

【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2月7日(2008.2.7)

【公開番号】特開2007-314551(P2007-314551A)

【公開日】平成19年12月6日(2007.12.6)

【年通号数】公開・登録公報2007-047

【出願番号】特願2007-182287(P2007-182287)

【国際特許分類】

C 07 D 237/22	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
A 61 K 31/505	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 7/06	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 35/04	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 15/18	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 15/16	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 237/22	C S P
C 07 D 401/04	
A 61 K 31/506	
C 07 D 403/12	
A 61 K 31/55	
A 61 K 31/505	
C 07 D 401/14	
C 07 D 409/14	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 35/00	
A 61 P 3/10	
A 61 P 37/00	
A 61 P 7/06	
A 61 P 31/18	
A 61 P 37/06	

A 6 1 P 35/04  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 15/18  
A 6 1 P 19/10  
A 6 1 P 15/16  
A 6 1 P 25/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年12月17日(2007.12.17)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

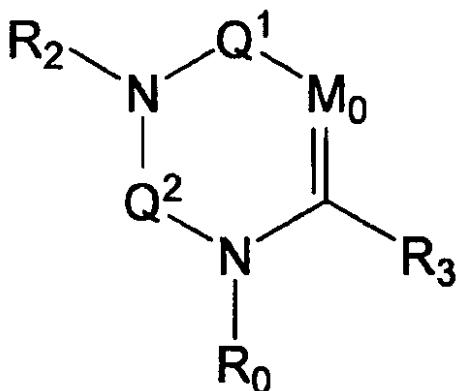
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

以下の式で表される化合物：

## 【化1】

ここで、 $M_0$ は、 $-C-LX$ 、Nまたは $CR_4$ を表し；Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり；

$R_0$ は $R_1$ または $-LX$ であり、但し $R_0$ および $M_0$ の一方のみが $-LX$ であることを条件とし；  
 $R_1$ は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、シアノ、チオ、( $C_{1-10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

$R_2$ は水素原子、または( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル( $C_{1-5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル( $C_{1-5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘ

テロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

$R_3$ はパーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、( $C_{1-10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり;

$R_4$ は水素原子であるか、あるいはハロ、パーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、シアノ、チオ、( $C_{1-10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

$R_9$ は水素原子であるか、またはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

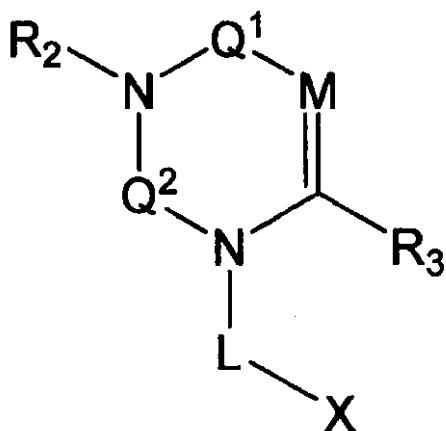
$L$ は、 $X$ と、 $L$ が結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーであり、ここで該分離を与える該リンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され; および

$X$ は( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

## 【請求項2】

以下の一般式で表される、請求項1記載の化合物:

### 【化2】



ここで、 $M$ は $N$ または $CR_4$ を表し;

$Q^1$ および $Q^2$ は各々独立に $CO$ 、 $CS$ 、 $SO$ 、 $SO_2$ および $C=NR_9$ からなる群から選択されるものであり;

$R_2$ は水素原子であるか、または( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、( $C_{3-12}$ )シ

クロアルキル( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、( $C_{9\sim 12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim 12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim 12}$ )ビシクロアリール( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

$R_3$ はパーハロ( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、アミノ、( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり;

$R_4$ は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、アミノ、シアノ、チオ、( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

$R_9$ は水素原子であるか、またはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり;

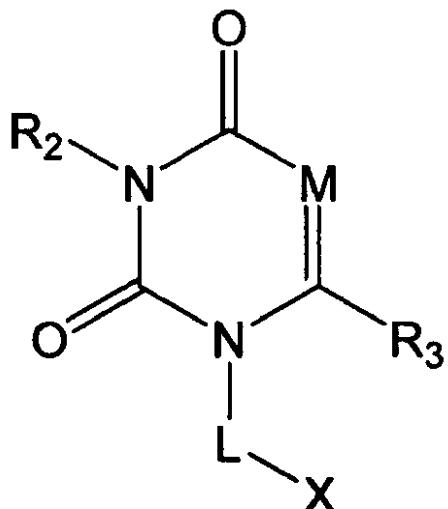
$L$ は、 $X$ と、 $L$ が結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーハリゲン結合であり、ここで該分離を与える該リンカーハリゲン結合の原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され; および

$X$ は( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、( $C_{9\sim 12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim 12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

### 【請求項3】

以下の式で表される、請求項2記載の化合物:

【化3】



ここで、MはNまたはCR<sub>4</sub>を表し；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

R<sub>4</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

Lは、Xと、Lが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーハーであり、ここで該分離を与える該リンカーハーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；および

Xは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

**【請求項4】**

該分離を与えるLの該1、2または3原子が、炭素原子からなる、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項5】**

該分離を与えるLの該1、2または3原子が、少なくとも一つの酸素原子または少なくとも一つの窒素原子からなるリンカーからなる群から選択される、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項6】**

該Lが、該リング原子からXを1原子だけ分離する、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項7】**

該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-、-O-、-OCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-N(CH<sub>3</sub>)-、-NHCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-、-NHC(O)-、-N(CH<sub>3</sub>)C(O)-、-C(O)NH-、-C(O)N(CH<sub>3</sub>)-、-NHC(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)NHCH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHC(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)NH-、-NHCH<sub>2</sub>C(O)-、-S-、-SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>S-、-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S-、-C(O)S-、-C(O)SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)S-、-C(O)CH<sub>2</sub>S-、および-CH<sub>2</sub>SC(O)-からなる群から選択される、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項8】**

該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-および-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-からなる群から選択される、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

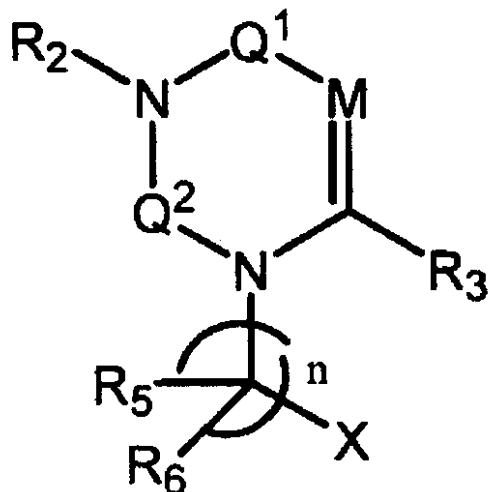
**【請求項9】**

該-L-Xが一緒に、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-(2-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-カルボキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-スルホナミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-スルホナミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-2-プロモ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジクロロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-プロモ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-3,5-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項1～3の何れか1項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

