

【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20年11月6日(2008.11.6)

【公表番号】特表2008-513413(P2008-513413A)

【公表日】平成20年5月1日(2008.5.1)

【年通号数】公開・登録公報2008-017

【出願番号】特願2007-531758(P2007-531758)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/04	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/32	(2006.01)
A 6 1 P 25/36	(2006.01)
A 6 1 P 25/34	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 K 49/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/519	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 495/04	1 0 5 A
C 0 7 D 495/04	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/32	
A 6 1 P 25/36	
A 6 1 P 25/34	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 K 49/00	A
A 6 1 K 31/519	
C 0 7 D 495/04	1 0 5 Z

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月18日(2008.9.18)

【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

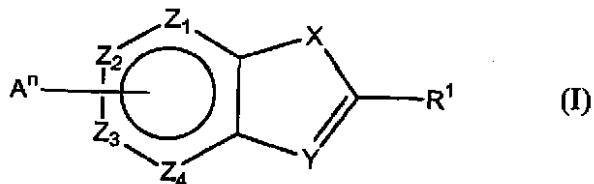
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



[式中：

Yは、-N-および-C(R²)-から選択され；Xは、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-、-O-および-N(R³)-から選択され；

R¹、R²およびR³は、それぞれ独立に、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-NH₂、-SH、-C(=NR⁴)NR⁵R⁶、-C(=O)R⁴、-C(=NR⁴)R⁵、-C(=O)OR⁴、-C(=O)NR⁴R⁵、-SR⁴、-S(O)R⁴、-S(O)₂R⁴、-NR⁴R⁵、-NR⁴C(=O)R⁵、-NR⁴C(=NR⁵)R⁶、-NR⁴R⁷、-NR⁴C(=O)OR⁵、-NR⁴C(=O)NR⁵R⁶、-NR⁴S(O)₂R⁵、-S(O)₂NR⁴R⁵、-C(=S)NR⁴R⁵、-OC(=O)R⁴、-OC(=O)NR⁴R⁵、-OR⁴、置換されてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₃~C₈)シクロアルケニル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-(C₁~C₆)アルキルアリール、-(C₁~C₆)アルキルヘテロアリール、アリールおよびヘテロアリールの群から選択される基、ならびに-V₁-T₁-M₁として記載される基、

よりなる群から選択され；

Z₁、Z₂、Z₃およびZ₄は、1から4個の基Aⁿによって場合により置換されてもよい5員または6員のヘテロアリール環またはアリール環を形成することを条件として、共有結合、C、S、NおよびOからそれぞれ独立に選択され；

Aⁿ基は、それぞれ独立に、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-SH、-NH₂、置換されてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキルハロ、-O-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₃~C₆)アルキニル、-O-(C₃~C₇)シクロアルキル、-O-(C₂~C₆)アルケニル、-O-(C₂~C₆)アルキル-OR⁸、-O-(C₁~C₆)アルキル-ヘテロアリール、-O-(C₀~C₆)アルキルアリール、-(C₀~C₆)アルキル-OR⁸、-(C₃~C₇)シクロアルキル-(C₁~C₆)アルキル、-O-ヘテロアリール、ヘテロアリール、-(C₁~C₆)アルキル-ヘテロアリール、アリール、-O-アリール、-(C₁~C₆)アルキルアリール、-(C₁~C₆)アルキルハロ-OR⁸、-(C₃~C₆)アルキニル-OR⁸、-(C₃~C₆)アルケニル-OR⁸、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)-R⁸、-O-(C₂~C₆)アルキル-SR⁸、-(C₁~C₆)アルキル-S(=O)-R⁸、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂-R⁸、-O-(C₁~C₆)アルキル-S(=O)₂-R⁸、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸R⁹、-O-(C₂~C₆)アルキル-NR⁸R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂NR⁸R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸-S(=O)₂R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-NR⁸R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸C(=O)-R⁹、-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-NR⁸R⁹、-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-NR⁸C(=O)-R⁹、-O-(C₀~C₆)アルキル-O-C(=O)-R⁸、-(C₀~C₆)アルキル-O-C(=O)-R⁸、-(C₀~C₆)

) アルキル - C (= O) - O R ⁸ 、 - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - O C (= O) - R ⁸ 、 - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - O R ⁸ 、 - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - R ⁸ 、 - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - R ⁹ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - C (= O) - N R ⁸ R ⁹ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= O) - O R ⁹ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - C (= O) - N R ⁹ R ¹⁰ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= O) - N R ⁹ R ¹⁰ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= S) - N R ⁹ R ¹⁰ の群から選択される基、ならびに - V ₂ - T ₂ - M ₂ 基、

よりなる群から選択され；

n は、1 から 4 までの整数であり；

T ₁ 、 V ₁ 、 T ₂ および V ₂ は、それぞれ独立に、共有結合、 - O - 、 - C (= O) - 、 - C (= O) O - 、 - C (= O) N R ¹ ² - 、 - S - 、 - S (O) - 、 - S (O) ₂ - 、 - S (O) ₂ N R ¹ ² - 、 - N R ¹ ² - 、 - N R ¹ ² C (= O) - 、 - N R ¹ ² C (= O) N R ¹ ³ - 、 - N R ¹ ² S (O) ₂ - 、 - N R ¹ ² C (= S) N R ¹ ³ - 、 - O C (= O) - 、 - O C (= O) N R ¹ ² 、 - N R ¹ ² C (= O) O - 、ならびに置換されてもよい基として - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₃ ~ C ₈) シクロアルケニル - 、 - (C ₁ ~ C ₆) アルキルハロ - 、 - (C ₁ ~ C ₆) アルキルシアノ - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₂ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ N R ¹ ² - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) ₂ N

