

【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26年8月14日(2014.8.14)

【公表番号】特表2013-533885(P2013-533885A)

【公表日】平成25年8月29日(2013.8.29)

【年通号数】公開・登録公報2013-046

【出願番号】特願2013-518779(P2013-518779)

【国際特許分類】

C 07D 215/14	(2006.01)
C 07D 215/18	(2006.01)
C 07D 215/22	(2006.01)
C 07D 215/38	(2006.01)
C 07D 215/48	(2006.01)
C 07D 491/06	(2006.01)
C 07D 401/12	(2006.01)
C 07D 519/00	(2006.01)
C 07D 471/04	(2006.01)
C 07D 401/04	(2006.01)
C 07D 417/04	(2006.01)
C 07D 413/04	(2006.01)
C 07D 405/04	(2006.01)
C 07D 498/06	(2006.01)

【F I】

C 07D 215/14	C S P
C 07D 215/18	
C 07D 215/22	
C 07D 215/38	
C 07D 215/48	
C 07D 491/06	
C 07D 401/12	
C 07D 519/00	3 0 1
C 07D 471/04	1 0 5 E
C 07D 471/04	1 0 1
C 07D 401/04	
C 07D 417/04	
C 07D 413/04	
C 07D 405/04	
C 07D 498/06	

【手続補正書】

【提出日】平成26年6月30日(2014.6.30)

【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

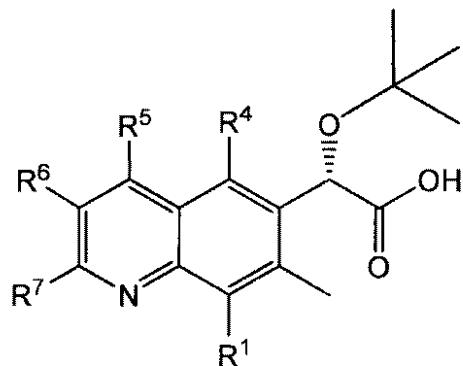
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I hの化合物

【化197】



Ih

〔式中、

R¹ が、R¹^a または R¹^b であり；R⁴ が、R⁴^a または R⁴^b であり；R⁵ が、R⁵^a または R⁵^b であり；R⁶ が、R⁶^a または R⁶^b であり；R⁷ が、R⁷^a または R⁷^b であり；R¹^a が、以下：(a) H、ハロ、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₁ ~ C₆) ハロアルキル；(b) (C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、ニトロ、シアノ、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール；；(c) -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、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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される)；ならびに(d) -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、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₃ ~ C₇) シクロアルキルから選択され、各 R¹⁰ は、独立して、R¹¹、-(C₁ ~ C₆) アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)O-R¹¹ および-C(=O)N(R⁹)R¹¹ から選択され、各 R¹¹ 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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される)；から選択され、R¹^a の任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1 個から 3 個の Z¹⁰ 基で必要に応じて独立して置換されており；R¹^b は、以下：(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 ~ C₇) 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 - Z^{1~3} 、 - C (O) -
 (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - S - (C
 1 ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - SO₂
 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~4} 、 - (C₁ ~ C
 6) アルキル - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル
 - C (O) - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C
 1 ~ C₆) アルキル - Z^{1~3} 、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル
 - Z^{1~3} 、 - (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、 - N R_a S
O₂ N R_c R_d 、 - N R_a SO₂O (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - N R_a SO₂O (C₆ ~ C
20) アリール、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆
) アルケニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C
7) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C
7) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) アルキル - Z³ (ここで、 各 (C₁ ~ C₆)
アルキル、 (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭
素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 (C₂ ~ C₆) アルキニル、 (C₆ ~ C₂₀) アリー
ル、 ヘテロ環およびヘテロアリールは、 単独でもしくはある基の一部として、 1 個から 5
個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、 各ス
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 個から 5 個の Z¹ 基
で必要に応じて独立して置換されており、 2 個の Z¹ 基は、 これらが結合している 1 個ま
たは複数個の原子と共に、 必要に応じて、 (C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し
、 (C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、 1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立し
て置換されている) ;

(c) (C₁ ~ C₆) アルキル (ここで、 (C₁ ~ C₆) アルキルは、 1 個から 5 個の
Z² 基で独立して置換されており、 1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換さ
れている) ;

(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、 各 - X (C₁ ~ C₆) アルキルおよび - X (C₁ ~ C₆) ハロアルキルは、 1 個か
ら 5 個の Z³ 基で独立して置換されており、 1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立し
て置換されており、 各 - 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 個から 5 個の Z⁴ 基で独立して置換されており、 1
個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(e) (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリール、 ヘテロ環、 - X (C₆ ~ C₂₀)
アリール、 - X ヘテロアリールおよび - X ヘテロ環 (各 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテ
ロアリールおよびヘテロ環は、 単独でもしくはある基の一部として、 1 個から 5 個の Z⁵
基で独立して置換されており、 1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換さ
れている) ;

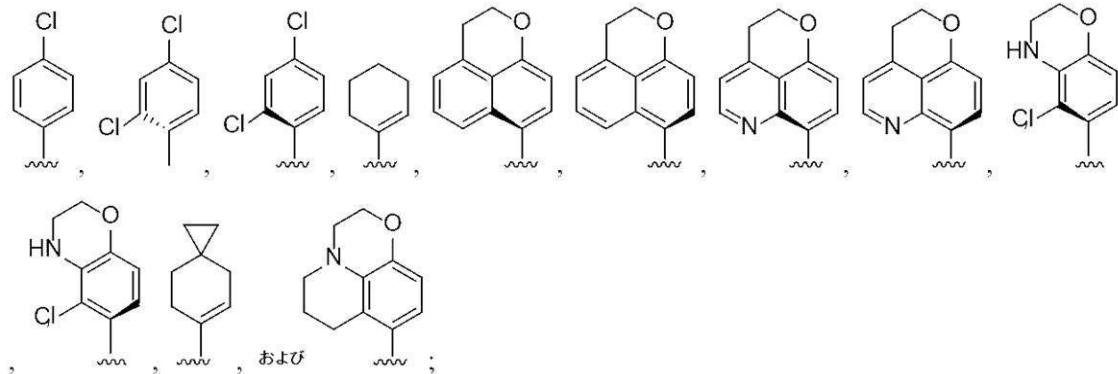
(f) (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニ
ルおよび (C₂ ~ C₆) アルキニル (ここで、 各 (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~
C₇) 炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニルおよび (C₂ ~ C₆) アルキニルはそれぞれ、
1 個から 5 個の Z⁶ 基で独立して置換されており、 1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて
独立して置換されている) ; ならびに

(g) - N R_e R_f 、 - C (O) NR_e R_f 、 - OC (O) NR_e R_f 、 - SO₂ NR

R_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 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルはそれぞれ、ある基の一部として、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている）；
から選択され、

R^{4a} は、

【化197】



から選択され；

R^{5a} は、以下：

(a) ハロ、ニトロおよびシアノ；
 (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}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-C(=O)-R^{1 1}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-C(=O)-O-R^{1 1}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-S-R^{1 1}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-S(O)-R^{1 1}および- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂-R^{1 1}（ここで、各R^{1 1}は、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、1個から3個のZ^{1 1}基で必要に応じて独立して置換されている）；ならびに

(c) -N(R⁹)R^{1 0}、-C(=O)-N(R⁹)R^{1 0}、-O-C(=O)-N(R⁹)R^{1 0}、-S-O-N(R⁹)R^{1 0}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-N(R⁹)R^{1 0}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-C(=O)-N(R⁹)R^{1 0}および- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂-N(R⁹)R^{1 0}（ここで、各R⁹は、独立して、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選択され、各R^{1 0}は、独立して、R^{1 1}、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-R^{1 1}、-SO₂-R^{1 1}、-C(=O)-R^{1 1}、-C(=O)O-R^{1 1}および-C(=O)N(R⁹)R^{1 1}から選択され、各R^{1 1}は、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され；

R^{5b} は、以下：

(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、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキ尔S(O)- $(C_1 \sim C_6)$ アルキ尔-($C_3 \sim C_6$)炭素環、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキ尔SO₂($C_1 \sim C_6$)アルキ尔-($C_3 \sim C_7$)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_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O($C_3 \sim C_7$)炭素環、-NR_aSO₂O($C_6 \sim C_{20}$)アリール

、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) アルキル - Z³ (ここで、各 (C₁ ~ C₆) アルキル、 (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 (C₂ ~ C₆) アルキニル、 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(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、各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個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されており、2個のZ¹ 基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、前記 (C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(c) (C₁ ~ C₆) アルキル (ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルは、1個から5個のZ² 基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(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、各 X (C₁ ~ C₆) アルキルおよび X (C₁ ~ C₆) ハロアルキルは、1個から5個のZ³ 基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されており、各 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、独立して、1個から5個のZ⁴ 基で置換されており、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(e) (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリール、 ヘテロ環、 - X (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - X ヘテロアリールおよび - X ヘテロ環 (ここで、各 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、独立して、1個から5個のZ⁵ 基で置換されており、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(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、各 (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) アルキニルは独立して、1個から5個のZ⁶ 基で置換されており、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されて

いる)；ならびに

(g) - N R_e R_f、 - C (O) N R_e R_f、 - O C (O) N R_e R_f、 - S O₂ 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 - S O₂ N R_e R_f (ここで、各 (C₁ ~ C₆) アルキルは、ある基の一部として、1個から5個のZ¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

から選択され、

R⁶^a は、以下：

- (a) H、ハロ、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび (C₁ ~ C₆) ハロアルキル；
- (b) (C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、ニトロ、シアノ、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール；
- (c) - C (= O) - R¹¹、- C (= O) - O - R¹¹、- O - R¹¹、- S - R¹¹、- S (O) - R¹¹、- S O₂ - R¹¹、- (C₁ ~ C₆) アルキル - R¹¹、- (

$C_1 \sim C_6$) アルキル - $C(=O) - R^{1,1}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $C(=O) - O - R^{1,1}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $O - R^{1,1}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $S - R^{1,1}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $S(O) - R^{1,1}$ および $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $SO_2 - R^{1,1}$ (ここで、各 $R^{1,1}$ は、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{2,0})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ; ならびに

(d) $-N(R^9)R^{1,0}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{1,0}$ 、 $-O-C(=O)-N(R^9)R^{1,0}$ 、 $-SO_2-N(R^9)R^{1,0}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $N(R^9)R^{1,0}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $O-C(=O)-N(R^9)R^{1,0}$ および $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $SO_2-N(R^9)R^{1,0}$ (ここで、各 R^9 は、独立して、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選択され、各 $R^{1,0}$ は、独立して、 $R^{1,1}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル - $R^{1,1}$ 、 $-SO_2-R^{1,1}$ 、 $-C(=O)-R^{1,1}$ 、 $-C(=O)O-R^{1,1}$ および $-C(=O)N(R^9)R^{1,1}$ から選択され、各 $R^{1,1}$ は、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{2,0})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ;

から選択され、

$R^{6,a}$ の任意の $(C_6 \sim C_{2,0})$ アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個から3個の $Z^{1,0}$ 基で必要に応じて独立して置換されており;

$R^{6,b}$ は、以下:

(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、 $-$ ハロ $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2NR_cR_d$ 、 $-NR_aSO_2O(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $-NR_aSO_2O(C_6 \sim C_{2,0})$ 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 - $(C_6 \sim C_{2,0})$ 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 - ヘテロ環、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環、 $- (C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_6 \sim C_{2,0})$ 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 - ヘテロ環、 $- (C_3 \sim C_7)$ 炭素環 - Z^1 および $-$ ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル - Z^3 (ここで、各 $(C_1 \sim C_6)$ 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、 $(C_6 \sim C_{2,0})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各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個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されており、2個の Z^1 基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、炭素環またはヘテロ環を形成し、前記炭素環またはヘテロ環は、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(c) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個から5個の Z^2 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各 $X(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $X(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個から5

個の Z^3 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されており、各 $X(C_2 \sim C_6)$ 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個から5個の Z^4 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(e) $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 $-X(C_6 \sim C_{20})$ アリール、 $-X$ ヘテロアリールおよび $-X$ ヘテロ環(ここで、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個の Z^5 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各 $(C_1 \sim C_6)$ 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 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルは独立して、1個から5個の Z^6 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ; ならびに

(g) $-NR_eR_f$ 、 $-C(O)NR_eR_f$ 、 $-OC(O)NR_eR_f$ 、 $-SO_2NR_eR_f$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ 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、ある基の一部として、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

から選択され、

R^{7a} は、以下:

(a) H、ハロ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル;

(b) $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、ニトロ、シアノ、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール
⋮

(c) $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、 $-S-R^{11}$ 、 $-S-O-R^{11}$ 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ 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- $O-R^{11}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル- $S-R^{11}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル- SO_2-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、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ; ならびに

(d) $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-O-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-SO_2-N(R^9)R^{10}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ 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、独立して、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選択され、各 R^{10} は、独立して、 R^{11} 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル- R^{11} 、 $-SO_2-R^{11}$ 、 $-C(=O)-R^{11}$ 、 $-C(=O)O-R^{11}$ および $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から選択され、各 R^{11} は、独立して、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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ;

から選択され、

R^{7a} の任意の $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個から3個の Z^{10} 基で必要に応じて独立して置換されており;

R^{7b} は、以下:

(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) - (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 - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - 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 - (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、 - 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 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) アルキル - Z³ (ここで、各 (C₁ ~ C₆) アルキル、 (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 (C₂ ~ C₆) アルキニル、 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各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個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されており、2個のZ¹基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、前記 (C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(c) (C₁ ~ C₆) アルキル (ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルは、1個から5個のZ²基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各 X (C₁ ~ C₆) アルキルおよび X (C₁ ~ C₆) ハロアルキルは、1個から5個のZ³基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されており、各 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個から5個のZ⁴基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(e) (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリール、 ヘテロ環、 - X (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - X ヘテロアリールおよび - X ヘテロ環 (ここで、各 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のZ⁵基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(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、各 (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個から5個のZ⁶基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ; ならびに

(g) - N R_e R_f、 - C (O) N R_e R_f、 - O C (O) N R_e R_f、 - SO₂ N R

$\text{R}_e \text{R}_f$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル- $\text{NR}_e \text{R}_f$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{C}(\text{O})$ - $\text{NR}_e \text{R}_f$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル- $\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{NR}_e \text{R}_f$ および $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル- $\text{SO}_2 \text{NR}_e \text{R}_f$ (ここで、各 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルは、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている);

から選択され、

あるいは、 R^5 および R^6 、または R^6 および R^7 のうち任意のものが、これらが結合している原子と共に、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環を形成し、前記5員環もしくは6員環の炭素環または前記4、5、6もしくは7員環のヘテロ環は、ハロ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ シクロアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{S}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキルおよび $-\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル)、から選択される1個から3個の置換基で必要に応じて独立して置換されているか;

あるいは、 R^5 および R^6 、または R^6 および R^7 のうち任意のものが、これらが結合している原子と共に、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環を形成し、各5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環は独立して、1個から3個の Z^7 基または Z^8 基で独立して置換されており、2個の Z^7 基が同じ原子上にある場合、前記2個の Z^7 基は、それらが結合している原子と共に、必要に応じて、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環または4、5もしくは6員環のヘテロ環を形成し;

X は、独立して、 O 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{O}-$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{C}(\text{O})$ -、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{S}-$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル $\text{S}(\text{O})-$ および $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル SO_2- から選択され;

各 Z^1 は、独立して、ハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{OH}$ 、 $=\text{NOR}_a$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $- (\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ 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、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 $- (\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 $- (\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-$ ヘテロ環、 $- \text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ 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、 $- \text{O}(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $- \text{O}$ ヘテロアリール、 $- \text{O}$ ヘテロ環、 $- \text{S}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ 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、 $- \text{S}(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルケニル、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ アルキニル、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ ハロ炭素環、 $- \text{S}(\text{O})(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $- \text{S}(\text{O})$ 炭素環、 $- \text{S}(\text{O})$ ヘテロアリール、 $- \text{S}(\text{O})$ ヘテロ環、 $- \text{SO}_2(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ 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、 $- \text{SO}_2(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $- \text{SO}_2$ ヘテロアリール、 $- \text{SO}_2$ ヘテロ環、 $- \text{SO}_2 \text{NR}_c \text{R}_d$ 、 $- \text{NR}_c \text{R}_d$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{R}_a$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{OR}_a$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{NR}_c \text{R}_d$ 、 $- \text{NR}_a \text{SO}_2 \text{R}_b$ 、 $- \text{NR}_a \text{SO}_2 \text{NR}_c \text{R}_d$ 、 $- \text{NR}_a \text{SO}_2 \text{O}(\text{C}_3 \sim \text{C}_7)$ 炭素環、 $- \text{R}_a \text{SO}_2 \text{O}(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $- \text{OS}(\text{O})_2 \text{R}_a$ 、 $- \text{C}(\text{O}) \text{R}_a$ 、 $- \text{C}(\text{O}) \text{OR}_b$ 、 $- \text{C}(\text{O}) \text{NR}_c \text{R}_d$ および $- \text{OC}(\text{O}) \text{NR}_c \text{R}_d$ から選択され、 Z^1 の任意の $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ ハロアルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$ 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、 $(\text{C}_6 \sim \text{C}_{20})$ アリール、 $-$ ヘテロアリールおよび $-$ ヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、 $- \text{OH}$ 、 $- \text{OR}_b$ 、 $- \text{CN}$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O})_2 \text{R}_b$ 、 $-$ ヘテロアリ-

ル、ヘテロ環、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-NHヘテロアリール、-NHヘテロ環、または-S(O)₂NR_cR_dで必要に応じて独立して置換されており；

各Z²は、独立して、-NO₂、-CN、スピロヘテロ環、架橋ヘテロ環、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(C₆～C₂₀)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(C₆～C₂₀)アリールから選択され；

各Z³は、独立して、-NO₂、-CN、-OH、オキソ、=NOR_a、チオキソ、-(C₆～C₂₀)アリール、-ヘテロ環、-ヘテロアリール、(C₃～C₇)炭素環、-(C₃～C₇)ハロ炭素環、-O(C₁～C₆)アルキル、-O(C₃～C₇)炭素環、-Oハロ(C₃～C₇)炭素環、-O(C₆～C₂₀)アリール、-Oヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリール、-Sヘテロ環、-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)(C₆～C₂₀)アリール、-S(O)ヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリール、-SO₂ヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリールから選択され；

各Z⁴は、独立して、ハロゲン、-(C₁～C₆)アルキル、(C₃～C₇)炭素環、-ハロ(C₁～C₆)アルキル、-NO₂、-CN、-OH、オキソ、=NOR_a、チオキソ、(C₆～C₂₀)アリール、ヘテロ環、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(C₆～C₂₀)アリール、-Oヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリール、-Sヘテロ環、-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)(C₆～C₂₀)アリール、-S(O)ヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリール、-SO₂ヘテロ環、-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(C₆～C₂₀)アリールから選択され；

各Z⁵は、独立して、-NO₂、-CN、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃～C₇)炭素環、-NR_aSO₂O(C₆～C₂₀)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(C₆～C₂₀)アリール、-NR_aSO₂ヘテロアリール、-NR_aSO₂ヘテロ環、-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)(C₆～C₂₀)アリール、-NR_aC(O)ヘテロアリール、-NR_aC(O)ヘテロ環、NR_aC(O)NR_cR_dおよびNR_aC(O)OR_bから選択され；

各Z⁶は、独立して、-NO₂、-CN、-NR_aR_a、NR_aC(O)R_b、-C(O)NR_cR_d、-(C₃～C₇)ハロ炭素環、(C₆～C₂₀)アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、-O(C₆～C₂₀)アリール、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-O(C₃～C₇)ハロ炭素環、-O(C₁～C₆)アルキル、-O(C₁～C₆)アルキル-O-(C₁～C₆)アルキル、-O(C₃～C₇)炭素環、-Oハロ(C₁～C₆)アルキル、-S(C₆～C₂₀)アリール、-Sヘテロアリール、-Sヘテロ環、-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) (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - S (O) ヘテロアリール、 - S (O) ヘテロ環、 - S (O) (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキル、 - S (O) (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - S (O) ハロ(C₁ ~ C₆) アルキル、 - SO₂ (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - SO₂ ヘテロアリール、 - SO₂ ヘテロ環、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - SO₂ (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - SO₂ (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - SO₂ NR_cR_d、 - NR_aSO₂ (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - NR_aSO₂ (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - NR_aSO₂ ヘテロアリール、 - NR_aSO₂ ヘテロアリール、 - NR_aSO₂ NR_cR_d、 - NR_aSO₂O (C₃ ~ C₇) 炭素環および - NR_aSO₂O (C₆ ~ C₂₀) アリールから選択され；