以下の一般式で表される請求項2記載の化合物：

## 【化4】



ここで、nは1、2または3であり；

MはNまたはCR<sub>4</sub>を表し；

Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

R<sub>4</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、独立に、水素原子、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキル、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、またはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は一緒に一つのリングを形成し；

R<sub>9</sub>は水素原子であるか、またはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

および

Xは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

**【請求項 1 1】**

該置換基Xが、置換または無置換の(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-7</sub>)ヘテロシクロアルキル、アリール、フェニル、ヘテロアリール、ヘテロフェニル、ジハロフェニル、ハロアリール、ハロヘテロアリール、ジハロアリール、ジハロヘテロアリール、リングの2または3位に水素以外の置換基を持つ、該リングを持つまたは環式の基である、請求項1~10の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 1 2】**

該置換基Xが、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、シアノ、ニトロ、ハロ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、該リングの2または3位に水素以外の置換基を持つ、該リングを持つまたは環式の基である、請求項1~10の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 1 3】**

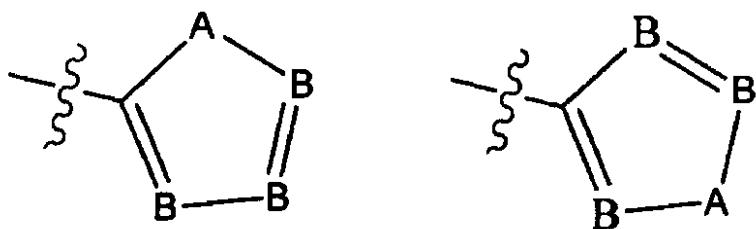
該置換基Xが、各々置換または無置換であり得る(2-シアノ)フェニル、(3-シアノ)フェニル、(2-ヒドロキシ)フェニル、(3-ヒドロキシ)フェニル、(2-アルケニル)フェニル、(3-アルケニル)フェニル、(2-アルキニル)フェニル、(3-アルキニル)フェニル、(2-メトキシ)フェニル、(3-メトキシ)フェニル、(2-ニトロ)フェニル、(3-ニトロ)フェニル、(2-カルボキシ)フェニル、(3-カルボキシ)フェニル、(2-カルボキサミド)フェニル、(3-カルボキサミド)フェニル、(2-スルホナミド)フェニル、(3-スルホナミド)フェニル、(2-テトラゾリル)フェニル、(3-テトラゾリル)フェニル、(2-アミノメチル)フェニル、(3-アミノメチル)フェニル、(2-ヒドロキシメチル)フェニル、(3-ヒドロキシメチル)フェニル、(2-フェニル)フェニル、(3-フェニル)フェニル、(2-ハロ)フェニル、(3-ハロ)フェニル、(2-CO-NH<sub>2</sub>)フェニル、(3-CONH<sub>2</sub>)フェニル、(2-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-NH<sub>2</sub>)フェニル、(3-NH<sub>2</sub>)フェニル、(2-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、(3-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、(2-アリール)フェニル、(3-アリール)フェニル、(2-ヘテロアリール)フェニル、(3-ヘテロアリール)フェニル、2-プロモ-5-フルオロフェニル、2-クロロ-5-フルオロフェニル、2-シアノ-5-フルオロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、2,5-ジフルオロフェニル、2,5-ジプロモフェニル、2-ブロモ-3,5-ジフルオロフェニル、2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル、2,3,5-トリフルオロフェニル、2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-ブロモ-3,5,6-トリフルオロフェニル、2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル、2-シアノ-3,5-ジフルオロフェニル、2-シアノ-3,5,6-トリフルオロフェニル、(2-ヘテロシクロアルキル)フェニル、および(3-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項1~10の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 1 4】**

該置換基Xが、以下の一般式で表される基からなる群から選択される、請求項1~10の何

れか1項に記載の化合物：

【化5】



ここで、AはS、OまたはNR<sub>2</sub><sub>4</sub>であり、

Bは、CR<sub>2</sub><sub>3</sub>またはNであり、

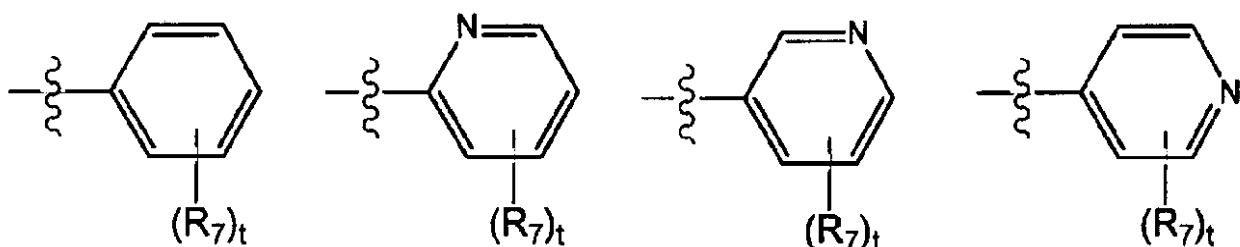
R<sub>2</sub><sub>3</sub>が、独立に、水素原子、ハロ、パーハロ(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、アミノ、チオ、シアノ、CF<sub>3</sub>、ニトロ、(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~<sub>12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3</sub>~<sub>12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1</sub>~<sub>5</sub>)アルキル、(C<sub>9</sub>~<sub>12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8</sub>~<sub>12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、および

R<sub>2</sub><sub>4</sub>は、独立に、水素原子、パーハロ(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~<sub>12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3</sub>~<sub>12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1</sub>~<sub>5</sub>)アルキル、(C<sub>9</sub>~<sub>12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8</sub>~<sub>12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

【請求項15】

Xが、以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1~10の何れか1項記載の化合物：

【化6】



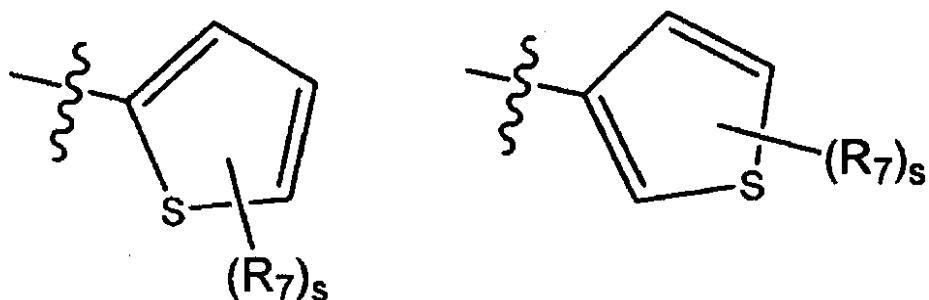
ここで、tは0、1、2、3、4または5であり、および

各R<sub>7</sub>は、夫々独立に、ハロ、パーハロ(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~<sub>10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

【請求項16】

Xが、以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1~10の何れか1項記載の化合物：

## 【化7】



ここで、sは0、1、2または3であり、および

各R<sub>7</sub>は、夫々独立に、ハロ、パー・ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

