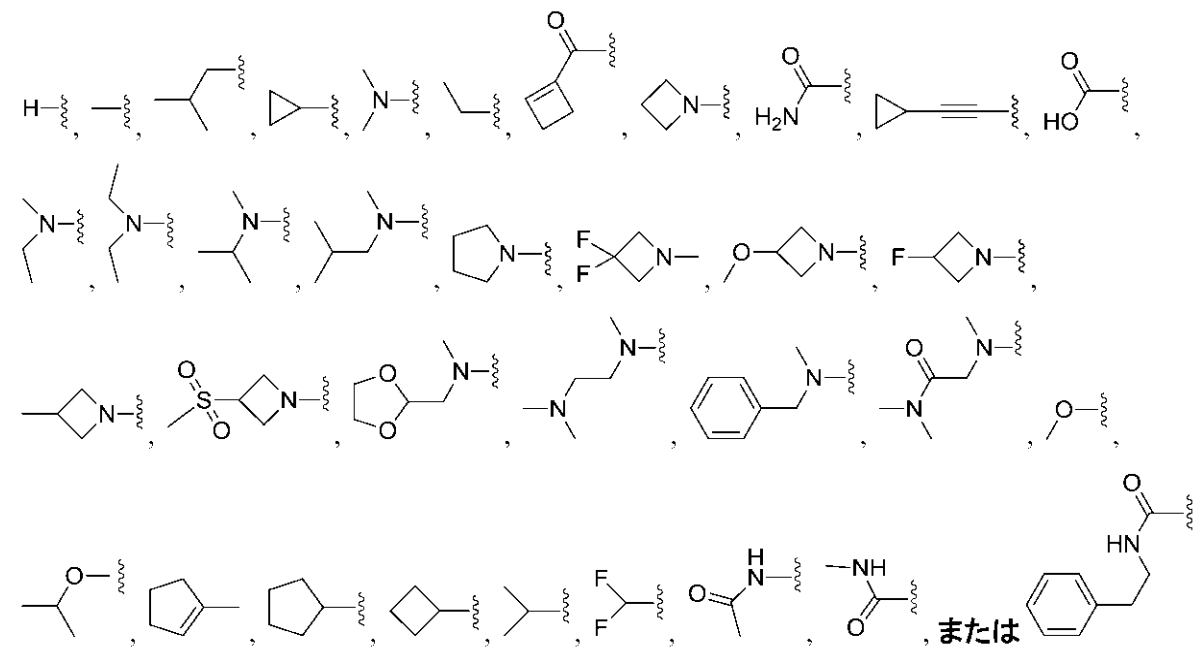
【請求項 6】

R^5 は R^{5a} である、請求項 5 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 7】

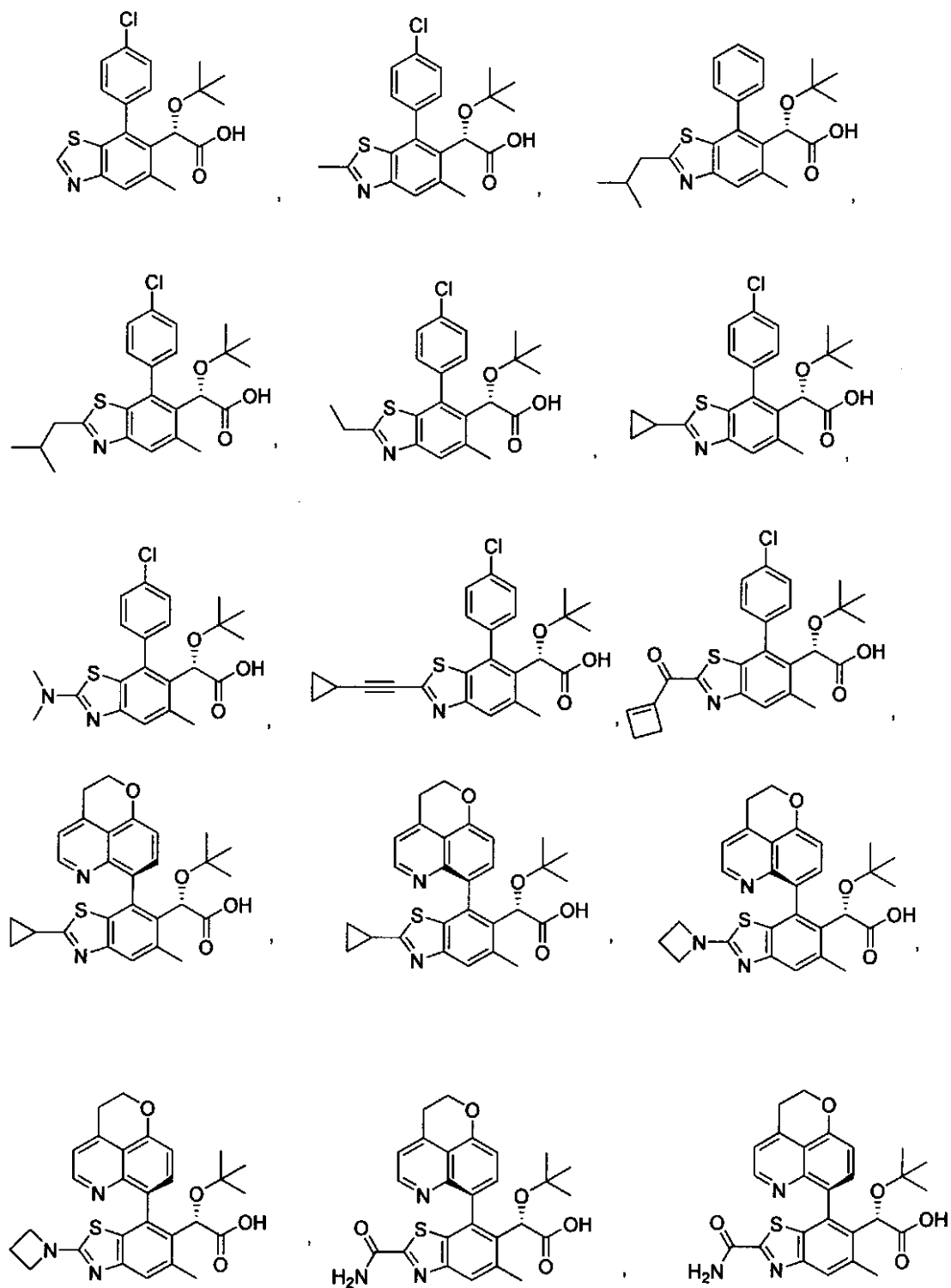
R^3 は $OC(CH_3)_3$ である、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物またはそ

【化 1 3 6】

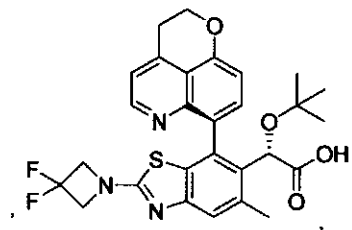
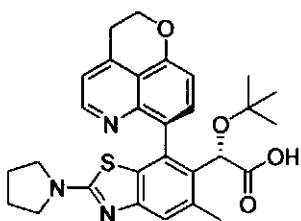
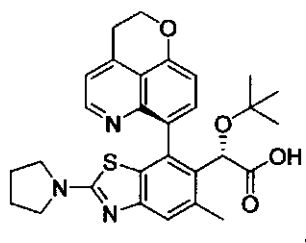
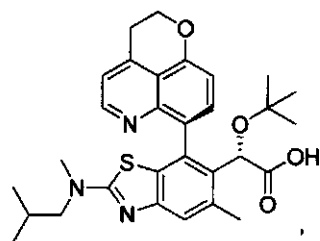
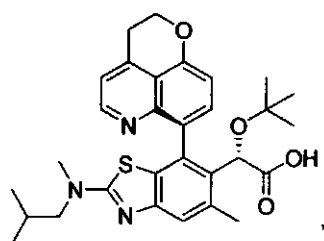
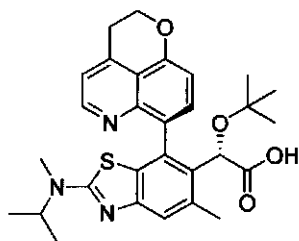
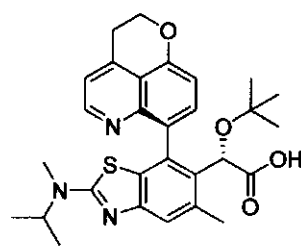
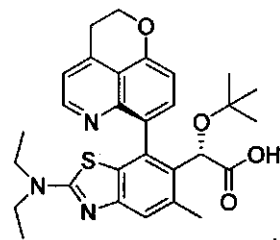
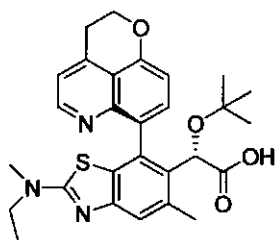
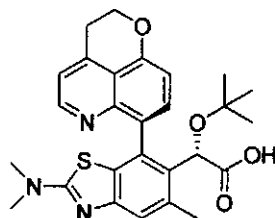
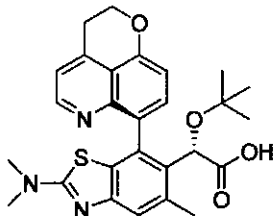
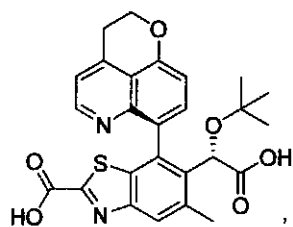


以下の

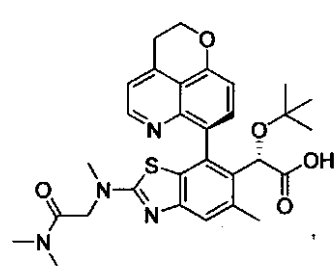
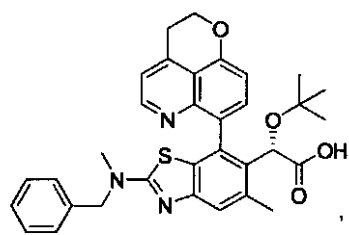
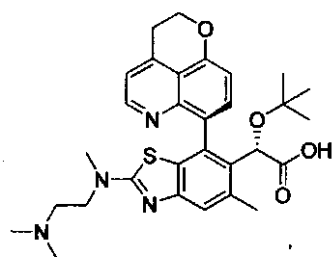
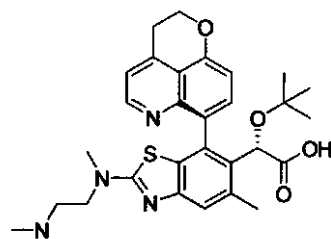
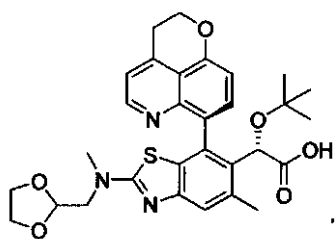
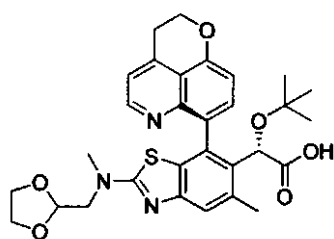
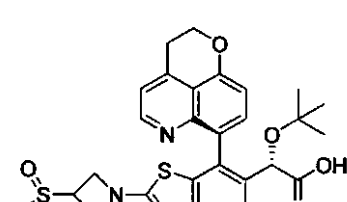
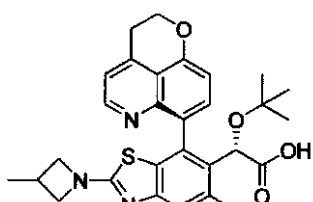
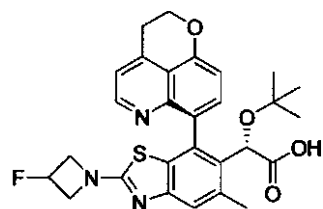
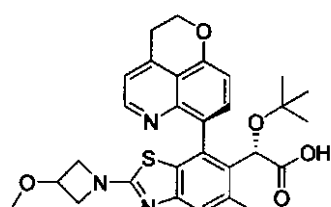
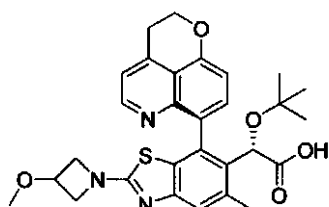
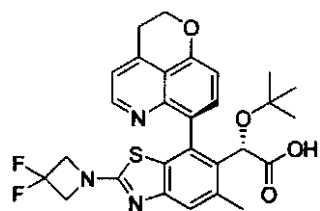
【化 1 3 8 - 1】