各Z⁷は、独立して、 - NO₂、 =NOR_a、 - CN、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹²、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - Z¹²、 - (C₂ ~ C₆) アルケニルOH、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - Z¹²、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - OH、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル - Z¹²、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキルOH、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹²、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環OH、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリール、 ヘテロ環、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹²、 - 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 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - O (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - O (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - O (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - O ヘテロアリール、 - O ヘテロ環、 - S (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹²、 - 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 (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - S (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - S (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - S (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - S ヘテロアリール、 - S ヘテロ環、 - 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) (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - S (O) (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - S (O) (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - S (O) ヘテロアリール、 - S (O) ヘテロ環、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - 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 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - SO₂ ヘテロアリール、 - SO₂ ヘテロ環、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - SO₂ NR_cR_d、 - 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 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - OS (O) R_a、 - C (O) NR_cR_d および - OC (O) NR_cR_d から選択され、ここで、 Z⁷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、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 (C₆ ~ C₂₀) アリール、 ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、 - OH、 - OR_b、 - CN、 - NR_aC(O)R_b、 ヘテロアリール、 - NH ヘテロ環、または - S (O) NR_cR_d で必要に応じて独立して置換されており；

各Z⁸は、独立して、 - NO₂ および - CN から選択され；

各Z⁹は、独立して、-(C₁~C₆)アルキルおよび-O(C₁~C₆)アルキルから選択され；

各Z¹¹は、独立して、Z¹⁰、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁~C₄)アルキル、-C(=O)-N((C₁~C₄)アルキル)₂、-C(=O)-(C₆~C₂₀)アリール、-C(=O)-ヘテロ環および-C(=O)-ヘテロアリールから選択され；

各Z¹⁰は、独立して、以下：

(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；

(ii) -OH、-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独立して置換された(C₁~C₆)アルキル；および

(iii)(C₆~C₂₀)アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、各(C₆~C₂₀)アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、ハロ、(C₁~C₆)アルキルまたはCOOHで必要に応じて独立して置換されている)；

から選択され。

各Z¹²は、独立して、-NO₂、=NOR_a、チオキソ、(C₆~C₂₀)アリール、ヘテロ環、ヘテロアリール、(C₃~C₇)ハロ炭素環、(C₃~C₇)炭素環、-O(C₃~C₇)炭素環、-Oハロ(C₃~C₇)炭素環、-O(C₆~C₂₀)アリール、-Oヘテロ環、-Oヘテロアリール、-S(C₁~C₆)アルキル、-S(C₃~C₇)炭素環、-Sハロ(C₃~C₇)炭素環、-S(C₆~C₂₀)アリール、-Sヘテロ環、-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)ハロ(C₃~C₇)炭素環、-S(O)(C₆~C₂₀)アリール、-S(O)ヘテロ環、-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(C₆~C₂₀)アリール、-SO₂ヘテロ環、-SO₂ヘテロアリール、-NR_aR_a、-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(C₆~C₂₀)アリールから選択され；

各Z¹³は、独立して、-NO₂、-OH、=NOR_a、-SH、-CN、-(C₃~C₇)ハロ炭素環、-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(C₆~C₂₀)アリール、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-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(C₆~C₂₀)アリール、-Sヘテロアリール、-Sヘテロ環、-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)(C₆~C₂₀)アリール、-S(O)ヘテロアリール、-S(O)ヘテロ環、-SO₂(C₁~C₆)アルキル、-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(C₆~C₂₀)アリール、-SO₂ヘテロ環、-SO₂NR_cR_d、-NR_cR_d、-NR_aC(O)R_b、-NR_aC(O)NR_cR_d、-NR_aSO₂R_b、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃~C₇)炭素環、-NR_aSO₂O(C₆~C₂₀)アリール、-OS(O)(C₂~C₆)R_a、-C(O)R_a、-C(O)OR_b、-C

(O)NR_cR_d および -OC(O)NR_cR_d から選択され、Z^{1~3} 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、(C₃~C₇) 炭素環、(C₃~C₇) ハロ炭素環、(C₆~C₂₀) アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、-OH、-OR_b、-CN、-NR_aC(O)₂R_b、-ヘテロアリール、-ヘテロ環、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-NHヘテロアリール、-NHヘテロ環、または -S(O)₂NR_cR_d で必要に応じて独立して置換されており；

各 Z^{1~4} は、独立して、-NO₂、=NOR_a、-CN、-(C₃~C₇) ハロ炭素環、-O(C₃~C₇) ハロ炭素環、-S(C₃~C₇) ハロ炭素環、-S(O)(C₃~C₇) ハロ炭素環、-SO₂(C₃~C₇) ハロ炭素環、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O(C₃~C₇) ハロ炭素環、-NR_aSO₂O(C₆~C₂₀) アリールおよび -OS(O)₂R_a から選択され、Z^{1~4} の任意の -(C₃~C₇) ハロ炭素環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、-OH、-OR_b、-CN、-NR_aC(O)₂R_b、-ヘテロアリール、-ヘテロ環、-Oヘテロアリール、-NHヘテロ環または -S(O)₂NR_cR_d で必要に応じて独立して置換されており；

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、ヘテロ環、(C₆~C₂₀) アリール、(C₆~C₂₀) 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、ヘテロ環、(C₆~C₂₀) アリールまたはヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、OH およびシアノで必要に応じて独立して置換されており；

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、ヘテロ環、(C₆~C₂₀) アリール、(C₆~C₂₀) 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、ヘテロ環、(C₆~C₂₀) アリールまたはヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、OH およびシアノで必要に応じて独立して置換されており；

R_c および R_d はそれぞれ独立して、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、(C₆~C₂₀) アリール、(C₆~C₂₀) アリール (C₁~C₆) アルキル - 、ヘテロ環、ヘテロアリールおよびヘテロアリール (C₁~C₆) アルキル - から選択され、ここで、R_c または R_d 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、ヘテロ環、(C₆~C₂₀) アリールおよびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個のハロゲン、OH もしくはシアノで必要に応じて独立して置換されているか；または R_c および R_d は、これらが結合している窒素と共にヘテロ環を形成し、R_c および R_d とこれらが結合している窒素とを合わせた任意のヘテロ環は、1個から5個のハロゲン、OH またはシアノで必要に応じて独立して置換されており；

各 R_e は、独立して、-OR_a、(C₁~C₆) アルキルおよび (C₃~C₇) 炭素環（ここで、各 (C₁~C₆) アルキルおよび (C₃~C₇) 炭素環は、1個から5個の Z⁶ で独立して置換されており、1個から5個の Z¹ で必要に応じて独立して置換されている）、-(C₂~C₆) ハロアルキル、-(C₂~C₆) アルケニルおよび -(C₂~C₆) アルキニル（各 -(C₂~C₆) ハロアルキル、-(C₂~C₆) アルケニルおよび -(C₂~C₆) アルキニルは、1個から5個の Z¹ で必要に応じて独立して置換されている）；および (C₆~C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール（各 (C₆~

C_{2~0})アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、1個から5個のZ⁵で独立して置換されている)から選択され;

各R_fは、独立して、-R_g、-OR_a、-(C_{1~C₆})アルキル-Z⁶、-SO₂R_g、-C(O)R_g、C(O)OR_gおよび-C(O)NR_eR_gから選択され;そして

各R_gは、独立して、H、-OR_a、(C_{1~C₆})アルキル、(C_{3~C₇})炭素環、(C_{1~C₆})ハロアルキル、(C_{2~C₆})アルケニル、(C_{2~C₆})アルキニル、(C_{6~C₂₀})アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、ここで、R_gの任意の(C_{1~C₆})アルキル、(C_{3~C₇})炭素環、(C_{1~C₆})ハロアルキル、(C_{2~C₆})アルケニル、(C_{2~C₆})アルキニル、(C_{6~C₂₀})アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されており、

ここで、各ヘテロアリールは、1個から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個から4個のヘテロ原子を有し、各複素環は、1個から6個の炭素原子と、酸素、窒素、および硫黄からなる群から選択される1個から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】

R¹がH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】

R⁶がHである、請求項1~2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。

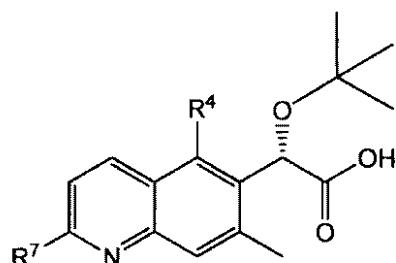
【請求項4】

R⁵がHまたは(C_{1~C₆})アルキルである、請求項1~3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5】

式I kの化合物

【化198】



Ik

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6】

R⁷が、R^{7a}またはR^{7b}であり、

R^{7a}は、

(a) H、ハロ、(C_{1~C₆})アルキル、および(C_{1~C₆})ハロアルキル；

(b) (C_{2~C₆})アルケニル、(C_{2~C₆})アルキニル、(C_{3~C₇})シクロアルキル、ニトロ、シアノ、(C_{6~C₂₀})アリール、ヘテロ環、およびヘテロアリール；

(c) -C(=O)-R¹¹、-C(=O)-O-R¹¹、-O-R¹¹、-S-R¹¹、-C¹-C(=O)-R¹¹、-C¹-C(=O)-O-R¹¹、-C¹-C(=O)-O-R¹¹、および-C¹-C(=O)-S-R¹¹ (各R¹¹は、H、(C_{1~C₆})アルキル、(C_{2~C₆})アルケニル、(C_{2~C₆})アルキニル、(C_{6~C₂₀})アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール、(C_{1~C₆})ハロアルキル、(C_{3~C₇})シク

口アルキル、(C₆ ~ C₂₀)アリール、ヘテロ環、およびヘテロアリールから独立して選択される) ; ならびに

(d) - N(R⁹)R¹⁰、- C(=O) - N(R⁹)R¹⁰、- O - C(=O) - 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 - O - C(=O) - N(R⁹)R¹⁰ (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、- C(=O) - R¹¹、および - C(=O)OR¹¹ から独立して選択され、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、(C₆ ~ C₂₀)アリール、ヘテロ環、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、

ここで、R^{7a} の任意の(C₆ ~ C₂₀)アリール、ヘテロ環、またはヘテロアリールは、1 個から 3 個の Z¹⁰ 基で必要に応じて独立して置換され；

R^{7b} は、

(a) - (C₂ ~ C₆)アルキニル - (C₃ ~ C₇)炭素環、および - (C₂ ~ C₆)アルキニル - (C₆ ~ C₂₀)アリール (各 (C₃ ~ C₇)炭素環、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₆ ~ C₂₀)アリールは、単独でまたは基の一部として、1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換される)；

(d) - X(C₁ ~ C₆)アルキル、および - X(C₁ ~ C₆)ハロアルキル (各 - X(C₁ ~ C₆)アルキルおよび - X(C₁ ~ C₆)ハロアルキルは、1 個から 5 個の Z³ 基で独立して置換されており、1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

(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 (各 (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 個から 5 個の Z⁶ 基で独立して置換されており、1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)； ならびに

(g) - NR_eR_f、- C(O)NR_eR_f、- OC(O)NR_eR_f、- (C₁ ~ C₆)アルキル - NR_eR_f、- (C₁ ~ C₆)アルキル C(O) - NR_eR_f、および - (C₁ ~ C₆)アルキル - O - C(O) - NR_eR_f (各 (C₁ ~ C₆)アルキルは、1 個から 5 個の Z¹ 基で必要に応じて独立して置換されている)；

X は O であり、

各 Z¹ は、ハロおよび - (C₁ ~ C₆)アルキルから独立して選択され；

各 Z³ は、- (C₆ ~ C₂₀)アリールおよび (C₃ ~ C₇)炭素環から独立して選択され；

各 Z¹¹ は、Z¹⁰ から独立して選択され；

各 Z¹⁰ は、ハロおよび - (C₁ ~ C₆)アルキルから独立して選択され；

各 R_e は、1 個から 5 個の Z⁶ 基で独立して置換されている (C₁ ~ C₆)アルキルから独立して選択され；

各 Z⁶ は、- (C₆ ~ C₂₀)アリール、ヘテロアリール、- ヘテロ環、および - O(C₁ ~ C₆)アルキル - O - (C₁ ~ C₆)アルキルから独立して選択され； ならびに各 R_f は、H である、

請求項 1 ~ 5 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 7】

R⁷ が、R^{7a} または R^{7b} であり、

R^{7a} は、

(a) H、(C₁ ~ C₆)アルキル、および (C₁ ~ C₆)ハロアルキル；

(b) (C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀)アリール、ヘテロ環、およびヘテロアリール；

(c) - C (=O) - R^{1~1}、- C (=O) - O - R^{1~1}、- O - R^{1~1}、- (C₁~C₆) アルキル - R^{1~1}、および - (C₁~C₆) アルキル - O - R^{1~1} (各 R^{1~1} は、H、(C₁~C₆) アルキル、(C₃~C₇) シクロアルキル、(C₆~C₂₀) アリール、およびヘテロ環から独立して選択される) ; ならびに

(d) - N (R⁹) R^{1~0}、- C (=O) - N (R⁹) R^{1~0}、および - (C₁~C₆) アルキル - N (R⁹) R^{1~0} (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}、および - (C₁~C₆) アルキル - R^{1~1} から独立して選択され、各 R^{1~1} は、H、(C₁~C₆) アルキル、(C₃~C₇) シクロアルキル、(C₆~C₂₀) アリール、ヘテロ環、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,

ここで、R^{7a} の任意の (C₆~C₂₀) アリール、ヘテロ環、またはヘテロアリールは、1 個から 2 個の Z^{1~0} 基で必要に応じて独立して置換され;

R^{7b} は、

(a) - (C₂~C₆) アルキニル - (C₃~C₇) 炭素環、および - (C₂~C₆) アルキニル - (C₆~C₂₀) アリール;

(d) - X (C₁~C₆) アルキル (- X (C₁~C₆) アルキルは、1 個の Z³ 基で置換されている);

(f) 1 個の Z⁶ 基で置換されている (C₂~C₆) アルキニル; ならびに

(g) - N R_e R_f;

から選択され;

X は O であり、

各 Z¹ は、ハロおよび - (C₁~C₆) アルキルから独立して選択され;

各 Z³ は、- (C₆~C₂₀) アリールおよび (C₃~C₇) 炭素環から独立して選択され;

各 Z^{1~1} は、Z^{1~0} から独立して選択され;

各 Z^{1~0} は、ハロおよび - (C₁~C₆) アルキルから独立して選択され;

各 R_e は、1 個の Z⁶ 基で独立して置換されている (C₁~C₆) アルキルから独立して選択され;

各 Z⁶ は、- (C₆~C₂₀) アリール、- ヘテロアリール、- ヘテロ環、および - O

(C₁~C₆) アルキル - O - (C₁~C₆) アルキルから独立して選択され; そして

各 R_f は、H である。

請求項 1 ~ 5 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】

R⁴ が

【化 200】



である、請求項 1 ~ 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】

R⁷ が、以下:

(a) H、ハロ、(C₁~C₆) アルキルおよび (C₁~C₆) ハロアルキル;

(b) (C₂~C₆) アルケニル、(C₂~C₆) アルキニル、(C₃~C₇) シクロアルキル、ニトロ、シアノ、(C₆~C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール (ここで、各 (C₆~C₂₀) アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1 個から 3

個の Z^{1^0} 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(c) - 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) - 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、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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、各 (C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1 個から 3 個の Z^{1^0} 基で必要に応じて独立して置換されている)

(d) - 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} および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - N (R⁹) R^{1 0} (ここで、各 R⁹ は、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび (C₃ ~ C₇) シクロアルキルから選択され、各 R^{1 0} は、独立して、R^{1 1}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - R^{1 1}、 - SO₂ - R^{1 1}、 - C (=O) - R^{1 1}、 - C (=O) O R^{1 1} および - C (=O) N (R⁹) R^{1 1} から選択され、そして各 R^{1 1} 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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、各 (C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1 個から 3 個の Z^{1^0} 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(e) - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1 3}、 - (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、 - NR_a S O₂ NR_c R_d、 - NR_a SO₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - NR_a SO₂ O (C₆ ~ C₂₀) アリール、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₆ ~ C₂₀) 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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) アルキル - Z³ (各 (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、(C₆ ~ C₂₀) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1 個から 5 個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(f) - 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

、各 $X (C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $X (C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個から5個の Z^3 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されており、各 $X (C_2 \sim C_6)$ 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個から5個の Z^4 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(g) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル(ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個から5個の Z^2 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(h) $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 $-X (C_6 \sim C_{20})$ アリール、 $-X$ ヘテロアリールおよび $-X$ ヘテロ環(ここで、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個から5個の Z^5 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(i) $(C_1 \sim C_6)$ 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、各 $(C_1 \sim C_6)$ 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個から5個の Z^6 基で独立して置換されており、1個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ; ならびに

(j) $-NR_eR_f$ 、 $-C(O)NR_eR_f$ 、 $-OC(O)NR_eR_f$ 、 $-SO_2NR_eR_f$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ 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個から5個の Z^1 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

から選択される、請求項1～5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10】

R^7 が、以下：

(a) H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル；

(b) $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個から3個の Z^{10} 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(c) $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ および $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-R^{11}$ (ここで、各 R^{11} は、独立して、 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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個から3個の Z^{10} 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(d) $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル $-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、独立して、 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選択され、各 R^{10} は、独立して、 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 $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から選択され、そして各 R^{11} は、独立して、 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、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個から3個の Z^{10} 基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(e) $- (C_2 \sim C_6)$ アルキニル $- (C_3 \sim C_7)$ 炭素環および $- (C_2 \sim C_6)$ ア

ルキニル - $(C_6 \sim C_{20})$ アリール (ここで、各 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環および $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル - $(C_6 \sim C_{20})$ アリールは、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(f) - X $(C_1 \sim C_6)$ アルキル (ここで、- X $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個から5個のZ³基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されており、XはOである) ;

(g) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個から5個のZ²基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(h) $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環 (ここで、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、1個から5個のZ⁵基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(i) $(C_1 \sim C_6)$ 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、各 $(C_1 \sim C_6)$ 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個から5個のZ⁶基で置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ; ならびに

(j) - NR_eR_f、- C(O)NR_eR_f および - $(C_1 \sim C_6)$ アルキル - NR_eR_f (ここで、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル - NR_eR_f は、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている)

から選択される、請求項1～5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11】

R⁷が、以下:

(a) H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル;

(b) $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルおよび $(C_6 \sim C_{20})$ アリール (ここで、各 $(C_6 \sim C_{20})$ アリールは、1個から3個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(c) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個から5個のZ²基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ;

(d) $(C_6 \sim C_{20})$ アリール (ここで、 $(C_6 \sim C_{20})$ アリールは、1個から5個のZ⁵基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている) ; ならびに

(e) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個から5個のZ⁶基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている)

から選択される、請求項1～5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12】

R⁷が、以下:

