

【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18年2月2日(2006.2.2)

【公表番号】特表2002-508326(P2002-508326A)

【公表日】平成14年3月19日(2002.3.19)

【出願番号】特願2000-538696(P2000-538696)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)
A 6 1 K	31/4525	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	471/08	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/506			
A 6 1 K	31/422			
A 6 1 K	31/4375			
A 6 1 K	31/4525			
A 6 1 K	31/4545			
A 6 1 P	9/00			
A 6 1 P	17/02			
A 6 1 P	19/08			
A 6 1 P	19/10			
A 6 1 P	27/02			
A 6 1 P	29/00			
A 6 1 P	31/12			
A 6 1 P	35/00			
A 6 1 P	43/00	1	1	1
C 0 7 D	471/04	1	1	4 A
C 0 7 D	471/08			
C 0 7 D	487/04	1	3	7

【手続補正書】

【提出日】平成17年12月7日(2005.12.7)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

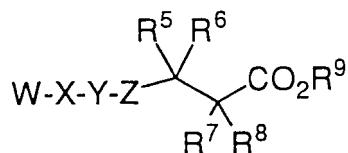
【補正方法】変更

## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記式の化合物および該化合物の医薬的に許容される塩。

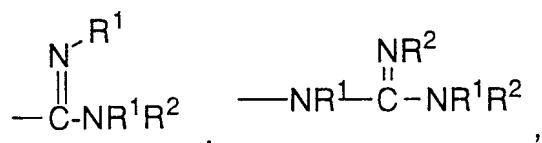
【化 1】



[ 式中、

W は

【化 2】



N、O および S からなる群から選択される 0、1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を有する 5 員もしくは 6 員の単環式芳香環もしくは非芳香環系（該環において、環窒素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている）、および

1 以上の環が芳香族であり、N、O および S からなる群から選択される 0、1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を有する 9 ~ 14 員の多環系（該多環系において、環窒素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている）

から選択され；

X は、- (CH<sub>2</sub>)<sub>v</sub> - (メチレン (CH<sub>2</sub>) 炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている)；N、O および S からなる群から選択される 0、1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を有する 5 員もしくは 6 員の単環式芳香環もしくは非芳香環系（該環において、環窒素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている）からなる群から選択され；

Y は、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - NR<sup>4</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - S - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - SO - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - SO<sub>2</sub> - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - NR<sup>4</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - NR<sup>4</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - NR<sup>4</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> - 、
- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - S - (CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub> - 、

- $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n - S - (CH_2)_p -$ 、
- $(CH_2)_m - NR^4 - (CH_2)_n - S - (CH_2)_p -$ 、
- $(CH_2)_m - NR^4 - (CH_2)_n - O - (CH_2)_p -$ 、
- $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n - O - (CH_2)_p -$  および
- $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n - NR^4 - (CH_2)_p -$

からなる群から選択され；

$Y$ における $R^4$ 以外のメチレン( $CH_2$ )炭素原子は1個もしくは2個の $R^3$ 置換基によって置換されていても良く；

$Z$ は、N、OおよびSからなる群から選択される0～6個のヘテロ原子を有する6～11員の芳香族もしくは非芳香族の単環式もしくは多環式の環系（該環系は、未置換であるか、1、2、3もしくは4個のオキソ置換基によって置換されており、未置換であるか $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ および $R^{13}$ からなる群から独立に選択される1個以上の置換基によって置換されている）；ただし、 $Z$ はフェニルおよびピリジルではなく；

$R^1$ および $R^2$ はそれぞれ独立に、水素、ハロゲン、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロヘテロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロヘテロアルキル $C_{1-6}$ アルキル、アリール、アリール $C_{1-8}$ アルキル、アミノ、アミノ $C_{1-8}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アシルアミノ、 $C_{1-3}$ アシルアミノ $C_{1-8}$ アルキル、 $(C_{1-6}$ アルキル) $_p$ アミノ、 $(C_{1-6}$ アルキル) $_p$ アミノ $C_{1-8}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_{1-6}$ アルキルオキシ、水酸基、ヒドロキシ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、 $C_{1-8}$ アルキル-S(O) $_p$ 、 $(C_{1-8}$ アルキル) $_p$ アミノカルボニル、 $C_{1-8}$ アルキルカルボニルアミノ、 $(C_{1-8}$ アルキル) $_p$ アミノカルボニルオキシ、(アリール $C_{1-8}$ アルキル) $_p$ アミノ、(アリール) $_p$ アミノ、アリール $C_{1-8}$ アルキルスルホニルアミノおよび $C_{1-8}$ アルキルスルホニルアミノからなる群から選択されるか；あるいは同一の炭素原子上にある場合に2個の $R^1$ 置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基を形成しており；