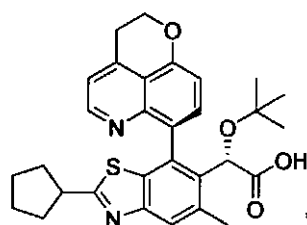
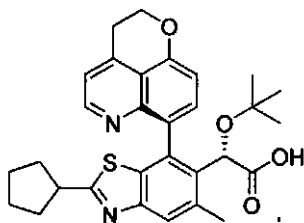
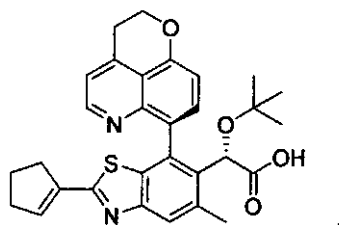
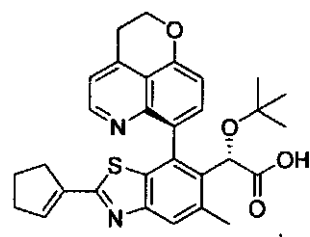
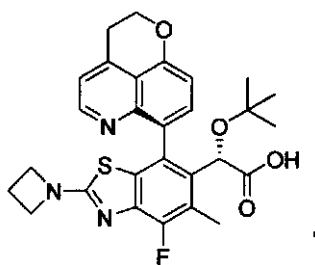
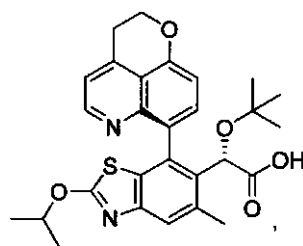
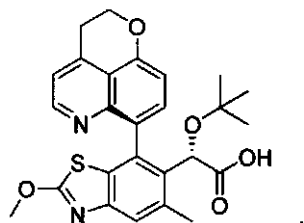
【化 1 3 8 - 2】



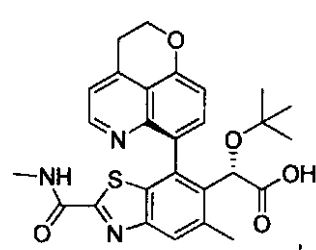
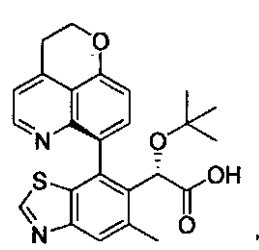
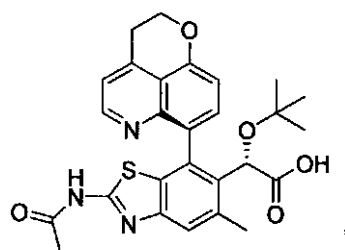
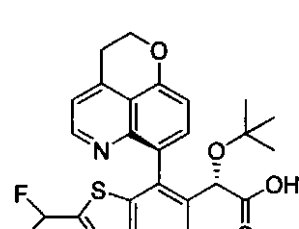
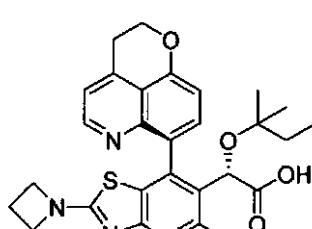
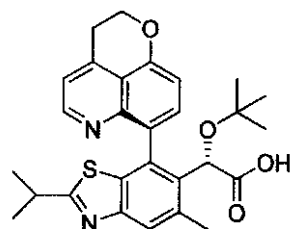
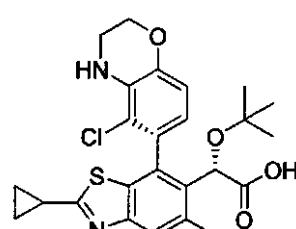
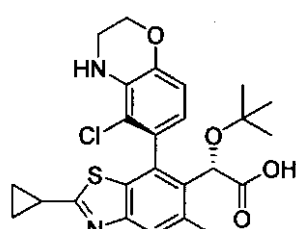
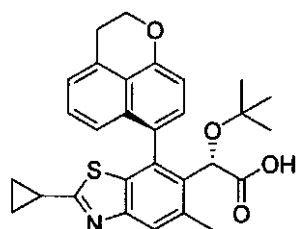
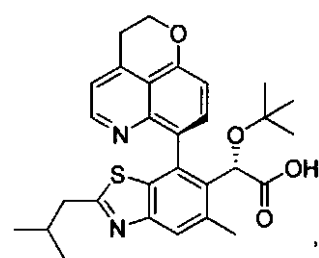
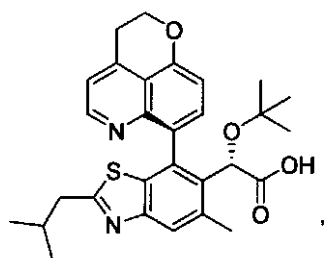
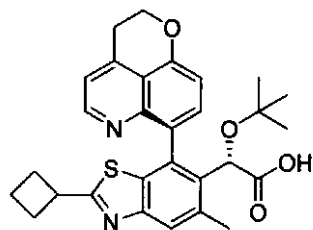
【化 1 3 8 - 3】



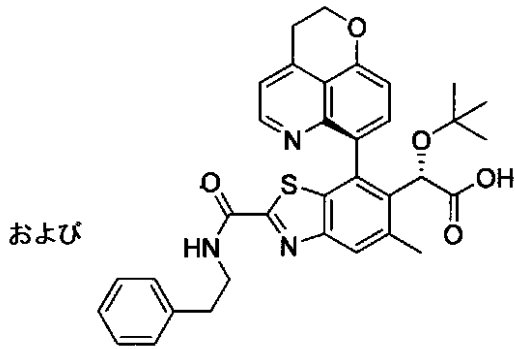
【化 1 3 8 - 4】



【化 1 3 8 - 5】



【化 1 3 8 - 6】

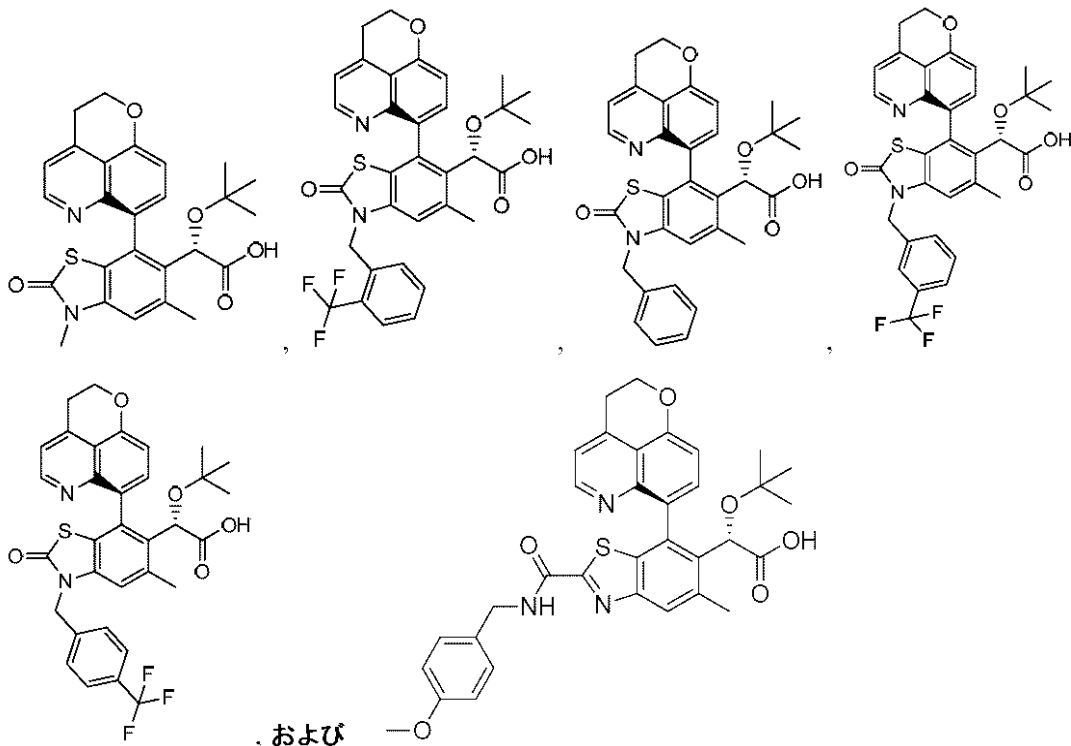


ならびにこれらの塩から選択される請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 1 0】

以下の

【化 1 4 0】



から選択される化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 1 1】

請求項 1 から 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩と、薬学的に許容され得るキャリアとを含む、薬学的組成物。

【請求項 1 2】

患者の HIV 感染を処置するための医薬であって、請求項 1 から 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含む、医薬。

【請求項 1 3】

患者の HIV 感染を処置する際に用いるための組成物であって、請求項 1 から 1 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含み、該組成物は、治療有効量の HIV プロテアーゼ阻害化合物、逆転写酵素の HIV 非ヌクレオシドインヒビター、逆転写酵素の HIV ヌクレオシドインヒビター、逆転写酵素の HIV ヌクレオチドイン

【請求項 14】

【請求項 15】

【請求項 16】

【手續補正2】

【補正対象項目名】 0 0 0 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

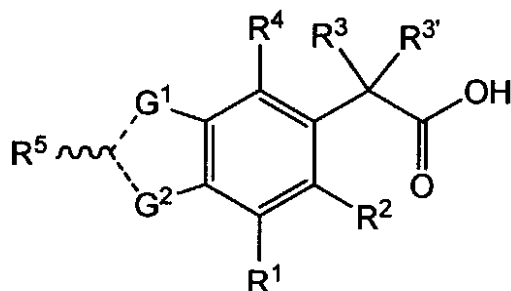
【 0 0 0 4 】

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目 1)

式 I :

【化 1 3 2】



I

(式中、

G¹ は S であり、G² は N であり、G¹ に連結された破線の結合は単結合であり、G² に連結された破線の結合は二重結合であり、R⁵ に連結された波線の結合は単結合であるか、または

G^1 は N であり、 G^2 は S であり、 G^1 に連結された破線の結合は二重結合であり、 G^2 に連結された破線の結合は単結合であり、 R^5 に連結された波線の結合は単結合であるか、または

G¹ は S であり、G² は N R⁶ であり、G¹ に連結された破線の結合は単結合であり、G² に連結された破線の結合は単結合であり、R⁵ に連結された波線の結合は二重結合であり、R⁵ は酸素であり、

R^1 は R^{1-a} または R^{1-b} であり、

R^2 は R^{2-a} または R^{2-b} であり、

 R^3 は R^{3a} または R^{3b} であり、

R^3 は R^{3a} または R^{3b} であり、

R^4 は R^{4a} または R^{4b} であり、

R^5 は R^{5a} または R^{5b} であり、

R^6 は R^{6a} または R^{6b} であり、

R^{1a} は、

a) ハロ；

b) R^{11} 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、 $-S$
 $-R^{11}$ 、 $-S(O)-R^{11}$ 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- R^{11}
 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $C(=O)-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $C(=$
 $O)-O-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $O-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル
 $-S-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $S(O)-R^{11}$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$
 アルキル- SO_2-R^{11} (ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2$
 $\sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3$
 $\sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択さ
 れ、ここで、アリール、複素環、またはヘテロアリールは、1 個以上の Z^{11} 基でそれぞ
 れ必要に応じて置換される)；および

c) $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-O-C(=O)-N(R$
 $R^9)R^{10}$ 、 $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $N(R^9)R$
 R^{10} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ ア
 ルキル- $O-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- SO_2
 $-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim$
 $C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ ア
 ルキル- R^{11} 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、お
 よび $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、H、 $($
 $C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1$
 $\sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテ
 ロアリールから独立して選択される)

から選択され、

R^{1b} は、

a) $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $O-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環
 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $S-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、
 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $S(O)-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $(C_3 \sim C_6)$ 炭素環、
 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $SO_2-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、
 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $SO_2-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-C(O)-($
 $C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-O-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-S-(C_1$
 $\sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-S(O)-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-SO_2-$
 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{14} 、 $-(C_1 \sim C_6$
 $)$ アルキル- $C(O)-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル-
 $C(O)-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $O-(C_1$
 $\sim C_6)$ アルキル- Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- $S-(C_1 \sim C_6)$ アルキル-
 Z^{13} 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル- $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_2 \sim C_6)$
 アルキニル- $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO$
 $_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、
 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル-アリ
 ール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル-ヘテロアリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル-複
 素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキ
 ニル-アリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル-ヘテロアリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキ
 ニル-複素環、 $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環- Z^1 、または $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル-
 Z^3 (ここで、任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim$
 $C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、アリール、また

はヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

b) スピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、および架橋二環式炭素環(ここで、任意のスピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、または架橋二環式炭素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されるか、またはここで、2個の Z^1 基が、それらが結合している原子(単数または複数)と一緒に炭素環または複素環を必要に応じて形成し、ここで、前記炭素環または複素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

c) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル(ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個以上の Z^2 基で置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

d) $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、および $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環(ここで、 $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $-X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個以上の Z^3 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、ここで、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、および $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1個以上の Z^4 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

e) アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-X$ アリール、 $-X$ ヘテロアリール、および $-X$ 複素環(ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^5 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

f) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル(ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルは、1個以上の Z^6 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

g) $-NR_e R_f$ 、 $-C(O)NR_e R_f$ 、 $-OC(O)NR_e R_f$ 、 $-SO_2 NR_e R_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-NR_e R_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $C(O)-NR_e R_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-C(O)-NR_e R_f$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2 NR_e R_f$ (ここで、各 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、基の一部として、1個以上の Z^6 基で独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；および

h) ニトロおよびシアノ

から選択され、

R^{2a} は、

a) ハロ；

b) R^{11} 、 $C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、 $-S-R^{11}$ 、 $-S(O)-R^{11}$ 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-S-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-S(O)-R^{11}$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2-R^{11}$ (ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される)；および

c) $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-O-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、ここで、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim$

C_6) アルキル - R^{11} 、 $-SO_2 - R^{11}$ 、 $-C(=O) - R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択される)

から選択され、

R^{2b} は、

a) $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $O - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $S - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $S(O) - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル - $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-C(O) - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-O - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-S - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-S(O) - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{14} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $C(O) - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $C(O) - O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $O - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $S - (C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^{13} 、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル - アリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル - ヘテロアリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル - 複素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - アリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - ヘテロアリール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - 複素環、 $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 - Z^1 、または $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル - Z^3 (ここで、任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、アリール、またはヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

b) スピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、および架橋二環式炭素環 (ここで、任意のスピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、または架橋二環式炭素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、2個の Z^1 基が、それらが結合している原子 (単数または複数) と一緒に $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環または複素環を必要に応じて形成し、ここで、前記 $(C_3 \sim C_6)$ 炭素環または複素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

c) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個以上の Z^2 基で置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

d) $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、および $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 (ここで、 $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個以上の Z^3 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、ここで、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、および $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1個以上の Z^4 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

e) アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-X$ アリール、 $-X$ ヘテロアリール、および $-X$ 複素環 (ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^5 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

f) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C$

7) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、および (C₂ ~ C₆) アルキニルは、1 個以上の Z⁶ 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;
 g) -NR_eR_f、-C(O)NR_eR_f、-OC(O)NR_eR_f、-SO₂NR_eR_f、-(C₁ ~ C₆) アルキル-NR_eR_f、-(C₁ ~ C₆) アルキルC(O)-NR_eR_f、-(C₁ ~ C₆) アルキル-O-C(O)-NR_eR_f、および-(C₁ ~ C₆) アルキル-SO₂NR_eR_f (ここで、各(C₁ ~ C₆) アルキルは、基の一部として、1 個以上の Z⁶ 基で独立して置換され、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ; および

h) ニトロおよびシアノ

から選択されるか、

または、R¹ および R² が、それらが結合している原子と一緒に 5 または 6 員の炭素環または 4、5、6、または 7 員の複素環を形成し、ここで、前記 5 または 6 員の炭素環または 4、5、6、または 7 員の複素環は、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されるか、

または、R¹ および R² が、それらが結合している原子と一緒に 5 または 6 員の炭素環または 4、5、6、または 7 員の複素環を形成し、ここで、前記 5 または 6 員の炭素環または 4、5、6、または 7 員の複素環は 1 個以上の Z⁷ 基または Z⁸ 基でそれぞれ独立して置換されるか、またはここで、2 個の Z⁷ 基が同一原子上に存在する場合、前記 2 個の Z⁷ 基が、それらが結合している原子と一緒に (C₃ ~ C₇) 炭素環または 4、5、または 6 員の複素環を必要に応じて形成し、

R^{3a} は、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、-(C₁ ~ C₆) アルキル-(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-(C₁ ~ C₆) アルキル-アリール、-(C₁ ~ C₆) アルキル-複素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル-ヘテロアリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、-O(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、-O(C₂ ~ C₆) アルケニル、-O(C₂ ~ C₆) アルキニル、-O(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-Oアリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-アリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-複素環、および-O(C₁ ~ C₆) アルキル-ヘテロアリールであり、R^{3a} の任意の (C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、-(C₁ ~ C₆) アルキル-(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-(C₁ ~ C₆) アルキル-アリール、-(C₁ ~ C₆) アルキル-複素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル-ヘテロアリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、-O(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、-O(C₂ ~ C₆) アルケニル、-O(C₂ ~ C₆) アルキニル、-O(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-Oアリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-アリール、-O(C₁ ~ C₆) アルキル-複素環、または-O(C₁ ~ C₆) アルキル-ヘテロアリールは、(C₁ ~ C₆) アルキル、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、ハロ、オキソ、および-CN から選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換され、

R^{3a'} は H であり、

R^{3b} は、-(C₃ ~ C₇) 炭素環、アリール、ヘテロアリール、複素環、-(C₁ ~ C₆) アルキルOH、-(C₁ ~ C₆) アルキル-O-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-O-(C₂ ~ C₆) アルケニル-Z¹²、-(C₂ ~ C₆) アルキル-O-(C₂ ~ C₆) アルキニル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S-(C₂ ~ C₆) アルケニル-Z¹²、-(C₂ ~ C₆) アルキル-S-(C₂ ~ C₆) アルキニル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S(O)-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S(O)-(C₂ ~ C₆) アルケニル-Z¹²、-(C₂ ~ C₆) アルキル-S(O)-(C₂ ~ C₆) アルキニル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-SO₂-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z¹²、-(C₁ ~ C₆) アルキル-SO₂-(C₂ ~ C₆) アルケニル-Z¹²、-(C₂ ~ C₆) アルキル-SO₂-(C₂ ~ C₆) アルキニル

- Z^{12} 、- ($C_2 \sim C_6$) アルキル - $NR_a R_b$ 、- ($C_2 \sim C_6$) アルキル $OC(O)$ - $NR_c R_d$ 、- ($C_2 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - C(O) - OR_b$ 、- ($C_2 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - C(O) - NR_a R_b$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $SO_2 NR_c R_d$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a SO_2 NR_c R_d$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a SO_2 O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a SO_2 O$ アリール、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ アルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_2 \sim C_6)$ アルケニル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_2 \sim C_6)$ アルキニル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ 炭素環、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 -$ アリール、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 -$ ヘテロアリール、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $NR_a - SO_2 -$ 複素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a R_b$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル $OC(O) - NR_c R_d$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - C(O) - OR_b$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - C(O) - NR_a R_b$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ アルキル、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_2 \sim C_6)$ アルケニル、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_2 \sim C_6)$ アルキニル、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ 炭素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 -$ アリール、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 -$ ヘテロアリール、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 -$ 複素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - NR_a R_b$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ 炭素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 - (C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a - SO_2 -$ アリール、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a SO_2 NR_c R_d$ 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a SO_2 O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル - $NR_a SO_2 O$ アリール、- O ヘテロアリール、- O 複素環、- S ヘテロアリール、- S 複素環、- $S(O)$ ヘテロアリール、- $S(O)$ 複素環、- SO_2 ヘテロアリール、または - SO_2 複素環であり、ここで、 R^3 の任意の ($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、($C_2 \sim C_6$) アルキニル、アリール、($C_3 \sim C_7$) 炭素環、ヘテロアリール、または複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、

$R^{3b'}$ は、 H 、($C_1 \sim C_6$) アルキル、または - $O(C_1 \sim C_6)$ アルキルであるか、あるいは、

R^{3b} および $R^{3b'}$ が、それらが結合している炭素と一緒に複素環または ($C_3 \sim C_7$) 炭素環を形成し、ここで、 R^{3b} および $R^{3b'}$ とそれらが結合している炭素との複素環または ($C_3 \sim C_7$) 炭素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、

R^{4a} は、アリール、複素環、およびヘテロアリールから選択され、ここで、 R^{4a} の任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル、($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、- OH 、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、- SH 、- $S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、- NH_2 、- $NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および - $N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ からそれぞれ独立して選択される1個以上の基で必要に応じて置換され、ここで、($C_1 \sim C_6$) アルキルは、ヒドロキシ、- $O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、シアノ、またはオキソで必要に応じて置換され、

R^{4b} は、

a) ($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、および ($C_2 \sim C_6$) アルキニル (ここで、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、または ($C_2 \sim$

C₆) アルキニルは、1 個以上の Z¹ 基でそれぞれ必要に応じて置換される) ;

b) (C₃ ~ C₁₄) 炭素環 (ここで、(C₃ ~ C₁₄) 炭素環は、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されるか、またはここで、2 個の Z¹ 基が、それらが結合している原子 (単数または複数) と一緒に (C₃ ~ C₇) 炭素環または複素環を必要に応じて形成する) ;

c) スピロ複素環または架橋複素環 (ここで、スピロ複素環または架橋複素環は 1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されるか、またはここで、2 個の Z¹ 基が、それらが結合している原子 (単数または複数) と一緒に (C₃ ~ C₇) 炭素環または複素環を必要に応じて形成する) ; および

d) アリール、ヘテロアリール、スピロ複素環、縮合複素環、または架橋複素環 (ここで、アリール、ヘテロアリール、スピロ複素環、縮合複素環、および架橋複素環は、1 個以上の Z⁷ 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される)

から選択されるか、または、

R⁴ および R³ が、それらが結合している原子と一緒に大環状複素環または大環状炭素環を形成し、ここで、R⁴ および R³ とそれらが結合している原子との任意の大環状複素環または大環状炭素環を、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換することができ、R³ ^b は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、または -O (C₁ ~ C₆) アルキルであり、

R⁵ ^a は、

a) ハロ ;

b) R^{1 1}、-C (=O) - R^{1 1}、-C (=O) - O - R^{1 1}、-O - R^{1 1}、-S - R^{1 1}、-S (O) - R^{1 1}、-SO₂ - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - C (=O) - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - C (=O) - O - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - O - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - S - R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - S (O) - R^{1 1}、および -(C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - R^{1 1} (ここで、各 R^{1 1} は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^{1 1} 基でそれぞれ必要に応じて置換される) ; および

c) -N (R⁹) R^{1 0}、-C (=O) - N (R⁹) R^{1 0}、-O - C (=O) - N (R⁹) R^{1 0}、-SO₂ - N (R⁹) R^{1 0}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - N (R⁹) R^{1 0}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - C (=O) - N (R⁹) R^{1 0}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - O - C (=O) - N (R⁹) R^{1 0}、および -(C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - N (R⁹) R^{1 0} (ここで、各 R⁹ は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、および (C₃ ~ C₇) シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{1 0} は、R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル - R^{1 1}、-SO₂ - R^{1 1}、-C (=O) - R^{1 1}、-C (=O) OR^{1 1}、および -C (=O) N (R⁹) R^{1 1} から独立して選択され、ここで、各 R^{1 1} は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択される)

から選択され、

R⁵ ^b は、

a) -(C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₆) 炭素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、-(C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、-(C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、-(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、-NR_a SO₂ NR_c R_d、-NR_a SO₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環、-NR_a SO₂ O アリール、-(C₂ ~ C₆)

アルケニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - アリール、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - ヘテロアリール、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 複素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - アリール、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - ヘテロアリール、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 複素環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹、または - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル - Z³ (ここで、任意の (C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、またはヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

b) スピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、および架橋二環式炭素環 (ここで、任意のスピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、または架橋二環式炭素環は、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されるか、またはここで、2個の Z¹ 基が、それらが結合している原子 (単数または複数) と一緒に (C₃ ~ C₇) 炭素環または複素環を必要に応じて形成し、ここで、前記 (C₃ ~ C₇) 炭素環または複素環は1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

c) (C₁ ~ C₆) アルキル (ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルは、1個以上の Z² 基で置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

d) - X (C₁ ~ C₆) アルキル、- X (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、- X (C₂ ~ C₆) アルケニル、- X (C₂ ~ C₆) アルキニル、および - X (C₃ ~ C₇) 炭素環 (ここで、- X (C₁ ~ C₆) アルキルおよび - X (C₁ ~ C₆) ハロアルキルは、1個以上の Z³ 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換され、ここで、- X (C₂ ~ C₆) アルケニル、- X (C₂ ~ C₆) アルキニル、および - X (C₃ ~ C₇) 炭素環は、1個以上の Z⁴ 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

e) アリール、ヘテロアリール、複素環、- X アリール、- X ヘテロアリール、および - X 複素環 (ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z⁵ 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

f) (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、および (C₂ ~ C₆) アルキニル (ここで、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、および (C₂ ~ C₆) アルキニルは、1個以上の Z⁶ 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

g) - NR_eR_f、- C(O)NR_eR_f、- OC(O)NR_eR_f、- SO₂NR_eR_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル - NR_eR_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル C(O) - NR_eR_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - C(O) - NR_eR_f、および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂NR_eR_f (ここで、各 (C₁ ~ C₆) アルキルは、1個以上の Z⁶ 基で独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ;

h) ニトロおよびシアノ ;

i) アリール、ヘテロアリール、および複素環 (ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1個以上の Z¹⁵ 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換される) ; および

j) オキシ

から選択され、

R^{6a} は、

a) R¹¹、- C(=O) - R¹¹、- C(=O) - O - R¹¹、- O - R¹¹、- S - R¹¹、- S(O) - R¹¹、- SO₂ - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C(=O) - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C(=O) - O - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - S - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - S(O) - R¹¹、および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - R¹¹ (ここで、各 R¹¹ は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、またはヘテロアリール、または複素環) ;

～ C_7) シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される) ; および

b) - $C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、- $SO_2-N(R^9)R^{10}$ 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- $N(R^9)R^{10}$ 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- $C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-O- $C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、および-($C_1 \sim C_6$)アルキル- $SO_2-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、H、($C_1 \sim C_6$)アルキル、および($C_3 \sim C_7$)シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- R^{11} 、- SO_2-R^{11} 、- $C(=O)-R^{11}$ 、- $C(=O)OR^{11}$ 、および- $C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、H、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_2 \sim C_6$)アルケニル、($C_2 \sim C_6$)アルキニル、($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル、($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル、-($C_1 \sim C_6$)アルキルアリール、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される)

から選択され、

R^6 は、

a) -($C_1 \sim C_6$)アルキル- SO_2 -($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、- $C(O)$ -($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-S-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-S(O)-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、- SO_2 -($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{14} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- $C(O)$ -($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- $C(O)$ -O-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-S-($C_1 \sim C_6$)アルキル- Z^{13} 、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-S-($C_1 \sim C_6$)アルキル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_1 \sim C_6$)アルキル-S(O)-($C_1 \sim C_6$)アルキル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_1 \sim C_6$)アルキル- SO_2 -($C_1 \sim C_6$)アルキル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_2 \sim C_6$)アルケニル-($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル、-($C_2 \sim C_6$)アルキニル-($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル、-($C_3 \sim C_7$)ハロ炭素環、-($C_2 \sim C_6$)アルケニル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_2 \sim C_6$)アルケニル-アリール、-($C_2 \sim C_6$)アルケニル-ヘテロアリール、-($C_2 \sim C_6$)アルケニル-複素環、-($C_2 \sim C_6$)アルキニル-($C_3 \sim C_7$)炭素環、-($C_2 \sim C_6$)アルキニル-アリール、-($C_2 \sim C_6$)アルキニル-ヘテロアリール、-($C_2 \sim C_6$)アルキニル-複素環、-($C_3 \sim C_7$)炭素環- Z^1 、-($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル- Z^3 、- $NR_aSO_2NR_cR_d$ 、- $NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および- NR_aSO_2O アリール (ここで、任意の($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル、($C_3 \sim C_7$)炭素環、($C_2 \sim C_6$)アルケニル、($C_2 \sim C_6$)アルキニル、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ;

b) スピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、および架橋二環式炭素環 (ここで、任意のスピロ二環式炭素環、縮合二環式炭素環、および架橋二環式炭素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されるか、またはここで、2個の Z^1 基が、それらが結合している原子 (単数または複数) と一緒に($C_3 \sim C_7$)炭素環または複素環を必要に応じて形成し、ここで、前記($C_3 \sim C_7$)炭素環または複素環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ;

c) ($C_1 \sim C_6$)アルキル (ここで、($C_1 \sim C_6$)アルキルは、1個以上の Z^2 基で置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ;

d) -X($C_1 \sim C_6$)アルキル、-X($C_1 \sim C_6$)ハロアルキル、-X($C_2 \sim C_6$)アルケニル、-X($C_2 \sim C_6$)アルキニル、および-X($C_3 \sim C_7$)炭素環 (こ

ここで、 $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1 個以上の Z^3 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換され、ここで、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、および $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1 個以上の Z^4 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

e) アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-X$ アリール、 $-X$ ヘテロアリール、および $-X$ 複素環 (ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、単独でまたは基の一部として、1 個以上の Z^5 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；

f) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルは、1 個以上の Z^6 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；
および

g) $-C(O)NR_eR_f$ 、 $-SO_2NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $C(O)-NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-C(O)-NR_eR_f$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2NR_eR_f$ (ここで、任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、基の一部として、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)

から選択され、

各 X は、 O 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $O-$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $C(O)-$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $C(O)O-$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $S-$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $S(O)-$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル SO_2- から独立して選択され、

各 Z^1 は、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $=NOR_a$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O$ アリール、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S$ アリール、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S$ 複素環、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 炭素環、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_cR_d$ 、 $-NR_aC(O)R_a$ 、 $-NR_aC(O)OR_b$ 、 $-NR_aC(O)NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2R_b$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-OS(O)_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ 、 $-C(O)OR_b$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、および $-OC(O)NR_cR_d$ から独立して選択され、ここで、 Z^1 の任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、または複素環は、単独でまたは基の一部として、1 個以上のハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_b$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aC(O)_2R_b$ 、 $-$ ヘテロアリール、 $-$ 複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-NH$ ヘテロアリール、 $-NH$ 複素環、または $-S(O)_2NR_cR_d$ で必要に応じて置換され、

各 Z^2 は、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、スピロ複素環、架橋複素環、スピロ二環式炭素環、架橋二環式炭素環、 $NR_aSO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2$ アリール、 $-NR_aSO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および $-NR_aSO_2O$ アリールから独立して選択され、

各 Z^3 は、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、オキソ、 $=NOR_a$ 、チオキソ、アリール、複素環、ヘテロアリール、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O$ アリール、 $-O$ 複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S$ アリール、 $-S$ 複素環、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 SO_2 アリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aR_b$ 、 $-NR_aC(O)R_b$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および $-NR_aSO_2O$ アリールから独立して選択され、

各 Z^4 は、ハロゲン、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、オキソ、 $=NOR_a$ 、チオキソ、 $-A$ リール、 $-$ 複素環、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O$ アリール、 $-O$ 複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S$ アリール、 $-S$ 複素環、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 SO_2 アリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aR_b$ 、 $-NR_aC(O)R_a$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および $-NR_aSO_2O$ アリールから独立して選択され、

各 Z^5 は、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-NR_aSO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NR_aSO_2(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-NR_aSO_2(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-NR_aSO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO_2$ アリール、 $-NR_aSO_2$ ヘテロアリール (heteraryl)、 $-NR_aSO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aSO_2$ 複素環、 $-NR_aC(O)$ アルキル、 $-NR_aC(O)$ アルケニル、 $-NR_aC(O)$ アルキニル、 $-NR_aC(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aC(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aC(O)$ アリール、 $-NR_aC(O)$ ヘテロアリール、 $-NR_aC(O)$ 複素環、 $-NR_aC(O)NR_cR_d$ 、および $-NR_aC(O)OR_b$ から独立して選択され、

各 Z^6 は、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aR_a$ 、 $NR_aC(O)R_b$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-O$ アリール、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S$ アリール、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S$ 複素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2NR_cR$

d 、 $-NR_aSO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO_2$ アリール、 $-NR_aSO_2$ ヘテロアリール (heteraryl)、 $-NR_aSO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および $-NR_aSO_2O$ アリールから独立して選択され、ここで、 Z^6 の任意のアリールは、単独でまたは基の一部として、1 個以上のハロゲン、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-CN$ 、または $-(C_1 \sim C_6)$ アルキルで必要に応じて置換され、

各 Z^7 は、 $-NO_2$ 、 $=NOR_a$ 、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-Z^{12}$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-Z^{12}$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル OH 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-Z^{12}$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル OH 、 $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル $-Z^{12}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル OH 、 $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 $-Z^{12}$ 、 $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 OH 、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル NR_cR_d 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aC(O)R_a$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aSO_2R_a$ 、アリール、ヘテロアリール、複素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-Z^{12}$ 、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O$ アリール、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル NR_cR_d 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aC(O)R_a$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aSO_2R_a$ 、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-Z^{12}$ 、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル NR_cR_d 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aC(O)R_a$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aSO_2R_a$ 、 $-S$ アリール、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S$ 複素環、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル NR_cR_d 、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aC(O)R_a$ 、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aSO_2R_a$ 、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル NR_cR_d 、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aC(O)R_a$ 、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル $NR_aSO_2R_a$ 、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aC(O)OR_b$ 、 $-NR_aC(O)NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2R_b$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-OS(O)_2R_a$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、および $-OC(O)NR_cR_d$ から独立して選択され、ここで、 Z^7 の任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、または複素環は、単独でまたは基の一部として、1 個以上のハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_b$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aC(O)_2R_b$ 、ヘテロアリール、複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-NH$ ヘテロアリール、 $-NH$ 複素環、または $-S(O)_2NR_cR_d$ で必要に応じて置換され、

各 Z^8 は、 $-NO_2$ または $-CN$ から独立して選択され、

各 Z^{10} は、

i) ハロ、オキソ、チオキソ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-N((C_1 \sim C_6) \text{ アルキル})_2$ ；

ii) $-OH$ 、 $-O-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、または $-O-(C_1 \sim C_6)$ ア

ルキルで必要に応じて置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル ; および

$i i i$) アリール、複素環、およびヘテロアリール (前記アリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、($C_1 \sim C_6$) アルキル、または $COOH$ で必要に応じて置換される)

から独立して選択され、

各 Z^{11} は、 Z^{10} 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-C(=O)-N((C_1 \sim C_4)$ アルキル) $_2$ 、 $-C(=O)-$ アリール、 $-C(=O)-$ 複素環、および $-C(=O)-$ ヘテロアリールから独立して選択され、

各 Z^{12} は、 $-NO_2$ 、 $=NOR_a$ 、チオキソ、アリール、複素環、 $-$ ヘテロアリール、($C_3 \sim C_7$) ハロ炭素環、($C_3 \sim C_7$) 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環 (halocarbocycle)、 $-O$ アリール、 $-O$ 複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環 (halocarbocycle)、 $-S$ アリール、 $-S$ 複素環、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 SO_2 アリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-NR_aR_a$ 、 $-NR_aC(O)R_b$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、および $-NR_aSO_2O$ アリールから独立して選択され、

各 Z^{13} は、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $=NOR_a$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、($C_3 \sim C_7$) ハロ炭素環、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O$ アリール、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S$ アリール、 $-S$ ヘテロアリール、 $-S$ 複素環、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-S(O)(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-S(O)(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2$ アリール、 $-SO_2$ ヘテロアリール、 $-SO_2$ 複素環、 $-SO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_cR_d$ 、 $-NR_aC(O)R_a$ 、 $-NR_aC(O)OR_b$ 、 $-NR_aC(O)NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2R_b$ 、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-OS(O)_2R_a$ 、 $-C(O)R_a$ 、 $-C(O)OR_b$ 、 $-C(O)NR_cR_d$ 、および $-OC(O)NR_cR_d$ から独立して選択され、ここで、 Z^{13} の任意の ($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、($C_2 \sim C_6$) アルキニル、($C_3 \sim C_7$) ハロ炭素環、($C_3 \sim C_7$) 炭素環、($C_3 \sim C_7$) ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、または複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上のハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_b$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aC(O)_2R_b$ 、 $-$ ヘテロアリール、 $-$ 複素環、 $-O$ ヘテロアリール、 $-O$ 複素環、 $-NH$ ヘテロアリール、 $-NH$ 複素環、または $-S(O)_2NR_cR_d$ で必要に応じて置換され、