(a) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル; ならびに

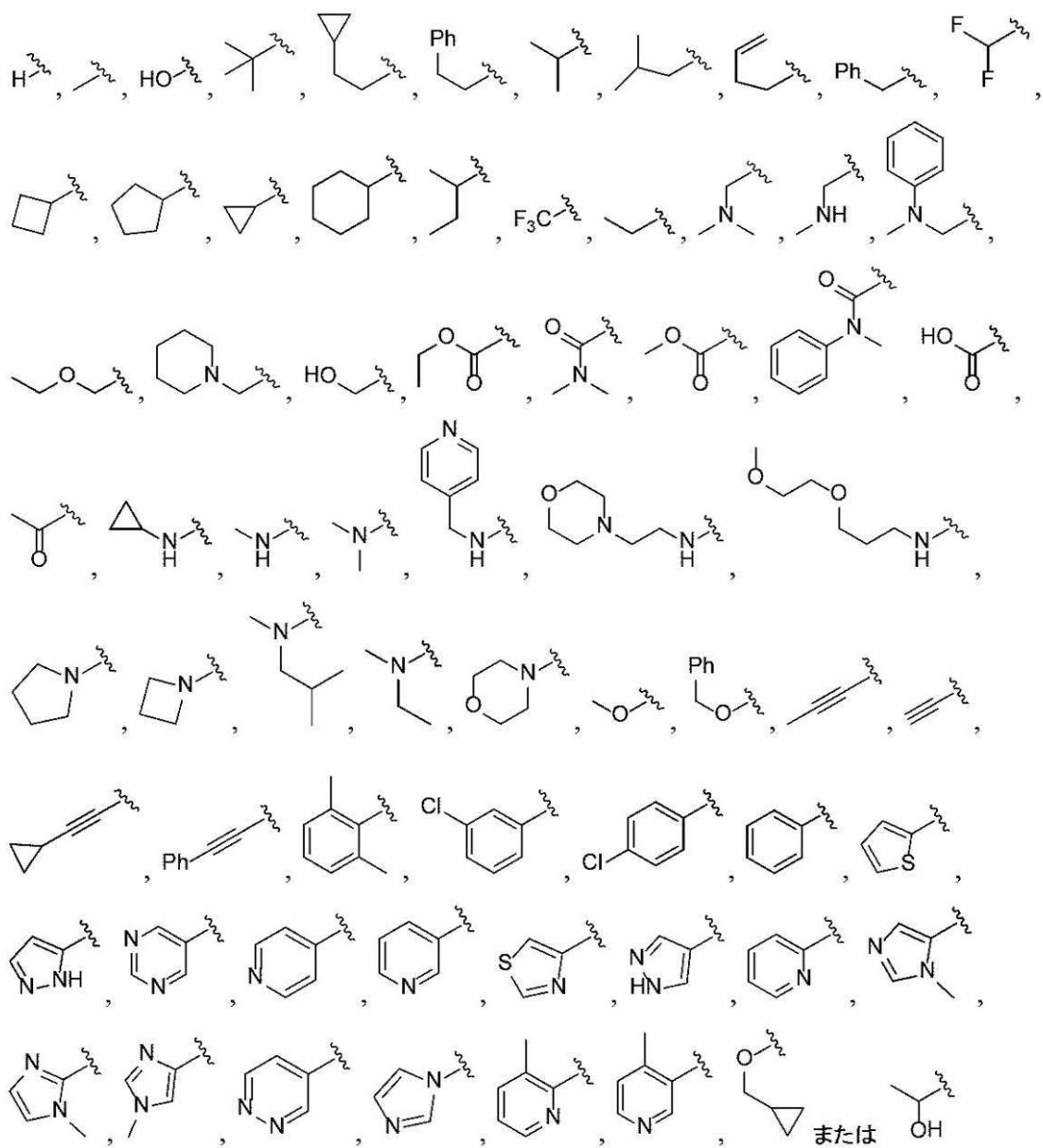
(b) $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル (ここで、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルは、1個から5個のZ⁶基で独立して置換されており、1個から5個のZ¹基で必要に応じて独立して置換されている)

