

【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 07 D 277/62	(2006.01)
C 07 D 277/66	(2006.01)
C 07 D 277/82	(2006.01)
C 07 D 491/06	(2006.01)
C 07 D 417/04	(2006.01)
C 07 D 277/68	(2006.01)
A 61 K 31/428	(2006.01)
A 61 K 31/4741	(2006.01)
A 61 K 31/538	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 277/62	C S P
C 07 D 277/66	
C 07 D 277/82	
C 07 D 491/06	
C 07 D 417/04	
C 07 D 277/68	
A 61 K 31/428	
A 61 K 31/4741	
A 61 K 31/538	
A 61 P 31/18	
A 61 P 43/00	1 2 1
A 61 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

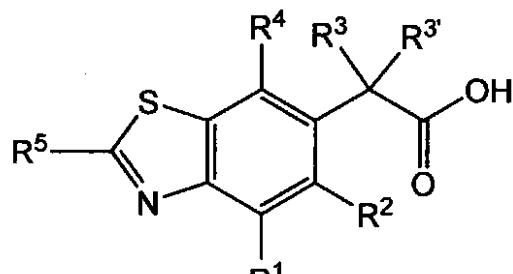
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I_a :

【化132】



(式中、

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

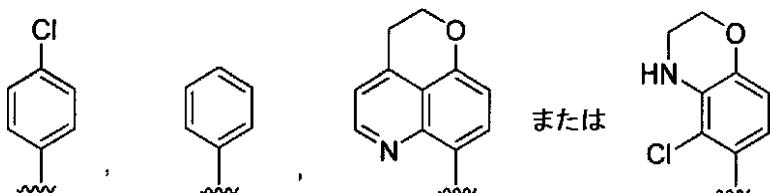
a) ハロ；または

b) H

であり、

R^{1 b} 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133】



であり、

R^{5 a} 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)-R^{1 1}、-C(=O)-O-R^{1 1}、-O-R^{1 1}、または - (C₁ ~ C₆) アルキル-R^{1 1} (ここで、各 R^{1 1} 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 Z^{1 1} 基でそれぞれ必要に応じて置換される)；あるいは

b) -N(R⁹)R^{1 0} または -C(=O)-N(R⁹)R^{1 0} (ここで、各 R⁹ は独立して、H または (C₁ ~ C₆) アルキルであり、各 R^{1 0} 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-R^{1 1}、または -C(=O)-R^{1 1} であり、ここで、各 R^{1 1} 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^{5 b} は、a) -(C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環；または

b) - N R_e R_f
であり、

各 Z¹ は独立して、ハロ、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、-SO₂(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、複素環、またはヘテロアリール(前記(C₆ ~ C₂₀) アリール、複素環、およびヘテロアリールはそれぞれ、ハロ、(C₁ ~ C₆) 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、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、

各 R_f は独立して、-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z⁶ であり、

各 Z⁶ 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、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、そして

R_c および R_d は各々独立して、(C₁ ~ C₆) 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】

R⁵^a は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹^a、-C(=O)-R¹^a、-N(R⁹)R¹⁰、-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、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Z¹基で必要に応じて置換されているか、あるいはR⁵^b は、-(C₂ ~ C₆) アルキニル-(C₃ ~ C₇) 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。

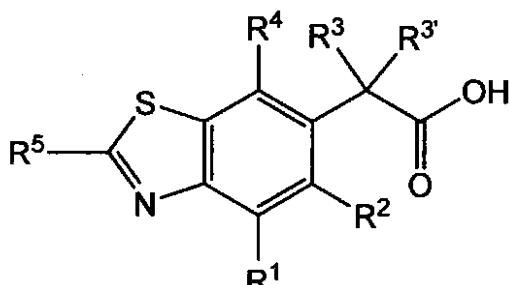
【請求項3】

R⁵ は R⁵^a 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 I a :

【化134】



Ia

(式中、

R¹ は R¹^a または R¹^b であり、

R⁵ は R⁵^a または R⁵^b であり、

R¹^a は、

a) ハロ；または

b) H

であり、

R¹^b は、シアノであり、

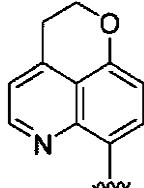
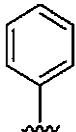
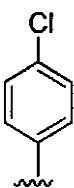
R² は、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、

R³ は、 -O(C₁ ~ C₆) アルキルであり、

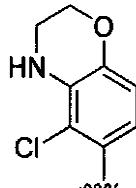
R³' は H であり、

R⁴ は、

【化 1 3 5】



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、単環複素環、-C(=O)-R¹、-C(=O)-O-R¹、-O-R¹、または-C(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹ (ここで、各 R¹ 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、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Z¹ 基で必要に応じて置換される) ; あるいは

b) -N(R⁹)R¹、または-C(=O)-N(R⁹)R¹ (ここで、各 R⁹ は独立して、H または (C₁ ~ C₆) アルキルであり、各 R¹ 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、単環複素環、- (C₁ ~ C₆) アルキル-R¹、または-C(=O)-R¹ であり、ここで、各 R¹ 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、または単環複素環である)

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 Z¹ は独立して、ハロ、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、-SO₂(C₁ ~ C₆) アルキル、または(C₁ ~ C₆) アルキルであり、

各 R_e は独立して、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、

各 R_f は独立して、-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z⁶ であり、

各 Z⁶ 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、(C₁ ~ C₆) アルキルであり、そして

R_c および R_d は各々独立して、(C₁ ~ C₆) 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、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、-(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹、-C(=O)-R¹、-N(R⁹)R¹、-C(=O)-N(R⁹)R¹、または単環複素環であるか、あるいは R^{5b} は、-(C₂ ~ C₆) アルキニル-(C₃ ~ C₇) 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】

R⁵ 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】

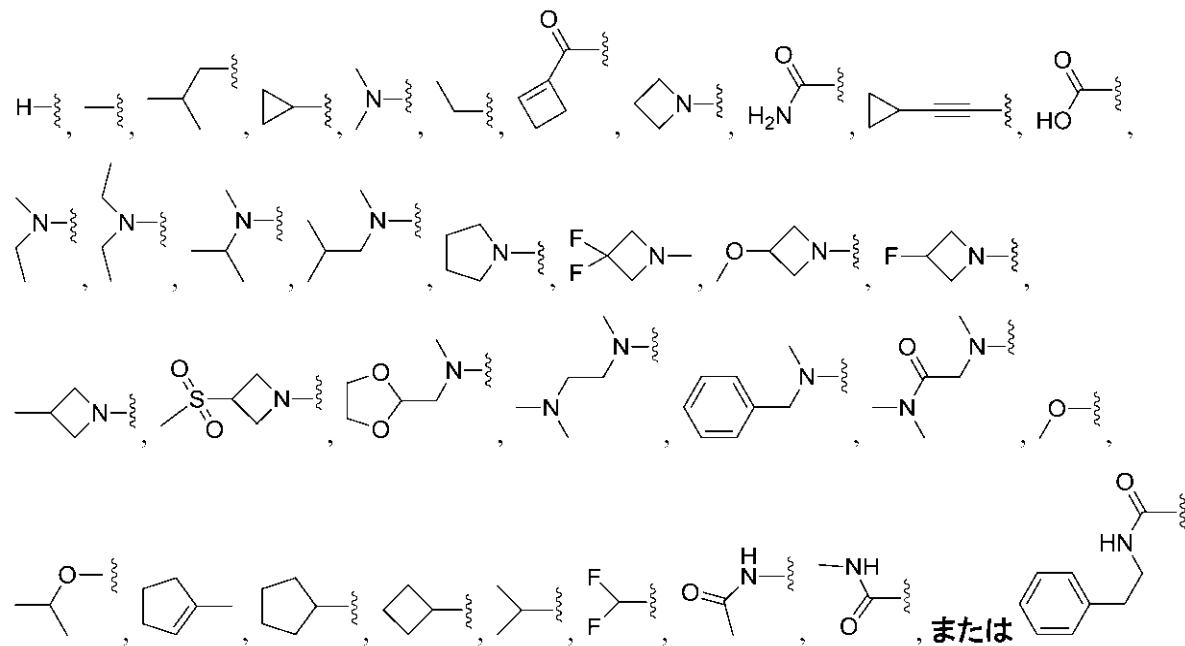
R³ は OC(CH₃)₃ である、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物またはそ

の薬学的に許容され得る塩。

【請求項 8】

R⁵ は、

【化 1 3 6】

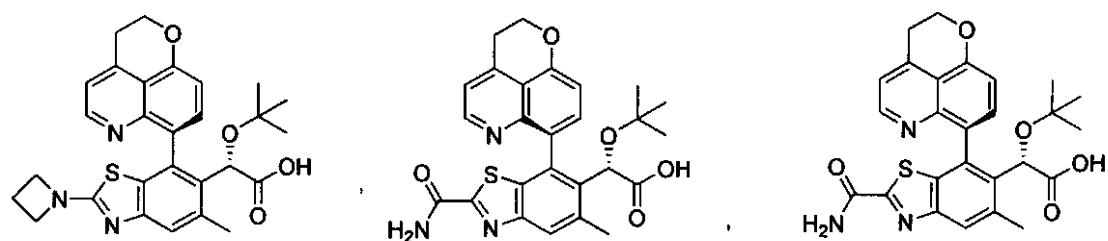
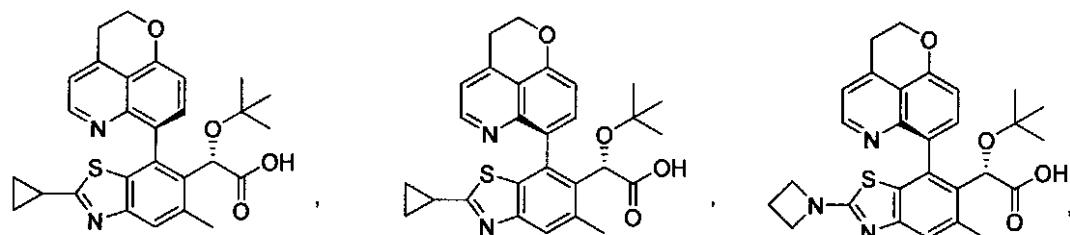
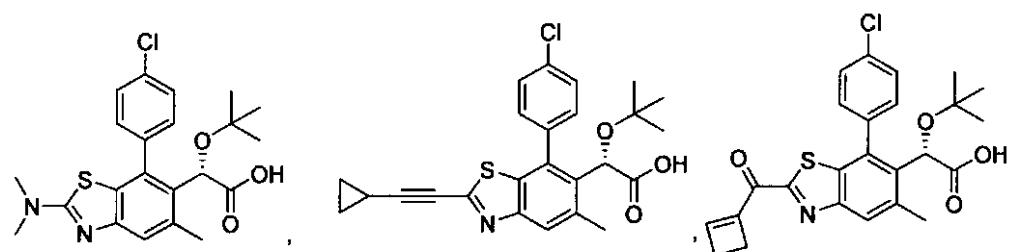
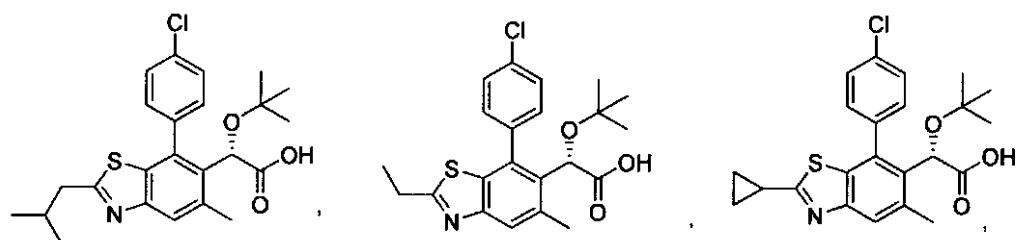
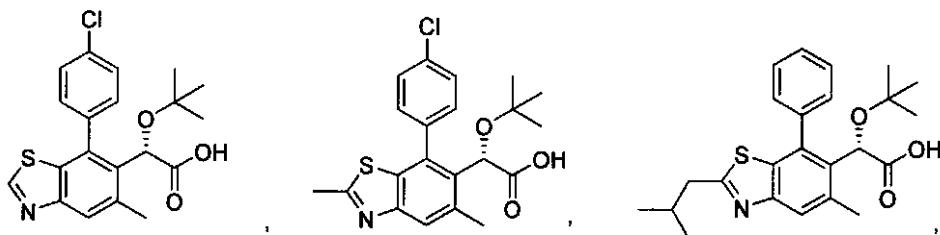