ルキル - O C (= O) N R ¹ ₂ - (C ₄ ~ C ₁ ₀) アルキルシクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O C (= O) N R ¹ ₂ - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= O) O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= O) O - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= O) O - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= O) O - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= O) O - (C ₄ ~ C ₁ ₀) アルキルシクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) N R ¹ ₄ - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) N R ¹ ₄ - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) N R ¹ ₄ - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) N R ¹ ₄ - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) N R ¹ ₄ - (C ₄ ~ C ₁ ₀) アルキルシクロアルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (= N R ¹ ₃) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ¹ ₂ C (

$= N R^{1-3}$) - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - $N R^{1-2} C$ ($= N R^{1-3}$) - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - $N R^{1-2} C$ ($= N R^{1-3}$) - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - $N R^{1-2}$ C ($= N R^{1-3}$) - ($C_4 \sim C_{10}$) アルキルシクロアルキル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - C ($= N R^{1-2}$) $N R^{1-3}$ - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - C ($= N R^{1-2}$) $N R^{1-3}$ - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル - 、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - C ($= N R^{1-2}$) $N R^{1-3}$ - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル - および - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - C ($= N R^{1-2}$) $N R^{1-3}$ - ($C_4 \sim C_{10}$) アルキルシクロアルキル - の群から選択される基、

よりなる群から選択され、

M_1 および M_2 は、それぞれ独立に、水素、 - CN 、 - OH 、 - NO_2 、 - CF_3 、 - NH_2 、 - SH 、 - $C(=O)R^{1-5}$ 、 - $C(=NR^{1-5})R^{1-6}$ 、 - $C(=O)OR^{1-5}$ 、 - $C(=O)NR^{1-5}R^{1-6}$ 、 - SR^{1-5} 、 - $S(O)R^{1-5}$ 、 - $S(O)_2R^{1-5}$ 、 - $NR^{1-5}R^{1-6}$ 、 - $NR^{1-5}C(=O)R^{1-6}$ 、 - $NR^{1-5}C(=NR^{1-6})R^{1-7}$ 、 - $NR^{1-5}R^{1-8}$ 、 - $NR^{1-5}C(=O)OR^{1-6}$ 、 - $NR^{1-5}C(=O)NR^{1-6}R^{1-7}$ 、 - $NR^{1-5}S(O)_2R^{1-6}$ 、 - $C(=S)NR^{1-5}R^{1-6}$ 、 - $OC(=O)R^{1-5}$ 、 - $OC(=O)NR^{1-5}R^{1-6}$ 、 - OR^{1-5} 、 - $S(O)_2NR^{1-5}R^{1-6}$ 、 置換されていてもよい基として - ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキルおよび - ($C_3 \sim C_8$) シクロアルケニルの群から選択される基、ならびにアリール、ヘテロアリール、複素環およびシクロアルキル環から選択されていてもよい 3 員から 10 員から 10 員環、

よりなる群から選択され；

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、 R^{1-4} 、 R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} および R^{1-8} は、それぞれ独立に、水素または - ($C_1 \sim C_6$) アルキルハロ、 - ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 - ($C_1 \sim C_6$) アルキルシアノ、 - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、 - ($C_4 \sim C_{10}$) アルキルシクロアルキル、ヘテロアリール、 - ($C_1 \sim C_6$) アルキルヘテロアリール、アリール、 - ($C_1 \sim C_6$) アルキルアリール、 - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、 - ($C_2 \sim C_6$) アルキニル - ヘテロアリール、 - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル - アリール、 - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル - ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、 - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル - ヘテロアリールおよび - ($C_2 \sim C_6$) アルケニル - アリールの群から選択される場合によって置換されている基であり；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、一緒になって、場合によって置換されている 3 員から 10 員の非芳香族複素環あるいは場合によって置換されている 5 員から 10 員の芳香族複素環を形成していてもよく；

R^8 、 R^9 、 R^{10} および R^{1-1} は、一緒になって、場合によって置換されている 3 員から 10 員の非芳香族複素環あるいは場合によって置換されている 5 員から 10 員の芳香族複素環を形成していてもよく；

R^{1-2} 、 R^{1-3} および R^{1-4} は、一緒になって、場合によって置換されている 3 員から 10 員の非芳香族複素環あるいは場合によって置換されている 5 員から 10 員の芳香族複素環を形成していてもよく；

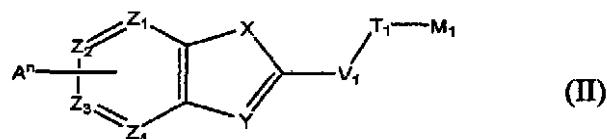
R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} および R^{1-8} は、一緒になって、場合によって置換されている 3 員から 10 員の非芳香族複素環あるいは場合によって置換されている 5 員から 10 員の芳香族複素環を形成していてもよい】

の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびその N - オキシド形態。

【請求項 2】

式 (I I)

【化2】

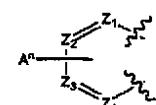


[式中：

Z_1 、 Z_2 、 Z_3 および Z_4 は、1から4個の基 A^n によって場合により置換されてもよい5員または6員のヘテロアリール環またはアリール環を形成することを条件として、CおよびNからそれぞれ独立に選択され；

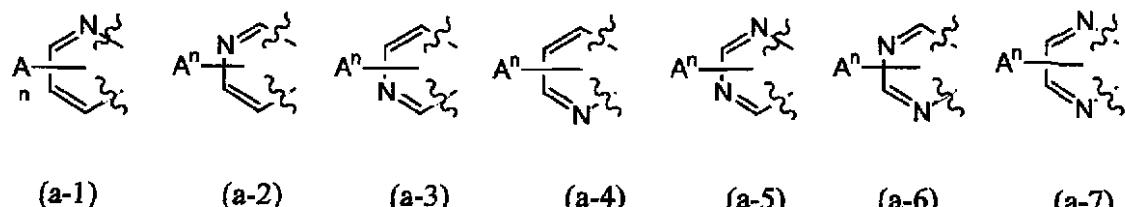
基

【化3】



は、基(a-1)、(a-2)、(a-3)、(a-4)、(a-5)、(a-6)および(a-7)