から選択される、請求項1～5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13】

R⁷が、

【化 2 0 1 A】

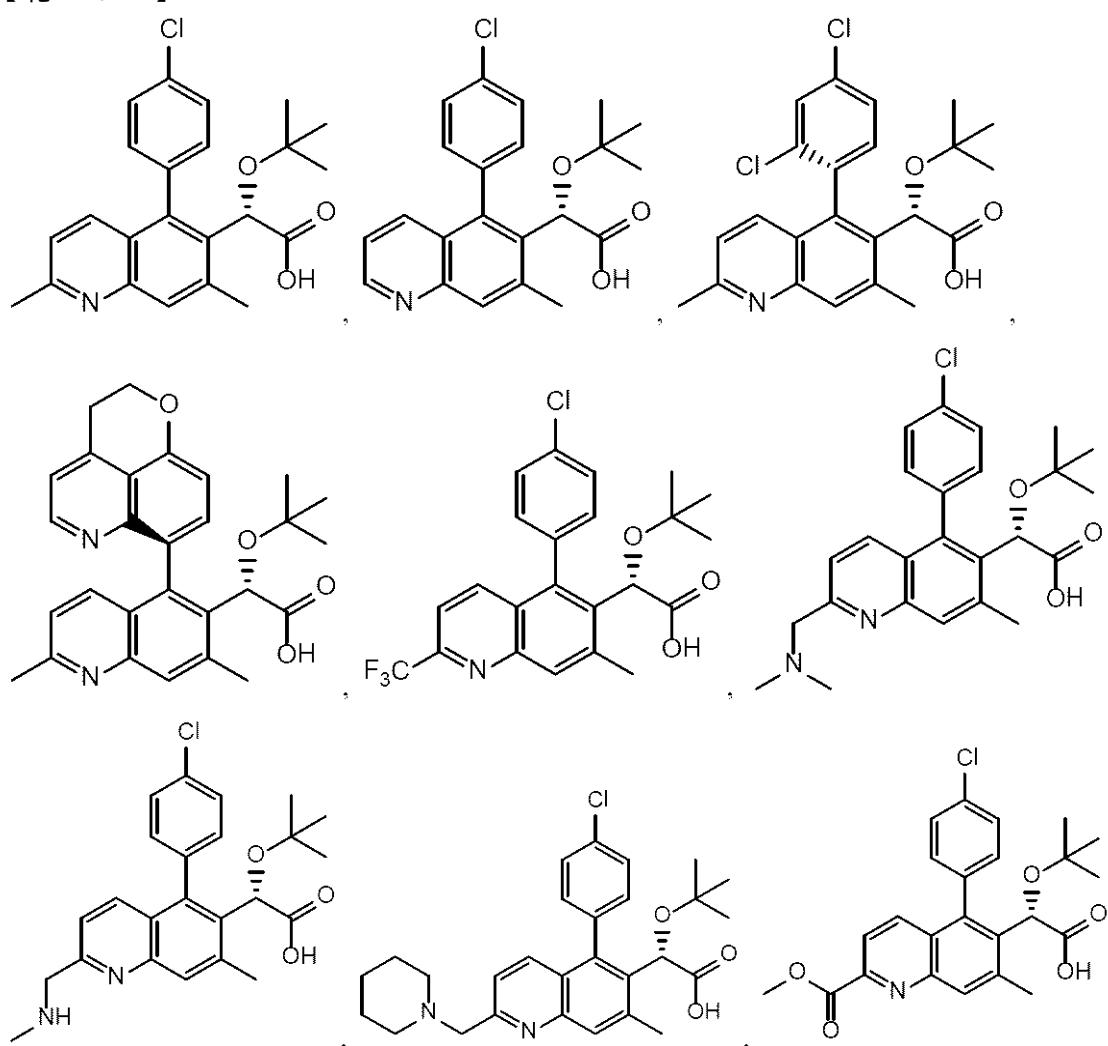


である、請求項 1 ~ 5のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容され得る塩。

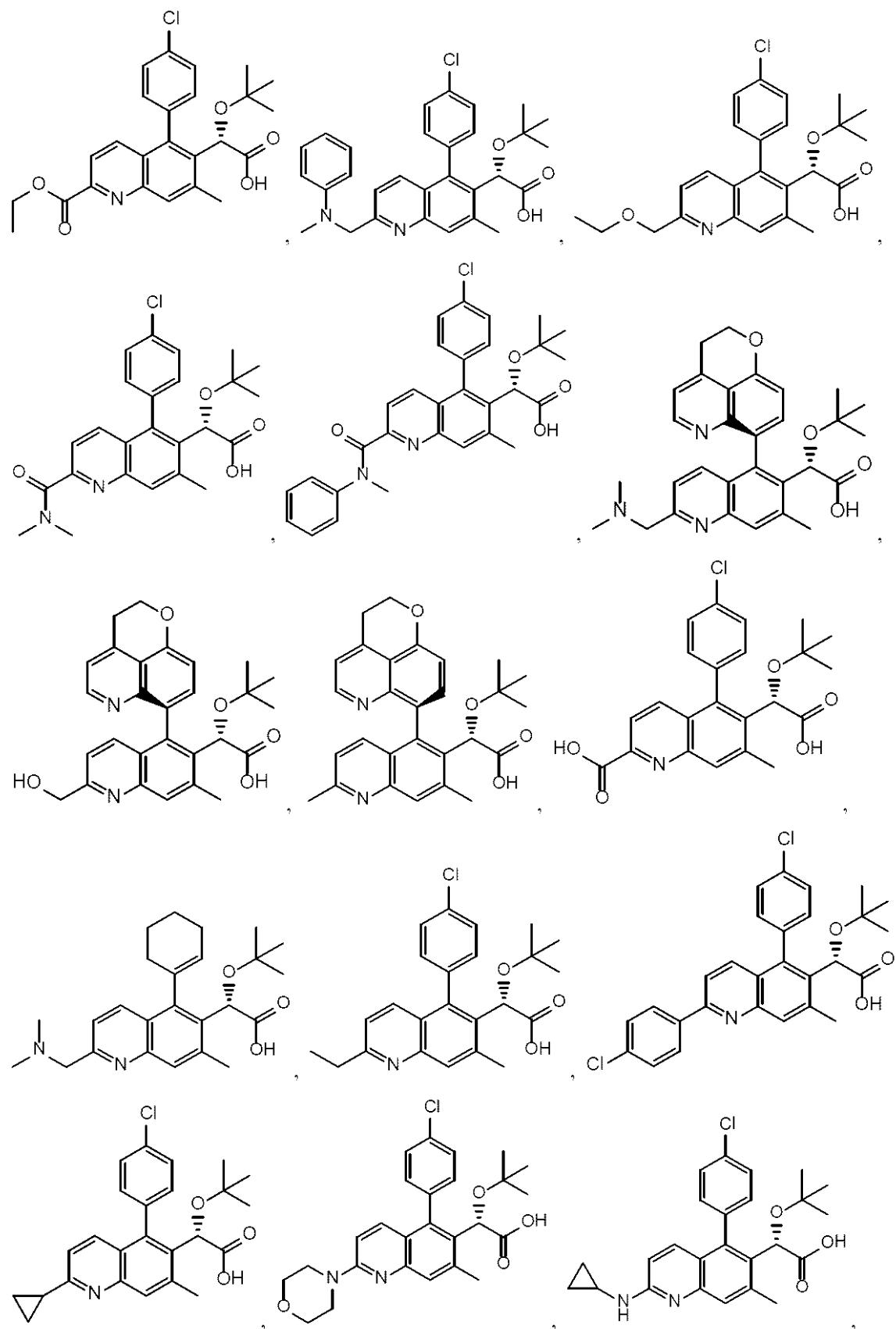
【請求項14】

以下：

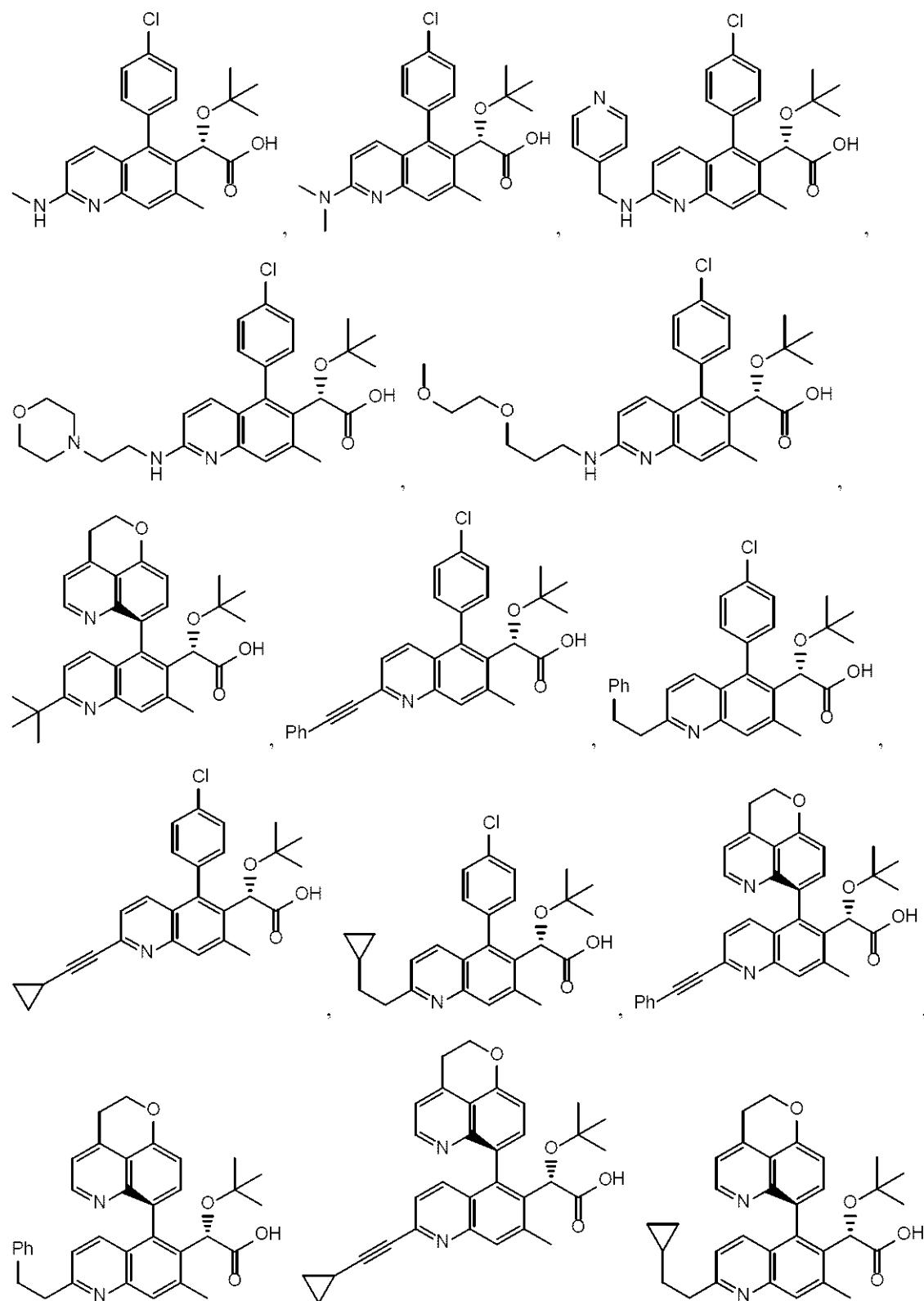
【化 2 0 4】



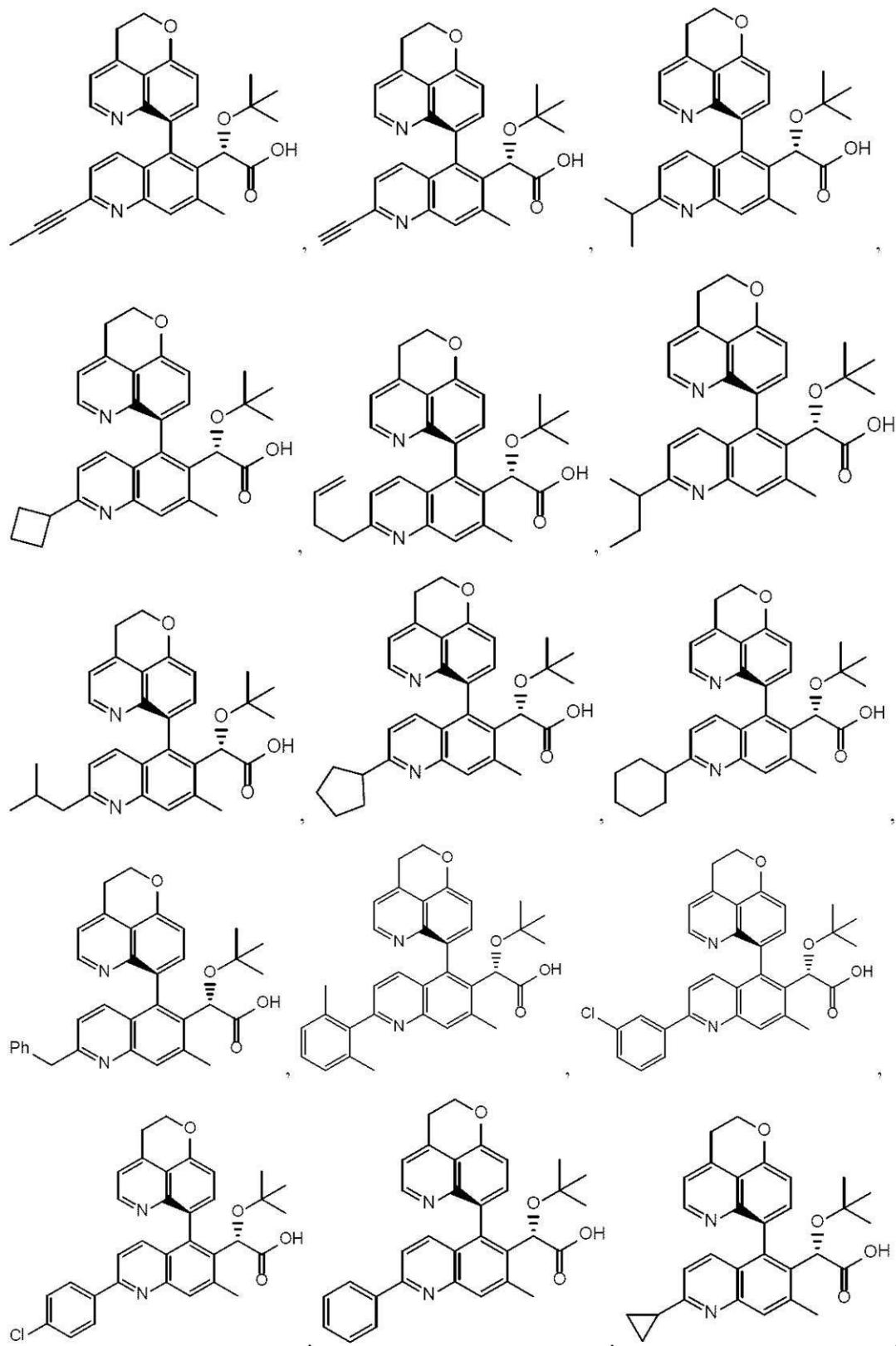
【化 2 0 5】



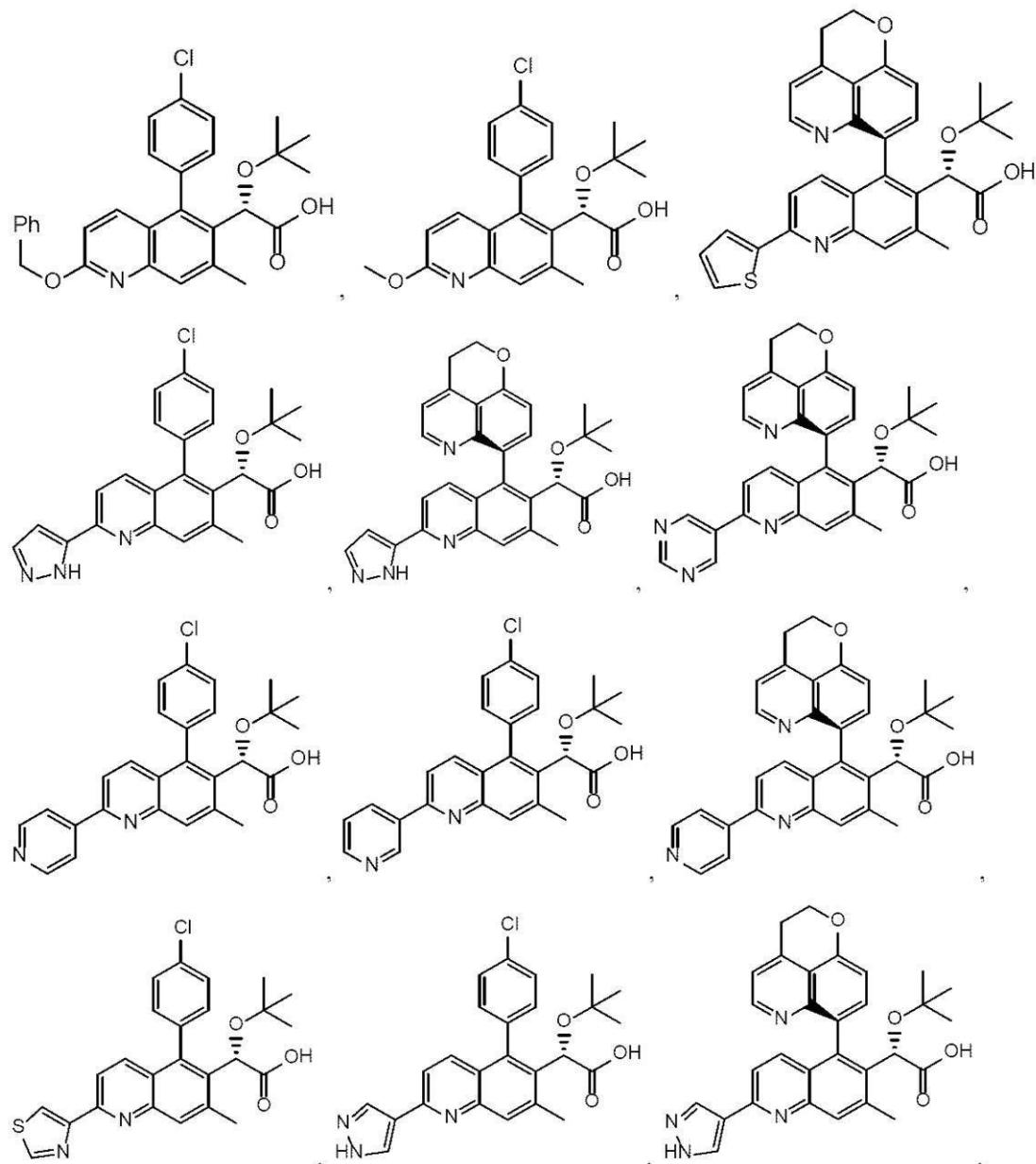
【化 2 0 6】



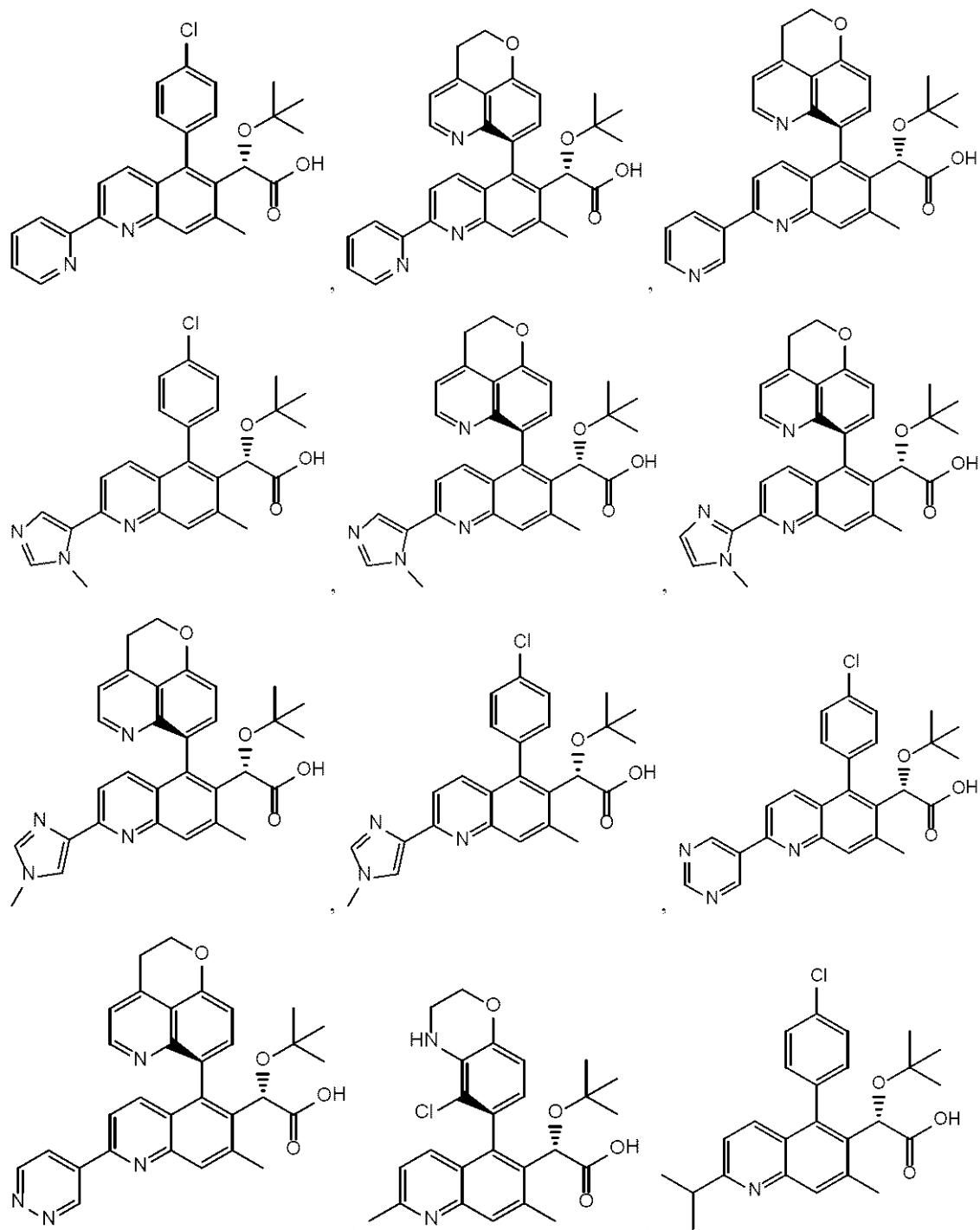
【化 2 0 7】



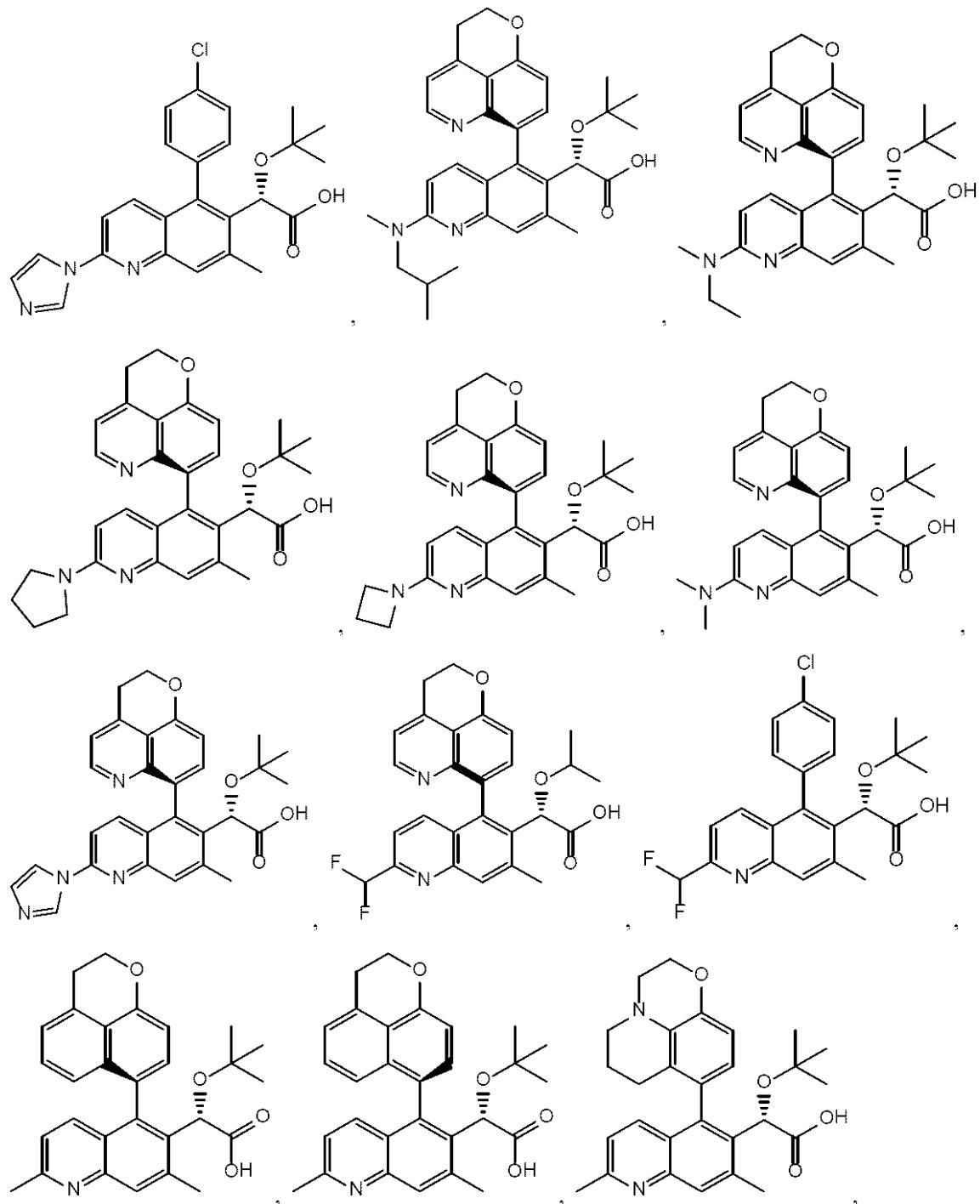
【化 2 0 8】



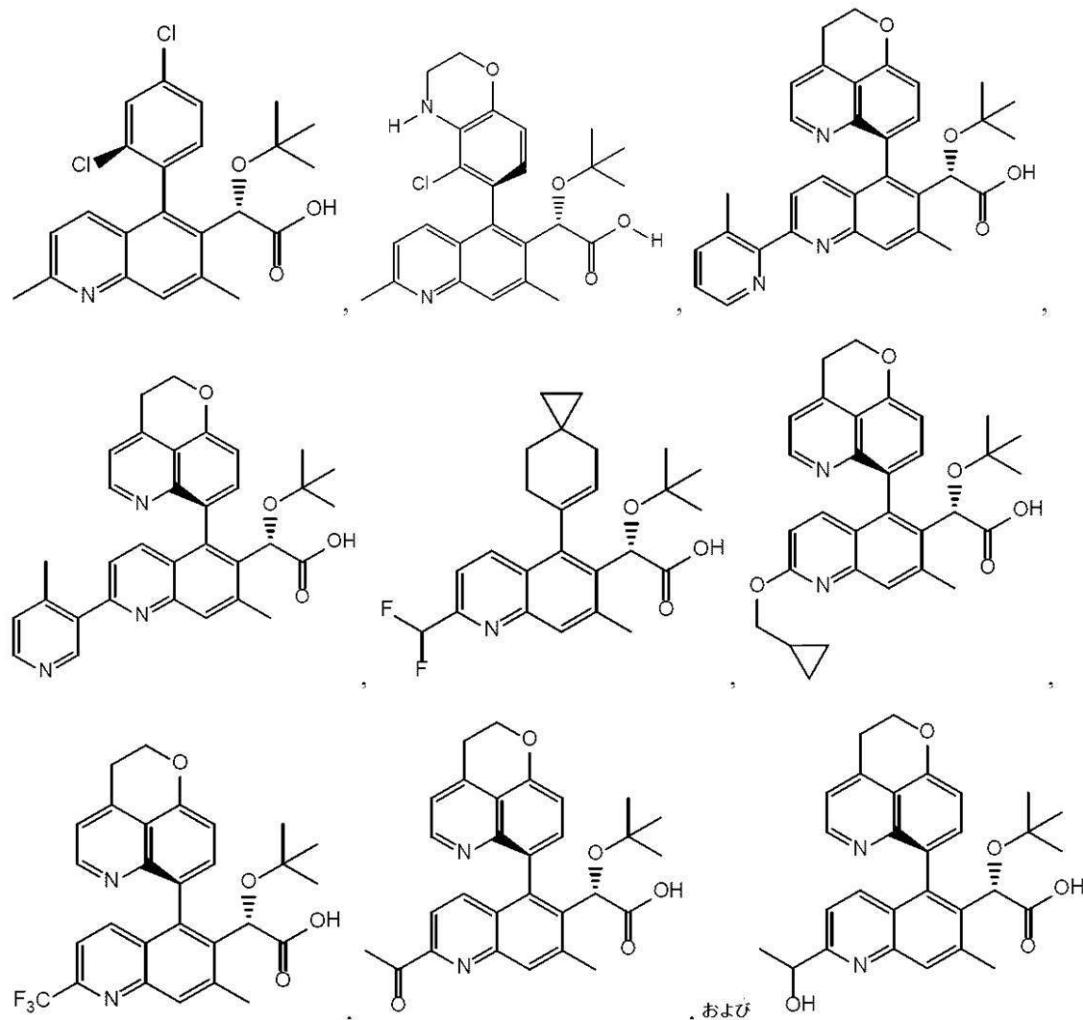
【化 2 0 9】



【化 2 1 0】



【化 2 1 1】

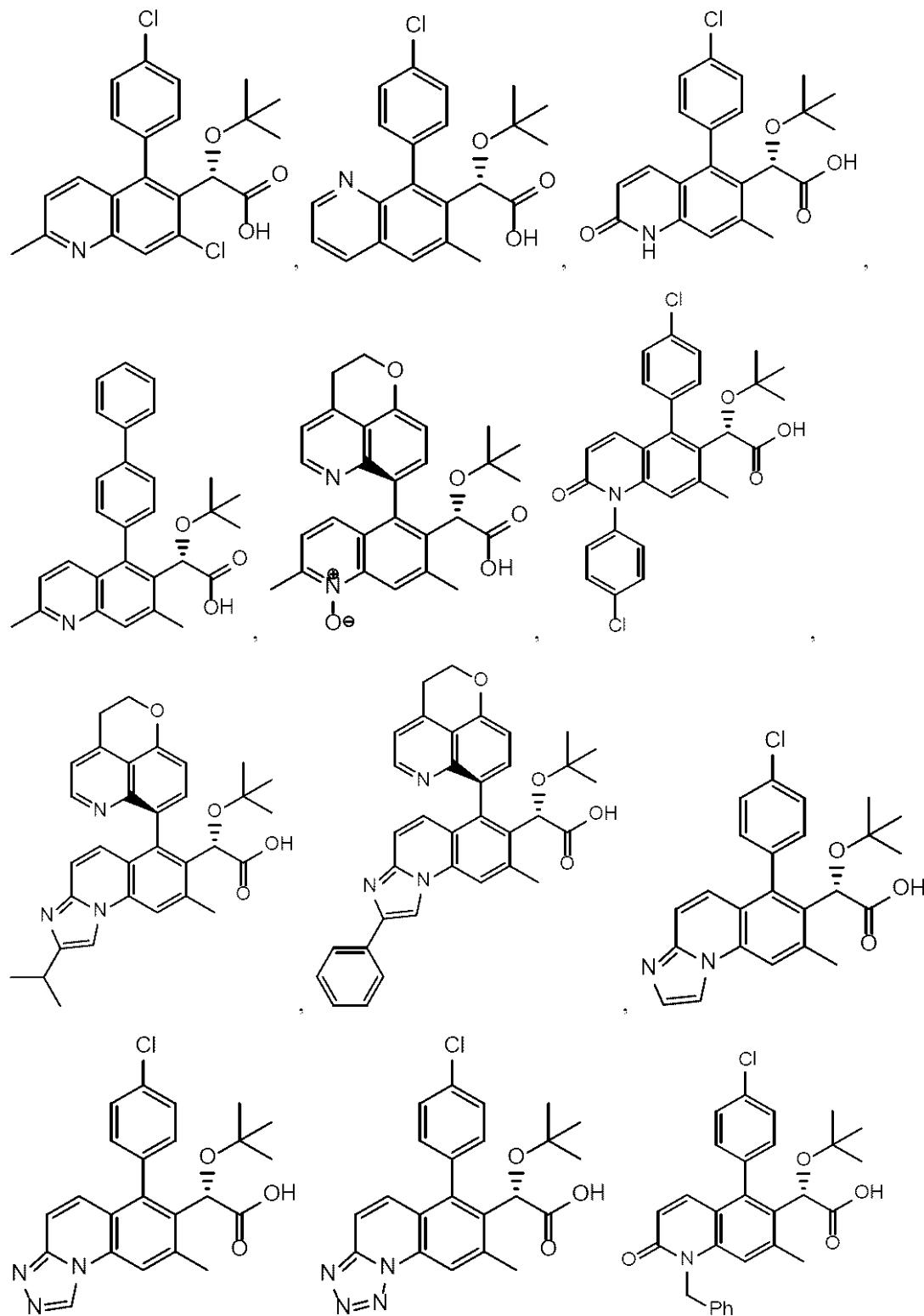


から選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容され得る塩。

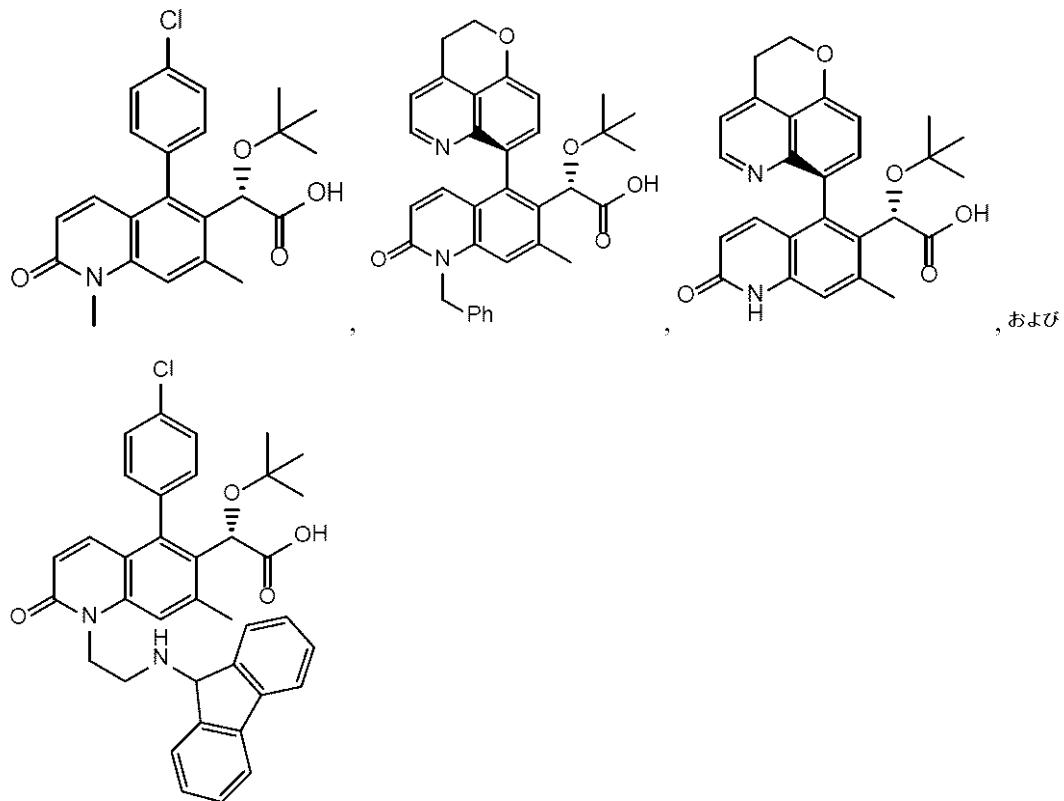
【請求項 1 5】

以下：

【化 2 1 2】



【化 2 1 3】



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 6】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩を、医薬的に許容され得る担体と組み合わせて含む、医薬組成物。

【請求項 1 7】

ヒトにおいて H I V ウィルスの増殖を処置するか、A I D S を処置するか、または、A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせるための、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその医薬的に許容され得る塩を含む、医薬。

【請求項 1 8】

医学的治療において使用するための、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 1 9】

ヒトにおいて H I V ウィルスの増殖もしくは A I D S の予防的もしくは治療的処置において使用するための、または、ヒトにおいて A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせる治療的処置において使用するための、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩を含む、組成物。

【請求項 2 0】

ヒトにおいて、H I V ウィルスの増殖を処置するため、A I D S を処置するため、または A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせるための医薬を製造するための、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩の使用。

【請求項 2 1】

ヒトにおいて、H I V 感染を処置するのに使用するための、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬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】0 0 1 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 1】