各 $R^3$ は独立に、

水素、

アリール、

$C_{1-10}$ アルキル、

アリール- $(CH_2)_r - O - (CH_2)_s -$ 、

アリール- $(CH_2)_r - S(O)_p - (CH_2)_s -$ 、

アリール- $(CH_2)_r - C(O) - (CH_2)_s -$ 、

アリール- $(CH_2)_r - C(O) - N(R^4) - (CH_2)_s -$ 、

アリール- $(CH_2)_r - N(R^4) - C(O) - (CH_2)_s -$ 、

アリール- $(CH_2)_r - N(R^4) - (CH_2)_s -$ 、

ハロゲン、

水酸基、

オキソ、

トリフルオロメチル、

$C_{1-8}$ アルキルカルボニルアミノ、

アリール $C_{1-5}$ アルコキシ、

$C_{1-5}$ アルコキシカルボニル、

$(C_{1-8}$ アルキル) $_p$ アミノカルボニル、

$C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ、

$C_{3-8}$ シクロアルキル、

$(C_{1-6}$ アルキル) $_p$ アミノ、

アミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリールアミノカルボニル、  
 アリール C<sub>1 - 5</sub> アルキルアミノカルボニル、  
 アミノカルボニル、  
 アミノカルボニル C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 ヒドロキシカルボニル、  
 ヒドロキシカルボニル C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 H C - C (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキル - C - C (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>3 - 7</sub> シクロアルキル - C - C - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 アリール - C - C (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキルアリール - C - C - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C H<sub>2</sub> = C H - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキル - C H = C H - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>3 - 7</sub> シクロアルキル - C H = C H - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 アリール - C H = C H - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキルアリール - C H = C H - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキル - S O<sub>2</sub> - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルキルアリール - S O<sub>2</sub> - (C H<sub>2</sub>)<sub>t -</sub>、  
 C<sub>1 - 6</sub> アルコキシ、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルコキシ、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 (C<sub>1 - 6</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノ、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 (アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノ、  
 (アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリールカルボニルオキシ、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキルカルボニルオキシ、  
 (C<sub>1 - 6</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルオキシ、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルキルスルホニルアミノ、  
 アリールスルホニルアミノ、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルキルスルホニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリールスルホニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキルスルホニルアミノ、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキルスルホニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルコキシカルボニルアミノ、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1 - 8</sub> アルキル、  
 アリールオキシカルボニルアミノ C<sub>1 - 8</sub> アルキル、  
 アリール C<sub>1 - 8</sub> アルコキシカルボニルアミノ、  
 アリール C<sub>1 - 8</sub> アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1 - 8</sub> アルキル、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルキルカルボニルアミノ、  
 C<sub>1 - 8</sub> アルキルカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリールカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキルカルボニルアミノ、  
 アリール C<sub>1 - 6</sub> アルキルカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 アミノカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 (C<sub>1 - 8</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、  
 (C<sub>1 - 8</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1 - 6</sub> アルキル、

(アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノカルボニルアミノ、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノスルホニルアミノ、  
 (C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール) p アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノスルホニルアミノ、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール) p アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノカルボニルおよび  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル) p アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル

からなる群から選択されるか；あるいは同一の炭素原子上にある場合に2個のR<sup>3</sup>置換基が、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基またはシクロプロピル基を形成しており；

R<sup>3</sup>におけるアルキル基は未置換であるかあるいは1～3個のR<sup>1</sup>置換基によって置換されており；ただし、各R<sup>3</sup>の選択は、得られる化合物において、R<sup>3</sup>が結合している1個もしくは複数の炭素原子自体が1個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