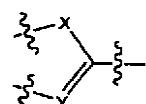
【化4】



の群から選択され；

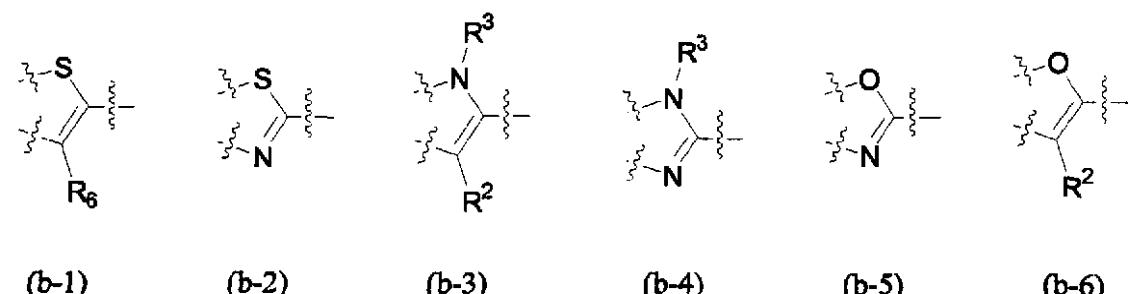
基

【化5】



は、基(b-1)、(b-2)、(b-3)、(b-4)、(b-5)および(b-6)

【化6】



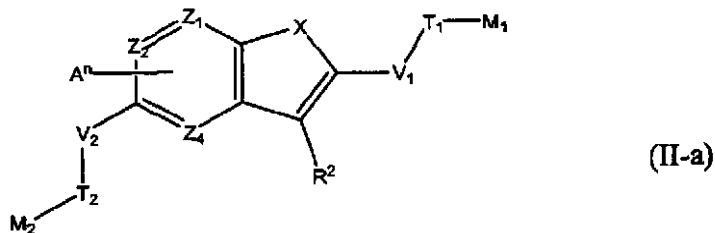
の群から選択される】

を有する請求項1に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびそのN-オキシド形態。

【請求項3】

式(I I a)

【化 7】



[式中：

R^2 は、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-NH₂、-SH、-C(=NR⁴)NR⁵R⁶、-C(=O)R⁴、-C(=NR⁴)R⁵、-C(=O)OR⁴、-C(=O)NR⁴R⁵、-SR⁴、-S(O)R⁴、-S(O)₂R⁴、-NR⁴R⁵、-NR⁴C(=O)R⁵、-NR⁴C(=NR⁵)R⁶、-NR⁴C(=NR⁵)NR⁶R⁷、-NR⁴C(=O)OR⁵、-NR⁴C(=O)NR⁵R⁶、-NR⁴S(O)₂R⁵、-S(O)₂NR⁴R⁵、-C(=S)NR⁴R⁵、-OC(=O)R⁴、-OC(=O)NR⁴R⁵、-OR⁴、ならびに置換されていてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₃~C₈)シクロアルケニル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-(C₁~C₆)アルキルアリール、-(C₁~C₆)アルキルヘテロアリール、アリールおよびヘテロアリールの群から選択される基、

よりなる群から選択され；

= O) - N R ⁸ R ⁹ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= N R ⁹) - N R ¹ R ¹ 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= O) - N R ⁹ R ¹ および - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - N R ⁸ - C (= S) - N R ⁹ R ¹ の群から選択される基、
よりなる群から選択され；

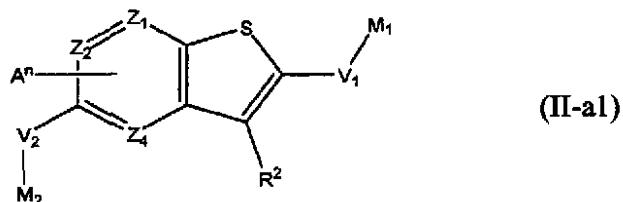
n は、1 から 3 までの整数である】

を有する、請求項 2 に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、
その立体化学的異性体形態およびその N - オキシド形態。

【請求項 4】

式 (II-a1)

【化 8】



【式中：

V ₁ および V ₂ は、それぞれ独立に、共有結合、- O - 、 - C (= O) - 、 - C (= O) O - 、 - C (= O) N R ¹ ² - 、 - S - 、 - S (O) - 、 - S (O) ₂ - 、 - S (O) ₂ N R ¹ ² - 、 - N R ¹ ² - 、 - N R ¹ ² C (= O) - 、 - N R ¹ ² C (= O) N R ¹ ³ - 、 - N R ¹ ² S (O) ₂ - 、 - N R ¹ ² C (= S) N R ¹ ³ - 、 - O C (= O) - 、 - O C (= O) N R ¹ ² 、 - N R ¹ ² C (= O) O - 、 ならびに置換されていてもよい基として - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₃ ~ C ₈) シクロアルケニル - 、 - (C ₁ ~ C ₆) アルキルハロ - 、 - (C ₁ ~ C ₆) アルキルシアノ - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - O - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) O - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - C (= O) N R ¹ ² - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₃ ~ C ₇) シクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S - (C ₄ ~ C ₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₁ ~ C ₆) アルキル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₂ ~ C ₆) アルキニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O) - (C ₂ ~ C ₆) アルケニル - 、 - (C ₀ ~ C ₆) アルキル - S (O)