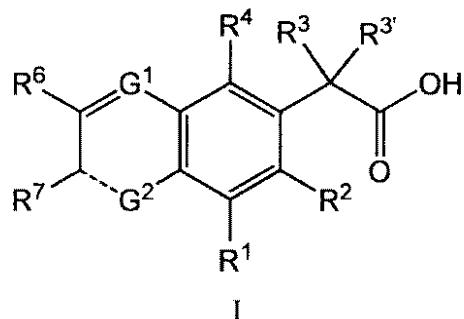
本発明はまた、式Iの化合物またはその塩を調製するのに有用な、本明細書に開示されるプロセスおよび中間体を提供する。

一実施形態において、たとえば、以下の項目が提供される。

(項目1)

式Iの化合物：

【化196】



[式中、

G¹ が N であり、G² が C R⁸ であり、点線の結合が二重結合であるか；または

G¹ が C R⁵ であり、G² が N であり、点線の結合が二重結合であるか；または

G¹ が C R⁵ であり、G² が N R^{1~3} であり、点線の結合が単結合であり、R⁷ がオキソ(=O)基であるか；または

G¹ が C R⁵ であり、G² が N R^{1~3} であり、点線の結合が単結合であり、R⁷ および R^{1~3} が、これらが結合している原子と共にヘテロアリールを形成し、ヘテロアリールが、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており；

R¹ が、R^{1~a} または R^{1~b} であり；

R² が、R^{2~a} または R^{2~b} であり；

R³ が、R^{3~a} または R^{3~b} であり；

R^{3'} が、R^{3~a'} または R^{3~b'} であり；

R⁴ が、R^{4~a} または R^{4~b} であり；

R⁵ が、R^{5~a} または R^{5~b} であり；

R⁶ が、R^{6~a} または R^{6~b} であり；

R⁷ が、R^{7~a} または R^{7~b} であり；

R⁸ が、R^{8~a} または R^{8~b} であり；

R^{1~3} が、R^{1~3~a} または R^{1~3~b} であり；

R^{1~a} が、以下：

(a) H、ハロ、(C₁~C₆)アルキルおよび(C₁~C₆)ハロアルキル；

(b) (C₂~C₆)アルケニル、(C₂~C₆)アルキニル、(C₃~C₇)シクロアルキル、ニトロ、シアノ、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール；

(c) -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-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、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、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される)；および

(d) - 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、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび (C₃ ~ C₇) シクロアルキルから選択され、各 R^{1~0} は、独立して、R^{1~1}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - R^{1~1}、- SO₂ - R^{1~1}、- C (= O) - R^{1~1}、- C (= O) O R^{1~1} および - C (= O) N (R⁹) R^{1~1} から選択され、各 R^{1~1} 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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される)；

から選択され、

R^{1~a} の任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1 個以上の Z^{1~0} 基で必要に応じて置換されており；

R^{1~b} は、以下：

(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 ~ C₇) 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 - Z^{1~3}、- C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- SO₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~4}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₂ ~ C₆) アルキル - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (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 S O₂ 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 - ヘテロ環、- (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、- (C₂ ~ C₆) アルキニル - ヘテロアリール - (C₂ ~ C₆) アルキニル - ヘテロ環、- (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) 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、(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている)；

(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ており、2 個の Z¹ 基は、これらが結合している 1 個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている)；

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

(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、任意の - 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 基で置換されており、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されており、任意の - 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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、-Xアリール、-Xヘテロアリールおよび-Xヘテロ環(任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(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)アルキニルはそれぞれ、1個以上のZ⁶基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(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および-(C₁～C₆)アルキル-SO₂NR_eR_f(ここで、任意の(C₁～C₆)アルキルはそれぞれ、ある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

から選択され、

R^{2a}は、以下：

(a) H、(C₁～C₆)アルキルおよび-O(C₁～C₆)アルキル；

(b) (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、ヘテロ環、ヘテロアリール、ハロ、ニトロおよびシアノ；

(c) -C(=O)-R¹¹、-C(=O)-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(O)-R¹¹および-(C₁～C₆)アルキル-SO₂-R¹¹(ここで、各R¹¹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、(C₁～C₆)ハロアルキル、(C₃～C₇)シクロアルキル、アリールおよびヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールはそれぞれ、1個以上のZ¹¹基で必要に応じて置換されている)；

(d) -OH、-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)シクロアルキル、-Oアリール、-Oヘテロ環および-Oヘテロアリール；ならびに

(e) -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、-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、独立して、H、(C₁～C₆)アルキルおよび(C₃～C₇)シクロアルキルから選択され、各R¹⁰は、独立して、R¹¹、-(C₁～C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から選択され、各R¹¹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、(C₁～C₆)ハロアルキル、(C₃～C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される)；

から選択され、

R^{2b}は、以下：

(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～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、 - (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 ~ C
 6) アルキル - Z¹³、 - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - S(O) - (C₁ ~ C
 6) 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 - C(O) - 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、 - (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - NR_aS
 O, NR_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 -
 ヘテロ環、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - (C₂ ~ C₆) 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、 (C
 3 ~ C₇) 炭素環、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 (C₂ ~ C
 6) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の
 一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(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ており、2個のZ¹基は、これらが結合している1個または複数
 個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、(C₃
 ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

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

(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、任意の - X (C₁ ~ C₆) アルキル、 - X (C₁ ~ C₆) ハロアルキルは、1個以
 上のZ³基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており、任意の
 - 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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換
 されている) ;

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 - X アリール、 - X ヘテロアリールおよ
 び - X ヘテロ環 (ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でも
 しくはある基の一部として、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必
 要に応じて置換されている) ;

(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 ~ C
 7) 炭素環、 (C₂ ~ C₆) アルケニルおよび (C₂ ~ C₆) アルキニルはそれぞれ、1
 個以上のZ⁶基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;
 ならびに

(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 ~ C
 6) アルキル - SO₂NR_eR_f (ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルはそれぞれ、1個以
 上のZ¹で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R³^a 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 - ヘテロ環、- (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 - ヘテロ環または - O (C₁ ~ C₆)アルキル - ヘテロアリール (ここで、R^{3-a} の任意の (C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニルまたは (C₂ ~ C₆) アルキニルは、単独でもしくはある基の一部として、- O (C₁ ~ C₆) アルキル、ハロ、オキソおよび - CN から選択される 1 つ以上の基で必要に応じて置換されており、R^{3-a} の任意の (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、(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 つ以上の基で必要に応じて置換されており；

R^3 は H であり；

N R_a R_b、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a - SO₂ - (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a - SO₂ - ハロ (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a - SO₂ NR_c R_d、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a SO₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a SO₂ O アリール、 - O (C₁ ~ C₆) アルキル - N R_a SO₂ ハロアリール、 - O ヘテロアリール、 - O ヘテロ環、 - S ヘテロアリール、 - S ヘテロ環、 - S (O) ヘテロアリール、 - S (O) ヘテロ環、 - SO₂ ヘテロアリールまたは - SO₂ ヘテロ環であり、ここで、R^{3 b} の任意の (C₁ ~ C₆) アルキル、 (C₂ ~ C₆) アルケニル、 - (C₇ ~ C₁₄) アルキル、 (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ヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており；

R^{3 b} は、H、(C₁ ~ C₆) アルキルまたは - O (C₁ ~ C₆) アルキルであるか；または、R^{3 b} およびR^{3 b'} は、これらが結合している炭素と共に、ヘテロ環または (C₃ ~ C₇) 炭素環を形成し、R^{3 b} およびR^{3 b'} とこれらが結合している炭素とを合わせたヘテロ環または (C₃ ~ C₇) 炭素環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており；

R^{4 a} は、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、R^{4 a} の任意のアリール、ヘテロ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、- 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つ以上の基で必要に応じて置換されており、(C₁ ~ C₆) アルキルは、ヒドロキシ、- O (C₁ ~ C₆) アルキル、シアノおよびオキソで必要に応じて置換されており；

R^{4 b} は、以下：

(a) (C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニルおよび (C₂ ~ C₆) アルキニル（ここで、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニルおよび (C₂ ~ C₆) アルキニルはそれぞれ、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている）；

(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ており、2個のZ¹基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成する）；

(c) スピロヘテロ環および架橋ヘテロ環（ここで、スピロヘテロ環および架橋ヘテロ環はそれぞれ、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており、2個のZ¹基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成する）；ならびに

(d) アリール、ヘテロアリール、スピロヘテロ環、縮合ヘテロ環および架橋ヘテロ環（ここで、アリール、ヘテロアリール、スピロヘテロ環、縮合ヘテロ環および架橋ヘテロ環はそれぞれ独立して、1個以上のZ⁷基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている）；

から選択されるか、または

R⁴ およびR³ は、これらが結合している原子と共に、大環状ヘテロ環または大環状炭素環を形成し、R⁴ およびR³ とこれらが結合している原子とを合わせた任意の大環状ヘテロ環または大環状炭素環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されていてもよく；

R³' は、H、(C₁ ~ C₆) アルキルまたは - O (C₁ ~ C₆) アルキルであり；

R^{5 a} は、以下：

(a) ハロ、ニトロおよびシアノ；

(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 - 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、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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールはそれぞれ、1 個以上の Z^{1 1} 基で必要に応じて置換されている) ; ならびに

(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 - 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、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₃ ~ C₇) シクロアルキルから選択され、各 R^{1 0} は、独立して、R^{1 1}、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - R^{1 1}、 - SO₂ - R^{1 1}、 - C (= O) - R^{1 1}、 - C (= O) O R^{1 1} および - C (= O) N (R⁹) R^{1 1} から選択され、各 R^{1 1} 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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され;

R^{5 b} は、以下:

(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 - ヘテロ環、 - (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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) 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、 - (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている);

(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ており、2 個の Z¹ 基は、これらが結合している 1 個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている);

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

(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、任意の 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 基で置換されており、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されており、任意の - 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、独立して、1 個以上の Z⁴ 基で置換されており、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている);

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 - X アリール、 - X ヘテロアリールおよび - X ヘテロ環 (ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でも

しくはある基の一部として、それぞれ独立して、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(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)アルキニルはそれぞれ独立して、1個以上のZ⁶基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;ならびに

(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、任意の(C₁ ~ C₆)アルキルは、ある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R^{6a}は、以下:

(a) H、ハロ、(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₁ ~ C₆)ハロアルキル；
(b) (C₂ ~ C₆)アルケニル、(C₂ ~ C₆)アルキニル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、ニトロ、シアノ、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール；

(c) -C(=O)-R¹¹、-C(=O)-O-R¹¹、-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、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、(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ;および

(d) -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、独立して、H、(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₃ ~ C₇)シクロアルキルから選択され、各R¹⁰は、独立して、R¹¹、-(C₁ ~ C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から選択され、各R¹¹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、(C₁ ~ C₆)ハロアルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ;

から選択され、

R^{6a}の任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上のZ¹⁰基で必要に応じて置換されており；

R^{6b}は、以下:

(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 ~ 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、-ハロ-(C₃ ~ C₇)炭素環、-NR_aSO₂NR_c、-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-ヘテロ環

、 - (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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) 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、 ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(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ており、2個のZ¹基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、炭素環またはヘテロ環を形成し、炭素環またはヘテロ環は、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

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

(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、任意の - 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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており、任意の - 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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 - X アリール、 - X ヘテロアリールおよび - X ヘテロ環 (ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(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) アルキニルはそれぞれ独立して、1個以上のZ⁶基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ; および

(g) - N R_e R_f、 - C (O) N R_e R_f、 - O C (O) N R_e R_f、 - S O₂ 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 - S O₂ N R_e R_f (ここで、任意の (C₁ ~ C₆) アルキルは、ある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R^{7a} は、以下：

(a) H、ハロ、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび (C₁ ~ C₆) ハロアルキル；

(b) (C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、ニトロ、シアノ、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール；

(c) - C (= O) - R¹¹、 - C (= O) - O - R¹¹、 - O - R¹¹、 - S - R¹¹、 - S (O) - R¹¹、 - S O₂ - 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 - S O₂ - R¹¹ (ここで、各R¹¹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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択される) ; および

(d) - N (R⁹) R¹⁰、 - C (= O) - N (R⁹) R¹⁰、 - O - C (= O) - N

$(R^9)R^{1-0}$ 、 $-SO_2-N(R^9)R^{1-0}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル- $N(R^9)$
 R^{1-0} 、 $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル- $C(=O)-N(R^9)R^{1-0}$ 、 $- (C_1 \sim C_6)$
 アルキル-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁻⁰および $- (C_1 \sim C_6)$ アルキル-SO₂
 $-N(R^9)R^{1-0}$ （ここで、各R⁹は、独立して、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選択され、各R¹⁻⁰は、独立して、R¹⁻¹、 $- (C_1$
 $\sim C_6)$ アルキル-R¹⁻¹、 $-SO_2$ 、 $-R^{1-1}$ 、 $-C(=O)-R^{1-1}$ 、 $-C(=O)O$
 R^{1-1} および $-C(=O)N(R^9)R^{1-1}$ から選択され、各R¹⁻¹は、独立して、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、ヘテロ環および
 テロアリールから選択される）；

から選択され、

R^7 の任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されており；

R⁷b は、以下：

(a) - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - C(CO) - (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 - C(O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - C(O) - O(C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z¹³、 - (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、 - 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 - ヘテロ環、 - (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 - ヘテロ環、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ(C₁ ~ C₆) 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、(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(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ており、2個の Z^1 基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、($C_3 \sim C_7$)炭素環またはヘテロ環を形成し、($C_3 \sim C_7$)炭素環またはヘテロ環は、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている）：

(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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)：

(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、任意の-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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており、任意の-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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて

置換されている) ;

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、-Xアリール、-Xヘテロアリールおよび-Xヘテロ環(ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

(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)アルキニルはそれぞれ、1個以上のZ⁶基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ; および

(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、(C₁~C₆)アルキルはそれぞれ、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R^{8a}は、以下：

(a) ハロ、ニトロおよびシアノ；

(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、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、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールはそれぞれ、1個以上のZ¹¹基で必要に応じて置換されている) ; 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および-(C₁~C₆)アルキル-SO₂-N(R⁹)R¹⁰(ここで、各R⁹は、独立して、H、(C₁~C₆)アルキルおよび(C₃~C₇)シクロアルキルから選択され、各R¹⁰は、独立して、R¹¹、-(C₁~C₆)アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹および-C(=O)N(R⁹)R¹¹から選択され、各R¹¹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、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールはそれぞれ、1個以上のZ¹¹基で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R^{8b}は、以下：

(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、-SO₂-(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-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-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-

₇) 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、- ハロ (C₃ ~ C₇) 炭素環、- NR_aS
 O₂NR_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 - ヘテロ環、
 - (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 - ヘテロ環、
 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹ および - ハロ (C₁ ~ C₆) 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、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている) ;

(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ており、2個の Z^1 基は、これらが結合している1個または複数個の原子と共に、必要に応じて、(C₃ ~ C₇)炭素環またはヘテロ環を形成し、(C₃

(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^1 基で必要に応じて置換されている) ;
基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている) ;

(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、任意の-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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されており、任意の-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基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、-Xアリール、-Xヘテロアリールおよび-Xヘテロ環（ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ⁵基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている）：

(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($C_2 \sim C_6$) アルキニルはそれぞれ独立して、1個以上の Z^6 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；および

(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、(C₁-C₆)アルキルはそれぞれ、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている）；

から選択され、

R¹ 3 a は、以下：

(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

アルキル - SO₂ - R^{1~1} (ここで、各 R^{1~1} 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、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₃ ~ C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、それぞれ 1 個以上の Z^{1~1} 基で必要に応じて置換されている) ; および

(b) - 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} および - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - N (R⁹) R^{1~0} (ここで、各 R⁹ は、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₃ ~ C₇) シクロアルキルから選択され、各 R^{1~0} は、独立して、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} から選択され、各 R^{1~1} は、独立して、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキルアリール、(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、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールはそれぞれ、1 個以上の Z^{1~1} 基で必要に応じて置換されている) ;

から選択され、

R^{1~3}^b は、以下：

(a) - (C₁ ~ C₆) アルキル - SO₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- SO₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - C (O) - O (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (C₁ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~3}、- (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) 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 - ヘテロ環、- (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 - ヘテロ環、- (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z¹、- ハロ (C₁ ~ C₆) アルキル - Z³、- NR_a SO₂ NR_c R_d、- NR_a SO₂ O (C₃ ~ C₇) 炭素環および - NR_a SO₂ O 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、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている) ;

(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、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ており、2 個の Z¹ 基は、これらが結合している 1 個または複数個の原子と共に、必要に応じて (C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成し、(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環は、1 個以上の Z¹ 基で必要に応じて置換されている) ;

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

(d) - X (C₁ ~ C₆) アルキル、- X (C₁ ~ C₆) ハロアルキル、- X (C₂ ~

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、任意の $X(C_1 \sim C_6)$ 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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されており、任意の $-X(C_2 \sim C_6)$ 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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(e) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 $-X$ アリール、 $-X$ ヘテロアリールおよび $-X$ ヘテロ環(ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上の Z^5 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(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 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルはそれぞれ独立して、1個以上の Z^6 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；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、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、それぞれ1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

から選択されるか、

または R^{5a} および R^{6a} 、 R^{6a} および R^{7a} 、 R^{7a} および R^{8a} 、 R^1 および R^8 、 R^1 および R^2 、または R^1 および R^{13} のうち任意のものが、これらが結合している原子と共に、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環を形成し、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環は、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、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim C_6)$ 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)からそれぞれ独立して選択される1つ以上の置換基で必要に応じて置換されているか；

または、 R^5 および R^6 、 R^6 および R^7 、または R^7 および R^8 のうち任意のものが、これらが結合している原子と共に、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環を形成し、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環はそれぞれ独立して、1個以上の Z^7 基または Z^8 基で置換されており、2個の Z^7 基が同じ原子上にある場合、その2個の Z^7 基は、それらが結合している原子と共に、必要に応じて、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環または4、5もしくは6員環のヘテロ環を形成するか；

または、 R^1 および R^8 、 R^1 および R^2 、または R^1 および R^{13} のうち任意のものが、これらが結合している原子と共に、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環を形成し、5員環もしくは6員環の炭素環または4、5、6もしくは7員環のヘテロ環はそれぞれ独立して、1個以上の Z^7 基または Z^8 基で置換されており、2個の Z^7 基が同じ原子上にある場合、その2個の Z^7 基は、それらが結合している原子と共に、必要に応じて、 $(C_3 \sim C_7)$ 炭素環または4、5もしくは6員環のヘテロ環を形成し；

X は、独立して、 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- から選択され；

各 Z^1 は、独立して、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、 $-(C_1 \sim C_6)$

$C_1 \sim C_6$) 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、-ヘテロ環、-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ヘテロ環、-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ヘテロ環、-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、-SO₂($C_1 \sim C_6$) 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)ヘテロ環、-SO₂($C_2 \sim C_6$) アルケニル、-SO₂($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル、-SO₂($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-SO₂アリール、-SO₂ヘテロアリール、-SO₂ヘテロ環、-SO₂NR_cR_d、-NR_cR_d、-NR_aC(O)R_a、-NR_aC(O)NR_cR_d、-NR_aSO₂R_b、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-R_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-OOC(O)NR_cR_dから選択され、Z¹の任意の($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)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、- $(C_3 \sim C_7)$ 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、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、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、ヘテロ環、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-NHヘテロアリール、-NHヘテロ環、または-S(O)₂NR_cR_dで必要に応じて置換されており；

各Z²は、独立して、-NO₂、-CN、スピロヘテロ環、架橋ヘテロ環、スピロ二環式炭素環、架橋二環式炭素環、NR_aSO₂($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-NR_aSO₂アリール、-NR_aSO₂ヘテロアリール、-NR_aSO₂NR_cR_d、-NR_aSO₂O($C_3 \sim C_7$) 炭素環および-NR_aSO₂Oアリールから選択され；

各Z³は、独立して、-NO₂、-CN、-OH、オキソ、=NOR_a、チオキソ、-アリール、-ヘテロ環、-ヘテロアリール、($C_3 \sim C_7$) 炭素環、- $(C_3 \sim C_7)$ 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ハロ($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-Oアリール、-Oヘテロ環、-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(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)ヘテロ環、-S(O)ヘテロアリール、-SO₂($C_1 \sim C_6$) アルキル、-SO₂($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-SO₂アリール、-SO₂ヘテロ環、-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($C_3 \sim C_7$) 炭素環および-NR_aSO₂Oアリールから選択され；