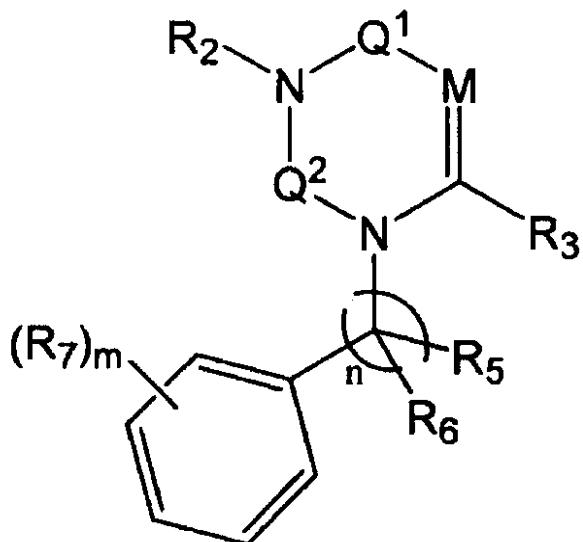
## 【請求項17】

R<sub>7</sub>が、独立に、-シアノ、-メトキシ、-ニトロ、-カルボキシ、-スルホンアミド、-テトラゾリル、-アミノメチル、-ヒドロキシメチル、-フェニル、-ハロ、-CONH<sub>2</sub>、-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル、-NH<sub>2</sub>、-OH、-(C<sub>1-5</sub>)アルキル、-アルケニル、-アルキニル、-(C<sub>1-5</sub>)シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクロアルキル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、請求項15または16記載の化合物。

## 【請求項18】

以下の式で表される請求項10記載の化合物：

## 【化8】



ここで、mは0、1、2、3、4または5であり、

nは0、1、2または3であり、

MはNまたはCR<sub>4</sub>であり、

Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は、各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり、

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、あるいは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(

$C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

$R_3$ はパーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、( $C_{1-10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングからなる群から選択され、

$R_4$ は水素原子であるか、またはハロ、パーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、シアノ、チオ、( $C_{1-10}$ )アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

各 $R_5$ および $R_6$ は、夫々独立に、水素原子であるか、あるいは置換または無置換の( $C_{1-10}$ )アルキル、置換または無置換の( $C_{1-10}$ )アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、または $R_5$ および $R_6$ は一緒に一つのリングを形成し、

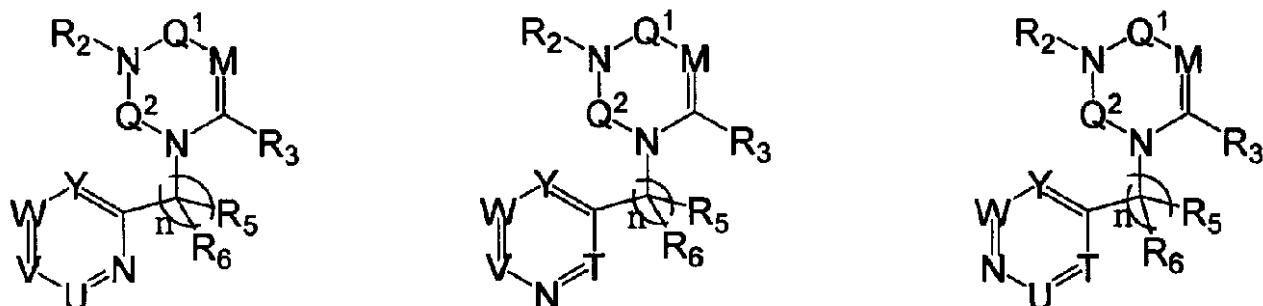
各 $R_7$ は、夫々独立に、ハロ、パーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、 $CF_3$ 、( $C_{1-10}$ )アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、および

$R_9$ は水素原子であるか、あるいはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

#### 【請求項 19】

以下の式の何れか一つにより表される、請求項10記載の化合物：

#### 【化 9】



ここで、nは1、2または3であり、

MはNまたは $CR_4$ であり、

T、U、V、WおよびYの各々は、夫々独立に、窒素原子または $CR_{16}$ であるが、これらT、U、V、WおよびYの多くとも2つが、窒素原子であることを条件とし、

$Q^1$ および $Q^2$ は、各々独立にCO、CS、SO、 $SO_2$ およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり、

$R_2$ は水素原子であるか、あるいは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

$R_3$ はパーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングからなる群から選択され、

$R_4$ は水素原子であるか、またはハロ、パーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

各 $R_5$ および $R_6$ は、夫々独立に、水素原子であるか、あるいは置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキル、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、または $R_5$ および $R_6$ は一緒に一つのリングを形成し、

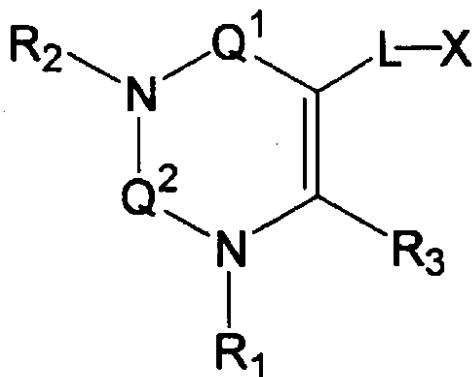
$R_9$ は水素原子であるか、あるいはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

各 $R_{16}$ は、夫々独立に、ハロ、パーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)る。

## 【請求項 20】

以下の式で表される請求項1記載の化合物：

【化10】



ここで、Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は、各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり；

R<sub>1</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

R<sub>9</sub>は水素原子であるか、またはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

Lは、Xと、Lが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーハロ、ここで該分離を与える該リンカーハロの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；および

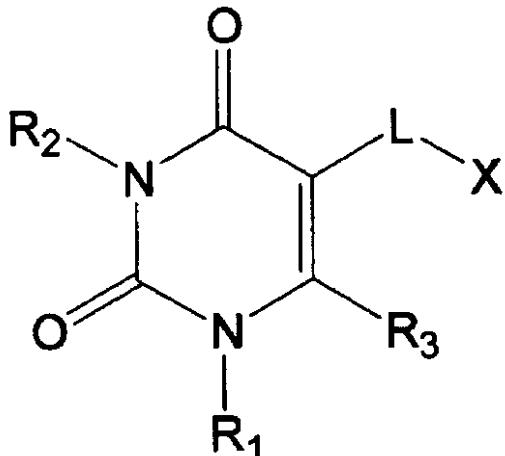
Xは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択

される基である。

【請求項 21】

以下の一般式で表される、請求項20記載の化合物：

【化 11】



ここで、R<sub>1</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

Lは、Xと、Lが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカ－であり、ここで該分離を与える該リンカ－の原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；および

Xは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択

される基である。

**【請求項 2 2】**

該分離を与える、該Lの1、2または3原子が炭素原子からなる、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 3】**

該分離を与える、該Lの1、2または3原子が少なくとも一つの酸素原子または少なくとも一つの窒素原子からなるリンカーパー群から選択される、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 4】**