- (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ NR^{1,2} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ NR^{1,2} - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ NR^{1,2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)₂ NR^{1,2} - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} S (O)₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} S (O)₂ - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} S (O)₂ - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - および - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1,2} S (O)₂ - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - の群から選択される基、

よりなる群から選択される】

を有する、請求項3に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびそのN-オキシド形態。

【請求項5】

V₁ が、 -O- 、 -C (=O) - 、 -C (=O) O- 、 -C (=O) NR^{1,2} - 、 -S - 、 -S (O) - 、 -S (O)₂ - 、 -S (O)₂ NR^{1,2} - 、 -NR^{1,2} - 、 -NR^{1,2} C (=O) - 、 -NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - 、 -NR^{1,2} S (O)₂ - 、 -NR^{1,2} C (=S) NR^{1,3} - 、 -OC (=O) - 、 -OC (=O) NR^{1,2} 、 -NR^{1,2} C (=O) O- 、 ならびに置換されていてもよい基として - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₁ ~ C₆) アルキルハロ - 、 - (C₁ ~ C₆) アルキルシアノ - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (=O) - (C₁ ~ C₁₀) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (=O) O - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (=O) O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (=O) NR^{1,2} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (=O) NR^{1,2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₃ ~ C₇) シ

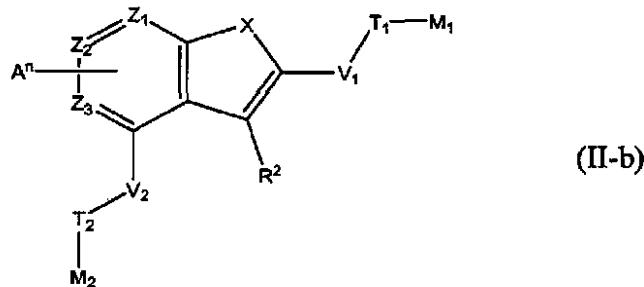
クロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- S (O) - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- S (O) ₂ - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- S (O) ₂ NR^{1,2} - (C₁ ~ C₆) アルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- S (O) ₂ NR^{1,2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} - (C₁ ~ C₆) アルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} C (=O) - (C₁ ~ C₆) アルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} C (=O) - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₁ ~ C₆) アルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} C (=O) NR^{1,3} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル-、- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} S (O) ₂ - (C₁ ~ C₆) アルキル- および- (C₀ ~ C₆) アルキル- NR^{1,2} S (O) ₂ - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル- の群から選択される基、

よりなる群から選択される基である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

式 (II-b)

【化9】



【式中：

R² は、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-NH₂、-SH、-C(=NR⁴)NR⁵R⁶、-C(=O)R⁴、-C(=NR⁴)R⁵、-C(=O)OR⁴、-C(=O)NR⁴R⁵、-SR⁴、-S(O)R⁴、-S(O)₂R⁴、-NR⁴R⁵、-NR⁴C(=O)R⁵、-NR⁴C(=NR⁵)R⁶、-NR⁴C(=NR⁵)NR⁶R⁷、-NR⁴C(=O)OR⁵、-NR⁴C(=O)NR⁵R⁶、-NR⁴S(O)₂R⁵、-S(O)₂NR⁴R⁵、-C(=S)NR⁴R⁵、-OC(=O)R⁴、-OC(=O)NR⁴R⁵、-OR⁴、ならびに置換されていてもよい基として- (C₁ ~ C₆) アルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキルハロ、- (C₂ ~ C₆) アルキニル、- (C₂ ~ C₆) アルケニル、- (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- (C₃ ~ C₈) -シクロアルケニル、- (C₁ ~ C₆) アルキルシアノ、- (C₁ ~ C₆) アルキルアリール、- (C₁ ~ C₆) アルキルヘテロアリール、アリールおよびヘテロアリールの群から選択される基、

よりなる群から選択され；

Aⁿ 基は、それぞれ独立に、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-SH、-NH₂、-NH₂、ならびに置換されていてもよい基として- (C₁ ~ C₆) アルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキルハロ、- (C₂ ~ C₆) アルキニル、- (C₂ ~ C₆) アルケニル、- (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆) アルキルシアノ、-O- (C₁ ~ C₆) アルキル、-O- (C₁ ~ C₆) アルキルハロ、-O- (C₁ ~ C₆) アルキルシアノ、-O- (C₃ ~ C₆) アルキニル、-O- (C₃ ~ C₇) シクロアルキル、-O- (C₂ ~ C₆) アルケニル、-O- (C₂ ~ C₆) アルキル-OR⁸、-O- (C₁ ~ C₆) アルキル-ヘテロアリール、-O- (C₀ ~ C₆) アルキルアリール、- (C₀ ~ C₆) アルキル-OR⁸、- (C₃ ~ C₇) シクロアルキル- (C₁ ~ C₆) アルキル、-

O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - (C₁ ~ C₆) アルキル、 - O - ヘテロアリール、ヘテロアリール、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - ヘテロアリール、アリール、 - O - アリール、 - (C₁ ~ C₆) アルキルアリール、 - (C₁ ~ C₆) アルキルハロ - OR⁸、 - (C₃ ~ C₆) アルキニル - OR⁸、 - (C₃ ~ C₆) アルケニル - OR⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - SR⁸、 - O - (C₂ ~ C₆) アルキル - SR⁸、 - (C₁ ~ C₆) アルキル - S(=O) - R⁸、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - S(=O) - R⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S(=O)₂ - R⁸、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - S(=O)₂ - R⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸R⁹、 - O - (C₂ ~ C₆) アルキル - NR⁸R⁹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - S(=O)₂R⁹、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - NR⁸R⁹、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - S(=O)₂R⁹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - NR⁸R⁹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸C(=O) - R⁹、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - C(=O) - NR⁸R⁹、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - NR⁸C(=O) - R⁹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - OR⁸、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - OC(=O) - R⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - OR⁸、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - C(=O) - OR⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - R⁸、 - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - C(=O) - R⁸、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - C(=O) - OR⁹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - C(=NR⁹) - NR¹⁰R¹¹、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - C(=O) - NR⁹R¹⁰ および - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR⁸ - C(=S) - NR⁹R¹⁰ の群から選択される基、