各R<sup>4</sup>は独立に、

水素、

アリール、

アミノカルボニル、

C<sub>3</sub> - 8 シクロアルキル、

アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

(アリール) p アミノカルボニル、

(アリール C<sub>1</sub> - 5 アルキル) p アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル

C<sub>1</sub> - 8 アルキル、

アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

(C<sub>1</sub> - 6 アルキル) p アミノ C<sub>2</sub> - 6 アルキル、

(アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル) p アミノ C<sub>2</sub> - 6 アルキル、

C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニル、

C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニル、

アリールオキシカルボニル、

アリール C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニル、

C<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキルカルボニル、  
 アリールカルボニル、  
 アリールC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルカルボニル、  
 (C<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル、  
 アミノスルホニル、  
 C<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキルアミノスルホニル、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノスルホニル、  
 (アリールC<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノスルホニル、  
 アリールスルホニル、  
 アリールC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルスルホニル、  
 C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルチオカルボニル、  
 アリールチオカルボニルおよび  
 アリールC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルチオカルボニル

からなる群から選択され；

R<sup>4</sup> におけるアルキル基は未置換であるかあるいは1～3個のR<sup>1</sup>置換基によって置換されており；

R<sup>5</sup> およびR<sup>6</sup> はそれぞれ独立に、

水素、

C<sub>1</sub> -<sub>10</sub> アルキル、

アリール、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - S (O)<sub>p</sub> - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - C (O) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - C (O) - N (R<sup>4</sup>) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - N (R<sup>4</sup>) - C (O) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - N (R<sup>4</sup>) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> - 、

ハロゲン、

水酸基、

C<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキルカルボニルアミノ、

アリールC<sub>1</sub> -<sub>5</sub> アルコキシ、

C<sub>1</sub> -<sub>5</sub> アルコキシカルボニル、

(C<sub>1</sub> -<sub>8</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル、

C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルカルボニルオキシ、

C<sub>3</sub> -<sub>8</sub> シクロアルキル、

(C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル)<sub>p</sub> アミノ、

アミノC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

アリールアミノカルボニル、

アリールC<sub>1</sub> -<sub>5</sub> アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル、

アミノカルボニルC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

ヒドロキシカルボニル、

ヒドロキシカルボニルC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

H C - C (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル - C - C (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

C<sub>3</sub> -<sub>7</sub> シクロアルキル - C - C - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

アリール - C - C (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルアリール - C - C - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

CH<sub>2</sub> = CH - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル - CH = CH - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

C<sub>3</sub> -<sub>7</sub> シクロアルキル - CH = CH - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - 、

アリール - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルアリール - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキル - S O<sub>2</sub> - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルアリール - S O<sub>2</sub> - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノ、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールカルボニルオキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルオキシ、  
( C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルオキシ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニルアミノ、  
アリールスルホニルアミノ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
アリールオキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルアミノ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

アリールカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルおよび  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル

からなる群から選択されるか；あるいは R<sup>5</sup> と R<sup>6</sup> とが、それらが結合している炭素原子と一体となってカルボニル基を形成しており；

R<sup>5</sup> または R<sup>6</sup> におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R<sup>1</sup> 置換基によって置換されており；ただし、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> それぞれの選択は、得られる化合物において、R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> が結合している炭素原子自体が 1 個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> はそれぞれ独立に、

水素、

C<sub>1</sub> - 10 アルキル、

アリール、

アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、  
 アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - S(O)<sub>p</sub> - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、  
 アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - C(O) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、  
 アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - C(O) - N(R<sup>4</sup>) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、  
 アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - N(R<sup>4</sup>) - C(O) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、  
 アリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub> - N(R<sup>4</sup>) - (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub> -、

ハロゲン、

水酸基、

C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルアミノ、

アリール C<sub>1</sub> - 5 アルコキシ、

C<sub>1</sub> - 5 アルコキシカルボニル、

(C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル、

C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルオキシ、

C<sub>3</sub> - 8 シクロアルキル、

(C<sub>1</sub> - 6 アルキル)<sub>p</sub> アミノ、

アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

アリールアミノカルボニル、

アリール C<sub>1</sub> - 5 アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル、

アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

ヒドロキシカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

H C - C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

C<sub>1</sub> - 6 アルキル - C - C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