から選択される、請求項 1 から7 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

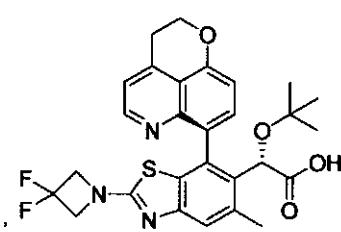
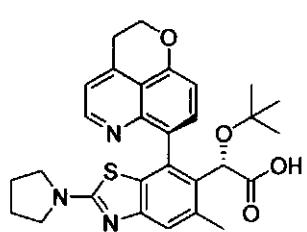
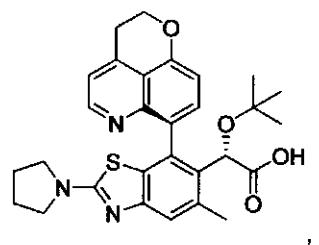
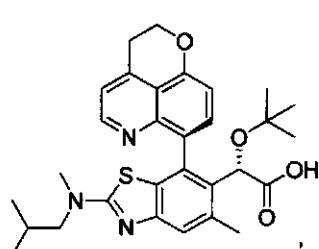
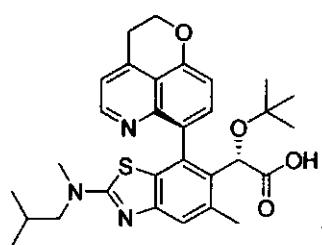
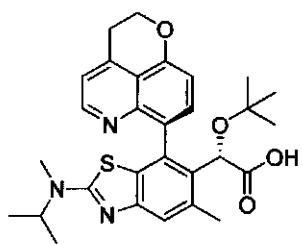
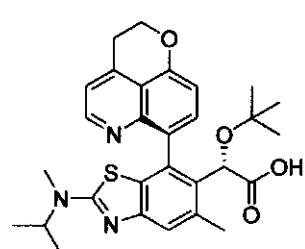
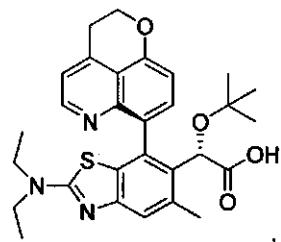
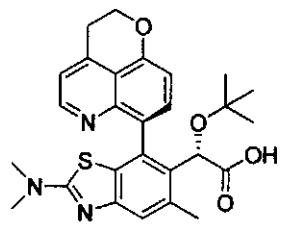
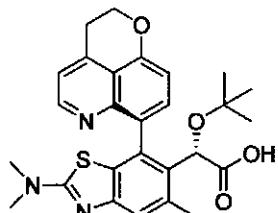
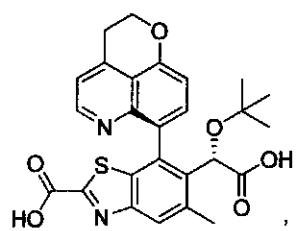
【請求項 9】

以下の

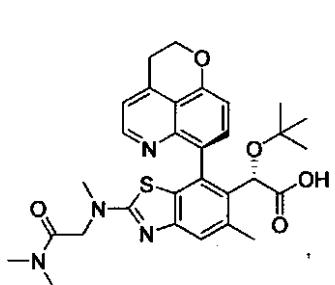
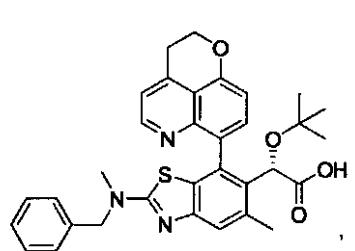
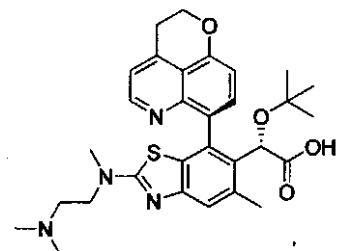
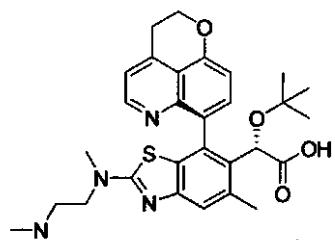
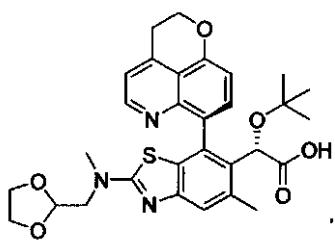
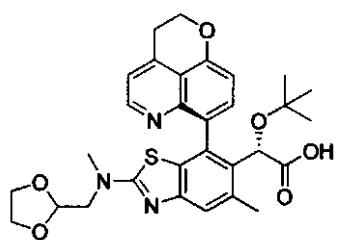
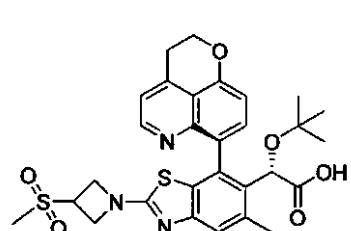
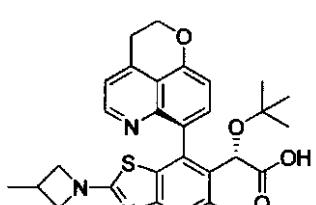
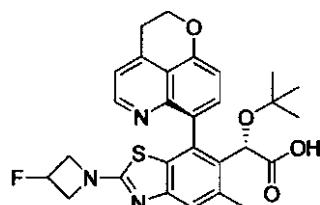
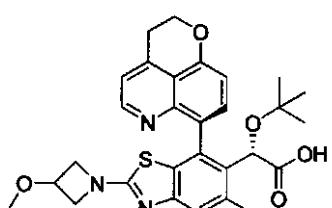
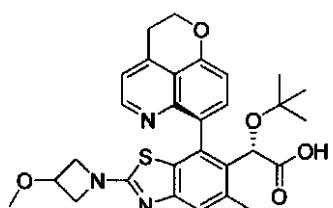
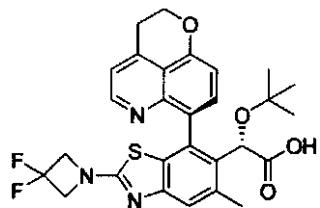
【化 1 3 8 - 1】



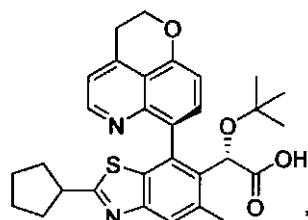
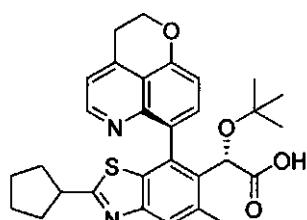
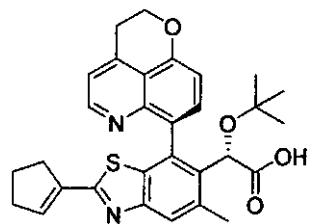
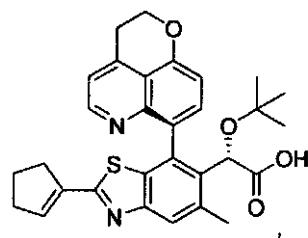
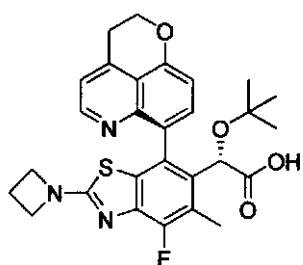
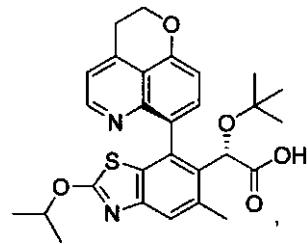
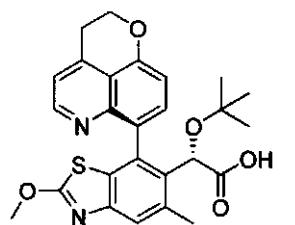
【化 1 3 8 - 2】



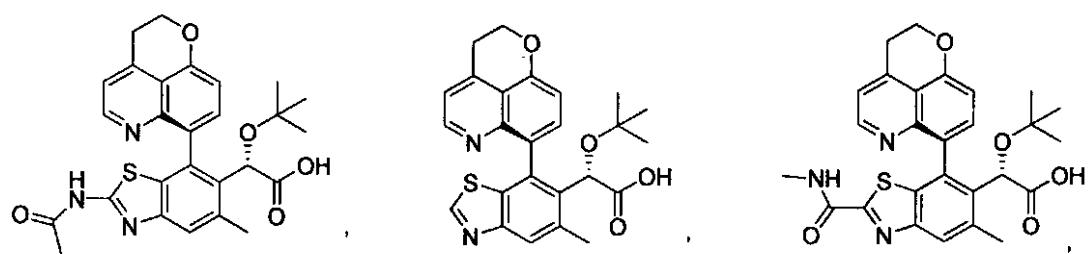
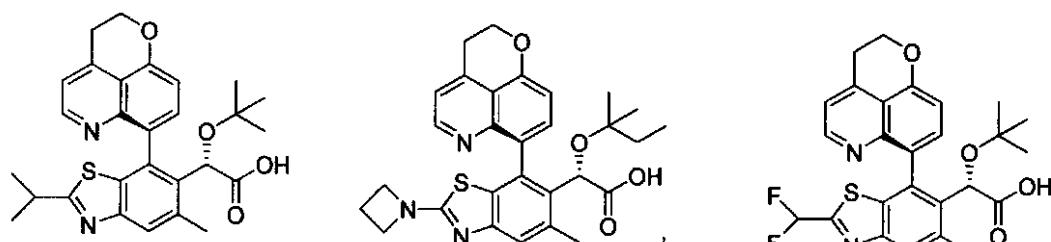
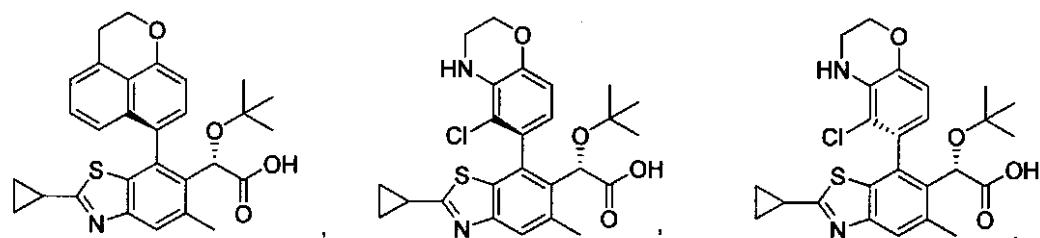
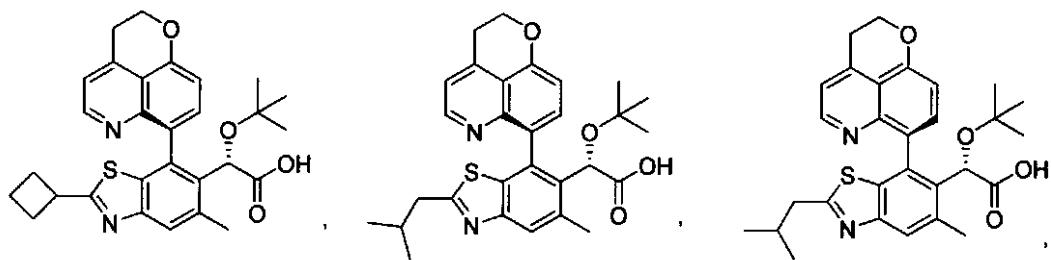
【化 1 3 8 - 3】