よりなる群から選択され；

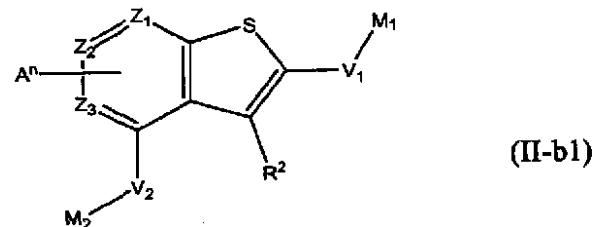
n は、1 から 3 までの整数である]

を有する、請求項 2 に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびその N - オキシド形態。

【請求項 7】

式 (II-1)

【化 10】



[式中：

V₁ および V₂ は、それぞれ独立に、共有結合、 - O - 、 - C(=O) - 、 - C(=O)O - 、 - C(=O)NR¹² - 、 - S - 、 - S(O) - 、 - S(O)₂ - 、 - S(O)₂NR¹² - 、 - NR¹² - 、 - NR¹²C(=O) - 、 - NR¹²C(=O)NR¹³ - 、 - NR¹²S(O)₂ - 、 - NR¹²C(=S)NR¹³ - 、 - OOC(=O) - 、 - OOC(=O)NR¹² - 、 - NR¹²C(=O)O - 、 ならびに置換されていてよい基として - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₃ ~ C₈) シクロアルケニル - 、 - (C₁ ~ C₆) アルキルハロ - 、 - (C₁ ~ C₆) アルキルシアノ - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - O - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - O - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C(=O) - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、

₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) - (C₄ ~ C₁₀) アルキル
 シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) - (C₃ ~ C₇) シクロアル
 キル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) O - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C
 0 ~ C₆) アルキル - C (= O) O - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) ア
 ルキル - C (= O) O - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O)
 O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) O - (C₄ ~ C₁₀)
 NR^{1 2} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) NR^{1 2} - (C
 2 ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) NR^{1 2} - (C₃ ~ C
 7) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - C (= O) NR^{1 2} - (C₄ ~ C₁
 0) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₁ ~ C₆) アルキ
 ル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆)
 アルキル - S - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₃ ~ C
 7) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシ
 クロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 -
 (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) ア
 ルキル - S (O) - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C
 3 ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₄ ~ C
 10) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₂ ~ C₆)
 アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C
 6) アルキル - S (O) - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキ
 ル - S (O) - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキ
 ル - S (O) - NR^{1 2} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O)
 O - NR^{1 2} - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - NR<sup>1
 2</sup> - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - NR^{1 2} - (C
 3 ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - S (O) - NR^{1 2} - (C₄ ~ C
 10) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₂ ~ C₆)
 アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C
 0 ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキ
 ル - NR^{1 2} - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキ
 ル - NR^{1 2} C (= O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR<sup>1
 2</sup> C (= O) - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} C (= O)
 O - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} C (= O) - (C
 4 ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} C (= O) - (C₁
 3 ~ C₆) NR^{1 3} - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} C (= O)
 C (= O) NR^{1 3} - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} C (= O)
 C (= O) NR^{1 3} - (C₂ ~ C₆) アルケニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR<sup>1
 2</sup> C (= O) NR^{1 3} - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキ
 ル - NR^{1 2} C (= O) NR^{1 3} - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀
 ~ C₆) アルキル - NR^{1 2} S (O) - (C₁ ~ C₆) アルキル - 、 - (C₀ ~ C₆)
 アルキル - NR^{1 2} S (O) - (C₂ ~ C₆) アルキニル - 、 - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR
 1 2 S (O) - (C₃ ~ C₇) シクロアルキル - および - (C₀ ~ C₆) アルキル - NR
 1 2 S (O) - (C₄ ~ C₁₀) アルキルシクロアルキル - の群から選択される基
 、
 よりなる群から選択される]

を有する、請求項 6 に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびその N - オキシド形態。

【請求項 8】

V_1 が、共有結合、-O-、-C(=O)-、-C(=O)O-、-C(=O)NR¹₂-、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-、-S(O)₂NR¹₂-、-NR¹₂-、-NR¹₂C(=O)-、-NR¹₂C(=O)NR¹₃-、-NR¹₂S(O)₂-、-NR¹₂C(=S)NR¹₃-、-OC(=O)-、-OC(=O)NR¹₂、-NR¹₂C(=O)O-、ならびに置換されていてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₂~C₆)アルキニル-、-(C₂~C₆)アルケニル-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₁~C₆)アルキルハロ-、-(C₁~C₆)アルキルシアノ-、-(C₀~C₆)アルキル-O-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-O-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-、-(C₄~C₁₀)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)O-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)O-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)NR¹₂-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)NR¹₂-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S(O)-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S(O)-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S(O)₂-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S(O)₂NR¹₂-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂C(=O)-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂C(=O)-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂C(=O)NR¹₃-、-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂C(=O)NR¹₃-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂S(O)₂-、-(C₁~C₆)アルキル-および-(C₀~C₆)アルキル-NR¹₂S(O)₂-、-(C₃~C₇)シクロアルキル-の群から選択される基、