該リンカーパーが、該リング原子からXを、1原子分だけ分離している、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 5】**

該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-、-O-、-OCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-N(CH<sub>3</sub>)-、-NHCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-、-NHC(O)-、-N(CH<sub>3</sub>)C(O)-、-C(O)NH-、-C(O)N(CH<sub>3</sub>)-、-NHC(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)NHCH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHC(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)NH-、-NHCH<sub>2</sub>C(O)-、-S-、-SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>S-、-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S-、-C(O)S-、-C(O)SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)S-、-C(O)CH<sub>2</sub>S-、および-CH<sub>2</sub>SC(O)-からなる群から選択される、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 6】**

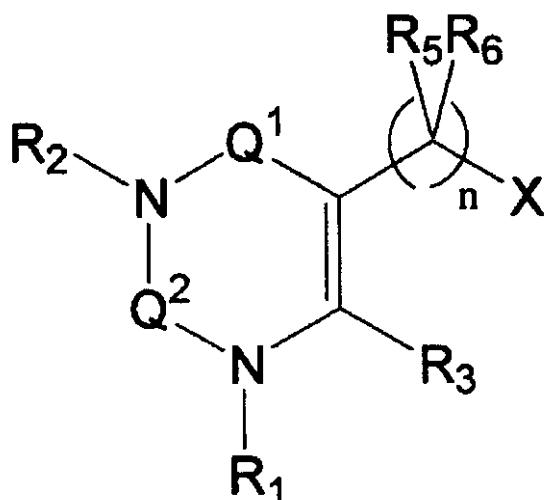
該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-および-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-からなる群から選択される、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 7】**

該-L-Xが一緒に、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-(2-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-カルボキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-スルホナミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-スルホナミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヘテロアリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヘテロアリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-2-プロモ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジクロロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジブロモフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-ブロモ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-ブロモ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヘテロシクロアルキル)フェニル、および-CH<sub>2</sub>-(3-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項20または21記載の化合物。

**【請求項 2 8】**

以下の一般式で表される、請求項20記載の化合物：  
【化12】



ここで、nは1、2または3であり；

Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり；

R<sub>1</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パー-ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパー-ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)、および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、独立に、水素原子であるか、または置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキル、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、またはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は一緒に一つのリングを形成し；

R<sub>9</sub>は水素原子であるか、またはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；および

Xは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリー

ル( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、( $C_{9\sim 12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim 12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

【請求項 29】

該置換基Xが、置換または無置換の( $C_{3\sim 7}$ )シクロアルキル基である、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 30】

該置換基Xが、置換または無置換の( $C_{3\sim 7}$ )ヘテロシクロアルキル基である、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 31】

該置換基Xが、置換または無置換のアリール基である、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 32】

該置換基Xが、置換または無置換のフェニル基である、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 33】

該置換基Xが、置換または無置換のヘテロアリール基である、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 34】

該置換基Xが、リングであり、該リングの2または3位において、水素原子以外の置換基を持つ、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 35】

該置換基Xが、( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3\sim 12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1\sim 10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim 5}$ )アルキル、( $C_{9\sim 12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim 12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim 3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、シアノ、ニトロ、ハロ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、リングの2または3位に水素以外の置換基を持つ、該リングである、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 36】

該置換基Xが、置換または無置換のハロフェニルまたはジハロフェニルである、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 37】

該置換基Xが、置換または無置換のハロアリール、ハロヘテロアリール、ジハロアリールまたはジハロヘテロアリールである、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 38】

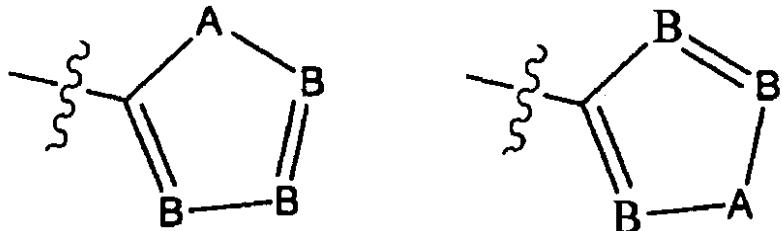
該置換基Xが、各々置換または無置換であり得る(2-シアノ)フェニル、(3-シアノ)フェニル、(2-ヒドロキシ)フェニル、(3-ヒドロキシ)フェニル、(2-アルケニル)フェニル、(3-アルケニル)フェニル、(2-アルキニル)フェニル、(3-アルキニル)フェニル、(2-メトキシ)フェニル、(3-メトキシ)フェニル、(2-ニトロ)フェニル、(3-ニトロ)フェニル、(2-カルボキシ)フェニル、(3-カルボキシ)フェニル、(2-カルボキサミド)フェニル、(3-カルボキサミド)フェニル、(2-スルホナミド)フェニル、(3-スルホナミド)フェニル、(2-テトラゾリル)フェニル、(3-テトラゾリル)フェニル、(2-アミノメチル)フェニル、(3-アミノメチル)フェニル、(2-ヒドロキシメチル)フェニル、(3-ヒドロキシメチル)フェニル、(2-フ

エニル)フェニル、(3-フェニル)フェニル、(2-ハロ)フェニル、(3-ハロ)フェニル、(2-CO-NH<sub>2</sub>)フェニル、(3-COHN<sub>2</sub>)フェニル、(2-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-NH<sub>2</sub>)フェニル、(3-NH<sub>2</sub>)フェニル、(2-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、(3-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、(2-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、(3-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、(2-アリール)フェニル、(3-アリール)フェニル、(2-ヘテロアリール)フェニル、(3-ヘテロアリール)フェニル、2-ブロモ-5-フルオロフェニル、2-クロロ-5-フルオロフェニル、2-シアノ-5-フルオロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、2,5-ジフルオロフェニル、2,5-ジブロモフェニル、2-ブロモ-3,5-ジフルオロフェニル、2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル、2,3,5-トリフルオロフェニル、2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-ブロモ-3,5,6-トリフルオロフェニル、2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル、2-シアノ-3,5-ジフルオロフェニル、2-シアノ-3,5,6-トリフルオロフェニル、(2-ヘテロシクロアルキル)フェニル、および(3-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 39】**

該置換基Xが、以下の一般式で表される基からなる群から選択される、請求項21～28の何れか1項に記載の化合物：

**【化13】**



ここで、AはS、OまたはNR<sub>24</sub>であり、

Bは、CR<sub>23</sub>またはNであり、

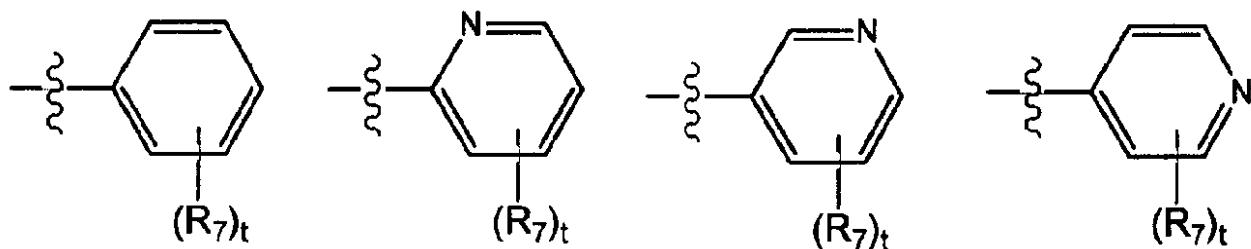
R<sub>23</sub>が、独立に、水素原子、ハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、チオ、シアノ、CF<sub>3</sub>、ニトロ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、および