各Z⁴は、独立して、ハロゲン、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、($C_3 \sim C_7$) 炭素環、-ハロ($C_1 \sim C_6$) アルキル、-NO₂、-CN、-OH、オキソ、=NOR_a、チオキソ、アリール、ヘテロ環、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ヘテロ環、-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ヘテロ環、-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)ヘテロ環、-S(O)ヘテロアリール、-SO₂($C_1 \sim C_6$) アルキル、-SO₂($C_3 \sim C_7$) 炭素環

、 - SO₂ (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 SO₂ アリール、 - SO₂ ヘテロ環、 - 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アリールから選択され；

各Z⁵は、独立して、 - 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、 - NR_aSO₂ヘテロアリール、 - NR_aSO₂ヘテロ環、 - 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) アルキル、 - NR_aC(O) アリール、 - NR_aC(O) ヘテロアリール、 - NR_aC(O) ヘテロ環、 NR_aC(O)NR_cR_d および NR_aC(O)OR_b から選択され；

各Z⁶は、独立して、 - 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、 ヘテロ環、 - Oアリール、 - Oヘテロアリール、 - Oヘテロ環、 - O(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - O(C₁ ~ C₆) アルキル、 - O(C₁ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル、 - O(C₃ ~ C₇) 炭素環、 - Oハロ(C₁ ~ C₆) アルキル、 - Sアリール、 - Sヘテロアリール、 - Sヘテロ環、 - 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)ヘテロアリール、 - S(O)ヘテロ環、 - S(O)(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S(O)(C₁ ~ C₆) アルキル、 - SO₂アリール、 - SO₂ヘテロアリール、 - SO₂ヘテロ環、 - SO₂(C₁ ~ C₆) アルキル、 - SO₂(C₃ ~ C₇) 炭素環、 - SO₂(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - SO₂NR_cR_d、 - NR_aSO₂(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - NR_aSO₂アリール、 - NR_aSO₂ヘテロアリール、 - 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アリールから選択され；

各Z⁷は、独立して、 - NO₂、 = NOR_a、 - CN、 - (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OH、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - Z^{1~2}、 - (C₁ ~ C₆) アルキニル - OH、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキル - Z^{1~2}、 - (C₁ ~ C₆) ハロアルキルOH、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環 - Z^{1~2}、 - (C₃ ~ C₇) 炭素環OH、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - (C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 アリール、 ヘテロアリール、 ヘテロ環、 - 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(C₁ ~ C₆) アルキル、 - O(C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - O(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - O(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - Oヘテロアリール、 - Oヘテロ環、 - S(C₁ ~ C₆) アルキル - Z^{1~2}、 - S(C₂ ~ C₆) アルケニル、 - S(C₂ ~ C₆) アルキニル、 - S(C₁ ~ C₆) アルキル、 - S(C₃ ~ C₇) 炭素環、 - S(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S(C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - S(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - S(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - Sアリール、 - Sヘテロアリール、 - Sヘテロ環、 - 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)(C₁ ~ C₆) アルキルNR_cR_d、 - S(O)(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aC(O)R_a、 - S(O)(C₁ ~ C₆) アルキルNR_aSO₂R_a、 - S(O)アリール、 - S(O)

ヘテロアリール、-S(=O)ヘテロ環、-SO₂(C₁~C₆)アルキル、-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ヘテロ環、-SO₂(C₁~C₆)アルキルNR_cR_d、-SO₂(C₁~C₆)アルキルNR_aC(=O)R_a、-SO₂(C₁~C₆)アルキルNR_aSO₂R_a、-SO₂NR_cR_d、-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)NR_cR_dおよび-OOC(=O)NR_cR_dから選択され、ここで、Z⁷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、(C₃~C₇)炭素環、(C₃~C₇)ハロ炭素環、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、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、ヘテロ環、-Oヘテロアリール、-Oヘテロ環、-NHヘテロアリール、-NHヘテロ環、または-S(=O)₂NR_cR_dで必要に応じて置換されており；

各Z⁸は、独立して、-NO₂および-CNから選択され；

各Z⁹は、独立して、-(C₁~C₆)アルキルおよび-O(C₁~C₆)アルキルから選択され；

各Z¹⁰は、独立して、以下：

(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)；

(ii) -OH、-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(C₁~C₆)アルキル；および

(iii) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、ハロ、(C₁~C₆)アルキルまたはCOOHで必要に応じて置換されている)；

から選択され、

各Z¹¹は、独立して、Z¹⁰、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁~C₄)アルキル、-C(=O)-N((C₁~C₄)アルキル)、-C(=O)-アリール、-C(=O)-ヘテロ環および-C(=O)-ヘテロアリールから選択され；

各Z¹²は、独立して、-NO₂、=NOR_a、チオキソ、アリール、ヘテロ環、ヘテロアリール、(C₃~C₇)ハロ炭素環、(C₃~C₇)炭素環、-O(C₃~C₇)炭素環、-Oハロ(C₃~C₇)炭素環、-Oアリール、-Oヘテロ環、-Oヘテロアリール、-S(C₁~C₆)アルキル、-S(C₃~C₇)炭素環、-Sハロ(C₃~C₇)炭素環、-Sアリール、-Sヘテロ環、-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)ハロ(C₃~C₇)炭素環、-S(O)アリール、-S(O)ヘテロ環、-S(O)ヘテロアリール、-SO₂(C₁~C₆)アルキル、-SO₂(C₃~C₇)炭素環、-SO₂ハロ(C₃~C₇)炭素環、-SO₂アリール、-SO₂ヘテロ環、-SO₂ヘテロアリール、-NR_aR_a、-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アリールから選択され；

各Z¹³は、独立して、-NO₂、-OH、=NOR_a、-SH、-CN、-(C₃~C₇)ハロ炭素環、-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ヘテロ環

、 - 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 ヘテロ環、 - 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、 - S (O) アリール、 - S (O) ヘテロアリール、 - S (O) ヘテロ環、 - SO₂ (C₁ ~ C₆) アルキル、 - SO₂ (C₂ ~ C₆) アルケニル、 - SO₂ (C₂ ~ C₆) アルキニル、 - 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 ヘテロ環、 - SO₂ NR_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 から選択され、 Z^{1~3} 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、 (C₃ ~ C₇) 炭素環、 (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 アリール、 ヘテロアリールおよびヘテロ環は、 単独でもしくはある基の一部として、 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、 - ヘテロ環、 - NH ヘテロアリール、 - NH ヘテロ環、 または - S(O)₂NR_cR_d で必要に応じて置換されており；

各 Z^{1~4} は、 独立して、 - NO₂、 =NOR_a、 - CN、 - (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - O(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - S(O)(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - SO₂(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - NR_aSO₂NR_cR_d、 - NR_aSO₂O(C₃ ~ C₇) ハロ炭素環、 - NR_aSO₂O アリール および - OS(O)₂R_a から選択され、 Z^{1~4} の任意の - (C₃ ~ C₇) ハロ炭素環は、 単独でもしくはある基の一部として、 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、 - ヘテロ環、 - O ヘテロアリール、 - O ヘテロ環、 - NH ヘテロアリール、 - NH ヘテロ環 または - S(O)₂NR_cR_d で必要に応じて置換されており；

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、 ヘテロ環、 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、 ヘテロ環、 アリール または ヘテロアリール は、 単独でもしくはある基の一部として、 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ており；

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、 ヘテロ環、 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、 ヘテロ環、 アリール または ヘテロアリール は、 単独でもしくはある基の一部として、 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ており；

R_c および R_d は それぞれ 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、 アリール、 アリール (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 ヘテロ環、 ヘテロアリール および ヘテロアリール (C₁ ~ C₆) アルキル - から選択され、 ここで、 R_c または R_d 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、 ヘテロ環、 アリール または ヘテロアリール は、 単独でもしくはある基の一部として、 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ているか； または R_c および R_d は、

これらが結合している窒素と共にヘテロ環を形成し、R_c および R_d とこれらが結合している窒素とを合わせた任意のヘテロ環は、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ており；

各 R_e は、独立して、-OR_a、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₃ ~ C₇) 炭素環（ここで、(C₁ ~ C₆) アルキルおよび(C₃ ~ C₇) 炭素環は、1個以上のZ⁶ で置換されており、1個以上のZ¹ で必要に応じて置換されている）、(C₂ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニルおよび(C₂ ~ C₆) アルキニル（任意の(C₂ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニルおよび(C₂ ~ C₆) アルキニルは、1個以上のZ¹ で必要に応じて置換されている）；およびアリール、ヘテロ環およびヘテロアリール（アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、1個以上のZ⁵ で置換されている）から選択され；

各 R_f は、独立して、-R_g、-OR_a、-(C₁ ~ C₆) アルキル-Z⁶、-SO₂R_g、-C(O)R_g、C(O)OR_g および-C(O)NR_eR_g から選択され；および

各 R_g は、独立して、H、-OR_a、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、ここで、R_g の任意の(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₃ ~ C₇) 炭素環、(C₁ ~ C₆) ハロアルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル、(C₂ ~ C₆) アルキニル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールは、1個以上のZ¹ 基で必要に応じて置換されている】

またはその塩。

(項目2)

R³ が、(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 の任意の(C₁ ~ C₆) アルキルまたは(C₂ ~ C₆) アルケニルが、-O(C₁ ~ C₆) アルキル、ハロ、オキソおよび-CN から選択される1つ以上の基で必要に応じて置換されており、R³ がHである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R³ が-O(C₁ ~ C₆) アルキルであり、R³ がHである、項目1に記載の化合物。

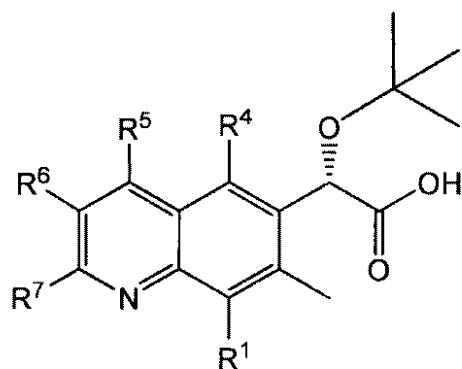
(項目4)

R² が、ハロ、Hまたは-CH₃ である、項目1 ~ 3 のいずれか1項に記載の化合物。

(項目5)

式Ihの化合物

【化197】



Ih

ある項目1に記載の化合物、またはその塩。

(項目6)

R¹ が H である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

R⁶ が H である、項目 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

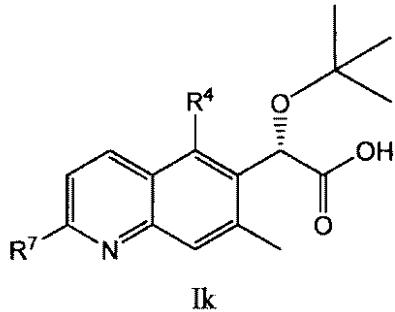
(項目 8)

R⁵ が H または (C₁ ~ C₆) アルキルである、項目 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

式 I k の化合物

【化 198】



ある項目 1 に記載の化合物、またはその塩。

(項目 10)

R⁴ が、以下：

(a) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、ヘテロ環およびヘテロアリールが、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、-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 つ以上の基で必要に応じて置換されており、(C₁ ~ C₆) アルキルが、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ている)；

(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ており、2 個のZ¹ 基は、これらが結合している 1 個または複数個の原子と共に、必要に応じて(C₃ ~ C₇) 炭素環またはヘテロ環を形成する)；および

(c) アリール、ヘテロアリール、スピロヘテロ環、縮合ヘテロ環および架橋ヘテロ環(ここで、アリール、ヘテロアリール、スピロヘテロ環、縮合ヘテロ環および架橋ヘテロ環はそれぞれ独立して、1 個以上のZ⁷ 基で置換されており、1 個以上のZ¹ 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 11)

R⁴ が、以下：

(a) アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、ヘテロ環およびヘテロアリールが、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、-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 つ以上の基で必要に応じて置換されており、(C₁ ~ C₆) アルキルが、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ている)；および

(b) アリール、ヘテロアリールおよび縮合ヘテロ環(ここで、アリール、ヘテロアリールおよび縮合ヘテロ環はそれぞれ独立して、1 個以上のZ⁷ 基で置換されており、1 個以上のZ¹ 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～9のいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

R⁴が、以下：

(a) ヘテロ環(ここで、ヘテロ環は、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、-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つ以上の基で必要に応じて置換されており、(C₁～C₆)アルキルが、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ている)；および

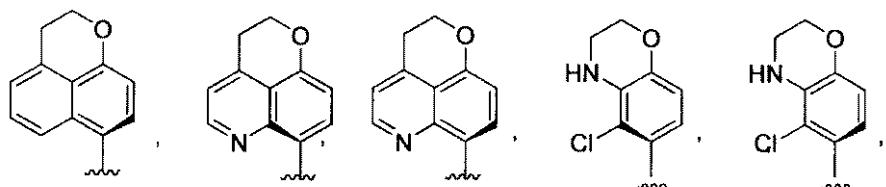
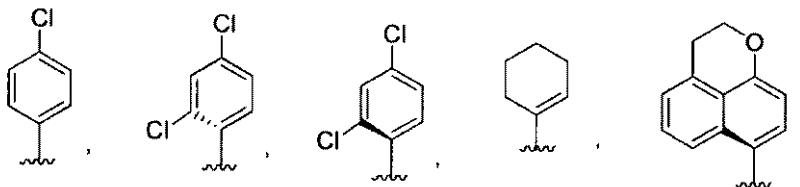
(b) 縮合ヘテロ環(ここで、縮合ヘテロ環は、1個以上のZ⁷基で置換されており、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～9のいずれか1項に記載の化合物。

(項目13)

R⁴が

【化199】

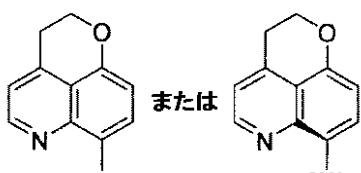


である、項目1～9のいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

R⁴が

【化200】



である、項目1～9のいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

R⁷が、以下：

(a) H、ハロ、(C₁～C₆)アルキルおよび(C₁～C₆)ハロアルキル；

(b) ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、($C_2 \sim C_6$) アルキニル、($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、ニトロ、シアノ、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(c) -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-SO₂R¹¹(ここで、各R¹¹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、(C₁~C₆) ハロアルキル、(C₃~C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(d) -N(R⁹)R¹⁰、-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-O-C(=O)-N(R⁹)R¹⁰、-S-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、独立して、H、(C₁~C₆) アルキルおよび(C₃~C₇) シクロアルキルから選択され、各R¹⁰は、独立して、R¹¹、-(C₁~C₆) アルキル-R¹¹、-SO₂-R¹¹、-C(=O)-R¹¹、-C(=O)OR¹¹ および -C(=O)N(R⁹)R¹¹ から選択され、各R¹¹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、(C₁~C₆) ハロアルキル、(C₃~C₇) シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(e) -(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-C(O)-(C₁~C₆) アルキル-Z¹³、-(C₁~C₆) アルキル-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-(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、-NR_aS O₂NR_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-ヘテロ環、-(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-ヘテロ環、-(C₃~C₇) 炭素環-Z¹ または -ハロ(C₁~C₆) アルキル-Z³(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、ヘテロ環およびヘテロアリールは、単独でもしくはある基の一部として、1個以上のZ¹基で必要に応じて置換されている)；

(f) -X(C₁~C₆) アルキル、X(C₁~C₆) ハロアルキル、X(C₂~C₆)

) アルケニル、 $-X(C_2 \sim C_6)$ アルキニルおよび $-X(C_3 \sim C_7)$ 炭素環(ここで、任意の $X(C_1 \sim C_6)$ 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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されており、任意の $X(C_2 \sim C_6)$ 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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

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

(h) アリール、ヘテロアリール、ヘテロ環、 $-X$ アリール、 $-X$ ヘテロアリールおよび $-X$ ヘテロ環(ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、単独でもしくはある基の一部として、1個以上の Z^5 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(i) $(C_1 \sim C_6)$ 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 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルはそれぞれ、1個以上の Z^6 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(j) $-NR_eR_f$ 、 $-C(O)NR_eR_f$ 、 $-OC(O)NR_eR_f$ 、 $-SO_2NR_eR_f$ 、 $-NR_eR_f$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ 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^1 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目16)

R^7 が、以下：

(a) H 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル；

(b) $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、ヘテロ環およびヘテロアリール(ここで、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(c) $-C(=O)-O-R^{11}$ 、 $-O-R^{11}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-R^{11}$ および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-O-R^{11}$ (ここで、各 R^{11} は、独立して、 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、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(d) $-N(R^9)R^{10}$ 、 $-C(=O)-N(R^9)R^{10}$ 、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキル $-N(R^9)R^{10}$ (ここで、各 R^9 は、独立して、 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選択され、各 R^{10} は、独立して、 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 $-C(=O)N(R^9)R^{11}$ から選択され、各 R^{11} は、独立して、 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、ヘテロ環およびヘテロアリールから選択され、任意のアリール、ヘテロ環またはヘテロアリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(e) $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-(C_3 \sim C_7)$ 炭素環および $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-$ アリール(ここで、任意の $-(C_2 \sim C_6)$ アルキニル $-$ アリールは、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(f) $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキル(ここで、 $-X(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、1個以上の Z^3 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されており、 X は O である)；

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

(h) アリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環(ここで、任意のアリール、ヘテロアリールおよびヘテロ環は、1個以上の Z^5 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(i) ($C_1 \sim C_6$) 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、任意の($C_1 \sim C_6$) 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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；および

(j) -NR_eR_f、-C(O)NR_eR_fおよび-($C_1 \sim C_6$) アルキル-NR_eR_f(ここで、-($C_1 \sim C_6$) アルキル-NR_eR_fは、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目17)

R⁷が、以下：

(a) H、($C_1 \sim C_6$) アルキルおよび($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル；

(b) ($C_2 \sim C_6$) アルキニルおよびアリール(ここで、アリールは、1個以上の Z^{10} 基で必要に応じて置換されている)；

(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 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(d) アリール(ここで、アリールは、1個以上の Z^5 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)；

(e) ($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル(ここで、($C_1 \sim C_6$) ハロアルキルは、1個以上の Z^6 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

R⁷が、以下：

(a) ($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル；および

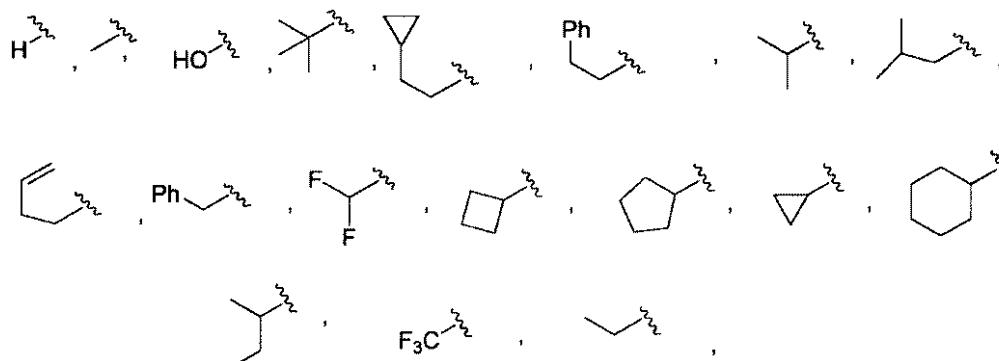
(b) ($C_1 \sim C_6$) ハロアルキル(ここで、($C_1 \sim C_6$) ハロアルキルは、1個以上の Z^6 基で置換されており、1個以上の Z^1 基で必要に応じて置換されている)