よりなる群から選択され；

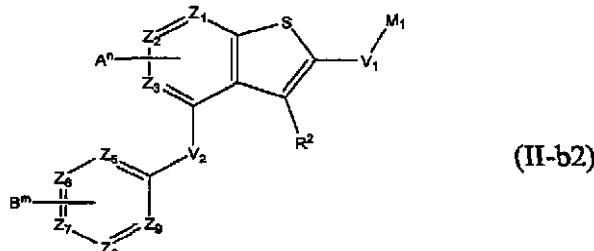
M_2 が、アリール、ヘテロアリール、複素環およびシクロアルキル環の群から選択される場合によって置換されている 3 員から 10 員の環である、

請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式 (II-*b*2)

【化 11】



[式中：

Z_5 、 Z_6 、 Z_7 、 Z_8 および Z_9 は、1 から 5 個の基 B^m によってさらに置換されていてもよい 5 員または 6 員のヘテロアリール環またはアリール環を形成することを条件と

して、共有結合、C、S、NおよびOからそれぞれ独立に選択され；

B^m基は、それぞれ独立に、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-SH、-NH₂、ならびに置換されていてよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキルハロ、-O-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₃~C₆)アルキニル、-O-(C₃~C₇)シクロアルキル、-O-(C₂~C₆)アルケニル、-O-(C₂~C₆)アルキル-OR^{2,2}、-(C₀~C₆)アルキル-OR^{2,2}、-O-ヘテロアリール、ヘテロアリール、-(C₃~C₆)アルキニル-OR^{2,2}、-(C₃~C₆)アルケニル-OR^{2,2}、-(C₀~C₆)アルキル-S-R^{2,2}、-(C₀~C₆)アルキル-NR^{2,2}R^{2,3}、-O-(C₂~C₆)アルキル-NR^{2,2}R^{2,3}、-(C₀~C₆)アルキル-NR^{2,2}-S(=O)₂NR^{2,2}R^{2,3}、-(C₀~C₆)アルキル-NR^{2,2}-S(=O)₂R^{2,3}、-O-(C₁~C₆)アルキル-S(=O)₂R^{2,3}、-O-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-NR^{2,2}R^{2,3}、-(C₀~C₆)アルキル-NR^{2,2}C(=O)-R^{2,3}、-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-R^{2,3}、-(C₀~C₆)アルキル-OC(=O)-R^{2,2}、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-OR^{2,2}、-O-(C₁~C₆)アルキル-OC(=O)-R^{2,2}、-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-OR^{2,2}、-O-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-R^{2,2}および-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-R^{2,2}の群から選択される基、

よりなる群から選択され；

mは、1から5までの範囲の整数であり；

R^{2,2}およびR^{2,3}は、それぞれ独立に、水素または-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₄~C₁₀)アルキルシクロアルキル、ヘテロアリール、-(C₁~C₆)アルキルヘテロアリール、アリール、-(C₁~C₆)アルキルアリール、-(C₂~C₆)アルキニル-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₂~C₆)アルキニル-ヘテロアリール、-(C₂~C₆)アルキニル-アリール、-(C₂~C₆)アルケニル-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₂~C₆)アルケニル-ヘテロアリールおよび-(C₂~C₆)アルケニル-アリールの群から選択される場合により置換されている基であり；

Z₁、Z₂およびZ₃は、少なくとも1個の窒素が存在することを条件として、CおよびNからそれぞれ独立に選択され；

V₁およびV₂は、それぞれ独立に、共有結合、-C(=O)-、ならびに置換されていてよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-O-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁷-(C₀~C₆)アルキルおよび-(C₀~C₆)アルキル-NR⁷S(=O)₂-(C₀~C₆)アルキルの群から選択される基、

よりなる群から選択され；

R⁷は、水素または-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキルおよび-(C₁~C₆)アルキルシアノの群から選択される場合によって置換されている基であり；

Aⁿ は、水素、ハロ、-CN、-OH、-NO₂、-CF₃、-NH₂、ならびに置換されていてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキルハロ、-O-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₃~C₆)アルキニル、-O-(C₃~C₇)シクロアルキル、-O-(C₂~C₆)アルケニル、-O-(C₂~C₆)アルキル-OR⁸、-(C₀~C₆)アルキル-OR⁸、-O-ヘテロアリール、-(C₀~C₆)アルキル-SR⁸、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂R⁸、-O-(C₁~C₆)アルキル-S(=O)₂R⁸、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸R⁹、-(C₀~C₃)アルキル-O-(C₂~C₆)アルキル-NR⁸R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-NR⁸R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸C(=O)-R⁹、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-R⁸および-O-(C₁~C₆)アルキル-C(=O)-R⁸の群から選択される基、

よりなる群から選択される]

を有する、請求項8に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびそのN-オキシド形態。

【請求項10】

Z₁、Z₂およびZ₃が、少なくとも2個の窒素が存在することを条件として、CおよびNからそれぞれ独立に選択され；

V₁が、共有結合、-C(=O)-、ならびに-OCH₃、-OCF₃、-CF₃、-Fおよび-CNの群からの1つまたは複数の基によって置換されていてもよい-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-O-(C₁~C₆)アルキル-、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₁~C₆)アルキル-および-(C₀~C₆)アルキル-NR¹²-(C₁~C₆)アルキル-の群から選択される場合により置換されている基、

よりなる群から選択されてよく；

V₂が、-(C₁~C₆)アルキル、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-C(=O)NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-O-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S(=O)₂-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁷-(C₀~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁷C(=O)-(C₀~C₆)アルキルおよび-(C₀~C₆)アルキル-NR⁷S(=O)₂-(C₀~C₆)アルキルの群から選択される場合により置換されている基であり；