R<sub>24</sub>は、独立に、水素原子、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

**【請求項 40】**

Xが、以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項21～28の何れか1項記載の化合物：

## 【化14】



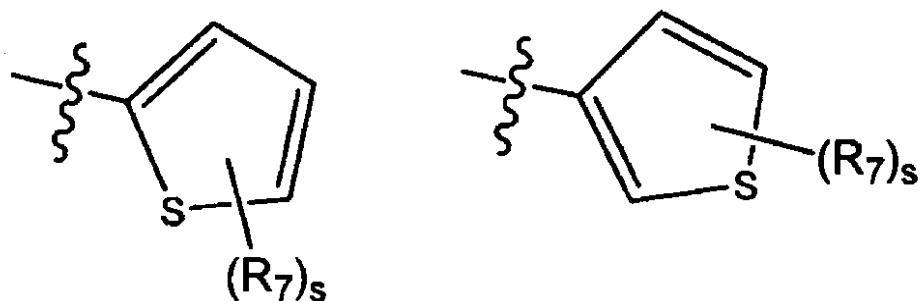
ここで、tは0、1、2、3、4または5であり、および

各 $R_7$ は、夫々独立に、ハロ、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、 $CF_3$ 、( $C_{1-10}$ )アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項41】

Xが、以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項21~28の何れか1項記載の化合物：

## 【化15】



ここで、sは0、1、2または3であり、および

各 $R_7$ は、夫々独立に、ハロ、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、 $CF_3$ 、( $C_{1-10}$ )アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

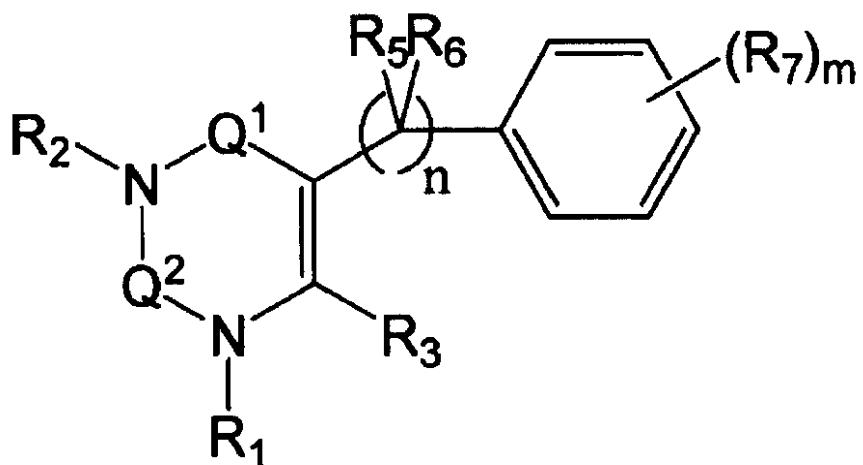
## 【請求項42】

$R_7$ が、独立に、-シアノ、-メトキシ、-ニトロ、-カルボキシ、-スルホンアミド、-テトラゾリル、-アミノメチル、-ヒドロキシメチル、-フェニル、-ハロ、-CONH<sub>2</sub>、-CONH( $C_{1-7}$ )アルキル、-CO<sub>2</sub>( $C_{1-7}$ )アルキル、-NH<sub>2</sub>、-OH、-( $C_{1-5}$ )アルキル、-アルケニル、-アルキニル、-( $C_{1-5}$ )シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクロアルキル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、請求項40または41記載の化合物。

## 【請求項43】

以下の式で表される請求項10記載の化合物：

【化16】



ここで、mは0、1、2、3、4または5であり、

nは0、1、2または3であり、

Q<sup>1</sup>およびQ<sup>2</sup>は、各々独立にCO、CS、SO、SO<sub>2</sub>およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり、

R<sub>1</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり、

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、あるいは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

R<sub>3</sub>はパーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)および置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングからなる群から選択され、

各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、夫々独立に、水素原子であるか、あるいは置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキル、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、またはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は一緒に一つのリングを形成し、

各R<sub>7</sub>は、夫々独立に、ハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)か

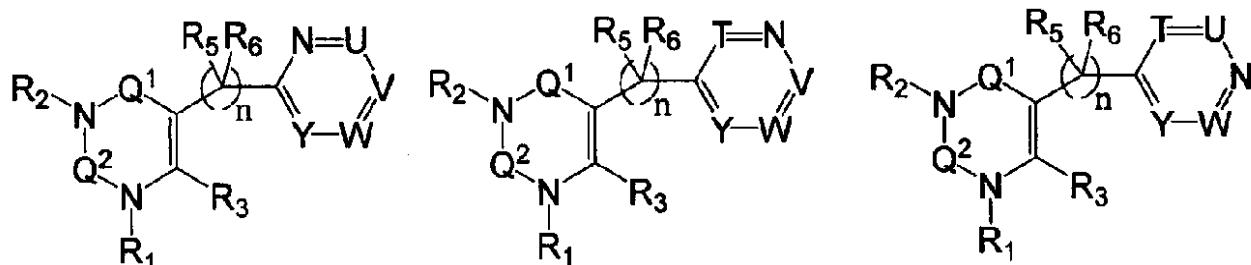
らなる群から選択され、および

$R_9$ は水素原子であるか、あるいはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

【請求項 4 4】

以下の式の何れか一つにより表される、請求項10記載の化合物：

【化 1 7】



ここで、 $n$ は1、2または3であり、

$Q^1$ および $Q^2$ は、各々独立にCO、CS、SO、 $SO_2$ およびC=NR<sub>9</sub>からなる群から選択されるものであり、

T、U、V、WおよびYの各々は、夫々独立に、窒素原子またはCR<sub>16</sub>であるが、これらT、U、V、WおよびYの多くとも2つが、窒素原子であることを条件とし、

$R_1$ は水素原子であるか、あるいはハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり、

$R_2$ は水素原子であるか、あるいは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

$R_3$ はパーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)および置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングからなる群から選択され、

各 $R_5$ および $R_6$ は、夫々独立に、水素原子であるか、あるいは置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキル、置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、シアノおよびハロからなる群から選択され、または $R_5$ および $R_6$ は一緒に一つのリングを形成し、

$R_9$ は水素原子であるか、あるいはアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリール、およびヘテロビシクロアリール(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、