各 Z^{14} は、 $-NO_2$ 、 $=NOR_a$ 、 $-CN$ 、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-O(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-S(O)(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-SO_2(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリール、 $-OS(O)_2R_a$ から独立して選択され、ここで、 Z^{14} の任意の $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上のハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_b$ 、 $-CN$ 、 $-NR_aC(O)_2R_b$

、 - ヘテロアリール、 - 複素環、 - Oヘテロアリール、 - O複素環、 - NHヘテロアリール、 - NH複素環、または - S(O)₂NR_cR_dで必要に応じて置換され、

各 Z^{1 5} は、アリール、ヘテロアリール、複素環、 - Oアリール、 - Oヘテロアリール、 - O複素環、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル - アリール、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル - ヘテロアリール、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル - 複素環から独立して選択され、ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1個以上の Z^{1 6} 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換され、ここで、任意の - Oアリール、 - Oヘテロアリール、 - O複素環、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル - アリール、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル - ヘテロアリール、または - O(C₁ ~ C₆)アルキル - 複素環は、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換され、

各 Z^{1 6} は、 - NO₂、 - OH、 = NOR_a、 - SH、 - CN、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、(C₃ ~ C₇)炭素環、(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、複素環、 - O(C₁ ~ C₆)アルキル、 - O(C₂ ~ C₆)アルケニル、 - O(C₂ ~ C₆)アルキニル、 - O(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、 - O(C₃ ~ C₇)炭素環、 - O(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、 - Oアリール、 - Oヘテロアリール、 - O複素環、 - S(C₁ ~ C₆)アルキル、 - S(C₂ ~ C₆)アルケニル、 - S(C₂ ~ C₆)アルキニル、 - S(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、 - S(C₃ ~ C₇)炭素環、 - S(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、 - Sアリール、 - Sヘテロアリール、 - S複素環、 - S(O)(C₁ ~ C₆)アルキル、 - S(O)(C₂ ~ C₆)アルケニル、 - S(O)(C₂ ~ C₆)アルキニル、 - S(O)(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、 - S(O)(C₃ ~ C₇)炭素環、 - S(O)(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、 - SO₂(C₁ ~ C₆)アルキル、 - S(O)アリール、 - S(O)炭素環、 - S(O)ヘテロアリール、 - S(O)複素環、 - SO₂(C₂ ~ C₆)アルケニル、 - SO₂(C₂ ~ C₆)アルキニル、 - SO₂(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、 - SO₂(C₃ ~ C₇)炭素環、 - SO₂(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、 - SO₂アリール、 - SO₂ヘテロアリール、 - SO₂複素環、 - SO₂NR_cR_d、 - NR_cR_d、 - NR_aC(O)R_a、 - NR_aC(O)OR_b、 - NR_aC(O)NR_cR_d、 - NR_aSO₂R_b、 - NR_aSO₂NR_cR_d、 - NR_aSO₂O(C₃ ~ C₇)炭素環、 - NR_aSO₂Oアリール、 - OS(O)₂R_a、 - C(O)R_a、 - C(O)OR_b、 - C(O)NR_cR_d、および - OC(O)NR_cR_dから独立して選択され、ここで、Z^{1 6}の任意の(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、 - (C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、(C₃ ~ C₇)炭素環、(C₃ ~ C₇)ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、または複素環は、単独でまたは基の一部として、1個以上のハロゲン、(C₁ ~ C₆)アルキル、 - OH、 - OR_b、 - CN、 - NR_aC(O)₂R_b、 - ヘテロアリール、 - 複素環、 - Oヘテロアリール、 - O複素環、 - NHヘテロアリール、 - NH複素環、または - S(O)₂NR_cR_dで必要に応じて置換され、

各 R_a は、独立して、H、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)炭素環、複素環、アリール、アリール(C₁ ~ C₆)アルキル - 、ヘテロアリール、またはヘテロアリール(C₁ ~ C₆)アルキル - であり、ここで、R_aの任意の(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)炭素環、複素環、アリール、またはヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上のハロゲン、OH、またはシアノで必要に応じて置換され、

各 R_b は、独立して、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)炭素環、複素環、アリール、アリール(C₁ ~ C₆)アルキル - 、ヘテロアリール、またはヘテロアリール(C₁ ~ C₆)アルキル - であり、ここで、R_bの任意の(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)炭素環、複素環、アリール、またはヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1個以上のハロゲン、OH、およびシアノで必要に応じて置換され、

R_c および R_d は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル -、複素環、ヘテロアリール、またはヘテロアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル - からそれぞれ独立して選択され、ここで、 R_c または R_d の任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、複素環、アリール、またはヘテロアリールは、単独でまたは基の一部として、1 個以上のハロゲン、 OH 、またはシアノで必要に応じて置換されるか、または、 R_c および R_d が、それらが結合している窒素と一緒に複素環を形成し、ここで、 R_c および R_d とそれらが結合している窒素との任意の複素環は、1 個以上のハロゲン、 OH 、またはシアノで必要に応じて置換され、

各 R_e は、 $-OR_a$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、または $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環（ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1 個以上の Z^6 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される）、 $(C_2 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル（ここで、任意の $(C_2 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、または $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルは、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される）、ならびにアリール、複素環、およびヘテロアリール（ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^5 基でそれぞれ独立して置換される）から独立して選択され、

各 R_f は、 $-R_g$ 、 $-OR_a$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^6 、 $-SO_2R_g$ 、 $-C(O)R_g$ 、 $C(O)OR_g$ 、および $-C(O)NR_eR_g$ から独立して選択され、

各 R_g は、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、 R_g の任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、アリール、複素環、またはヘテロアリールは、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される）の化合物またはその塩。

(項目 2)

G^1 は S であり、 G^2 は N であり、 G^1 に連結された破線の結合は単結合であり、 G^2 に連結された破線の結合は二重結合であり、 R^5 に連結された波線の結合は単結合であるか、または、

G^1 は S であり、 G^2 は NR^6 であり、 G^1 に連結された破線の結合は単結合であり、 G^2 に連結された破線の結合は単結合であり、 R^5 に連結された波線の結合は二重結合であり、 R^5 は酸素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

R^1 は H またはハロである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

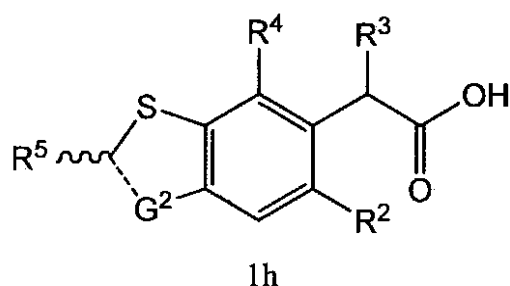
(項目 4)

$R^{3'}$ は H である、項目 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 5)

前記式 I の化合物が、式 I h :

【化 1 3 3】



(式中、

G^2 は N であり、 G^2 に連結された破線の結合は二重結合であり、 R^5 に連結された波線の結合は単結合であるか、または、

G^2 は NR^6 であり、 G^2 に連結された破線の結合は単結合であり、 R^5 に連結された波線の結合は二重結合であり、 R^5 は酸素である) の化合物またはその塩である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

R^3 は、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、または $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、 R^{3a} の任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキルまたは $(C_2 \sim C_6)$ アルケニルは、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ、オキソ、および $-CN$ から選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換される、項目 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

R^3 は $-OC(CH_3)_3$ である、項目 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8)

R^4 は、

a) アリール、複素環、およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ からそれぞれ独立して選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換され、ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、ヒドロキシ、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、シアノ、またはオキソで必要に応じて置換される) および

b) アリール、ヘテロアリール、スピロ複素環、縮合複素環、または架橋複素環(ここで、アリール、ヘテロアリール、スピロ複素環、縮合複素環、または架橋複素環は、1 個以上の Z^7 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)

から選択される、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

R^4 は、

a) アリール、複素環、およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ からそれぞれ独立して選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換され、ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、ヒドロキシ、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、シアノ、またはオキソで必要に応じて置換される) ; および

b) アリールおよびヘテロアリール(ここで、アリールおよびヘテロアリールは、1 個以上の Z^7 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)

から選択される、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

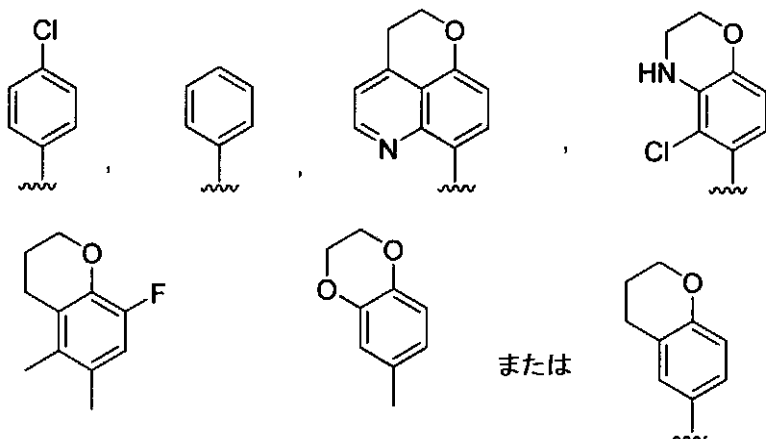
R^4 は、アリール、複素環、およびヘテロアリール(ここで、 R^4 の任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ からそれぞれ独立して選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換され、ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、ヒドロキシ、 $-O(C_1 \sim C_6)$

アルキル、シアノ、またはオキソで必要に応じて置換される) から選択される、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1)

R⁴ は、

【化 1 3 4】

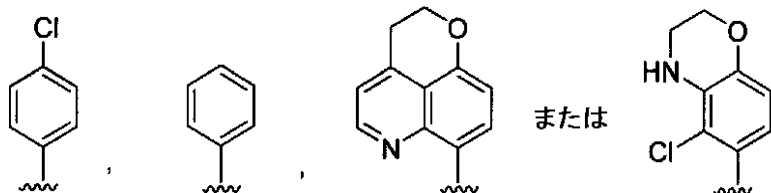


である、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2)

R⁴ は、

【化 1 3 5】



である、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3)

R² はハロ、H、または (C₁ ~ C₆) アルキルである、項目 1 から 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 4)

R² はハロ、H、または -CH₃ である、項目 1 から 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物

(項目 1 5)

R⁵ は、

a) R^{1 1}、-C(=O)-R^{1 1}、-C(=O)-O-R^{1 1}、-O-R^{1 1}、-S-R^{1 1}、-S(O)-R^{1 1}、-SO₂-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-C(=O)-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-C(=O)-O-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-O-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S-R^{1 1}、-(C₁ ~ C₆) アルキル-S(O)-R^{1 1}、および -(C₁ ~ C₆) アルキル-SO₂-R^{1 1} (ここで、各 R^{1 1} は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^{1 1} 基でそれぞれ必要に応じて置換される) ;

b) -N(R⁹)R^{1 0}、-C(=O)-N(R⁹)R^{1 0}、-O-C(=O)-N(

R^9) R^{10} 、 $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリーール、複素環、およびヘテロアリーールから独立して選択される) ;

c) $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-S-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $S(O)-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_6)$ 炭素環、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $SO_2-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O$ アリーール、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-アリーール$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-ヘテロアリーール$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルケニル $-複素環$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-アリーール$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-ヘテロアリーール$ 、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-複素環$ 、 $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 $-Z^1$ 、または $-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル $-Z^3$ (ここで、任意の $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、アリーール、またはヘテロアリーールは、単独でまたは基として、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ;

d) $-NR_eR_f$ 、 $-C(O)NR_eR_f$ 、 $-OC(O)NR_eR_f$ 、 $-SO_2NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $C(O)-NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-C(O)-NR_eR_f$ 、および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-SO_2NR_eR_f$ (ここで、各 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個以上の Z^6 基で独立して置換され、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ; および

e) オキソ

から選択される、項目 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 16)

R^5 は、

a) R^{11} 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、および $-O-R^{11}$ (ここで、各 R^{11} は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、アリーール、複素環、およびヘテロアリーールから独立して選択され、ここで、アリーール、複素環、およびヘテロアリーールは、1個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される) ;

b) $-N(R^9)R^{10}$ および $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、 H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリーール、複素環、およびヘテロアリーールから独立して選択される) ;

c) $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 (ここで、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は 1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される) ;

d) $-NR_eR_f$ および $-C(O)NR_eR_f$; および

e) オキソ

から選択される、項目 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 17)

R^5 は、

- a) R^{11} 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、および $-O-R^{11}$
 (ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される)；
- b) $-N(R^9)R^{10}$ および $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- R^{11} 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択される)；
- c) $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 (ここで、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；
- および
- d) $-NR_eR_f$ および $-C(O)NR_eR_f$