C<sub>3</sub> - 7 シクロアルキル - C - C - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

アリール - C - C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

C<sub>1</sub> - 6 アルキルアリール - C - C - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

C H<sub>2</sub> = C H - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> -、

C<sub>1</sub> - 6 アルキル - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>3</sub> - 7 シクロアルキル - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
アリール - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルアリール - C H = C H - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキル - S O<sub>2</sub> - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルアリール - S O<sub>2</sub> - ( C H<sub>2</sub> )<sub>t</sub> - 、  
C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノ、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールカルボニルオキシ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルオキシ、  
( C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルオキシ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニルアミノ、  
アリールカルボニルアミノ、  
アリールスルホニルアミノ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ、  
C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
アリールオキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 8 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルアミノ、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールアミノカルボニルアミノ、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、  
( C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、  
( アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル )<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、  
C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリールスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル、

アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリールチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ、  
 アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル、  
 (アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキルおよび  
 C<sub>7</sub> - 20 ポリシクリル C<sub>0</sub> - 8 アルキルスルホニルアミノ

からなる群から選択され；

R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> におけるアルキル基は未置換であるかあるいは 1 ~ 3 個の R<sup>1</sup> 置換基によって置換されており；ただし、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> それぞれの選択は、得られる化合物において、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> が結合している炭素原子自体が 1 個以下のヘテロ原子に結合するような形で行われ；

R<sup>9</sup> は、

水素、  
 C<sub>1</sub> - 8 アルキル、

アリール、  
 アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキル

C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルオキシ C<sub>1</sub> - 4 アルキル、  
 アリール C<sub>1</sub> - 8 アルキルカルボニルオキシ C<sub>1</sub> - 4 アルキル、  
 C<sub>1</sub> - 8 アルキルアミノカルボニルメチレンおよび  
 C<sub>1</sub> - 8 ジアルキルアミノカルボニルメチレン

からなる群から選択され；

R<sup>1</sup> - 0 、 R<sup>1</sup> - 1 、 R<sup>1</sup> - 2 および R<sup>1</sup> - 3 はそれぞれ独立に、

水素、

C<sub>1</sub> - 8 アルキル、

アリール、

ハロゲン、

水酸基、

オキソ、

アミノカルボニル、

C<sub>3</sub> - 8 シクロアルキル、

アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

(アリール)<sub>p</sub> アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル、

(アリール C<sub>1</sub> - 5 アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニル、

ヒドロキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

(C<sub>1</sub> - 6 アルキル)<sub>p</sub> アミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、

(アリール C<sub>1</sub> - 6 アルキル)<sub>p</sub> アミノ C<sub>2</sub> - 6 アルキル、

C<sub>1</sub> - 8 アルキルスルホニル、

C<sub>1</sub> - 8 アルコキシカルボニル、

アリールオキシカルボニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルカルボニル、  
 アリールカルボニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニル、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニル、  
 アミノスルホニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルアミノスルホニル、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノスルホニル、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニル、  
 アリールスルホニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニル、  
 アリールチオカルボニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニル、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-S(O)<sub>p</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-C(O)--(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-C(O)-N(R<sup>4</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-N(R<sup>4</sup>)-C(O)-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-N(R<sup>4</sup>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>-、  
 HC-C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-C-C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>3</sub>-<sub>7</sub>シクロアルキル-C-C-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 アリール-C-C(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルアリール-C-C-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 CH<sub>2</sub>=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>3</sub>-<sub>7</sub>シクロアルキル-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 アリール-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルアリール-CH=CH-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-SO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルアリール-SO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルカルボニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>5</sub>アルコキシ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>5</sub>アルコキシカルボニル、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノ、  
 アミノカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノ、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノ、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールカルボニルオキシ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルオキシ、

(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルオキシ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルスルホニルアミノ、  
 アリールスルホニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル、  
 アリールオキシカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アミノカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノ、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノ、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アミノスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノ、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノ、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールスルホニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールチオカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルアミノC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリール)<sub>p</sub>アミノカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルおよび  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル

からなる群から選択され；

R<sup>1-0</sup>、R<sup>1-1</sup>、R<sup>1-2</sup>およびR<sup>1-3</sup>におけるアルキル基は未置換であるかあるいは1

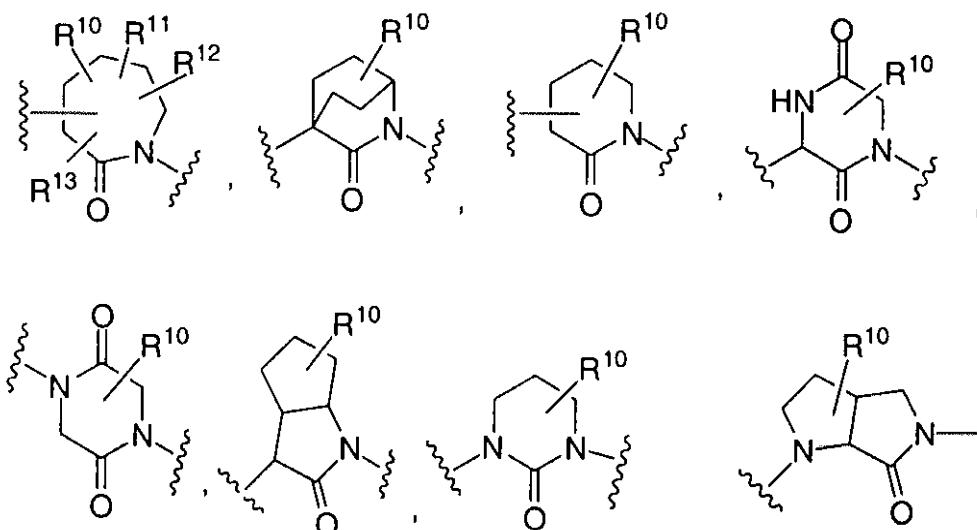
~ 3 個の R<sup>1</sup> 置換基によって置換されており；  
各 m は独立に 0 ~ 6 の整数であり；  
各 n は独立に 0 ~ 6 の整数であり；  
各 p は独立に 0 ~ 2 の整数であり；  
各 r は独立に 1 ~ 3 の整数であり；  
各 s は独立に 0 ~ 3 の整数であり；  
各 t は 0 ~ 3 の整数であり；  
v は独立に 0 ~ 6 の整数である。】

【請求項 2】 W が、1 個もしくは 2 個の窒素原子を有する 6 員の単環式芳香環（該環において各炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている）、あるいは 1 以上の環が芳香族であり、N、O および S からなる群から選択される 0、1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を有する 9 ~ 14 員の多環系（該多環系において、環窒素原子は未置換であるかあるいは 1 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されており、環炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されている）であり；

X が - (C H<sub>2</sub>)<sub>v</sub> - であり、該基においてメチレン (C H<sub>2</sub>) 炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の R<sup>1</sup> 置換基で置換されており；