から選択される、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

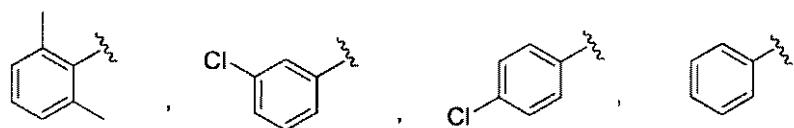
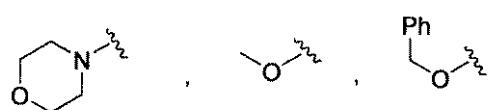
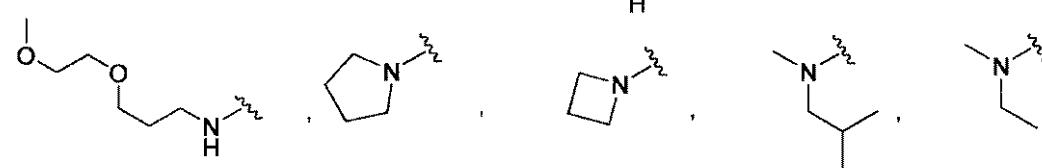
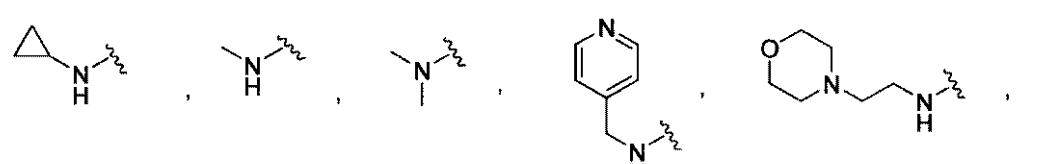
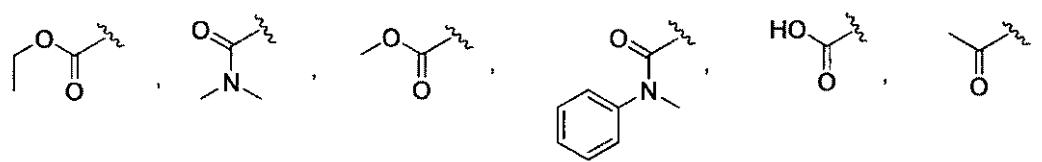
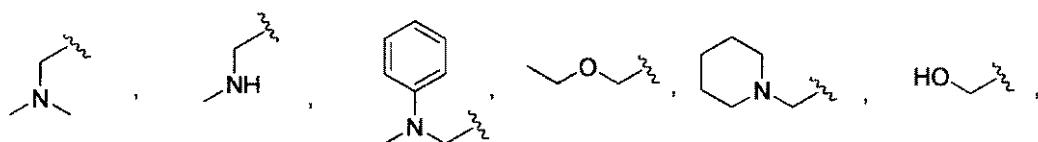
(項目19)

R⁷が、

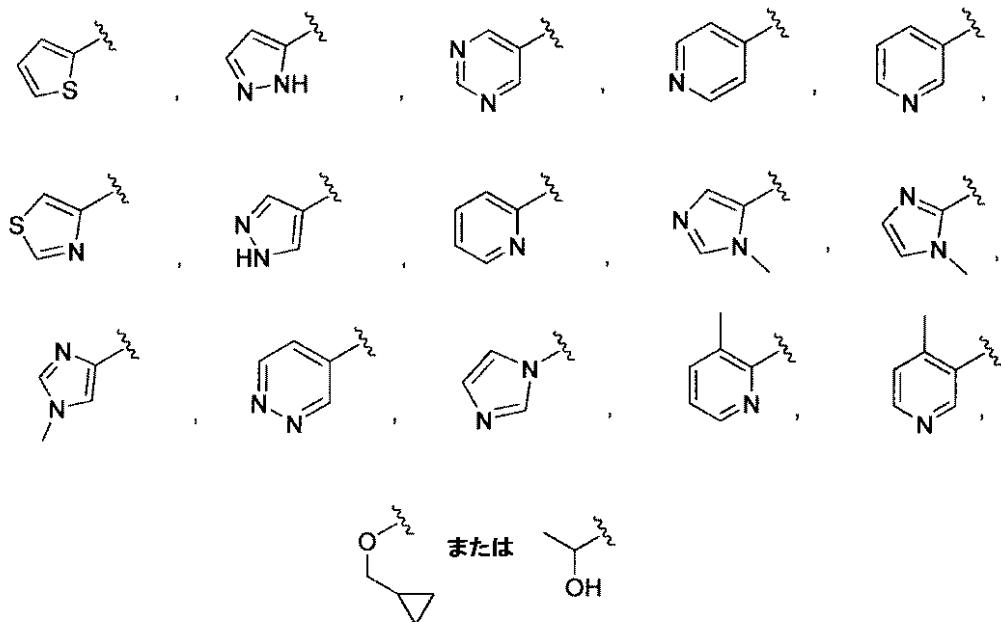
【化201】



【化 2 0 2】



【化203】

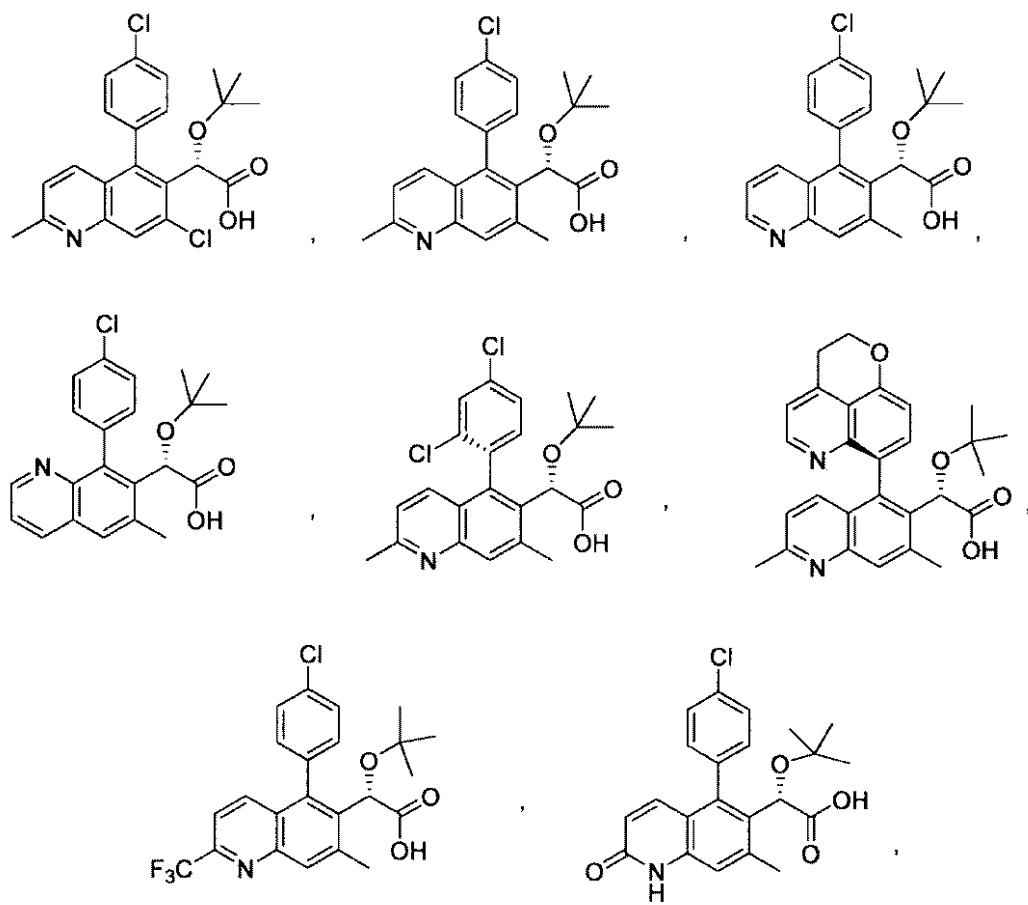


である、項目1～14のいずれか1項に記載の化合物。

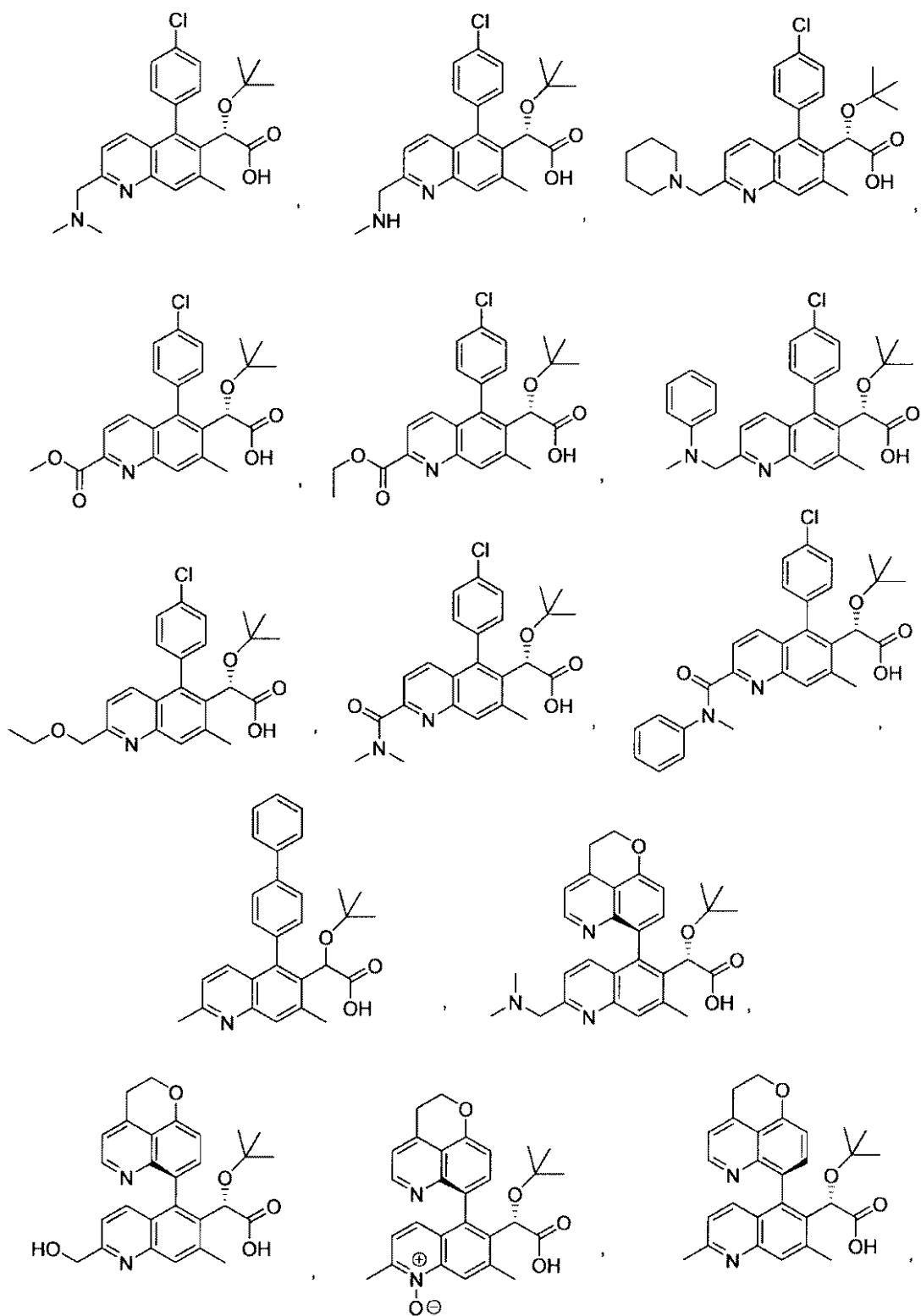
(項目20)