各 $R_{16}$ は、夫々独立に、ハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アル

ケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)る。

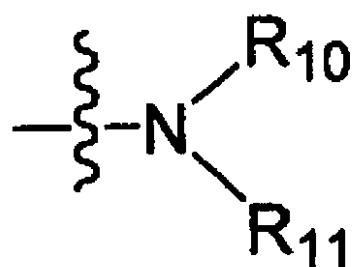
**【請求項 4 5】**

$R_3$ がアミノ、 $(C_{1-10})$ アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、およびヘテロアリール基(これらは各々置換または無置換であり得る)および置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングからなる群から選択される、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 4 6】**

$R_3$ が以下の式で表されるものである、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物：

**【化 1 8】**



ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は各々独立に、水素原子、パーアロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、 $(C_{1-10})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、 $(C_{9-12})$ ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、あるいは $R_{10}$ および $R_{11}$ は一緒に、置換または無置換の4、5、6または7員のリングを生成する。

**【請求項 4 7】**

$R_3$ が置換または無置換の3、4、5、6または7員のリングである、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 4 8】**

$R_3$ が置換または無置換の3、4、5、6または7員のシクロアルキルである、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 4 9】**

$R_3$ が置換または無置換の4、5、6または7員のヘテロシクロアルキルである、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 5 0】**

$R_3$ が置換または無置換のアリール基である、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

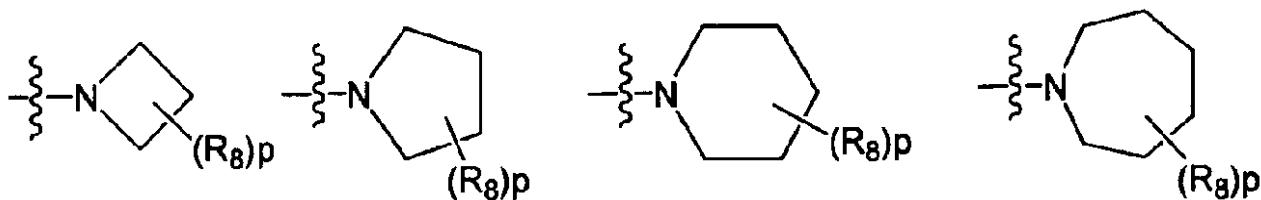
**【請求項 5 1】**

$R_3$ が置換または無置換のヘテロアリール基である、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 5 2】**

$R_3$ が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物：

## 【化19】

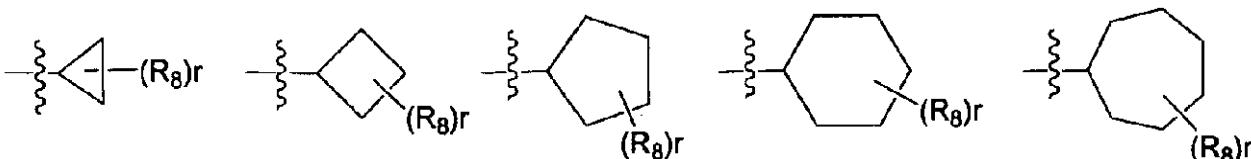


ここで、pは0-12であり、各R<sub>8</sub>は独立にハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項53】

R<sub>3</sub>が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1~44の何れか1項に記載の化合物：

## 【化20】



ここで、rは0-13であり、各R<sub>8</sub>は独立にハロ、パー哈ロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項54】

R<sub>3</sub>が各々置換または無置換であり得るフラン、チオフェン、ピロール、ピラゾール、トリアゾール、イソキサゾール、オキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、オキサジアゾール、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、トリアジン、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオフェン、イソベンゾチオフェン、イミダゾール、ベンズイミダゾール、インドール、イソインドール、キノリン、イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、ナフチリジン、ピリドピリジン、キノキサリン、フタラジン、およびベンゾチアゾールからなる群から選択される、置換または無置換のヘテロアリール基である、請求項1~44の何れか1項に記載の化合物。

## 【請求項55】

R<sub>3</sub>が(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、請求項1~44の何れか1項に記載の化合物。

## 【請求項56】

R<sub>3</sub>が置換または無置換の(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキルリングであり、場合により該リング内にO、N(O)、N、S、SO、SO<sub>2</sub>またはカルボニル基を含む、請求項1~44の何れか1項に記載の化合物。

## 【請求項57】

R<sub>3</sub>が、その中に第一、第二または第三アミン、環内窒素原子を含むヘテロシクロアルキ

ル、および環内窒素原子を含むヘテロアリール基からなる群から選択される置換基を含むように置換されている、請求項1～56の何れか1項に記載の化合物。

【請求項58】

$R_3$ が、タンパク質の活性サイト残基のカルボン酸側鎖と相互作用することができる、塩基性窒素原子を含む、請求項1～56の何れか1項に記載の化合物。

【請求項59】

$R_3$ の該塩基性窒素原子が、 $R_3$ が結合している該環構成原子から1～5原子だけ分離されている、請求項58記載の化合物。

【請求項60】

該塩基性窒素原子が、第一、第二または第三アミンの一部を形成する、請求項58記載の化合物。

【請求項61】

該塩基性窒素原子が、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基の、環内窒素原子である、請求項58記載の化合物。

【請求項62】

少なくとも一つの $R_8$ が、タンパク質の活性サイト残基のカルボン酸側鎖と相互作用することができる塩基性窒素原子を含む、請求項52または53記載の化合物。

【請求項63】

該塩基性窒素原子が、第一、第二または第三アミンの一部を形成する、請求項62記載の化合物。

【請求項64】

該塩基性窒素原子が、環内窒素原子を含むヘテロシクロアルキルまたは環内窒素原子を含むヘテロアリール基の環内窒素原子である、請求項62記載の化合物。

【請求項65】

少なくとも一つの $R_8$ が、第一、第二または第三アミンである、請求項52または53記載の化合物。

【請求項66】

少なくとも一つの $R_8$ が、環内窒素原子を含む置換または無置換のヘテロシクロアルキルまたは環内窒素原子を含む置換または無置換のヘテロアリール基である、請求項52または53記載の化合物。

【請求項67】

少なくとも一つの $R_8$ が、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-5} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_{1-5} \text{アルキル})_2$ 、ピペラジン、イミダゾールおよびピリジンからなる群から選択される、請求項52または53記載の化合物。

【請求項68】

$R_3$ が、各々置換または無置換であり得る、3-アミノピペリジン-1-イル、3-アミノメチル-ピロリジン-1-イル、3-アミノアゼチジン-1-イル、3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル、3-アミノシクロペント-1-イル、3-アミノメチルシクロペント-1-イル、3-アミノメチルシクロヘクス-1-イル、3-アミノヘキサヒドロアゼピン-1-イル、3-アミノシクロヘクス-1-イル、ピペラジン-1-イル、ホモピペラジン-1-イル、3-アミノピロリジン-1-イル、R-3-アミノピペリジン-1-イル、R-3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル、3-アミノシクロヘクス-1-イル、3-アミノシクロペント-1-イルおよび3-アミノピロリジン-1-イルからなる群から選択される、請求項1～44の何れか1項に記載の化合物。