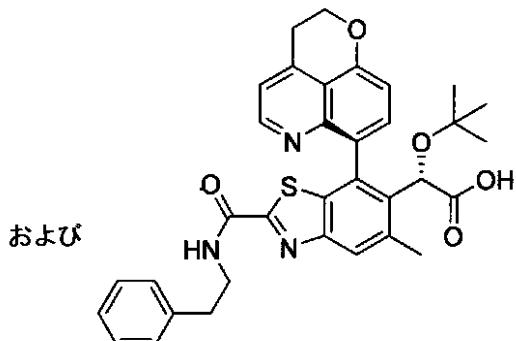
【化 1 3 8 - 4】



【化 1 3 8 - 5】



【化138-6】

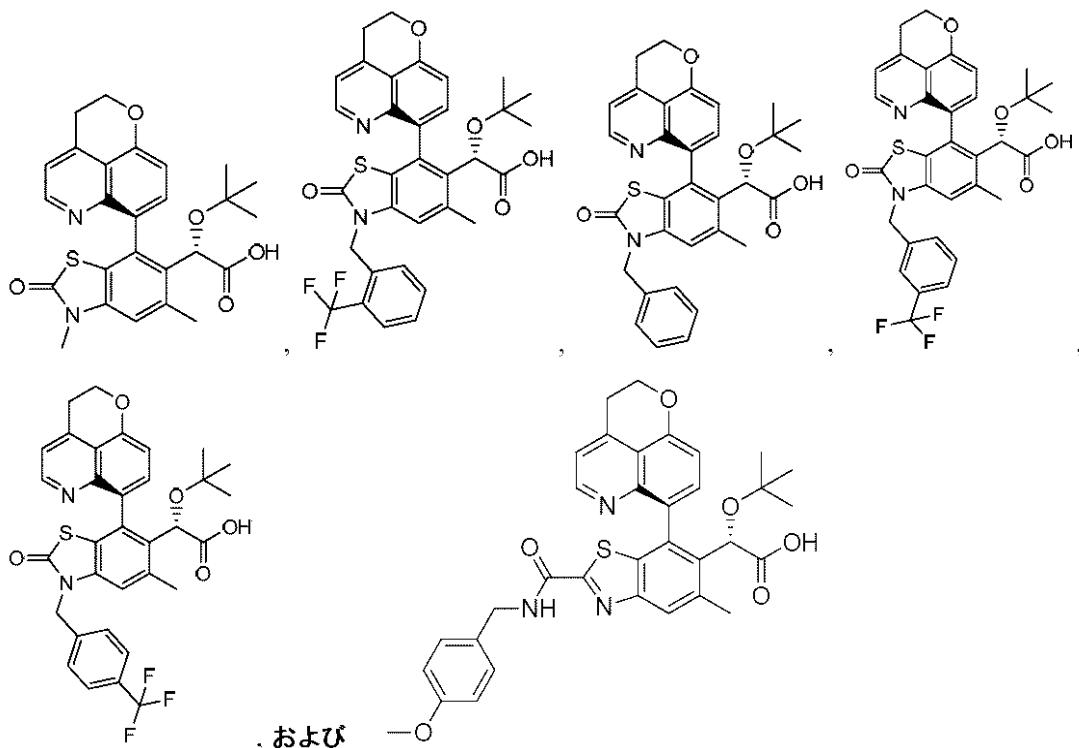


ならびにこれらの塩から選択される請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項10】

以下の

【化140】



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11】

請求項1から10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12】

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10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13】

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10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

ヒビター、HIVインテグラーゼインヒビター、gp41インヒビター、CXCR4インヒビター、gp120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投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項14】

医学療法で用いるための組成物であって、請求項1から10のいずれか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組成物。

【請求項15】

患者のHIV感染を処置するための医薬の製造のための、請求項1から10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の使用。

【請求項16】

患者のHIV感染の予防的処置または治療的処置で用いるための組成物であって、請求項1から10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組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

【補正の内容】

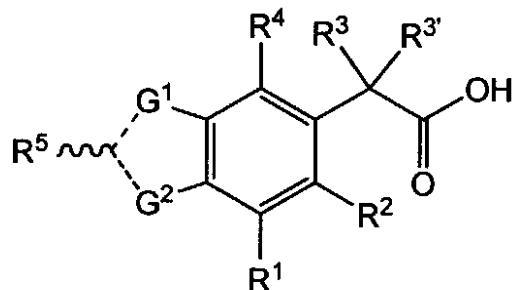
【0004】

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目1)

式I：

【化132】



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

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

G¹はSであり、G²はNR⁶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、

R¹はR^{1a}またはR^{1b}であり、

R²はR^{2a}またはR^{2b}であり、

R³はR^{3a}またはR^{3b}であり、

R³' は R^{3a}' または R^{3b}' であり、

R⁴ は R^{4a} または R^{4b} であり、

R⁵ は R^{5a} または R^{5b} であり、

R⁶ は R^{6a} または R^{6b} であり、

R^{1a} は、

a) ハロ；

b) 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)-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)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 Z¹¹ 基でそれ必要に応じて置換される)；および

c) -N(R⁹)R¹⁰、-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-SO₂-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁~C₆)アルキル-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、および-(C₁~C₆)アルキル-SO₂-N(R⁹)R¹⁰(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 R¹⁰ は、R¹¹、-(C₁~C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹、および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から独立して選択され、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)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) -(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、-(C₁~C₆)アルキル-SO₂-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-C(O)-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-O-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-S-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-S(O)-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-SO₂-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹⁴、-(C₁~C₆)アルキル-C(O)-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(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_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃~C₇)炭素環、-NR_aSO₂O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(单数または複数)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(C₂ ~ C₆)アルケニル、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、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、

R²^aは、

a) ハロ;

b) R¹¹、C(=O)-R¹¹、-C(=O)-O-R¹¹、-O-R¹¹、-S-R¹¹、-S(O)-R¹¹、-SO₂-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-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)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Z¹¹基でそれぞれ必要に応じて置換される) ; および

c) -N(R⁹)R¹⁰、-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-SO₂-N(R⁹)R¹⁰、-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁ ~ C₆)アルキル-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁ ~ C₆)アルキル-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、および-(C₁ ~ C₆)アルキル-SO₂-N(R⁹)R¹⁰(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、ここで、各R¹⁰は、R¹¹、-(C₁ ~

C_6) アルキル - $R^{1\ 1}$ 、- SO_2 - $R^{1\ 1}$ 、- $C(=O)$ - $R^{1\ 1}$ 、- $C(=O)OR^{1\ 1}$ 、および - $C(=O)N(R^9)R^{1\ 1}$ から独立して選択され、ここで、各 $R^{1\ 1}$ 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、

$R^{2\ b}$ 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 - $Z^{1\ 3}$ 、- $C(O)$ - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- O - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- S - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- S(O) - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- SO_2 - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 4}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - C(O) - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - C(O) - O($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - O - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキル - S - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - $Z^{1\ 3}$ 、- ($C_3 \sim C_7$) 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 (单数または複数) 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、($C_2 \sim C_6$) アルケニル、($C_2 \sim C_6$) 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)；

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-Z^{1~2}、-(C₁ ~ C₆)アルキル-O-(C₂ ~ C₆)アルケニル-Z^{1~2}、-(C₂ ~ C₆)アルキル-O-(C₂ ~ C₆)アルキニル-Z^{1~2}、-(C₁ ~ C₆)アルキル-S-(C₁ ~ C₆)アルキル-Z^{1~2}、-(C₂ ~ C₆)アルキル-S-(C₂ ~ C₆)アルキニル-Z^{1~2}、-(C₁ ~ C₆)アルキル-S(O)-(C₁ ~ C₆)アルキル-Z^{1~2}、-(C₂ ~ C₆)アルケニル-Z^{1~2}、-(C₁ ~ C₆)アルキル-S(O)-(C₂ ~ C₆)アルキニル-Z^{1~2}、-(C₁ ~ C₆)アルキル-SO₂-(C₁ ~ C₆)アルキル-Z^{1~2}、-(C₂ ~ C₆)アルキル-SO₂-(C₂ ~ C₆)アルケニル-Z^{1~2}、-(C₂ ~ C₆)アルキル-SO₂-(C₂ ~ C₆)アルキニル

$- Z^1$ 、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキル-NR_aR_b、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキルOC(O)
 $- NR_cR_d$ 、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-C(O)-OR_b、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-C(O)-NR_aR_b、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂(C₁~C₆)アルキル、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂NR_cR_d、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_aSO₂NR_cR_d、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_aSO₂O(C₃~C₇)炭素環、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_aSO₂Oアリール、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-アリール、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-ヘテロアリール、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-複素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_aR_b、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキルOC(O)-NR_cR_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_aR_b、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-アリール、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-ヘテロアリール、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-複素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-NR_aR_b、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂-アリール、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂- $(C_3 \sim C_7)$ ハロ炭素環、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR_a-SO₂O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、R³^bの任意の(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルキニル、(C₂~C₆)アルキニル、アリール、(C₃~C₇)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Z¹基で必要に応じて置換され、

R³^bは、H、(C₁~C₆)アルキル、または-O(C₁~C₆)アルキルであるか、あるいは、

R³^bおよびR³^bが、それらが結合している炭素と一緒に複素環または(C₃~C₇)炭素環を形成し、ここで、R³^bおよびR³^bとそれらが結合している炭素との複素環または(C₃~C₇)炭素環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換され、

R⁴^a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、R⁴^aの任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルキニル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-(C₃~C₇)シクロアルキル、-OH、 $- O(C_1 \sim C_6)$ アルキル、-SH、-S(C₁~C₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁~C₆)アルキル、および-N((C₁~C₆)アルキル)、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、(C₁~C₆)アルキルは、ヒドロキシ、-O(C₁~C₆)アルキル、シアノ、またはオキソで必要に応じて置換され、

R⁴^bは、

a)(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルキニル、および(C₂~C₆)アルキニル(ここで、(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルキニル、または(C₂~