Z が

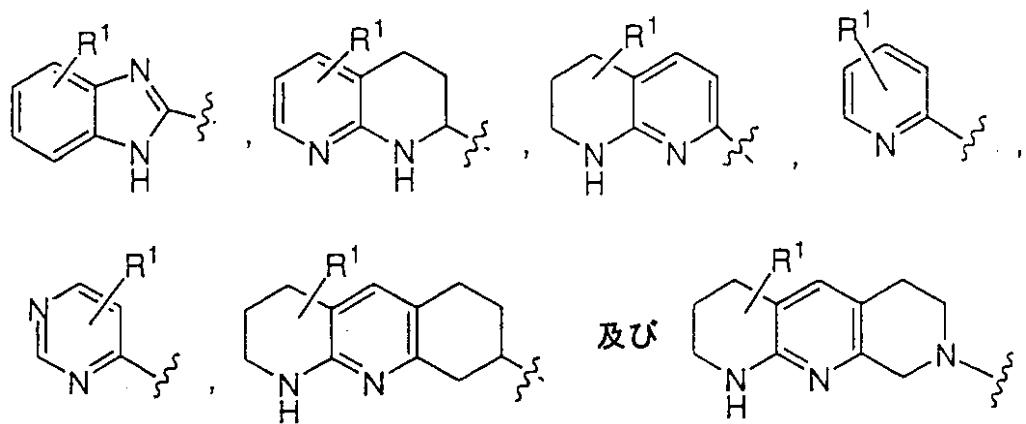
【化 3】



からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 W が

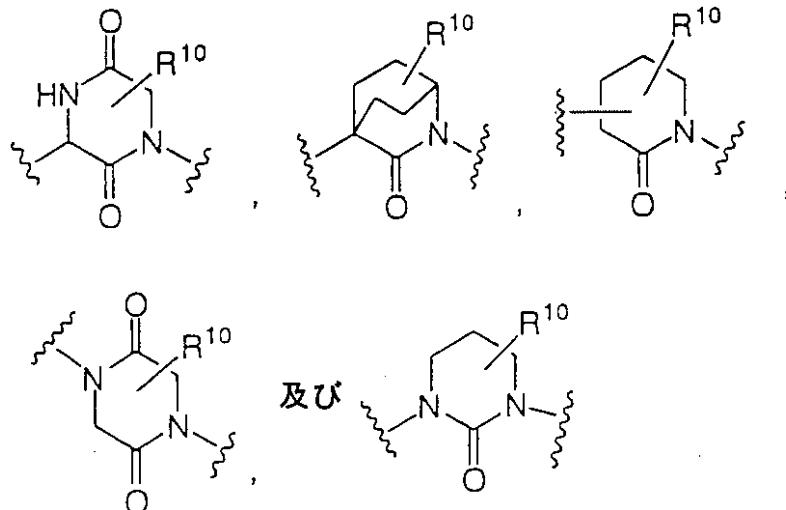
【化 4】



からなる群から選択され；

Z が

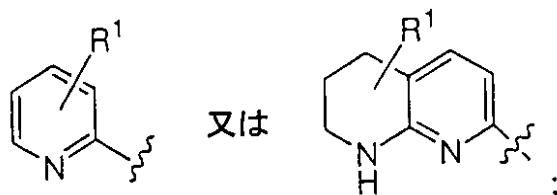
【化 5】



からなる群から選択される請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 W が

【化 6】



であり；

X が  $-\left(\text{CH}_2\right)_v-$  であり、該基においてメチレン ( $\text{CH}_2$ ) 炭素原子は未置換であるかあるいは 1 個もしくは 2 個の  $\text{R}^1$  置換基で置換されており；

Y が、

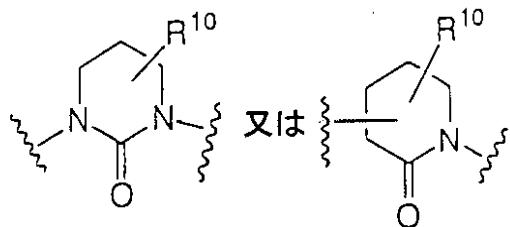
- $(\text{CH}_2)_m-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{O}- (\text{CH}_2)_n-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{NR}^4- (\text{CH}_2)_n-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{S}- (\text{CH}_2)_n-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{SO}- (\text{CH}_2)_n-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{SO}_2- (\text{CH}_2)_n-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{O}- (\text{CH}_2)_n-\text{O}- (\text{CH}_2)_p-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{O}- (\text{CH}_2)_n-\text{NR}^4- (\text{CH}_2)_p-$  、
- $(\text{CH}_2)_m-\text{NR}^4- (\text{CH}_2)_n-\text{NR}^4- (\text{CH}_2)_p-$  および
- $(\text{CH}_2)_m-\text{NR}^4- (\text{CH}_2)_n-\text{O}- (\text{CH}_2)_p-$

からなる群から選択され；

Y における  $\text{R}^4$  以外のメチレン ( $\text{CH}_2$ ) 炭素原子が 1 個もしくは 2 個の  $\text{R}^3$  置換基によって置換されていても良く；

Z が

【化 7】



である請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】 Yが、 $(CH_2)_m$ 、 $(CH_2)_m - S - (CH_2)_n$  および  $(CH_2)_m - NR^4 - (CH_2)_n$  からなる群から選択され；Yにおける $R^4$ 以外のメチレン $(CH_2)$ 炭素原子が1個もしくは2個の $R^3$ 置換基によって置換されていても良く； $m$ および $n$ が0～3の整数であり；