【請求項69】

$Q^1$ および $Q^2$ の少なくとも一つがCOである、請求項1、2、4～21および22～68の何れか1項に記載の化合物。

【請求項70】

$Q^1$ および $Q^2$ がCOである、請求項1、2、4～21および22～68の何れか1項に記載の化合物。

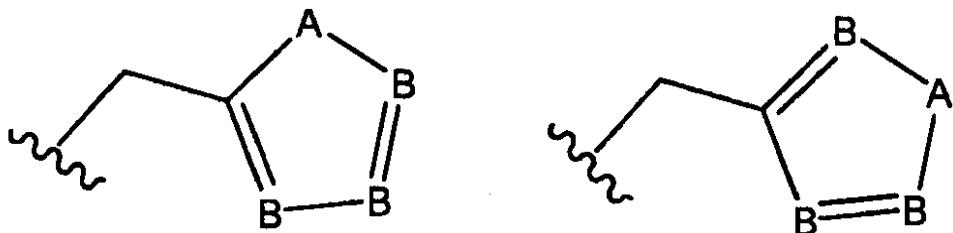
【請求項71】

Mが窒素である、請求項1～19の何れか1項に記載の化合物。

## 【請求項 7 2】

MがCR<sub>4</sub>であり、かつR<sub>4</sub>が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～19の何れか1項に記載の化合物：

## 【化 2 1】



ここで、AはS、OまたはNR<sub>24</sub>であり、

Bは、CR<sub>23</sub>またはNであり、

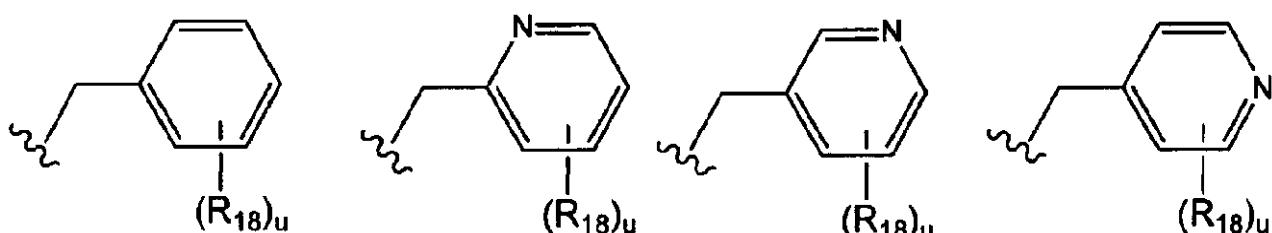
R<sub>23</sub>が、独立に、水素原子、ハロ、パーハロ(C<sub>1～10</sub>)アルキル、アミノ、チオ、シアノ、CF<sub>3</sub>、ニトロ、(C<sub>1～10</sub>)アルキル、(C<sub>3～12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3～12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1～10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1～5</sub>)アルキル、(C<sub>9～12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8～12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1～3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1～3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、および

R<sub>24</sub>は、独立に、水素原子、パー哈ロ(C<sub>1～10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1～10</sub>)アルキル、(C<sub>3～12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3～12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1～10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1～5</sub>)アルキル、(C<sub>9～12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>8～12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1～3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1～3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項 7 3】

MがCR<sub>4</sub>であり、かつR<sub>4</sub>が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～19の何れか1項記載の化合物：

## 【化 2 2】



ここで、uは0、1、2、3、4または5であり、および

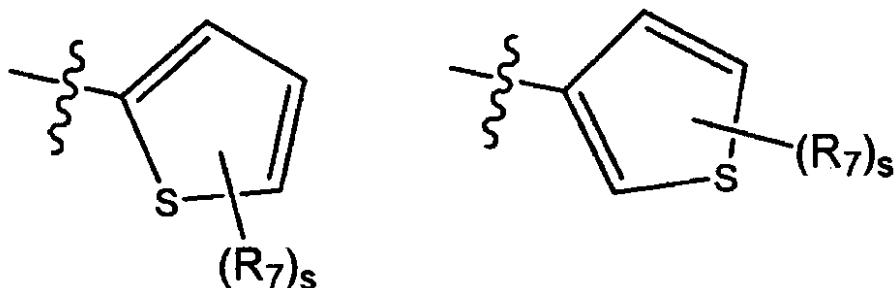
各R<sub>18</sub>は、夫々独立に、ハロ、パー哈ロ(C<sub>1～10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1～10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項 7 4】

MがCR<sub>4</sub>であり、かつR<sub>4</sub>が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～1

9の何れか1項記載の化合物：

【化23】



ここで、sは0、1、2または3であり、および

各R<sub>7</sub>は、夫々独立に、ハロ、パー・ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

【請求項75】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が水素原子である、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項76】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>がハロゲン原子である、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項77】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が一緒にリングを形成する、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項78】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>の少なくとも一つが、置換または無置換の-(C<sub>1-8</sub>)アルキレン-R<sub>13</sub>であり、ここでR<sub>13</sub>が、各々置換または無置換の(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>6-12</sub>)アリール、ヘテロ(C<sub>5-12</sub>)アリール、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール基からなる群から選択される請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項79】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が水素原子であり、mが1または2であり、かつ各R<sub>7</sub>が独立に各々置換または無置換のハロ、パー・ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択される、請求項18および43の何れか1項記載の化合物。

【請求項80】

2つのR<sub>7</sub>が一緒に、置換または無置換の、縮合または架橋リングを形成する、請求項18および43の何れか1項記載の化合物。

【請求項81】

nが1、2または3であり、およびR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が水素原子である、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項82】

$n$ が1または2であり、 $R_3$ がアミノ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基並びに置換または無置換の4、5、6または7員のリングからなる群から選択され、かつ $R_5$ および $R_6$ が水素原子である、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項 8 3】

$R_5$ および $R_6$ が水素原子であり、かつ $R_7$ が2-シアノ基である、請求項18および43の何れか1項記載の化合物。

【請求項 8 4】

$n$ が1である、請求項83記載の化合物。

【請求項 8 5】

$n$ が1、2または3であり、 $R_5$ および $R_6$ が水素原子であり、かつ $R_3$ が( $C_{3\sim12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3\sim12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1\sim10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim5}$ )アルキル、( $C_{9\sim12}$ )ビシクロアリール、およびヘテロ( $C_{4\sim12}$ )ビシクロアリール基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、請求項10、18、19、28、43および44の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 8 6】

$n$ が1、2または3であり、 $R_5$ および $R_6$ が水素原子であり、かつ各 $R_7$ が独立に、各々置換または無置換のハロ、パーハロ( $C_{1\sim10}$ )アルキル、アルケニル、アルキニル、 $CF_3$ 、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、ヘテロアリール、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択される、請求項18および43の何れか1項記載の化合物。