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(单数または複数)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(单数または複数)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) 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-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、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Z¹¹基でそれぞれ必要に応じて置換される)； および

c) -N(R⁹)R¹⁰、-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-SO₂-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁ ~ C₆)アルキル-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁ ~ C₆)アルキル-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁ ~ C₆)アルキル-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、および-(C₁ ~ C₆)アルキル-SO₂-N(R⁹)R¹⁰(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R¹⁰は、R¹¹、-(C₁ ~ C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹、および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から独立して選択され、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)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_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃ ~ C₇)炭素環、-NR_aSO₂O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 (单数または複数) 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) - N R_e R_f、- C(O) N R_e R_f、- O C(O) N R_e R_f、- SO₂ N R_e R_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_e R_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル C(O) - N R_e R_f、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - C(O) - N R_e R_f、および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ N R_e R_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Z¹ ~ 5 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) オキソ

から選択され、

R⁶^a は、

a) R¹ ~ 1、- C (= O) - R¹ ~ 1、- C (= O) - O - R¹ ~ 1、- O - R¹ ~ 1、- S - R¹ ~ 1、- S (O) - R¹ ~ 1、- SO₂ - R¹ ~ 1、- (C₁ ~ C₆) アルキル - R¹ ~ 1、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C (= O) - R¹ ~ 1、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - R¹ ~ 1、- (C₁ ~ C₆) アルキル - S - R¹ ~ 1、- (C₁ ~ C₆) アルキル - S (O) - R¹ ~ 1、および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - R¹ ~ 1 (ここで、各 R¹ ~ 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

$\sim C_7$) 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、およびヘテロアリールは、1個以上のZ¹基でそれ必要に応じて置換される) ; および

b) -C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-SO₂-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁~C₆)
) アルキル-N(R⁹)R¹⁰、-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、および-(C₁~C₆)アルキル-SO₂-N(R⁹)R¹⁰(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R¹⁰は、R¹¹、-(C₁~C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹、および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から独立して選択され、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)シクロアルキル、-(C₁~C₆)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Z¹基でそれ必要に応じて置換される)

から選択され、

R⁶ b) は、

a) -(C₁~C₆)アルキル-SO₂- (C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-C(O)
) -(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-O-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-S-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-S(O)-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-C(O)-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-O-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-S-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-O-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆)アルキル-Z¹³、-(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~C₇)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、-(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、-(C₁~C₆)ハロアルキル-Z³、-NR_aS
 O₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃~C₇)炭素環、および-NR_aSO₂Oアリール(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、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、および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(单数または複数)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、-X(C₃~C₇)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、 $-X(C_2 \sim C_6)$ 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) $(C_1 \sim C_6)$ 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) ; 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-SO₂NR_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Z¹ 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SO₂-から独立して選択され、

各Z¹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、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 炭素環、 $-S(O)$ ヘテロアリール、 $-S(O)$ 複素環、 $-SO_2(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)$ アリール、 $-S(O)$ 炭素環、 $-SO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-S(O)$ 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、Z¹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Z²は、-NO₂、-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_aSO₂(C₃～C₇)炭素環、-NR_aSO₂アリール、-NR_aSO₂ヘテロアリール、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃～C₇)炭素環、および-NR_aSO₂Oアリールから独立して選択され、

各Z³は、-NO₂、-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、(C₃～C₇)ハロ炭素環、-O(C₁～C₆)アルキル、-O(C₃～C₇)炭素環、-O(C₃～C₇)ハロ炭素環、-Oアリール、-O複素環、-Oヘテロアリール、-S(C₁～C₆)アルキル、-S(C₃～C₇)炭素環、-S(C₃～C₇)ハロ炭素環、-Sアリール、-S複素環、-Sヘテロアリール、-S(O)(C₁～C₆)アルキル、-S(O)(C₃～C₇)炭素環、-S(O)(C₃～C₇)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、-SO₂(C₁～C₆)アルキル、-SO₂(C₃～C₇)炭素環、-SO₂(C₃～C₇)ハロ炭素環、SO₂アリール、-SO₂複素環、-SO₂ヘテロアリール、-NR_aR_b、-NR_aC(O)R_b、-C(O)NR_cR_d、-SO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃～C₇)炭素環、および-NR_aSO₂Oアリールから独立して選択され、

各Z⁴は、ハロゲン、-(C₁～C₆)アルキル、(C₃～C₇)炭素環、-(C₁～C₆)ハロアルキル、-NO₂、-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、-(C₃～C₇)ハロ炭素環、-O(C₁～C₆)アルキル、-O(C₃～C₇)炭素環、-O(C₃～C₇)ハロ炭素環、-Oアリール、-O複素環、-Oヘテロアリール、-S(C₁～C₆)アルキル、-S(C₃～C₇)炭素環、-S(C₃～C₇)ハロ炭素環、-Sアリール、-S複素環、-Sヘテロアリール、-S(O)(C₁～C₆)アルキル、-S(O)(C₃～C₇)炭素環、-S(O)(C₃～C₇)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、-SO₂(C₁～C₆)アルキル、-SO₂(C₃～C₇)炭素環、-SO₂(C₃～C₇)ハロ炭素環、SO₂アリール、-SO₂複素環、-SO₂ヘテロアリール、-NR_aR_b、-NR_aC(O)R_a、-C(O)NR_cR_d、-SO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃～C₇)炭素環、および-NR_aSO₂Oアリールから独立して選択され、

各Z⁵は、-NO₂、-CN、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃～C₇)炭素環、-NR_aSO₂Oアリール、-NR_aSO₂(C₁～C₆)アルキル、-NR_aSO₂(C₂～C₆)アルケニル、-NR_aSO₂(C₂～C₆)アルキニル、-NR_aSO₂(C₃～C₇)炭素環、-NR_aSO₂(C₃～C₇)ハロ炭素環、-NR_aSO₂アリール、-NR_aSO₂ヘテロアリール(heteraryl)、-NR_aSO₂ヘテロアリール、-NR_aSO₂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)(C₃～C₇)炭素環、-NR_aC(O)(C₃～C₇)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Z⁶は、-NO₂、-CN、-NR_aR_a、NR_aC(O)R_b、-C(O)NR_cR_d、(C₃～C₇)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(C₃～C₇)ハロ炭素環、-O(C₁～C₆)アルキル、-O(C₃～C₇)炭素環、-O(C₁～C₆)ハロアルキル、-Sアリール、-Sヘテロアリール、-S複素環、-S(C₃～C₇)ハロ炭素環、-S(C₁～C₆)アルキル、-S(C₃～C₇)炭素環、-S(C₁～C₆)ハロアルキル、-S(O)アリール、-S(O)複素環、-S(O)ヘテロアリール、-S(O)複素環、-S(O)(C₃～C₇)炭素環、-S(O)(C₁～C₆)アルキル、-S(O)(C₃～C₇)炭素環、-S(O)(C₁～C₆)ハロアルキル、-SO₂アリール、-SO₂ヘテロアリール、-SO₂複素環、-SO₂(C₁～C₆)アルキル、-SO₂(C₁～C₆)ハロアルキル、-SO₂(C₃～C₇)炭素環、-SO₂(C₃～C₇)ハロ炭素環、-SO₂NR_cR_d

d、 - N R_a S O₂ (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - N R_a S O₂ アリール、 - N R_a S O₂ ヘテロアリール (heteraryl) 、 - N R_a S O₂ ヘテロアリール、 - N R_a S O₂ N R_c R_d 、 - N R_a S O₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環、 および - N R_a S O₂ O アリールから独立して選択され、 ここで、 Z⁶ 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、 - O H 、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル、 - C N 、 または - (C₁ ~ C₆) アルキルで必要に応じて置換され、

各 Z⁷ は、 - N O₂ 、 = N O R_a 、 - C N 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~2} 、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - Z^{1~2} 、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル O H 、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - Z^{1~2} 、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - O H 、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル - Z^{1~2} 、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル O H 、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z^{1~2} 、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 O H 、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - (C₁ ~ C₆) アルキル N R_c R_d 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a C (O) R_a 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a S O₂ R_a 、 アリール、 ヘテロアリール、 複素環、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~2} 、 - 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 (C₁ ~ C₆) アルキル N R_c R_d 、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a C (O) R_a 、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a S O₂ R_a 、 - O ヘテロアリール、 - O 複素環、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~2} 、 - S (C₂ ~ C₆) アルケニル、 - S (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - S (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル N R_c R_d 、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a C (O) R_a 、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a S O₂ R_a 、 - 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) (C₁ ~ C₆) アルキニル、 - S (O) (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキル N R_c R_d 、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a C (O) R_a 、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a S O₂ R_a 、 - S (O) アリール、 - S (O) ヘテロアリール、 - S (O) 複素環、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - S O₂ (C₂ ~ C₆) アルケニル、 - S O₂ (C₂ ~ C₆) アルキニル、 - S O₂ (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - S O₂ (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S O₂ アリール、 - S O₂ ヘテロアリール、 - S O₂ 複素環、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル N R_c R_d 、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a C (O) R_a 、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル N R_a S O₂ R_a 、 - S O₂ N R_c R_d 、 - N R_a C (O) O R_b 、 - N R_a C (O) N R_c R_d 、 - N R_a S O₂ R_b 、 - N R_a S O₂ N R_c R_d 、 - N R_a S O₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - N R_a S O₂ O アリール、 - O S (O)₂ R_a 、 - C (O) N R_c R_d 、 および - O C (O) N R_c R_d から独立して選択され、 ここで、 Z⁷ 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、 (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、 - O H 、 - O R_b 、 - C N 、 - N R_a C (O)₂ R_b 、 ヘテロアリール、 複素環、 または - S (O)₂ N R_c R_d で必要に応じて置換され、

各 Z⁸ は、 - N O₂ または - C N から独立して選択され、

各 Z^{1~0} は、

i) ハロ、 オキソ、 チオキソ、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、 (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - O H 、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル、 - O (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 - S H 、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル、 - S O (C₁ ~ C₆) アルキル、 - S O₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - N H₂ 、 - N H (C₁ ~ C₆) アルキル、 および - N ((C₁ ~ C₆) アルキル)₂ ;

i i) - O H 、 - O - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 または - O - (C₁ ~ C₆) 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 $Z^{1,1}$ は、 $Z^{1,0}$ 、 - $\text{C}(=\text{O})-\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(=\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$ アル
キル、 - $\text{C}(=\text{O})-\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$ アルキル) $_2$ 、 - $\text{C}(=\text{O})-$ アリール、 - $\text{C}(=\text{O})-$ 複素環、および - $\text{C}(=\text{O})-$ ヘテロアリールから独立して選択され、

各 $Z^{1,2}$ は、 - NO_2 、 = NOR_a 、チオキソ、アリール、複素環、 - ヘテロアリール
、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) ハロ炭素環、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) 炭素環、 - $\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環 (halocarbocycle) 、 - O アリール、 - O 複素環
、 - O ヘテロアリール、 - $\text{S}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{S}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{S}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環 (halocarbocycle) 、 - S アリール、 - S 複素環
、 - S ヘテロアリール、 - $\text{S(O)(C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{S(O)(C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{S(O)(C}_3 \sim \text{C}_7)$ 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、 - $\text{SO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{SO}_2(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{SO}_2(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 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 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)R}_b$ 、 - $\text{C(O)NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{SO}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環
、および - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}$ アリールから独立して選択され、