から選択される、項目 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 18)

R^5 は、

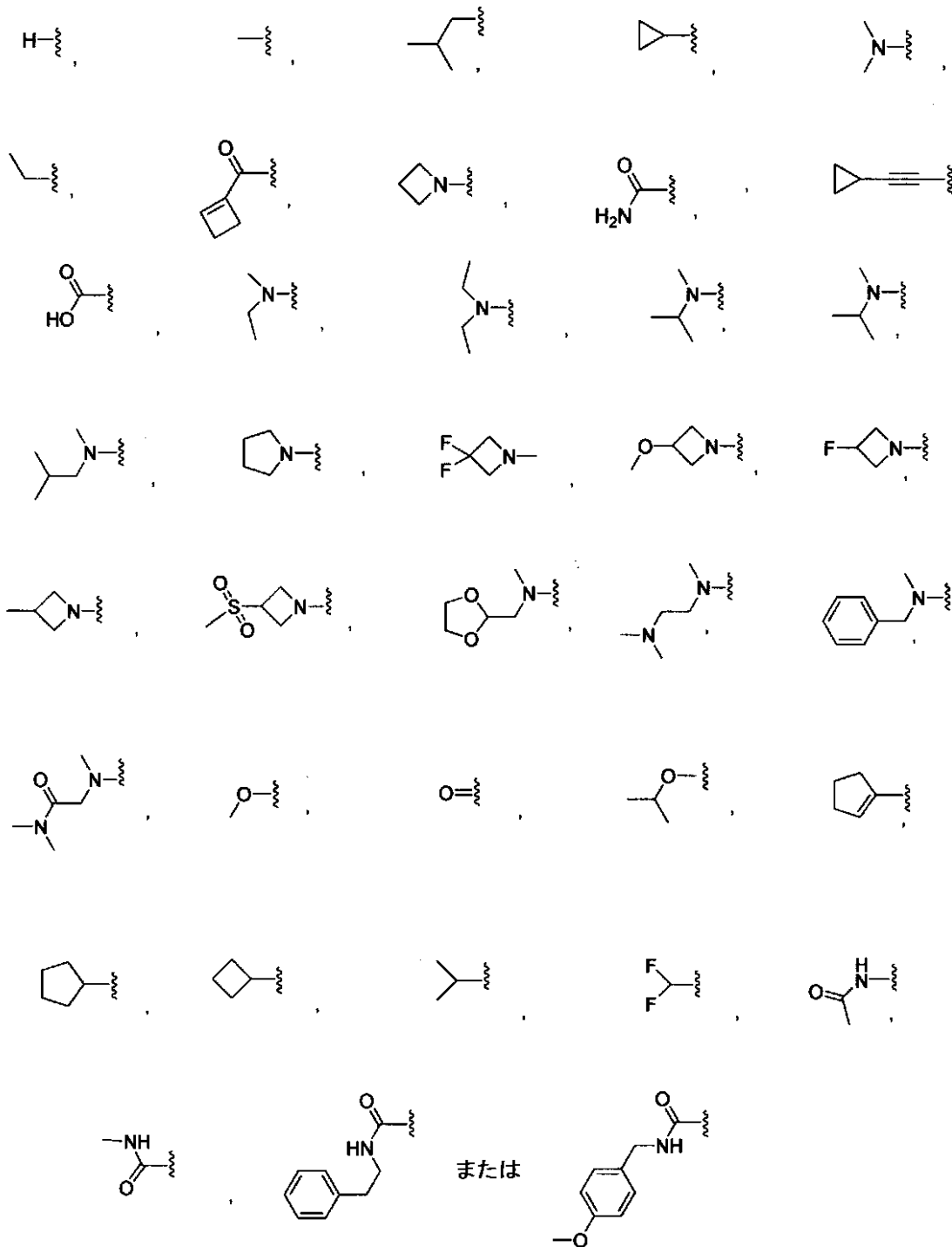
- a) H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、複素環、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、および $-O-R^{11}$ (ここで、複素環は 1 個以上の Z^{11} 基で必要に応じて置換され、ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される)；
- b) $-N(R^9)R^{10}$ および $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから独立して選択され、各 R^{10} は、 R^{11} 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- R^{11} 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から独立して選択され、ここで、各 R^{11} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択される)；
- c) $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環 (ここで、 $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環は、1 個以上の Z^1 基で必要に応じて置換される)；
- および
- d) $-NR_eR_f$ および $-C(O)NR_eR_f$

から選択される、項目 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 19)

R^5 は、

【化 1 3 6】



から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

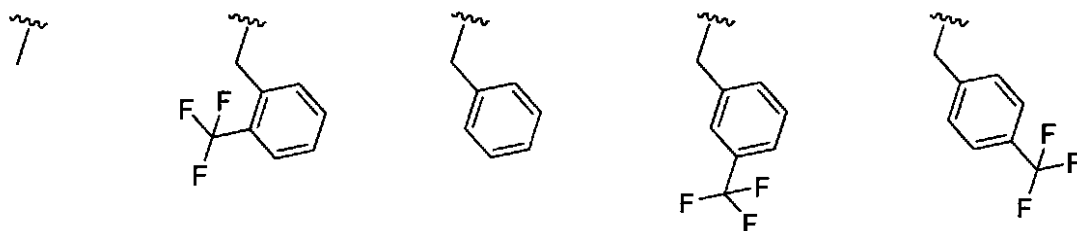
(項目 2 0)

R^5 はオキソであり、 R^6 は、 R^{11} および - ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$) アルキル - R^{11} (ここで、各 R^{11} は、 H 、($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$) アルキル、($\text{C}_2 \sim \text{C}_6$) アルケニル、($\text{C}_2 \sim \text{C}_6$) アルキニル、($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$) ハロアルキル、($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) シクロアルキル、アリール、複素環、およびヘテロアリールから独立して選択され、ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される) から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 1)

R^5 はオキソであり、 R^6 は、

【化 1 3 7】

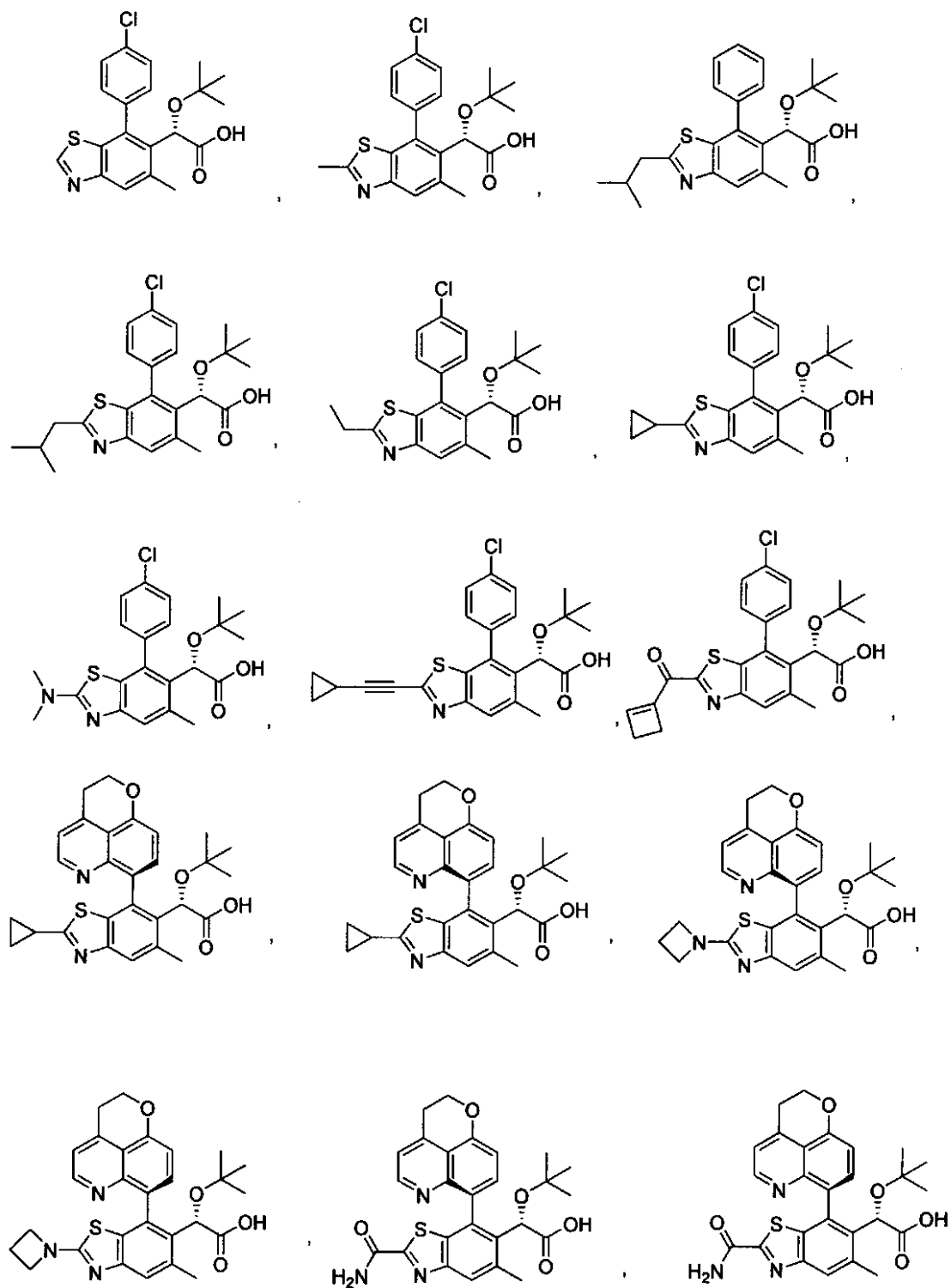


から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

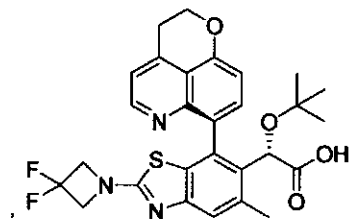
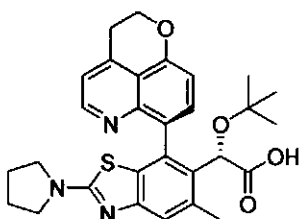
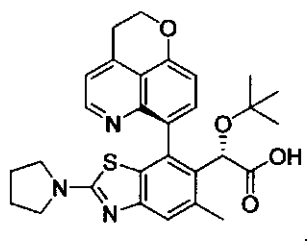
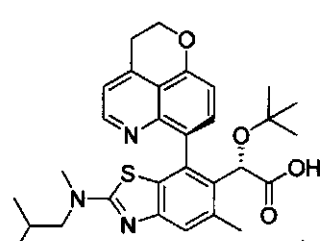
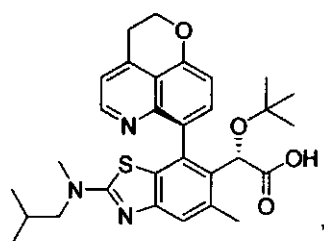
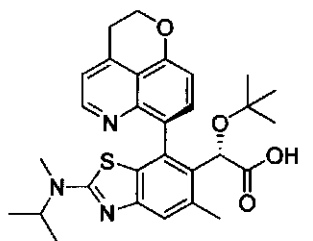
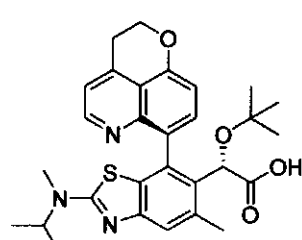
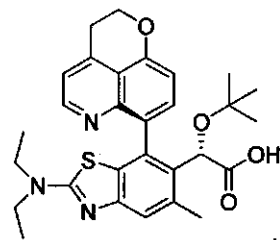
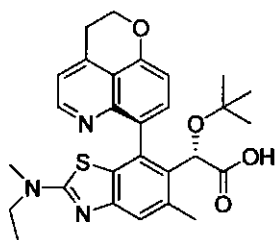
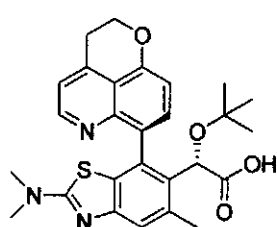
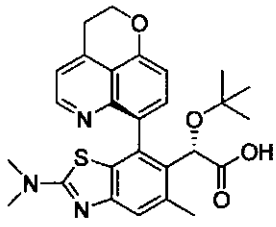
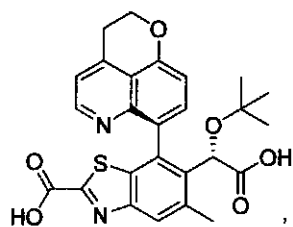
(項目 2 2)