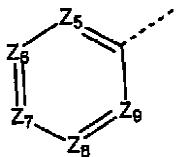
R²が、水素、ハロ、-OCH₃、-OCF₃、-CF₃、ならびに-CN、-OCH₃、-OCF₃、-CF₃またはハロによって場合により置換されている直鎖(C₁~C₆)アルキル基の群から選択され；

Aⁿが、水素、ハロ、-CN、-OH、-CF₃、-NH₂、ならびに置換されていてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキルハロ、-(C₂~C₆)アルキニル、-(C₂~C₆)アルケニル、-(C₃~C₇)シクロアルキル、-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキルハロ、-O-(C₁~C₆)アルキルシアノ、-O-(C₃~C₆)アルキニル、-O-(C₃~C₇)シクロアルキル、-O-(C₂~C₆)アルケニル、-O-(C₂~C₆)アルキル-OR¹⁸、-(C₀~C₆)アルキル-OR¹⁸、-(C₀~C₆)アルキル-NR¹⁸R¹⁹および-(C₀~C₃)アルキル-O-(C₂~C₆)アルキル-NR¹⁸R¹⁹の群から選択される基、

よりなる群から選択され；

基

【化12】



が、アリール、チエニル、ピリジル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリルおよびピリミジニル（各基 m B^m 基により場合によって置換されている）の群から選択される。

請求項9に記載の化合物、製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、その立体化学的異性体形態およびそのN-オキシド形態。

【請求項11】

Xが、-S-であり；

R¹が、-(C₁~C₆)アルキルまたは基V₁-T₁-M₁であり；

Z₁、Z₂、Z₃およびZ₄が、n個の基Aⁿで置換されている6員ヘテロアリール環が形成されることを条件として、CおよびNからそれぞれ独立に選択され；

Aⁿ基が、それぞれ独立に、水素、ハロ、-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸R⁹、および基V₂-T₂-M₂の群から選択され；

nが、1から2までの範囲の整数であり；

T₁およびT₂がそれぞれ共有結合であり；

V₁およびV₂が、それぞれ独立に、共有結合、-C(=O)-、ならびに置換されていてもよい基として-(C₁~C₆)アルキル、-(C₀~C₆)アルキル-S-(C₁~C₆)アルキル-および-(C₀~C₆)アルキル-NR¹R²-(C₁~C₆)アルキル-(ここでR¹R²は、水素またはヒドロキシで置換されていてもよい-(C₁~C₆)アルキルである)の群から選択される基、

よりなる群から選択され；

M₁およびM₂が、それぞれ独立に、水素、-CN、-OH、-NR¹R⁵R¹R⁶、-OR¹R⁵、ならびにアリールおよびヘテロアリールの群から選択される、置換されていてもよい6員環、

よりなる群から選択され；

R⁸、R⁹、R¹R²、R¹R⁵およびR¹R⁶は、それぞれ独立に、水素、または-(C₁~C₆)アルキルおよびアリールの群から選択される場合により置換されている基であり；

アリールは、フェニルであり；

場合による置換が、ヒドロキシ、-(C₁~C₆)アルキルオキシ、アリール、複素環、ハロ、トリフルオロメチル、アミノ、モノ-およびジ-(C₁~C₆)アルキルカルボニル)アミノ、-(C₁~C₆)アルキルスルホニルおよびアミノスルホニルの群から選択される1個または複数の置換基を指す、

請求項1から10のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

N-[2-(4-メトキシフェニル)エチル]チエノ-[2,3-d]ピリミジン-4-アミンおよび5-エチル-6-フェニル-チエノ[2,3-d]ピリミジン-2,4-ジアミンが除外されるという条件で、

Xが、-S-であり；

Z₁がNであり、Z₂がCであり、Z₃がNまたはCであり、Z₄がCであり；

Aが、水素、ハロ、-(C₁~C₆)アルキル、-O-(C₁~C₆)アルキルおよび-(C₀~C₆)アルキル-NR⁸R⁹（ここでR⁸およびR⁹はそれぞれ独立に、水素または-(C₁~C₆)アルキルである）の群から選択され；

nが、1または2に等しい整数であり；

R^1 が、 - ($C_1 \sim C_6$) アルキルまたは基 $V_1 - T_1 - M_1$ であり；

T_1 が、 共有結合であり；

V_2 が、 共有結合、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - $NR^{1,2}$ - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - (ここで $R^{1,2}$ は、 水素またはヒドロキシで置換されていてもよい - ($C_1 \sim C_6$) アルキルである) 、 および - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - S - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - の群から選択され；

M_1 が、 水素、 - OH 、 - $NR^{1,5}R^{1,6}$ (ここで $R^{1,5}$ および $R^{1,6}$ は、 それぞれ独立に、 水素または - ($C_1 \sim C_6$) アルキルである) 、 - $OR^{1,5}$ (ここで $R^{1,5}$ は - ($C_1 \sim C_6$) アルキルである) 、 およびフェニルの群から選択され；

V_2 が、 共有結合、 - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - $NR^{1,2}$ - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - (ここで $R^{1,2}$ は、 ヒドロキシで置換されていてもよい - ($C_1 \sim C_6$) アルキルである) 、 および - ($C_0 \sim C_6$) アルキル - S - ($C_1 \sim C_6$) アルキル - の群から選択され；