$\nu$ が0である請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】 各 $R^3$ が独立に、

水素、

フッ素、

トリフルオロメチル、

アリール、

$C_{1-8}$ アルキル、

アリール $C_{1-6}$ アルキル、

水酸基、

オキソ、

アリールアミノカルボニル、

アリール $C_{1-5}$ アルキルアミノカルボニル、

アミノカルボニル

および

アミノカルボニル $C_{1-6}$ アルキル

からなる群から選択され；

各 $R^4$ が独立に、

水素、

アリール、

$C_{3-8}$ シクロアルキル、

$C_{1-8}$ アルキル、

$C_{1-8}$ アルキルカルボニル、

アリールカルボニル、

$C_{1-6}$ アルキルスルホニル、

アリールスルホニル、

アリール $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、

アリール $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、

$C_{1-8}$ アルキルアミノカルボニル、

アリール $C_{1-5}$ アルキルアミノカルボニル、

アリール $C_{1-8}$ アルコキカルボニルおよび

$C_{1-8}$ アルコキカルボニル

からなる群から選択される請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】  $R^6$ 、 $R^7$  および $R^8$  がそれぞれ水素であり、 $R^5$  が

水素、

アリール、

$C_{1-8}$ アルキル、

アリール- $C-C-(CH_2)_t-$ 、

アリール $C_{1-6}$ アルキル、

$C_2H = CH - (CH_2)_t -$  および  
 $H - C - (CH_2)_t -$

からなる群から選択される請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】  $R^9$  が水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】  $R^9$  が水素である請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】  $R^5$ 、 $R^6$  および  $R^8$  がそれぞれ水素であり、 $R^7$  が、

水素、

アリール、

$C_{1-8}$  アルキルカルボニルアミノ、

$C_{1-8}$  アルキルスルホニルアミノ、

アリールカルボニルアミノ、

アリールスルホニルアミノ、

$C_{1-8}$  アルキルスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリールスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

$C_{1-8}$  アルコキシカルボニルアミノ、

$C_{1-8}$  アルコキシカルボニルアミノ  $C_{1-8}$  アルキル、

アリールオキシカルボニルアミノ  $C_{1-8}$  アルキル、

アリール  $C_{1-8}$  アルコキシカルボニルアミノ、

アリール  $C_{1-8}$  アルコキシカルボニルアミノ  $C_{1-8}$  アルキル、

$C_{1-8}$  アルキルカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリールカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アミノカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

( $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、

( $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

(アリール)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリールアミノカルボニルアミノ、

(アリール  $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ、

(アリール  $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アミノスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

( $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、

( $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

(アリール)<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

(アリール  $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ、

(アリール  $C_{1-8}$  アルキル)<sub>p</sub> アミノスルホニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

$C_{1-6}$  アルキルチオカルボニルアミノ、

$C_{1-6}$  アルキルチオカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリールチオカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルチオカルボニルアミノおよび

アリール  $C_{1-6}$  アルキルチオカルボニルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル

からなる群から選択される請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 11】  $R^7$  が、

水素、

アリール、

$C_{1-8}$  アルキルカルボニルアミノ、

アリール  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ、

アリールカルボニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキルスルホニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ、  
 アリールスルホニルアミノ、  
 C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノ、  
 アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルコキシカルボニルアミノ、  
 アリールアミノカルボニルアミノ、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノ、  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノカルボニルアミノ、  
 (C<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノおよび  
 (アリールC<sub>1</sub>-<sub>8</sub>アルキル)<sub>p</sub>アミノスルホニルアミノ  
 からなる群から選択される請求項10に記載の化合物。

【請求項12】 R<sup>9</sup>が水素、メチルおよびエチルからなる群から選択される請求項11に記載の化合物。

【請求項13】 R<sup>9</sup>が水素である請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

3(S)- (2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-6-イル)-3-{2-オキソ-3-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-テトラヒドロ-ピリミジン-1-イル}-プロピオン酸エチル；  
 3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(SまたはR)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸エチル；

3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(RまたはS)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸エチル；

3(S)- (2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-6-イル)-3-{2-オキソ-3-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-テトラヒドロ-ピリミジン-1-イル}-プロピオン酸；

3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(SまたはR)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸；

3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(RまたはS)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸

からなる群から選択される請求項6に記載の化合物ならびに該化合物の医薬的に許容される塩。

【請求項15】

3(S)- (2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-6-イル)-3-{2-オキソ-3-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-テトラヒドロ-ピリミジン-1-イル}-プロピオン酸；

3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(SまたはR)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸；

3(S)- (3-フルオロフェニル)-3-(2-オキソ-3(RまたはS)-[3-(5,6,7,8-テトラヒドロ[1,8]ナフチリジン-2-イル)-プロピル]-ピペリジン-1-イル)-プロピオン酸

からなる群から選択される請求項14に記載の化合物ならびに該化合物の医薬的に許容される塩。

【請求項16】 請求項1に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを含む医薬組成物。

【請求項 17】 請求項 1 に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを組み合わせることで製造される医薬組成物。

【請求項 18】 請求項 1 に記載の化合物と医薬的に許容される担体とを組み合わせる段階を有する医薬組成物の製造方法。

【請求項 19】

a ) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステル；

b ) エストロゲン受容体調節剤；

c ) 細胞毒剤 / 抗増殖剤；

d ) 基質金属プロテイナーゼ阻害剤；

e ) 表皮由来、線維芽細胞由来または血小板由来の成長因子の阻害剤；

f ) VEGF 阻害剤；

g ) Flk-1 / KDR、Flt-1、Tck / Tie-2 または Tie-1 の阻害剤；

h ) カテプシン K 阻害剤；および

i ) ファルネシル蛋白トランスフェラーゼ阻害薬もしくはゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ阻害薬またはファルネシル / ゲラニルゲラニルトランスフェラーゼ二重阻害薬などのブレニル化阻害薬；ならびにそれらの混合物

からなる群から選択される有効成分をさらに含む請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記有効成分が、

a ) 有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステル；

b ) エストロゲン受容体調節剤；および

c ) カテプシン K 阻害剤；ならびに

それらの混合物

からなる群から選択される請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】 前記有機ビスホスホン酸化合物または該化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステルが、アレンドロン酸モノナトリウム・3 水和物である請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】 前記有効成分が、

a ) 細胞毒剤 / 抗増殖剤；

b ) 基質金属プロテイナーゼ阻害剤；

c ) 表皮由来、線維芽細胞由来または血小板由来の成長因子の阻害剤；

d ) VEGF 阻害剤；

e ) Flk-1 / KDR、Flt-1、Tck / Tie-2 または Tie-1 の阻害剤；ならびに

それらの混合物

からなる群から選択される請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 23】 処置を必要とする哺乳動物でインテグリン受容体拮抗効果を誘発する方法であって、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を該哺乳動物に投与する段階を有してなる方法。

【請求項 24】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 3 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 25】 v 3 拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症、ウィルス疾患および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 24 に記載の方法。

【請求項 26】 v 3 拮抗効果が骨吸収阻害である請求項 25 に記載の方法。

【請求項 27】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 5 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 28】 v 5 拮抗効果が、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 3 / v 5 二重拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 30】 v 3 / v 5 二重拮抗効果が、骨吸収、再狭窄、血管形成、糖尿病性網膜症、黄斑変性、炎症、ウィルス疾患および腫瘍成長の阻害からなる群から選択される請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】 前記インテグリン受容体拮抗効果が v 6 拮抗効果である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 32】 v 6 拮抗効果が、血管形成、炎症応答および創傷治癒からなる群から選択される請求項 31 に記載の方法。

【請求項 33】 処置を必要とする哺乳動物においてインテグリン受容体拮抗効果を誘発する方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 34】 処置を必要とする哺乳動物におけるインテグリン受容体の拮抗が介在する状態の治療または予防方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 35】 処置を必要とする哺乳動物における骨吸収阻害方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 16 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 36】 処置を必要とする哺乳動物における骨吸収阻害方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 20 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 37】 処置を必要とする哺乳動物における腫瘍成長の治療方法であって、該哺乳動物に治療上有効量の請求項 22 に記載の組成物を投与する段階を有してなる方法。

【請求項 38】 処置を必要とする哺乳動物における腫瘍成長の治療方法であって、該哺乳動物に対して、放射線療法との併用で、治療上有効量の請求項 1 に記載の化合物を投与する段階を有してなる方法。