各 $Z^{1,3}$ は、 - NO_2 、 - OH 、 = NOR_a 、 - SH 、 - CN 、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) ハロ炭
素環、 - $\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{O}(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 - $\text{O}(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$
アルキニル、 - $\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 - $\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - O アリール、 - O ヘテロアリール、 - O 複素環、 - $\text{S}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{S}(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 - $\text{S}(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル、 - $\text{S}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 - $\text{S}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{S}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - S アリール、 - S ヘテロアリール、 - S 複素環、 - $\text{S(O)(C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{S(O)(C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 - $\text{S(O)(C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル、 - $\text{S(O)(C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 - $\text{S(O)(C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{S(O)(C}_3 \sim \text{C}_7)$ 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、 - $\text{SO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 - $\text{SO}_2(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 - $\text{SO}_2(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル、 - $\text{SO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 - $\text{SO}_2(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{SO}_2(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 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、 - $\text{SO}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ 、 - NR_cR_d 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)R}_a$ 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)OR}_b$ 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{R}_b$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}$ アリール
、 - $\text{OS(O)}_2\text{R}_a$ 、 - C(O)R_a 、 - C(O)OR_b 、 - $\text{C(O)NR}_c\text{R}_d$ 、 および - $\text{OC(O)NR}_c\text{R}_d$ から独立して選択され、ここで、 $Z^{1,3}$ の任意の ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$) 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、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) ハロ炭素環、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) 炭素環、 ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) 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 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)}_2\text{R}_b$ 、 - 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 - $\text{S(O)}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ で必要に応じて置換され、

各 $Z^{1,4}$ は、 - NO_2 、 = NOR_a 、 - CN 、 - $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - $\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - $\text{S}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - $\text{S(O)(C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - $\text{SO}_2(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{NR}_c\text{R}_d$ 、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 - $\text{NR}_a\text{SO}_2\text{O}$ アリール、 - $\text{OS(O)}_2\text{R}_a$ から独立して選択され、ここで、 $Z^{1,4}$ の任意の - $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 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 、 - $\text{NR}_a\text{C(O)}_2\text{R}_b$

、 - 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) ₂ NR _c R _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 (C ₁ ~ C ₆) アルキル - アリール、 - O (C ₁ ~ C ₆) アルキル - ヘテロアリール、 - O (C ₁ ~ C ₆) 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 Z ¹ 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 (C ₁ ~ C ₆) アルキル - アリール、 - O (C ₁ ~ C ₆) アルキル - ヘテロアリール、または - O (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 複素環は、1個以上の Z ¹ 基で必要に応じて置換され、

各 Z ¹ ₆ は、 - NO ₂ 、 - OH 、 = NOR _a 、 - SH 、 - CN 、 (C ₂ ~ C ₆) アルケニル、 (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 (C ₁ ~ C ₆) ハロアルキル、 (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 (C ₃ ~ C ₇) ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリール、複素環、 - O (C ₁ ~ C ₆) アルキル、 - O (C ₂ ~ C ₆) アルケニル、 - O (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 - O (C ₁ ~ C ₆) ハロアルキル、 - O (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 - O (C ₃ ~ 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 ~ C ₆) アルキル、 - S (C ₂ ~ C ₆) アルケニル、 - S (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 - S (C ₁ ~ C ₆) ハロアルキル、 - S (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 - S (C ₃ ~ 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 ~ C ₆) アルキル、 - S (O) (C ₂ ~ C ₆) アルケニル、 - S (O) (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 - S (O) (C ₁ ~ C ₆) ハロアルキル、 - S (O) (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 - S (O) (C ₃ ~ C ₇) ハロ炭素環、 - SO ₂ (C ₁ ~ 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 ~ C ₆) アルケニル、 - SO ₂ (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 - SO ₂ (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 - SO ₂ (C ₃ ~ 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 NR _c R _d 、 - NR _c R _d 、 - NR _a C (O) R _a 、 - NR _a C (O) OR _b 、 - NR _a C (O) NR _c R _d 、 - NR _a SO ₂ R _b 、 - NR _a SO ₂ NR _c R _d 、 - NR _a SO ₂ O (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 - NR _a SO ₂ O アリール、 - OS (O) ₂ R _a 、 - C (O) R _a 、 - C (O) OR _b 、 - C (O) NR _c R _d 、 および - OC (O) NR _c R _d から独立して選択され、ここで、Z ¹ ₆ の任意の (C ₁ ~ C ₆) アルキル、 (C ₂ ~ C ₆) アルケニル、 (C ₂ ~ C ₆) アルキニル、 - (C ₃ ~ C ₇) ハロ炭素環、 (C ₃ ~ C ₇) 炭素環、 (C ₃ ~ 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、(C ₁ ~ C ₆) アルキル、 - OH 、 - OR _b 、 - CN 、 - NR _a C (O) ₂ R _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) ₂ NR _c R _d で必要に応じて置換され、

各 R _a は、独立して、H、(C ₁ ~ C ₆) アルキル、(C ₂ ~ C ₆) アルケニル、(C ₂ ~ C ₆) アルキニル、(C ₃ ~ C ₇) 炭素環、複素環、アリール、アリール (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、ヘテロアリール、またはヘテロアリール (C ₁ ~ C ₆) アルキル - であり、ここで、R _a の任意の (C ₁ ~ C ₆) アルキル、(C ₂ ~ C ₆) アルケニル、(C ₂ ~ C ₆) アルキニル、(C ₃ ~ 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、

各 R _b は、独立して、(C ₁ ~ C ₆) アルキル、(C ₂ ~ C ₆) アルケニル、(C ₂ ~ C ₆) アルキニル、(C ₃ ~ C ₇) 炭素環、複素環、アリール、アリール (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、ヘテロアリール、またはヘテロアリール (C ₁ ~ C ₆) アルキル - であり、ここで、R _b の任意の (C ₁ ~ C ₆) アルキル、(C ₂ ~ C ₆) アルケニル、(C ₂ ~ C ₆) アルキニル、(C ₃ ~ 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、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 、 -SO₂R_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 NR⁶ 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。

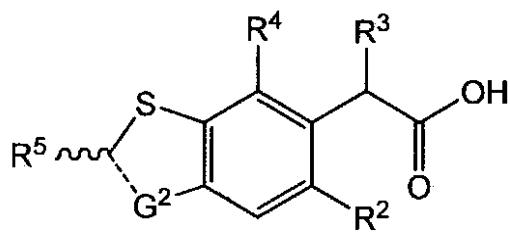
(項目 4)

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、

G² は N 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、

G² は N R⁶ 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)

R³ は、 (C₁ ~ C₆) アルキル、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、または - O (C₁ ~ C₆) アルキルであり、 R³ ^a の任意の (C₁ ~ C₆) アルキルまたは (C₂ ~ C₆) アルケニルは、 - 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る、項目 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

R³ は - OC (CH₃)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)

R⁴ 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、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- OH、- O (C₁ ~ C₆) アルキル、- SH、- S (C₁ ~ C₆) アルキル、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₆) アルキル、および - N ((C₁ ~ C₆) 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、(C₁ ~ C₆) アルキルは、ヒドロキシ、- O (C₁ ~ C₆) 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 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、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

R⁴ 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、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- OH、- O (C₁ ~ C₆) アルキル、- SH、- S (C₁ ~ C₆) アルキル、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₆) アルキル、および - N ((C₁ ~ C₆) 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、(C₁ ~ C₆) アルキルは、ヒドロキシ、- O (C₁ ~ C₆) 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 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、項目 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

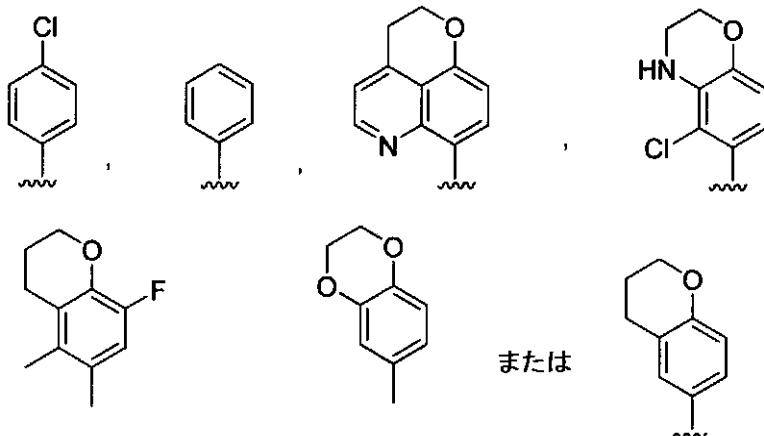
R⁴ は、アリール、複素環、およびヘテロアリール (ここで、R⁴ の任意のアリール、複素環、およびヘテロアリールは、ハロ、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキル - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- OH、- O (C₁ ~ C₆) アルキル、- SH、- S (C₁ ~ C₆) アルキル、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₆) アルキル、および - N ((C₁ ~ C₆) アルキル)₂ からそれぞれ独立して選択される 1 個以上の基で必要に応じて置換され、ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルは、ヒドロキシ、- O (C₁ ~ C₆)

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11)

R⁴は、

【化134】

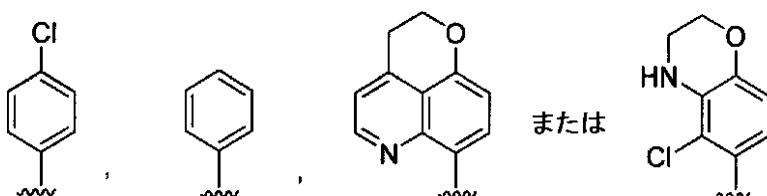


である、項目1から7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

R⁴は、

【化135】



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13)

R²はハロ、H、または(C₁~C₆)アルキルである、項目1から12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

R²はハロ、H、または-C₁H₃である、項目1から12のいずれか1項に記載の化合物。

。

(項目15)

R⁵は、

a) R¹~R¹、-C(=O)-R¹~R¹、-C(=O)-O-R¹~R¹、-O-R¹~R¹、-S-R¹~R¹、-S(O)-R¹~R¹、-SO₂-R¹~R¹、-(C₁~C₆)アルキル-R¹~R¹、-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-R¹~R¹、-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-O-R¹~R¹、-(C₁~C₆)アルキル-S-R¹~R¹、-(C₁~C₆)アルキル-S(O)-R¹~R¹、および-(C₁~C₆)アルキル-SO₂-R¹~R¹ (ここで、各R¹~R¹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Z¹~Z¹基でそれぞれ必要に応じて置換される)；

b) -N(R⁹)R¹~R¹、-C(=O)-N(R⁹)R¹~R¹、-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-O-C(=O)-N(R^9) R^{10} 、および $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂-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) $- (C_1 \sim C_6)$ 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SO₂($C_1 \sim C_6$)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-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-Z¹、または $- (C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル-Z³(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、単独でまたは基として、1個以上のZ¹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-SO₂NR_eR_f(ここで、各 $(C_1 \sim C_6)$ 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); 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Z¹¹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-R¹¹、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)OR^{11}$ 、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Z¹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)

R⁵は、

- a) R^{1 1}、-C(=O)-R^{1 1}、-C(=O)-O-R^{1 1}、および-O-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}基でそれ必要に応じて置換される)；
- b) -N(R⁹)R^{1 0}および-C(=O)-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)；
- c) -(C₂~C₆)アルキニル-(C₃~C₇)炭素環(ここで、-(C₂~C₆)アルキニル-(C₃~C₇)炭素環は、1個以上のZ¹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)