以下の

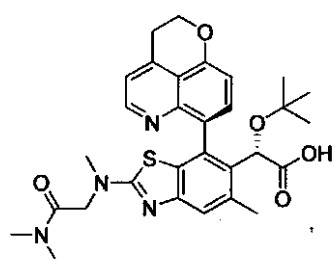
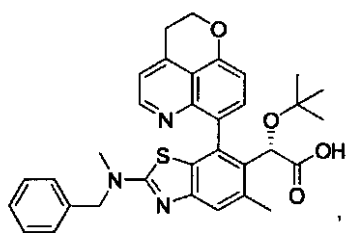
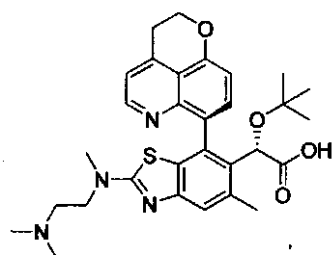
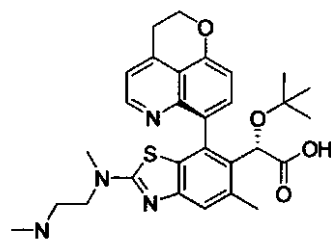
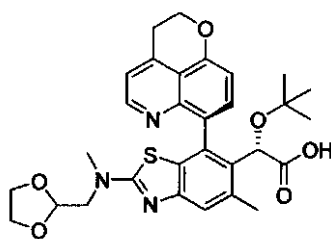
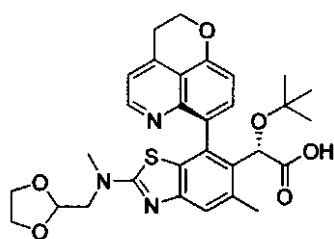
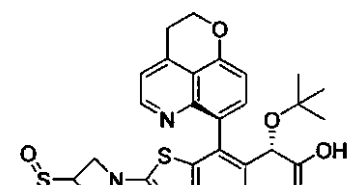
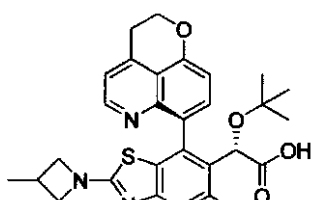
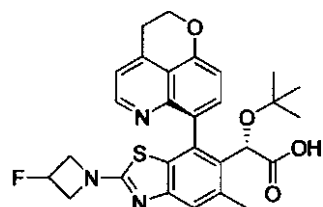
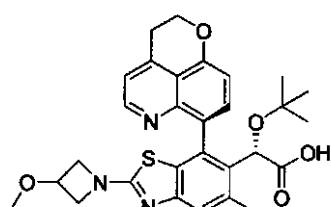
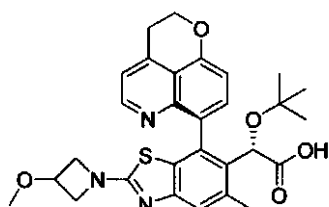
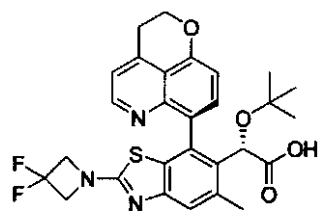
【化 1 3 8 - 1】



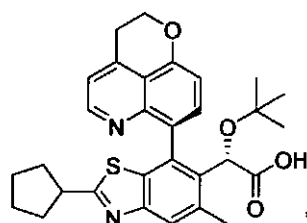
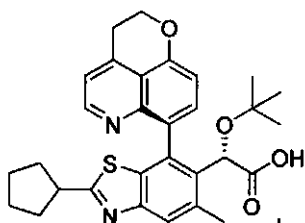
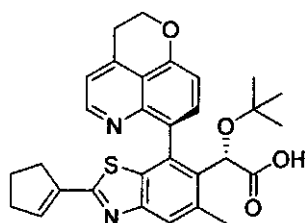
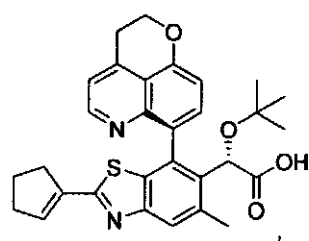
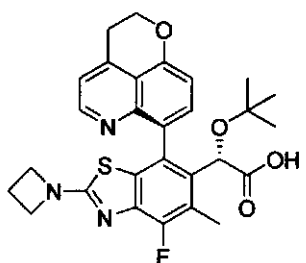
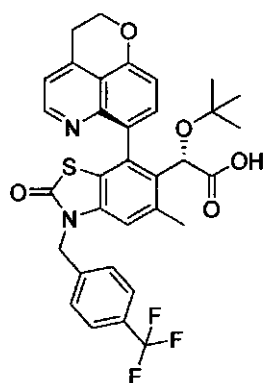
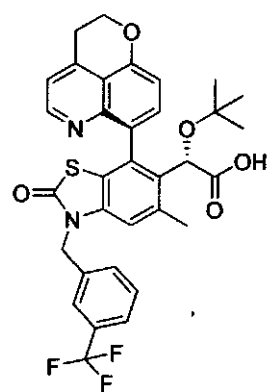
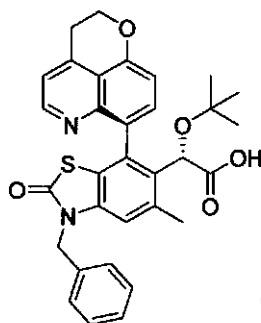
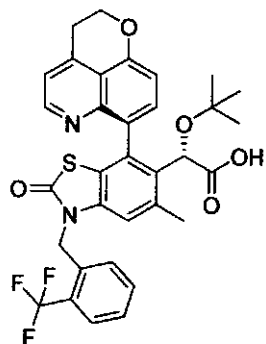
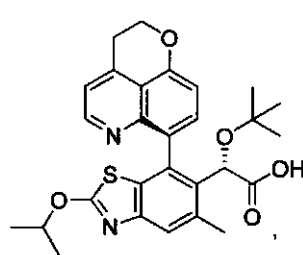
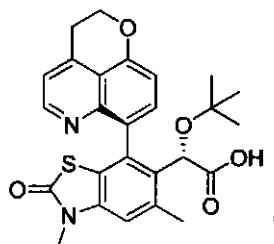
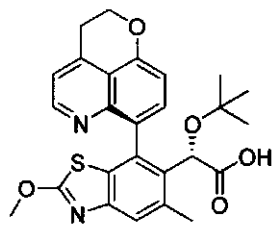
【化 1 3 8 - 2】



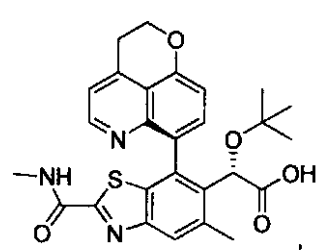
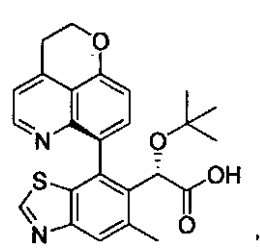
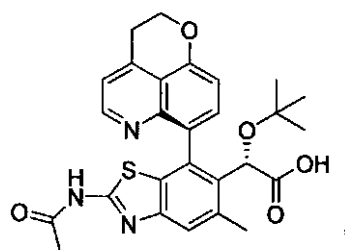
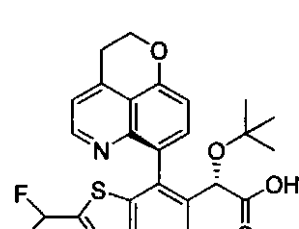
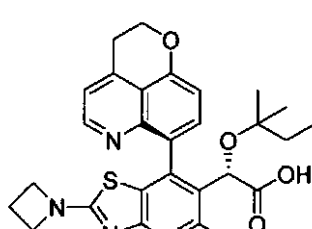
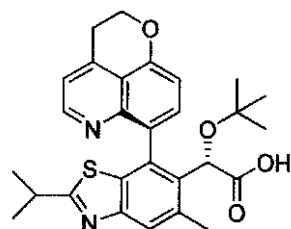
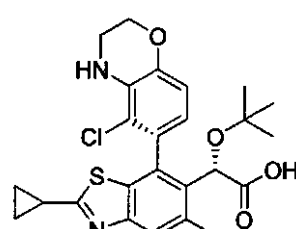
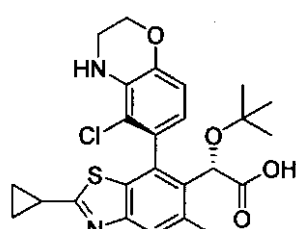
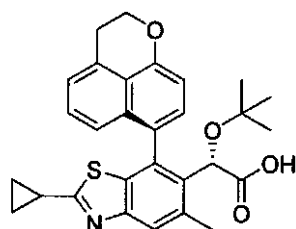
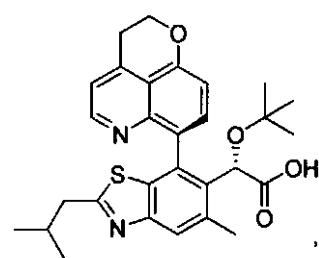
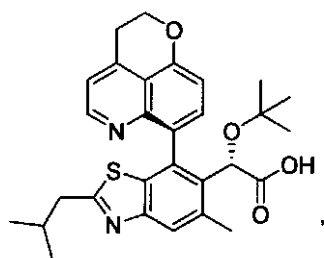
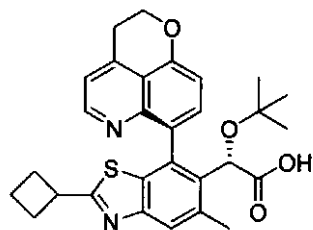
【化 1 3 8 - 3】



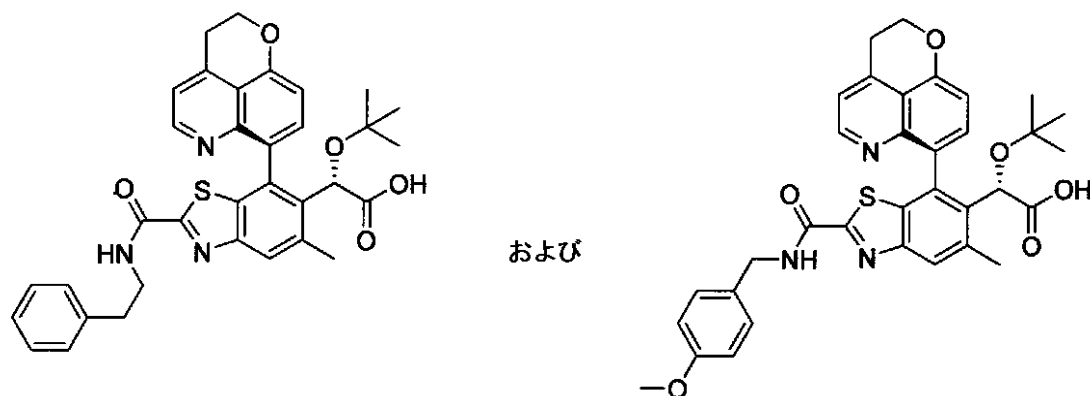
【化 1 3 8 - 4】



【化 1 3 8 - 5】



【化 1 3 8 - 6】



ならびにこれらの塩から選択される項目 1 に記載の化合物。

(項目 2 3)

R⁵ は、

a) アリール、複素環、およびヘテロアリール（ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1 個以上（例えば、1、2、または 3 個）の Z¹ 基でそれぞれ必要に応じて置換される）；

b) アリール、ヘテロアリール、および複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z⁵ 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）；および

c) アリール、ヘテロアリール、複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z^{1 5} 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）

から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 4)

R⁵ は、アリール、ヘテロアリール、および複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z^{1 5} 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物

。

(項目 2 5)

R⁵ は、

a) アリール（ここで、アリールは、1 個以上（例えば、1、2、または 3 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）；

b) アリール、ヘテロアリール、および複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z⁵ 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）；および

c) アリール、ヘテロアリール、複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z^{1 5} 基でそれぞれ独立して置換され、1 個以上（例えば、1、2、3、4、または 5 個）の Z¹ 基で必要に応じて置換される）

から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 6)