以下：

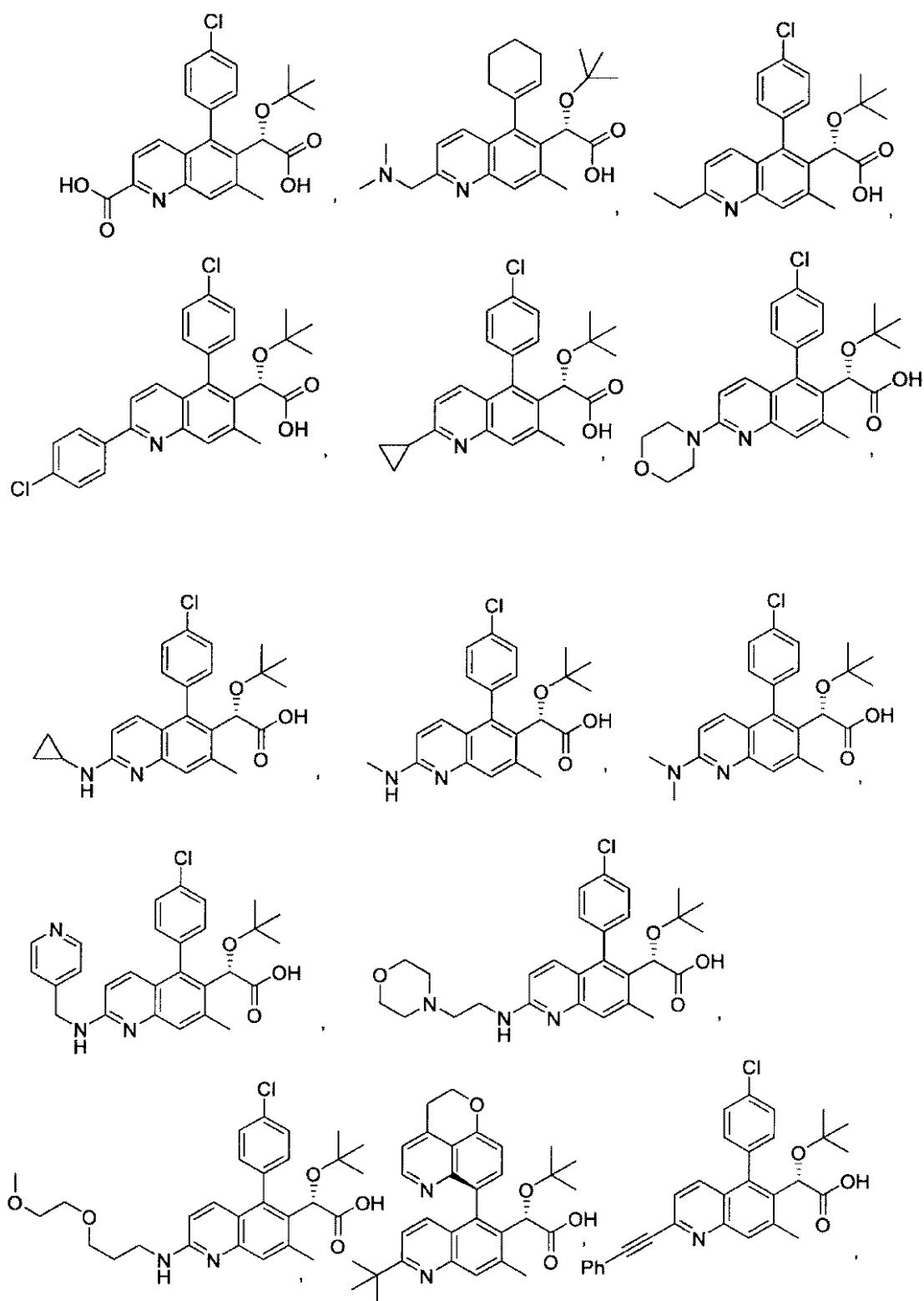
【化204】



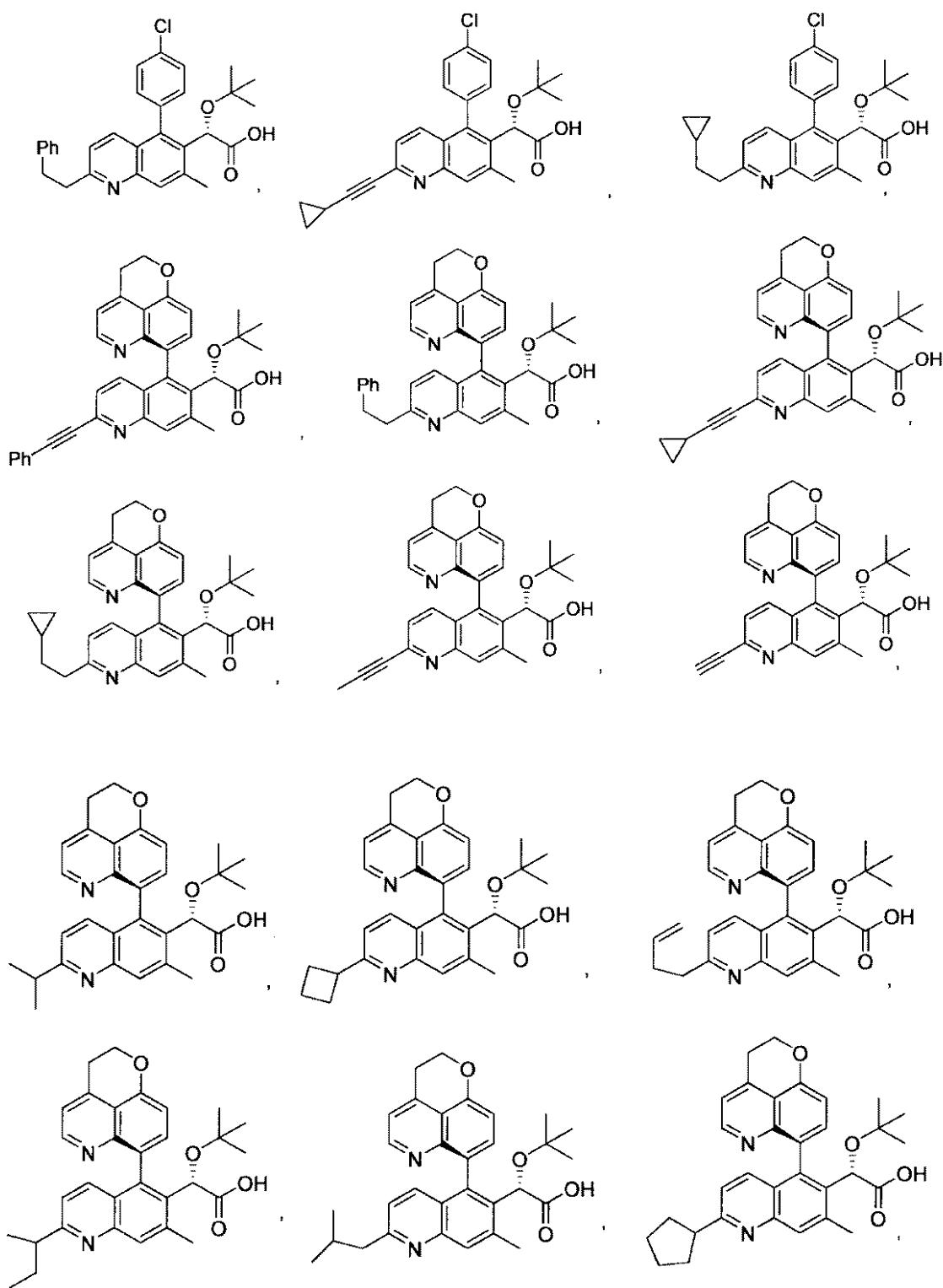
【化 2 0 5】



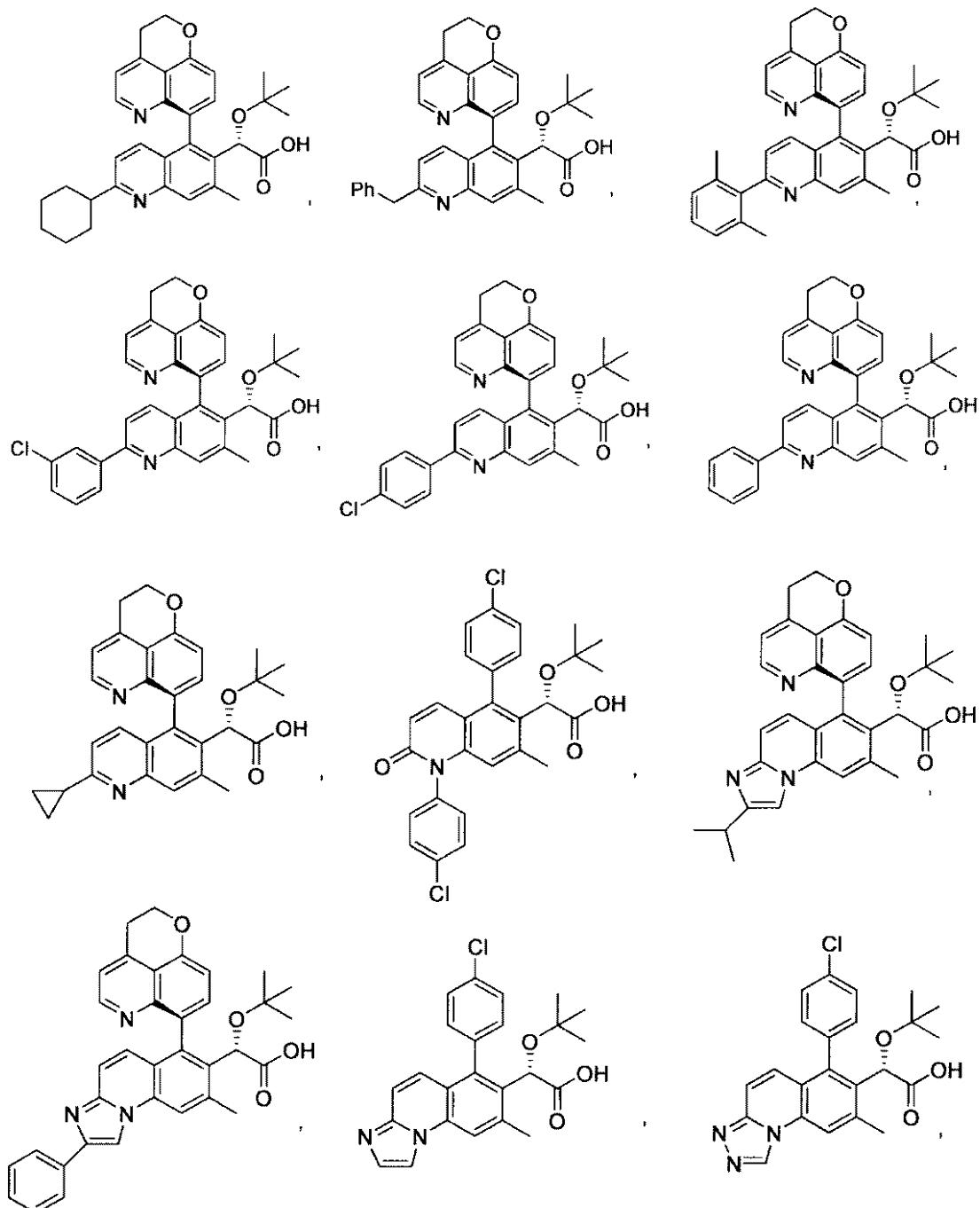
【化 2 0 6】



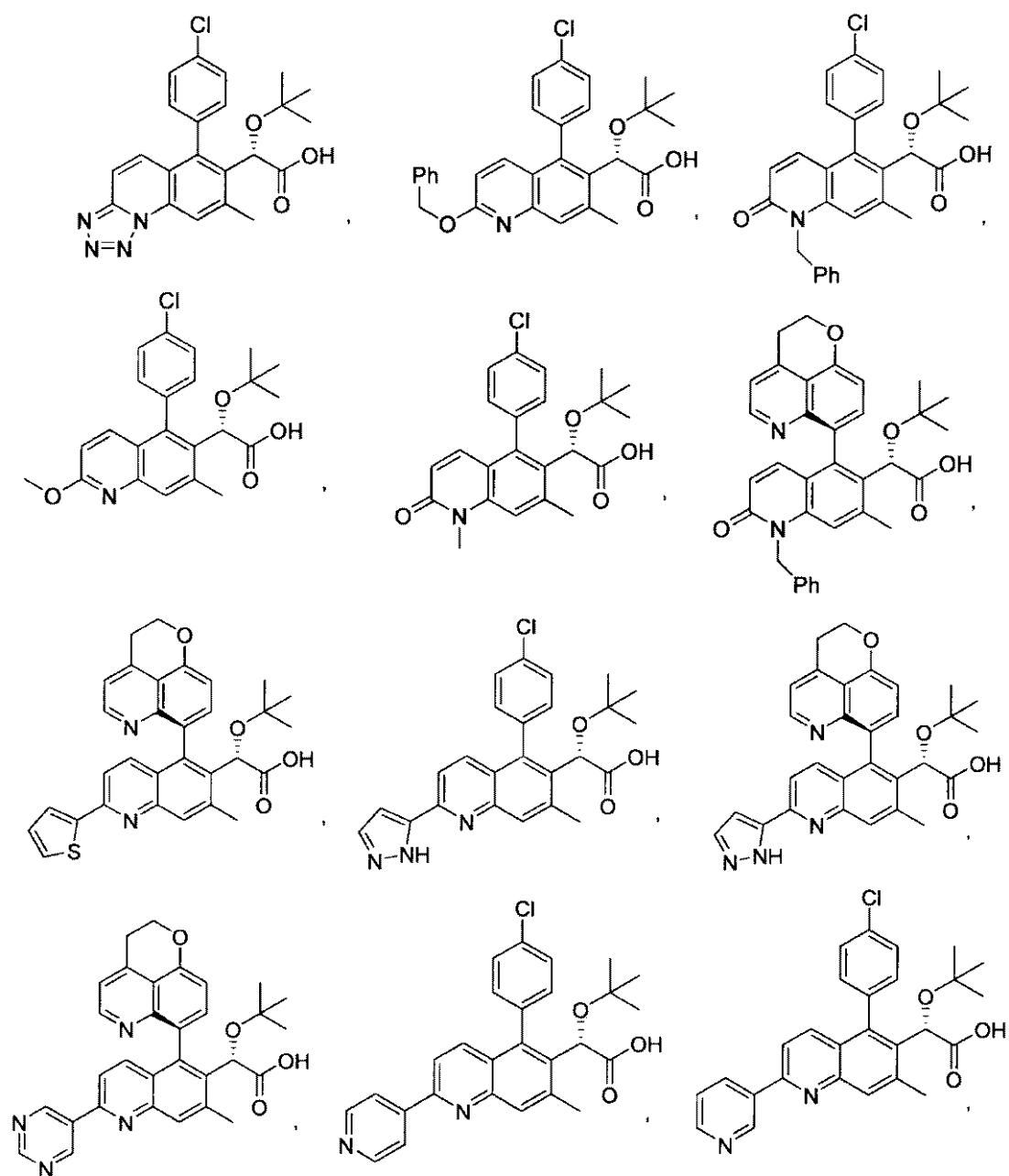
【化 2 0 7】



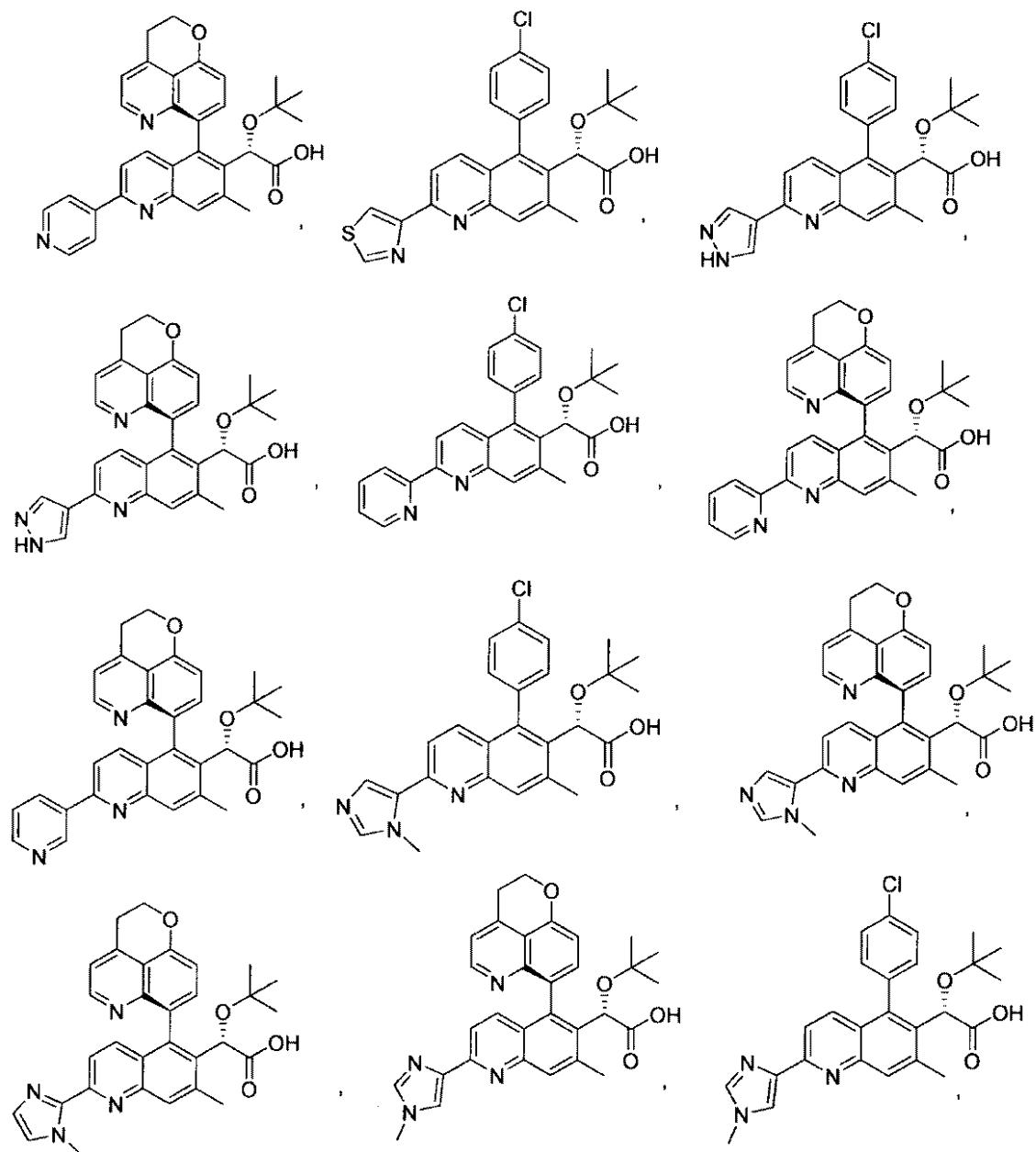
【化 2 0 8】



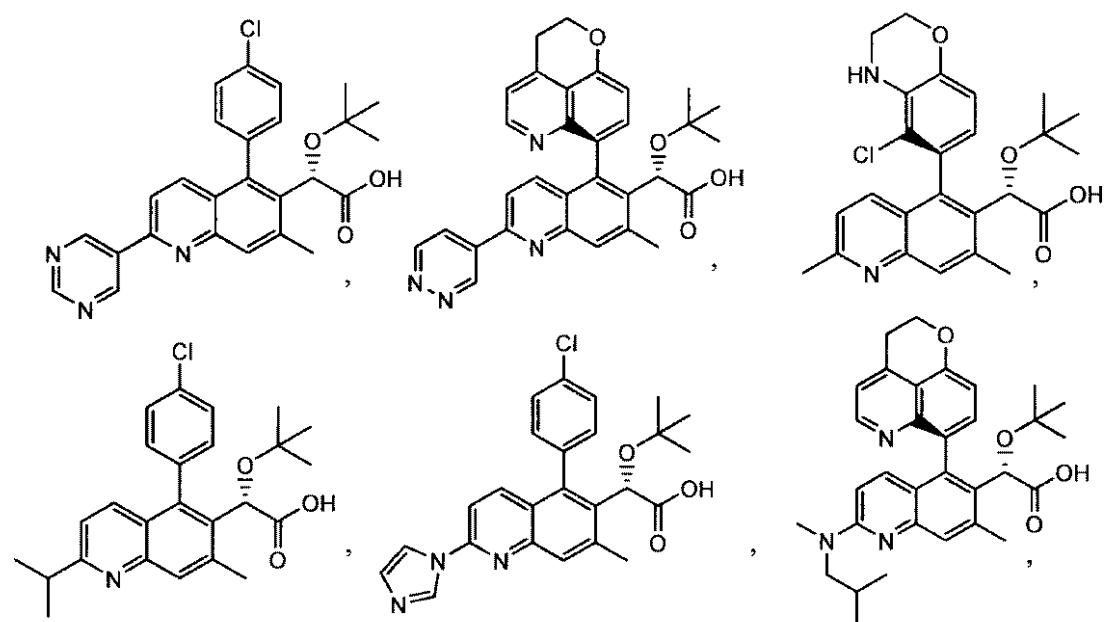
【化 2 0 9】



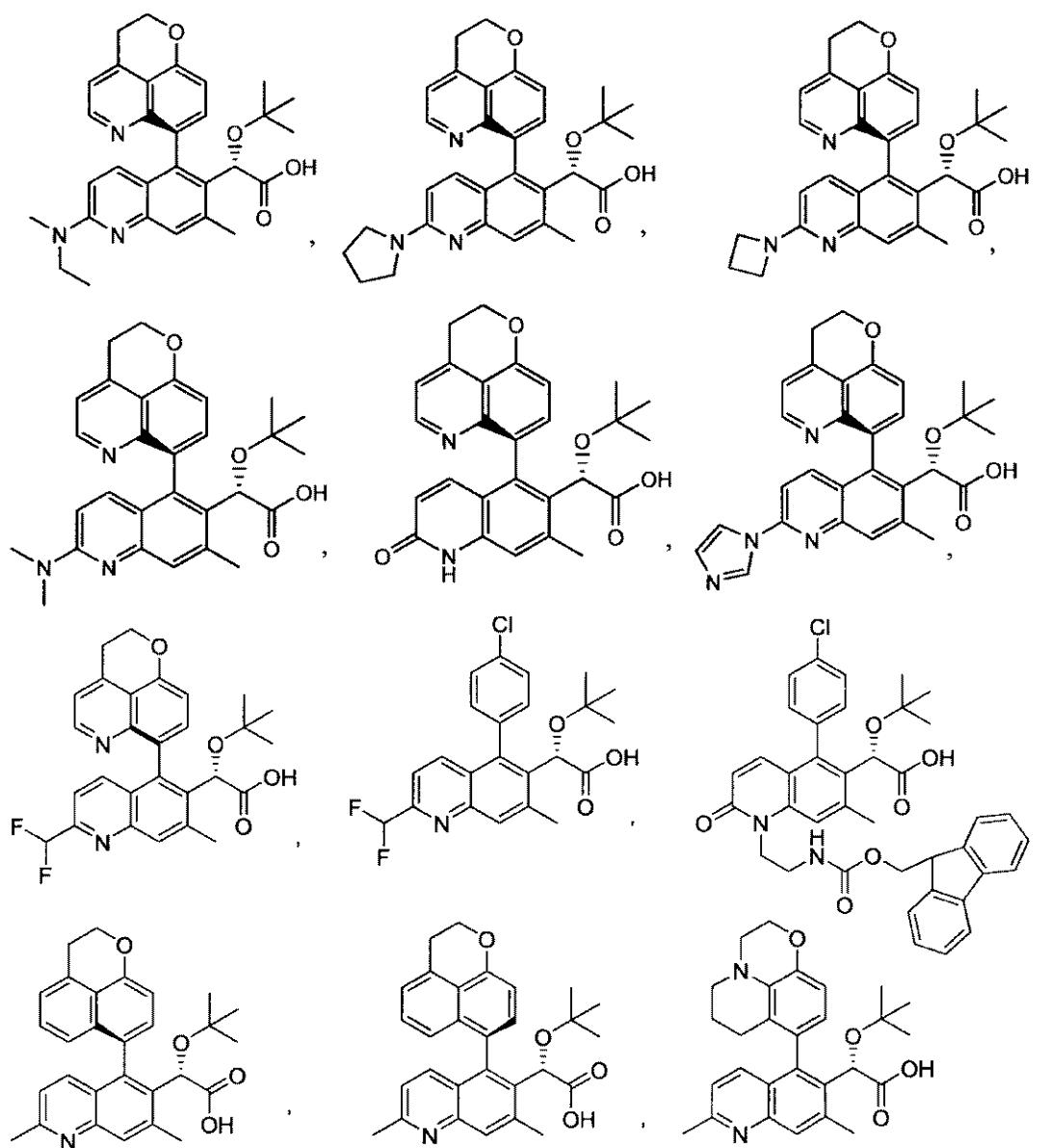
【化 2 1 0】



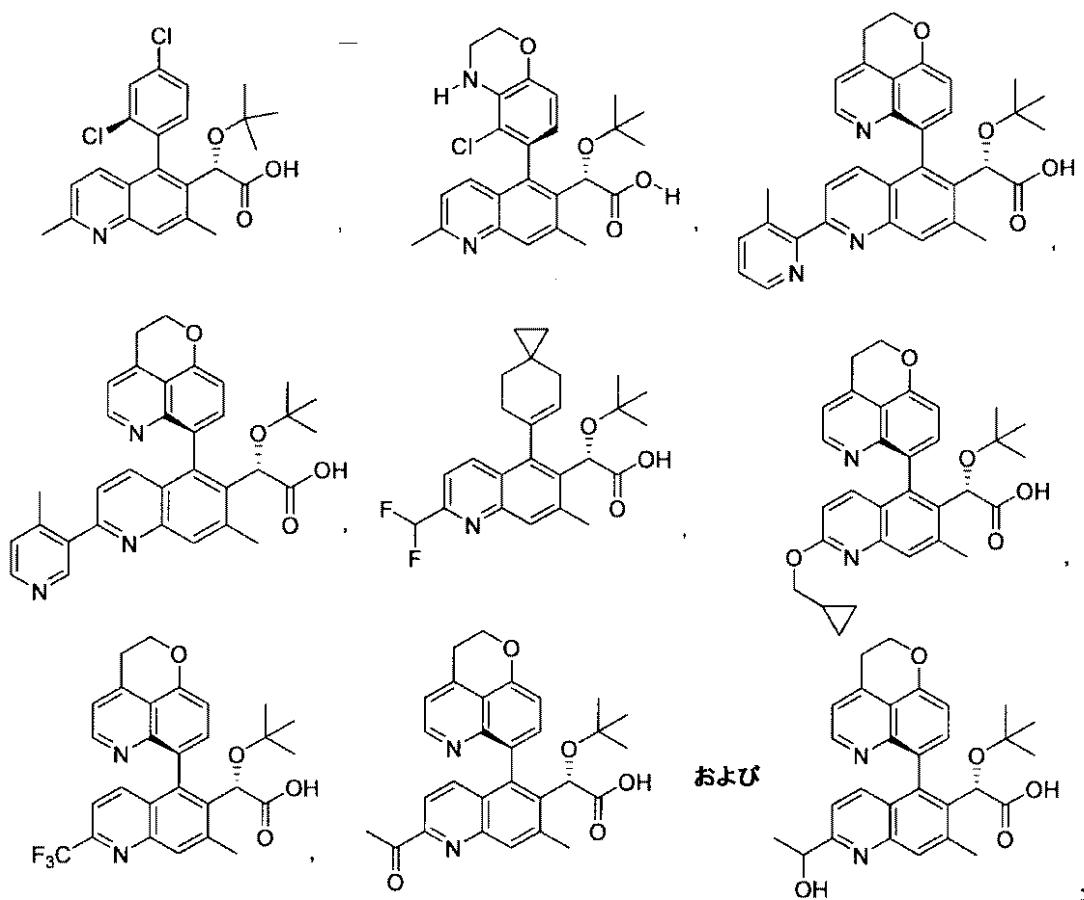
【化 2 1 1】



【化 2 1 2】



【化 2 1 3】

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 1)

項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物またはその医薬的に許容され得る塩を、医薬的に許容され得る担体と組み合わせて含む、医薬組成物。

(項目 2 2)

項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物もしくはその医薬的に許容され得る塩、または項目 2 1 に記載の組成物を哺乳動物に投与することを含む、前記哺乳動物において H I V ウィルスの増殖を処置するか、A I D S を処置するか、または、A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせる方法。

(項目 2 3)

医学的治療において使用するための項目 1 ~ 2 0 のいずれかに記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩。

(項目 2 4)

H I V ウィルスの増殖もしくは A I D S の予防的もしくは治療的処置において使用するため、または、A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせる治療的処置において使用するための項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩。

(項目 2 5)

哺乳動物において、H I V ウィルスの増殖を処置するため、A I D S を処置するため、または A I D S もしくは A R C の症状の発生を遅らせるための医薬を製造するため、項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩の使用。