R⁵は、

- a) H、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)炭素環、複素環、-C(=O)-R^{1 1}、-C(=O)-O-R^{1 1}、および-O-R^{1 1}(ここで、複素環は1個以上のZ^{1 1}基で必要に応じて置換され、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)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}基でそれ必要に応じて置換される)；
- b) -N(R⁹)R^{1 0}および-C(=O)-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)；
- c) -(C₂~C₆)アルキニル-(C₃~C₇)炭素環(ここで、-(C₂~C₆)アルキニル-(C₃~C₇)炭素環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換される)；
 および

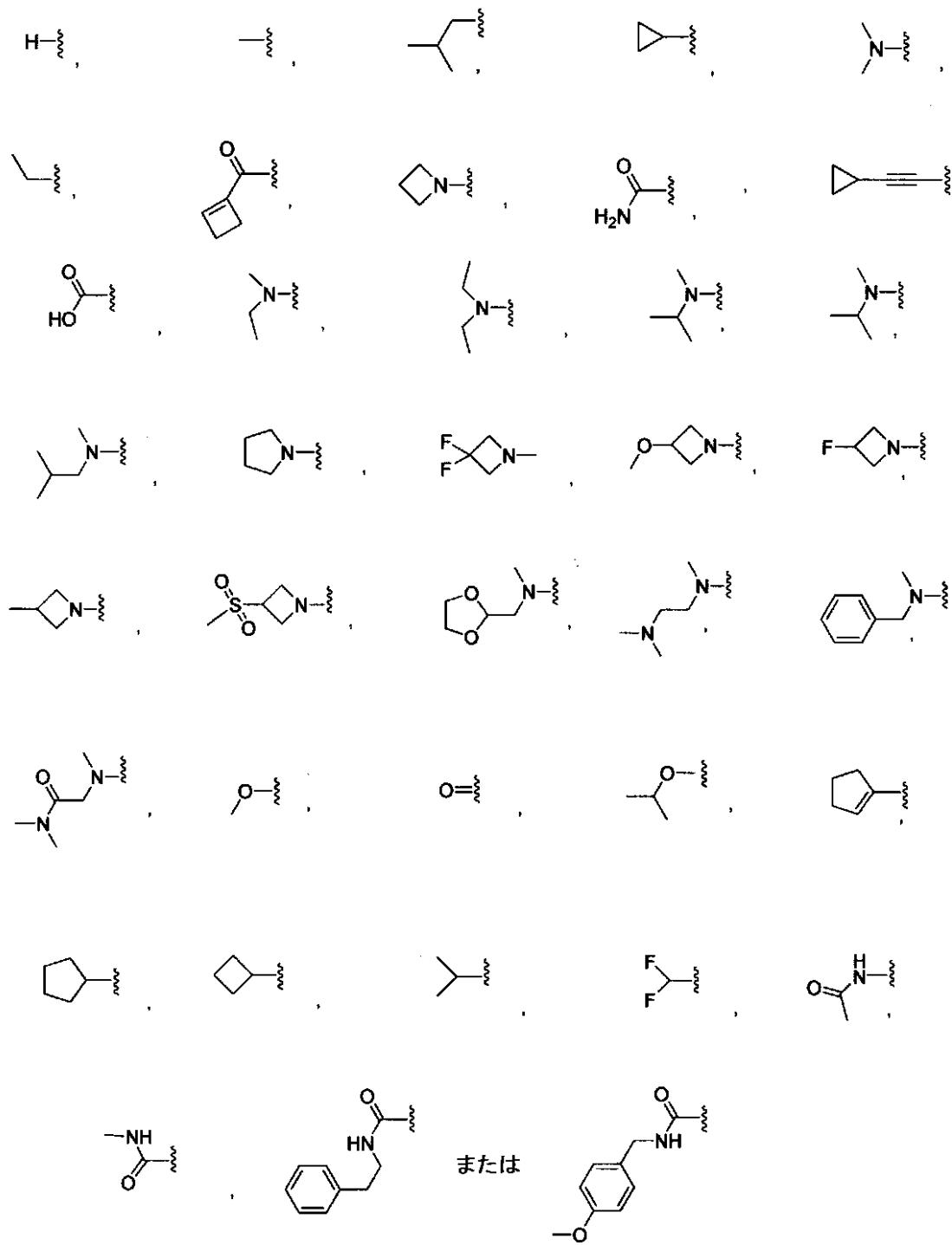
d) -NR_eR_fおよび-C(O)NR_eR_f

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)

R⁵は、

【化136】



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。

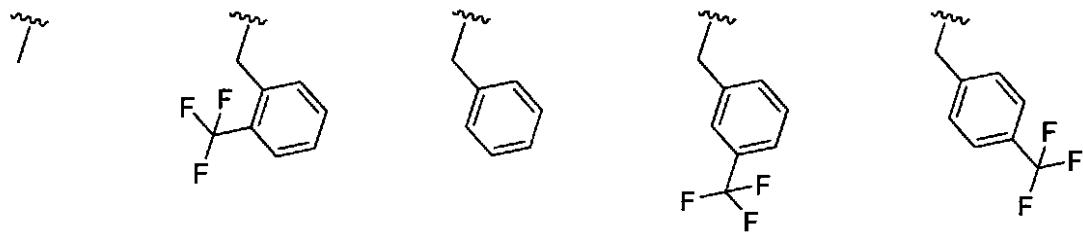
(項目20)

R^5 はオキソであり、 R^6 は、 R^{11} および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- 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、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14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目21)

R^5 はオキソであり、 R^6 は、

【化 1 3 7】

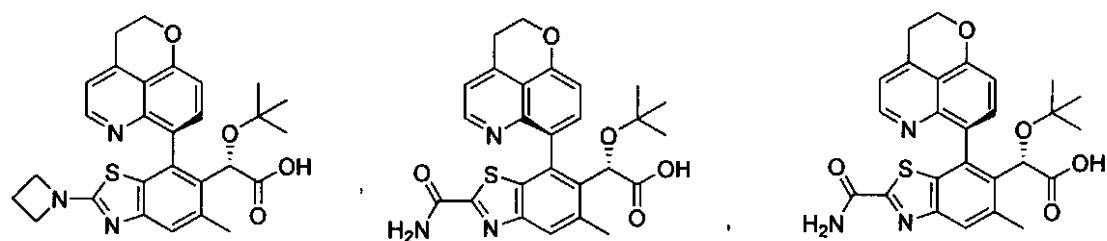
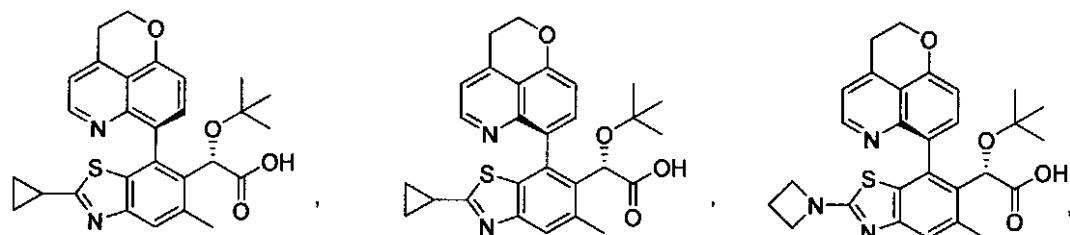
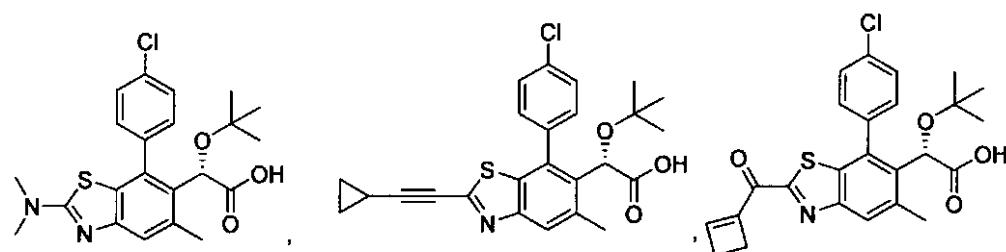
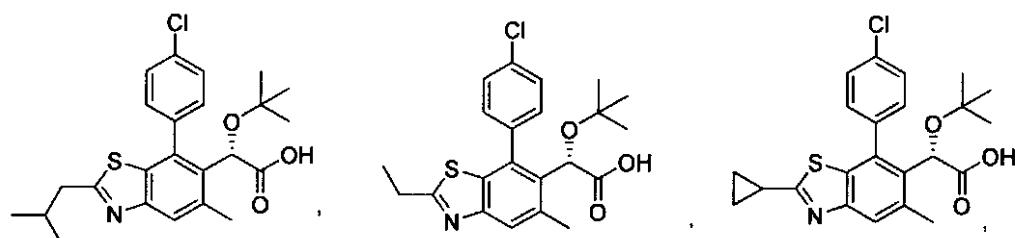
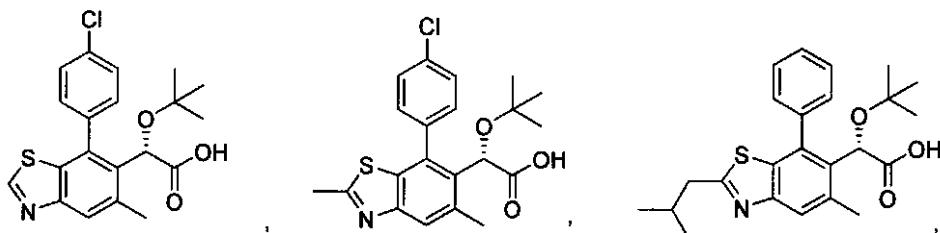


から選択される、項目 1 から 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

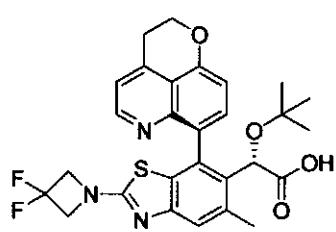
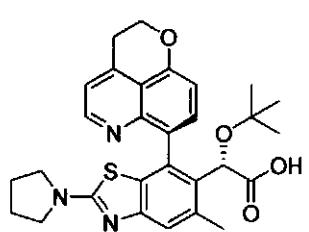
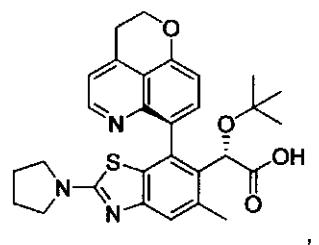
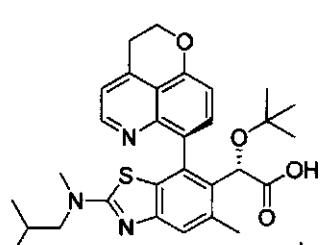
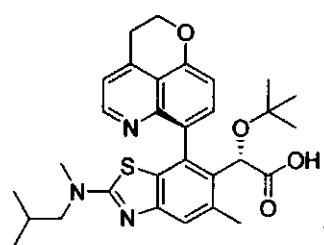
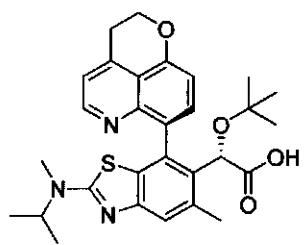
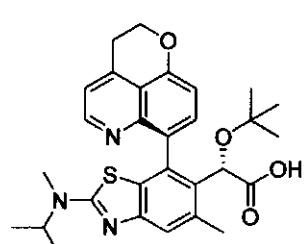
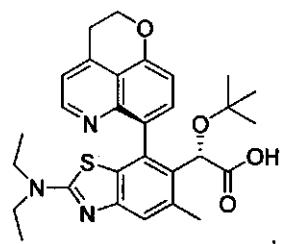
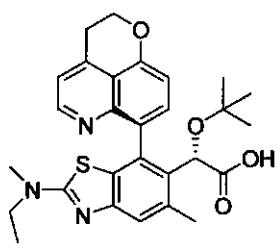
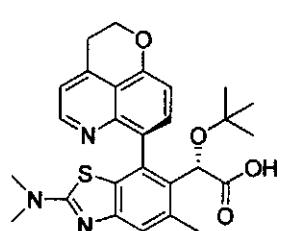
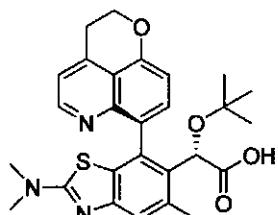
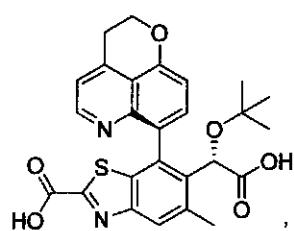
(項目 2 2)