M_2 が、 フェニル、 - CN 、ベンゾピペリジニル、ピリジニル、チエニル、ピペリジニル、フリル、 $OR^{1,5}$ (ここで $R^{1,5}$ は、 フェニルまたは - ($C_1 \sim C_6$) アルキルである) 、 - $NR^{1,5}R^{1,6}$ (ここで $R^{1,5}$ および $R^{1,6}$ は、 それぞれ独立に、 水素またはフェニルである) 、 - $C(=O)R^{1,5}$ (ここで $R^{1,5}$ は、 フェニルである) の群から選択され、 各アルキル部分およびフェニル部分が、 メトキシ、 エトキシ、 クロロ、 フルオロ、 フェニル、 メチル、 エチル、 トリフルオロメチル、 ヒドロキシ、 アミノ、 メチルカルボニルアミノ、 メチルスルホニル、 アミノスルホニル、 テトラゾリル、 テトラゾリル ($C_1 \sim C_6$) アルキルおよびテトラゾリル ($C_1 \sim C_6$) アルキルオキソの群から選択される 1 個または 2 個の基で場合によって置換されている

請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$N - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] チエノ - [2,3 - d] ピリミジン - 4 - アミンが除外されるという条件で、$

前記化合物が、 本明細書中に示されている特に好ましい化合物のリストから選択される、 請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の化合物および製薬学的に許容されるその酸または塩基の付加塩、 その立体化学的異性体形態およびその N - オキシド形態。

【請求項 1 4】

前記化合物が光学異性体として存在し、 ラセミ混合物であるか個々の光学異性体である、 請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物の治療有効量と、 製薬学的に許容される担体および / または賦形剤とを含む医薬品組成物。

【請求項 1 6】

薬物として使用する請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

ヒトを含む哺乳動物の状態を治療または予防するための薬物を製造するための、 前記条件のない 請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物または、 前記条件のない 請求項 1 5 に記載の医薬品組成物の使用であって、 その治療および予防が、 $mG1uR2$ ポジティブアロステリックモジュレーターの神経調節効果により影響されるか促進されることを特徴とするその使用。

【請求項 1 8】

ヒトを含む哺乳動物のグルタミン酸機能障害と関係するさまざまな神経障害および精神障害を治療、 予防、 改善、 制御またはそのリスクを減少させる薬物を製造するための、 前記条件のない 請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物または、 前記条件のない 請求項 1 5 に記載の医薬品組成物の使用であって、 その処置および予防が、 $mG1uR2$ ポジティブアロステリックモジュレーターの神経調節効果により影響されるか促進されることを特徴とするその使用。

【請求項 19】

前記の状態または障害が、不安障害、精神障害、人格障害、化学物質関連障害、摂食障害、気分障害、片頭痛、てんかんまたは痙攣性障害、幼児期障害、認知障害、神経変性、神経毒症状および虚血の群から選択される中枢神経系障害である、請求項17および18のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 20】

前記中枢神経系障害が、広場恐怖症、全般性不安障害（GAD）、強迫観念性障害（OCD）、パニック障害、心的外傷後ストレス障害（PTSD）、対人恐怖およびその他の恐怖症の群から選択される不安障害である、請求項19に記載の使用。

【請求項 21】

前記中枢神経系障害が、統合失調症、妄想性障害、統合失調性感情障害、統合失調症様障害および物質誘発性精神障害の群から選択される精神障害である、請求項19に記載の使用。

【請求項 22】

前記中枢神経系障害が、強迫性人格障害および分裂性統合失調型障害の群から選択される人格障害である請求項19に記載の使用。

【請求項 23】

前記中枢神経系障害が、アルコール中毒、アルコール依存症、アルコール禁断症状、アルコール禁断譫妄、アルコール誘発性精神障害、アンフェタミン依存症、アンフェタミン禁断症状、コカイン依存症、コカイン禁断症状、ニコチン依存症、ニコチン禁断症状、オピオイド依存症およびオピオイド禁断症状の群から選択される化学物質関連障害である、請求項19に記載の使用。

【請求項 24】

前記中枢神経系障害が、神経性食欲不振症および神経性過食症の群から選択される摂食障害である請求項19に記載の使用。

【請求項 25】

前記中枢神経系障害が、両相性障害（IおよびII）、気分循環性障害、うつ病、気分変調性障害、大うつ病性障害および物質誘発性気分障害の群から選択される気分障害である請求項19に記載の使用。

【請求項 26】

前記中枢神経系障害が、片頭痛である請求項19に記載の使用。

中枢神経系障害が、非痙攣性全般てんかん、痙攣性全般てんかん、小発作性てんかん重積、大発作性てんかん重積、意識障害を伴うか伴わない部分てんかん、幼児けいれん、部分持続てんかん、およびその他形態のてんかんの群から選択されるてんかんまたは痙攣性の障害である請求項19に記載の使用。

【請求項 27】

前記幼児期障害が、注意欠陥／多動性障害である請求項19に記載の使用。

【請求項 28】

前記中枢神経系障害が、譫妄、物質誘発持続性譫妄、認知症、HIV疾患による認知症、ハンチントン病による認知症、パーキンソン病による認知症、アルツハイマー型認知症、物質誘発持続性認知症および軽度認知障害の群から選択される認知障害である、請求項19に記載の使用。

【請求項 29】

前記中枢神経系障害が、不安症、統合失調症、片頭痛、うつ病、およびてんかんの群から選択される、請求項19に記載の使用。

【請求項 30】

mGluR2ポジティブアロステリックモジュレーターが、約1μM以下のED₅₀を有する、請求項17から29のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 31】

代謝型グルタメート受容体をイメージングするためのトレーサーを調製するための、前

記条件のない請求項 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 3 2】

ヒトを含む哺乳動物の請求項 1 7 から 2 9 のいずれか一項に挙げた状態を治療または予防するための薬物を製造するための、m G 1 u R 2 のオルトステリックアゴニストと組み合わせた、前記条件のない請求項 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、その治療および予防が、m G 1 u R 2 アロステリックモジュレーターの神経調節効果により影響されるか促進されることを特徴とするその使用。