R⁵ は、

a) アリール、複素環、およびヘテロアリール（ここで、アリール、複素環、およびヘ

テロアリールは、1個以上（例えば、1、2、または3個）の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される）；

b) アリール、ヘテロアリール、および複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^5 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^1 基で必要に応じて置換される）；および

c) アリール、ヘテロアリール、複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^{15} 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^1 基で必要に応じて置換される）

から選択され、

各 Z^{11} は、 Z^{10} 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-C(=O)-N((C_1 \sim C_4) \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(=O)-$ アリール、 $-C(=O)-$ 複素環、および $-C(=O)-$ ヘテロアリールから独立して選択され、

ここで、各 Z^{10} は、

i) ハロ、オキソ、チオキソ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-O(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6)$ アルキル、および $-N((C_1 \sim C_6) \text{ アルキル})_2$ ；

ii) $-OH$ 、 $-O-(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、または $-O-(C_1 \sim C_6)$ アルキルで置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル；および

iii) アリール（前記アリールは、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、または $COOH$ で必要に応じて置換される）

から独立して選択され、

各 Z^{11} は、 Z^{10} 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-C(=O)-NH(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-C(=O)-N((C_1 \sim C_4) \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(=O)-$ アリール、 $-C(=O)-$ 複素環、および $-C(=O)-$ ヘテロアリールから独立して選択される、項目1から14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目27）

R^5 は、

a) アリール、複素環、およびヘテロアリール（ここで、アリール、複素環、およびヘテロアリールは、1個以上（例えば、1、2、または3個）の Z^{11} 基でそれぞれ必要に応じて置換される）；および

b) アリール、ヘテロアリール、複素環（ここで、アリール、ヘテロアリール、および複素環は、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^{15} 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^1 基で必要に応じて置換される）

から選択される、項目1から14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目28）

R^5 は、

a) アリール（ここで、アリールは、1個以上（例えば、1、2、または3個）の Z^{11} 基で必要に応じて置換される）；および

b) アリールおよびヘテロアリール（ここで、アリールおよびヘテロアリールは、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^{15} 基でそれぞれ独立して置換され、1個以上（例えば、1、2、3、4、または5個）の Z^1 基で必要に応じて置換される）から選択される、項目1から14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目29）

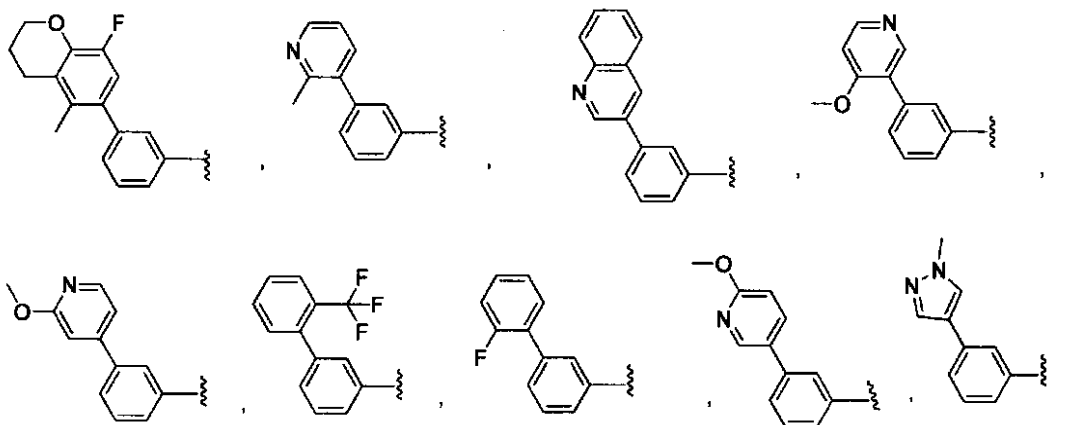
Z^{16} は、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環、および -

O (C₁ ~ C₆) アルキルから独立して選択され、ここで、Z¹⁻⁶の任意のアリール、ヘテロアリール、または複素環は、1個以上の(C₁ ~ C₆)アルキルで必要に応じて置換される、項目23から27のいずれか1項に記載の化合物。

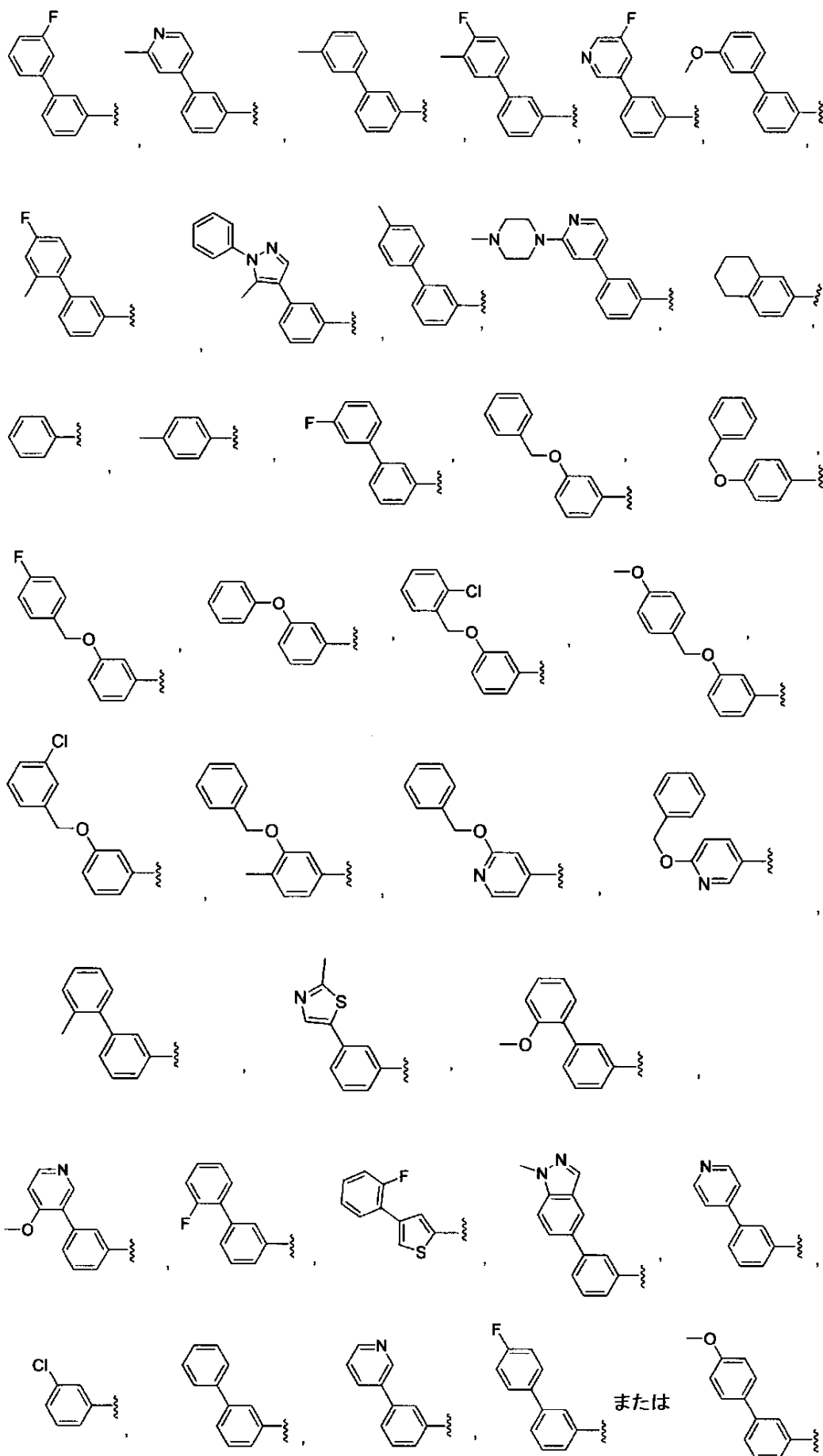
(項目30)

R⁵ は、

【化139-1】



【化 1 3 9 - 2】

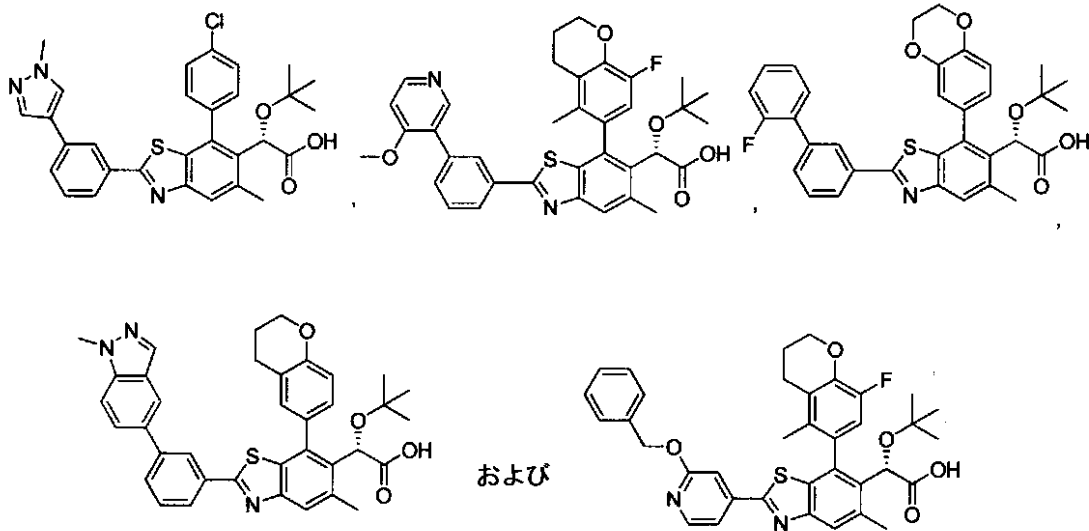


から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 1)

以下の

【化 1 4 0】



ならびにこれらの塩から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 2)

項目 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩と、薬学的に許容され得るキャリアとを含む、薬学的組成物。

(項目 3 3)

哺乳動物の HIV 感染を処置する方法であって、項目 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記哺乳動物に投与する工程を含む、方法。

(項目 3 4)

哺乳動物の HIV 感染を処置するための方法であって、治療有効量の項目 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を、治療有効量の HIV プロテアーゼ阻害化合物、逆転写酵素の HIV 非ヌクレオシドインヒビター、逆転写酵素の HIV ヌクレオシドインヒビター、逆転写酵素の HIV ヌクレオチドインヒビター、HIV インテグラーゼインヒビター、gp 41 インヒビター、CXCR4 インヒビター、gp 120 インヒビター、CCR5 インヒビター、キャプシド重合インヒビター、および HIV を処置するための他の薬物、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される 1 種以上のさらなる治療剤と組み合わせて、HIV 感染の処置を必要とする前記哺乳動物に投与する工程を含む、方法。

(項目 3 5)

医学療法で用いるための、項目 1 から 3 1 のいずれかに記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 3 6)

哺乳動物の HIV 感染を処置するための医薬の製造のための、項目 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 3 7)

哺乳動物の HIV 感染の予防的処置または治療的処置で用いるための、項目 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

発明の要旨

本発明は、HIV 感染を処置するための化合物および方法を提供する。したがって、1 つの実施形態では、本発明は、式 I :

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 4】

R^{3 a} の別の特定の値は - O C (C H₃) 3 である。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 0 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 6 0 4】

実施例 2 6 中の化合物 6 7 C を調製するために使用した手順（臭化ベンジルをヨウ化メチルの代わりに使用したことを除く）に従って化合物 7 2 を化合物 6 9 C から調製し、化合物 7 2 の合成の残りは実施例 2 5 中の化合物 6 5 K から化合物 6 6 の調製に類似している。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 0 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 6 0 8】

実施例 2 6 中の化合物 6 7 C を調製するために使用した手順（1 - (プロモメチル) - 3 - (トリフルオロメチル) ベンゼンをヨウ化メチルの代わりに使用したことを除く）に従って化合物 7 3 を化合物 6 9 C から調製し、化合物 7 3 の合成の残りは実施例 2 5 中の化合物 6 5 K から化合物 6 6 の調製に類似している。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 1 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 6 1 2】

実施例 2 6 中の化合物 6 7 C を調製するために使用した手順（1 - (プロモメチル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンゼンをヨウ化メチルの代わりに使用したことを除く）に従って化合物 7 4 を化合物 6 9 C から調製し、化合物 7 4 の合成の残りは実施例 2 5 中の化合物 6 5 K から化合物 6 6 の調製に類似している。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 6 3 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 6 3 6】

実施例 4 中の 8 E から化合物 8 F を調製するために使用した手順に従って、化合物 8 1 を化合物 7 9 から調製した。