以下の

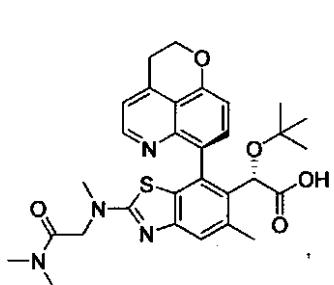
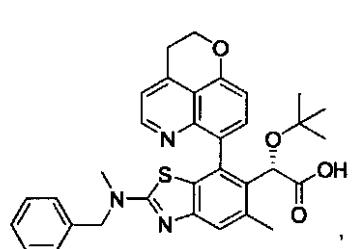
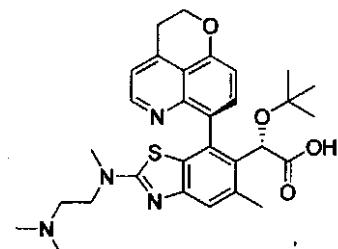
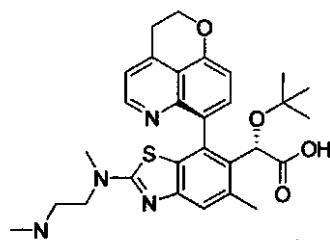
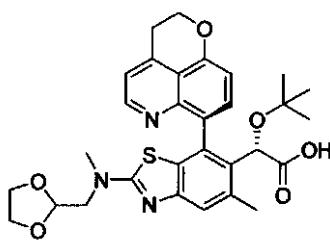
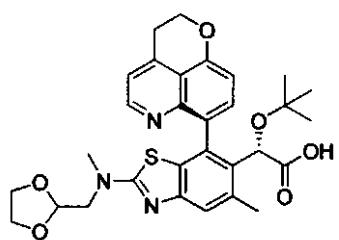
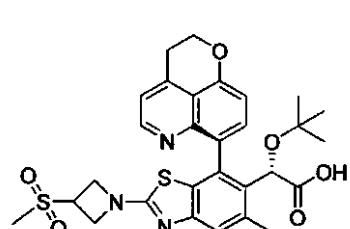
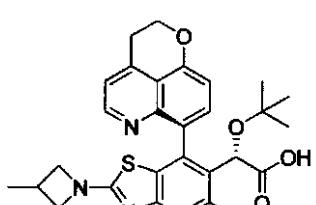
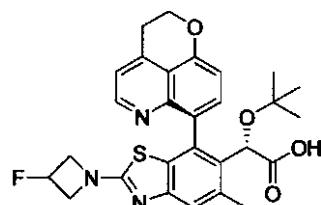
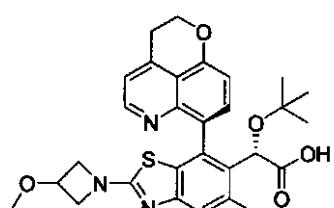
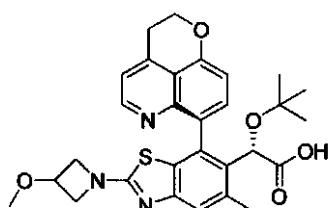
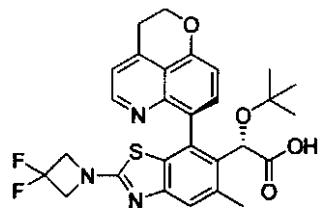
【化 1 3 8 - 1】



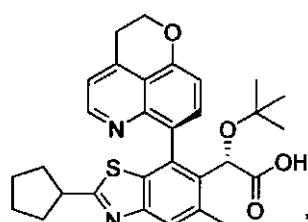
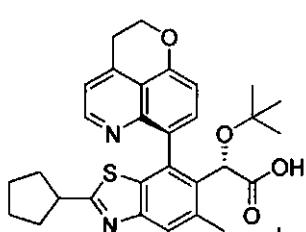
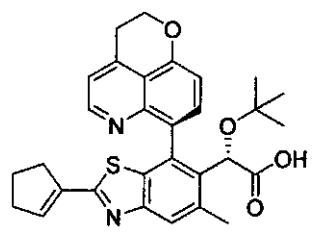
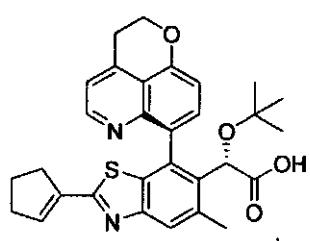
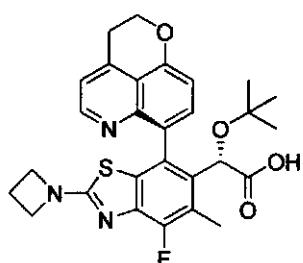
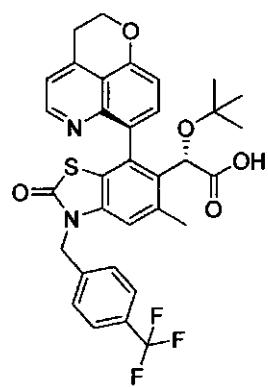
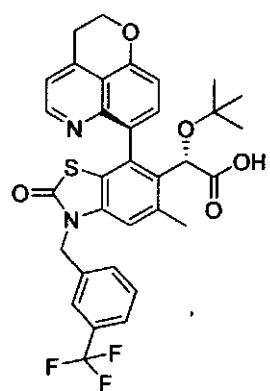
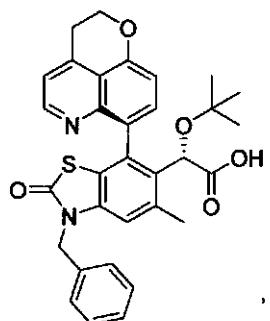
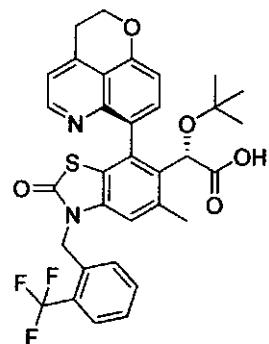
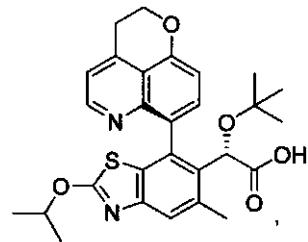
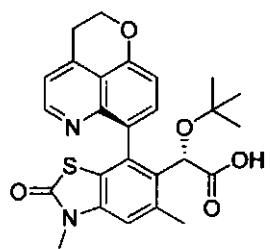
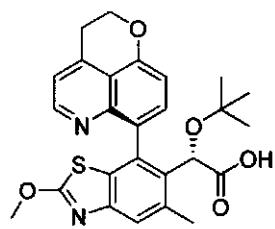
【化 1 3 8 - 2】



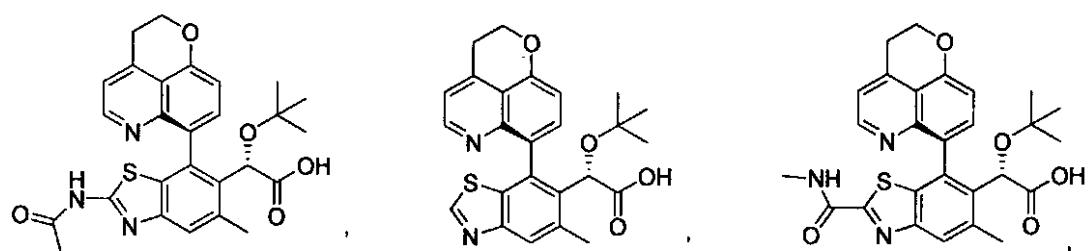
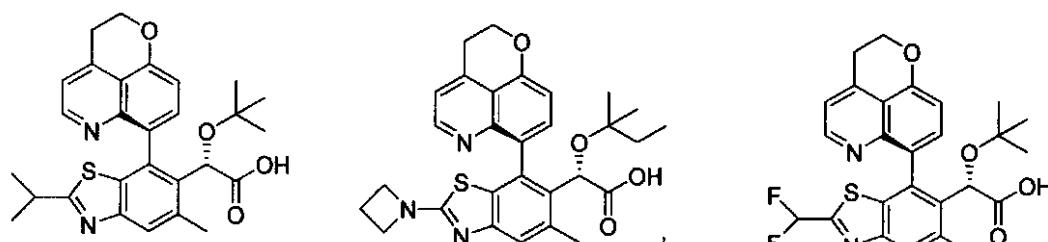
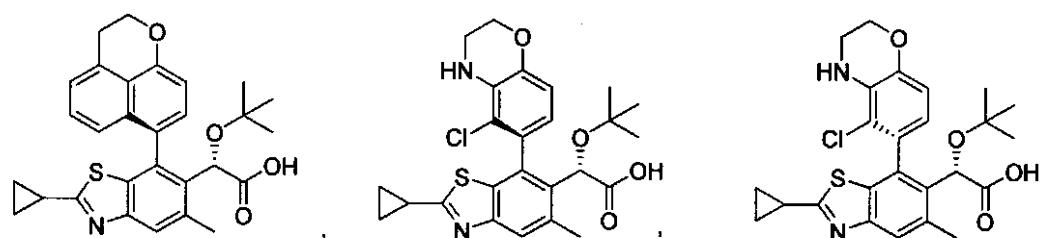
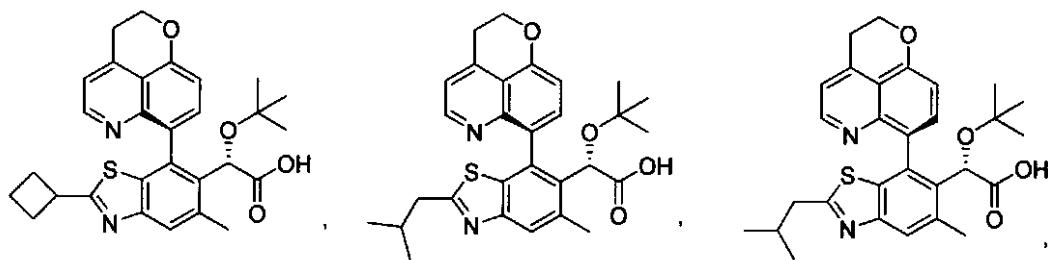
【化 1 3 8 - 3】



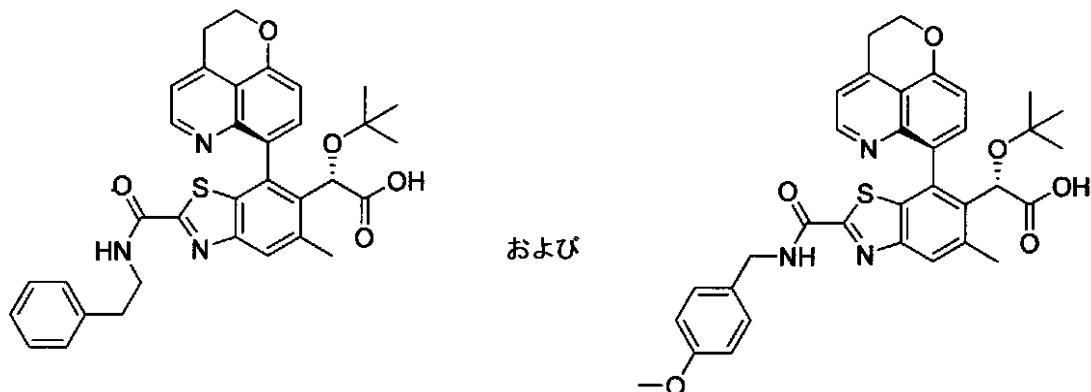
【化 1 3 8 - 4】



【化 1 3 8 - 5】



【化138-6】



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23)

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Z¹⁻¹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Z¹⁻⁵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14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目24)

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Z¹⁻⁵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14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目25)

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Z¹⁻⁵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14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目26)

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Z¹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、

各Z¹は、Z¹、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁~C₄)アルキル、-C(=O)-N((C₁~C₄)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Z¹は、

i) ハロ、オキソ、チオキソ、(C₂~C₆)アルケニル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル-(C₁~C₆)アルキル-、-OH、-O(C₁~C₆)アルキル、-O(C₁~C₆)ハロアルキル、-SH、-S(C₁~C₆)アルキル、-SO(C₁~C₆)アルキル、-SO₂(C₁~C₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁~C₆)アルキル、および-N((C₁~C₆)アルキル)₂；

i i) -OH、-O-(C₁~C₆)ハロアルキル、または-O-(C₁~C₆)アルキルで置換された(C₁~C₆)アルキル；および

i i i) アリール（前記アリールは、ハロ、(C₁~C₆)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Z¹は、Z¹、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁~C₄)アルキル、-C(=O)-N((C₁~C₄)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）

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）；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Z¹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14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目28）

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）；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Z¹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14のいずれか1項に記載の化合物。

（項目29）

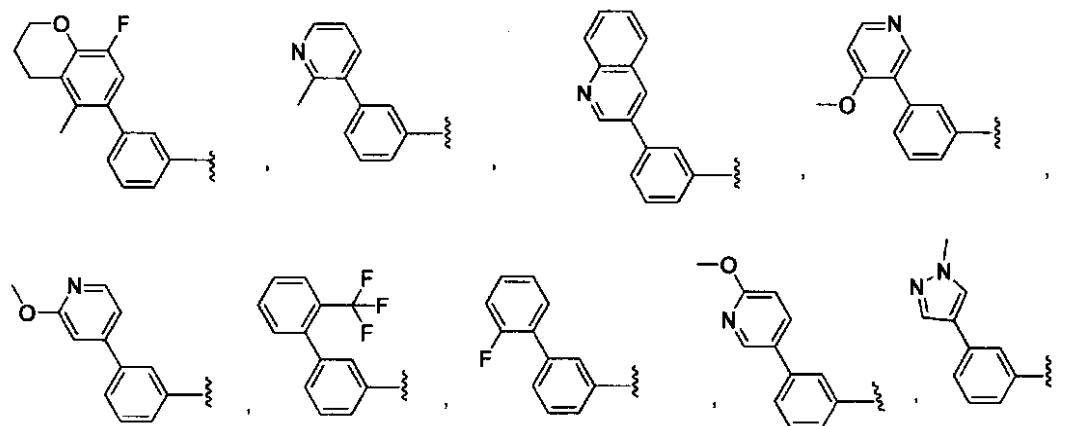
Z¹は、(C₁~C₆)ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環、および-

$O(C_1 \sim C_6)$ アルキルから独立して選択され、ここで、 $Z^{1 \sim 6}$ 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 $(C_1 \sim C_6)$ 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。

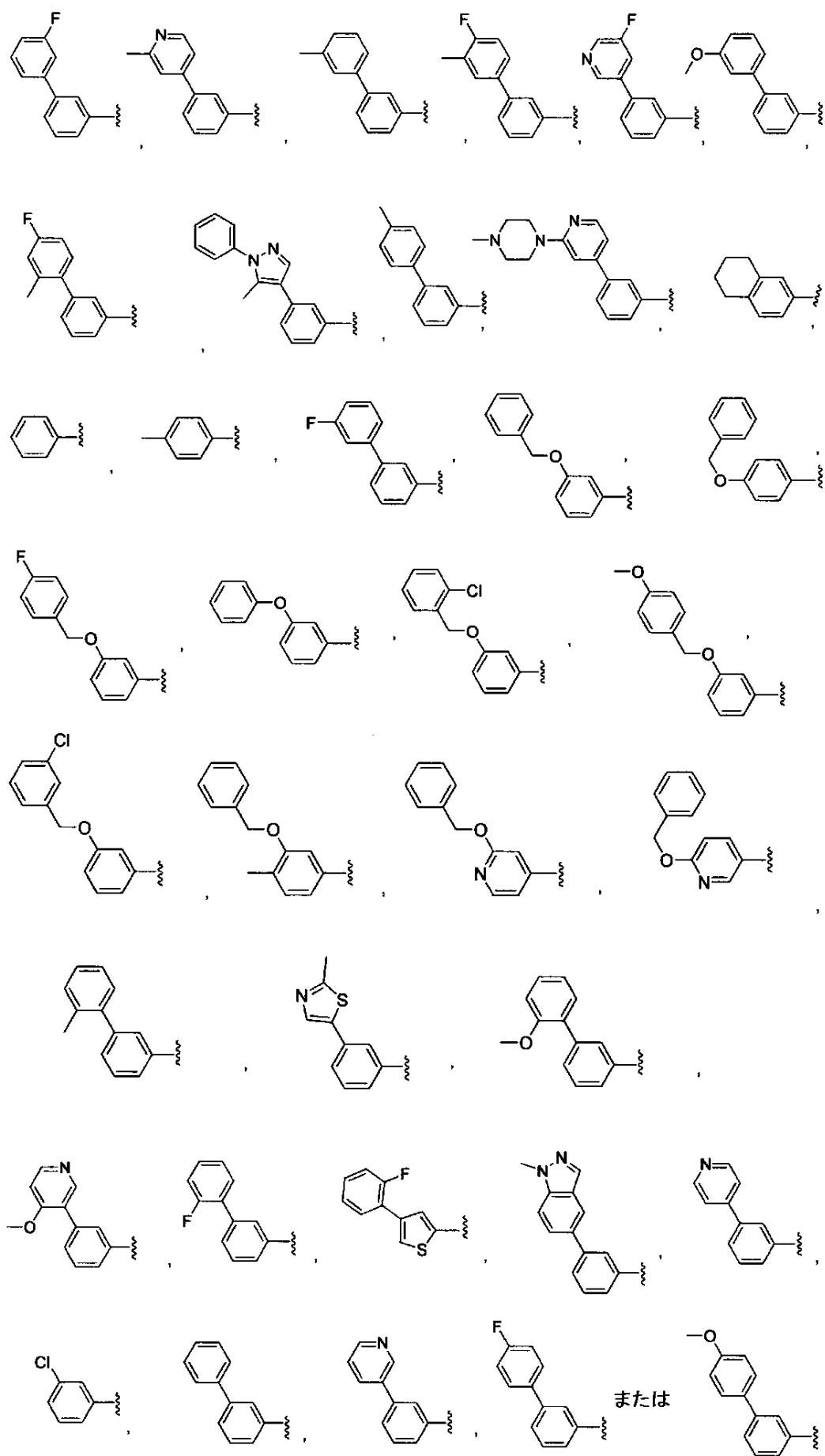
(項目 30)

R⁵ は、

【化 1 3 9 - 1】



【化 1 3 9 - 2】

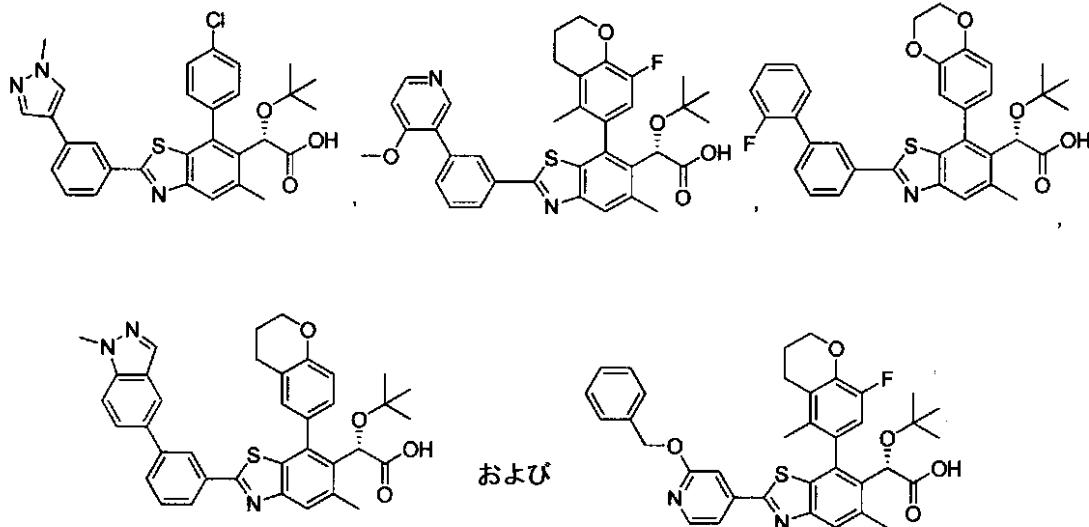


から選択される、項目 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 31)

以下の

【化 140】



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 32)

項目 1 から 31 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 33)

哺乳動物の HIV 感染を処置する方法であって、項目 1 から 31 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 34)

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 31 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 35)

医学療法で用いるための、項目 1 から 31 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 36)

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 31 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 37)

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 31 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】**0134**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【0134】**

R^{3-a}の別の特定の値は-O-C(=O)H₃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】**0604**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【0604】**

実施例26中の化合物67C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72を化合物69Cから調製し、化合物72の合成の残りは実施例25中の化合物65Kから化合物66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】**0608**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【0608】**

実施例26中の化合物67C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73を化合物69Cから調製し、化合物73の合成の残りは実施例25中の化合物65Kから化合物66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】**0612**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【0612】**

実施例26中の化合物67C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74を化合物69Cから調製し、化合物74の合成の残りは実施例25中の化合物65Kから化合物66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】**0636**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【0636】**

実施例4中の8Eから化合物8Fを調製するために使用した手順に従って、化合物81を化合物79から調製した。