【請求項 8 7】

2つの $R_7$ が一緒に、置換または無置換縮合リングを形成する、請求項15、16、18および40-43の何れか1項記載の化合物。

【請求項 8 8】

2つの $R_7$ が一緒に、置換または無置換架橋リングを形成する、請求項15、16、18および40-43の何れか1項記載の化合物。

【請求項 8 9】

$T$ 、 $U$ 、 $V$ 、 $W$ および $Y$ の内の2つが、利用可能な原子価を介して結合し、および置換されて、これら $T$ 、 $U$ 、 $V$ 、 $W$ および $Y$ によって形成されるリングと縮合、またはこれと架橋した、置換または無置換のリングを形成する、請求項19および44の何れか1項記載の化合物。

【請求項 9 0】

$R_2$ が置換または無置換の( $C_{1\sim10}$ )アルキル基である、請求項1~89の何れか1項記載の化合物。

【請求項 9 1】

$R_2$ が置換または無置換の( $C_{1\sim4}$ )アルキル基である、請求項1~89の何れか1項記載の化合物。

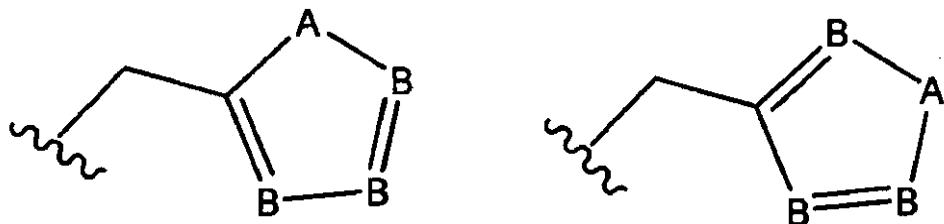
【請求項 9 2】

$R_2$ が-Y-Zであり、ここでYは、Zと、Yが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離を与えるリンカーであり、該分離を与える該リンカーの原子が炭素、酸素、窒素および硫黄から選択され、かつZが水素原子であるか、あるいは( $C_{1\sim10}$ )アルキル、( $C_{3\sim12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3\sim12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1\sim10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1\sim5}$ )アルキル、( $C_{9\sim12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4\sim12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1\sim3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1\sim3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1\sim3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1\sim3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1\sim3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される、請求項1~89の何れか1項記載の化合物。

【請求項 9 3】

$R_2$ が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～89の何れか1項に記載の化合物：

## 【化24】



ここで、AはS、Oまたは $NR_{24}$ であり、

Bは、 $CR_{23}$ またはNであり、

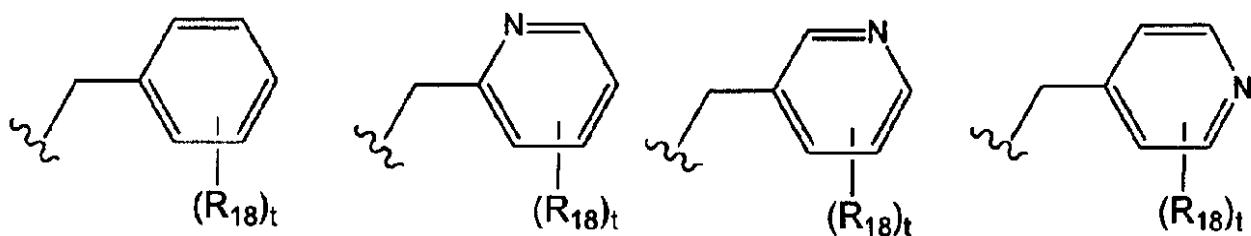
$R_{23}$ が、独立に、水素原子、ハロ、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、チオ、シアノ、 $CF_3$ 、ニトロ、( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{8-12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、および

$R_{24}$ は、独立に、水素原子、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、アミノ、( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{8-12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項94】

$R_2$ が以下の式で表される基からなる群から選択される、請求項1～89の何れか1項記載の化合物：

## 【化25】



ここで、tは0、1、2、3、4または5であり、および

各 $R_{18}$ は、夫々独立に、ハロ、パーハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、 $CF_3$ 、( $C_{1-10}$ )アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

## 【請求項95】

以下に列挙する化合物からなる群から選択される、請求項1～94の何れか1項記載の化合物：2-(6-クロロ-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル)-ベンゾニト

リル；2-(6-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル)-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-5-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-プロモベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-ヨードベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-プロモベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-アミノエチルアミノ)-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル(14)；2-[6-(3-アミノアゼパン-1-イル)-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(2-アミノエチルアミノ)-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(3-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(3-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(4-ピラゾール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3-(3-ピロール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3-(4-ピラゾール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-3,6-ジフルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-3,6-ジフルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；および(R)-2-((6-(3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル)-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)メチル)-4-フルオロベンゾニトリル。

#### 【請求項 9 6】

以下に列挙する化合物からなる群から選択される、請求項1~94の何れか1項記載の化合物：2-[6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-5-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-ヨードベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン

-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(3-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(4-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-2,4-ジオキソ-3-(4-ピラゾール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-2,4-ジオキソ-3-(3-ピロール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；3-{4-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-安息香酸メチルエステル；3-{4-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-安息香酸；および6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1,3-ビス-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン。

**【請求項 9 7】**

該化合物が製薬上許容される塩の状態にある、請求項1～96の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 9 8】**

該化合物が立体異性体混合物として存在する、請求項1～97の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 9 9】**

該化合物が単一の立体異性体を含む、請求項1～97の何れか1項に記載の化合物。

**【請求項 1 0 0】**

活性成分として、請求項1～99の何れか1項記載の化合物を含むことを特徴とする、薬理組成物。

**【請求項 1 0 1】**

該組成物が、経口投与に適した固体処方物である、請求項100記載の薬理組成物。

**【請求項 1 0 2】**

該組成物が錠剤である、請求項100記載の薬理組成物。

**【請求項 1 0 3】**

該組成物が経口投与に適した液状処方物である、請求項100記載の薬理組成物。

**【請求項 1 0 4】**

該組成物が非経口投与に適した液状処方物である、請求項100記載の薬理組成物。

**【請求項 1 0 5】**

請求項1～99の何れか1項に記載の化合物を含み、経口、腸管外、腹腔内、静脈内、動脈内、経皮、舌下、筋肉内、経直腸、経口腔、経鼻、リポソーム、吸入、経膣、眼内、局所放出(例えば、カテーテルまたはステントによる放出)、皮下、脂肪内、関節内、および胞膜内投与からなる群から選択される、経路によって投与するのに適した、薬理組成物。

**【請求項 1 0 6】**

請求項1～99の何れか1項に記載の化合物；および

該化合物を投与すべき疾患状態に関する表示、該化合物の保存に関する情報、用量に関する情報、および該化合物を投与する方法に関する指示からなる群から選択される、1種以上の情報を含む、ことを特徴とする、キット。

**【請求項 1 0 7】**

多重投与剤形にある該化合物を含む、請求項106記載のキット。

**【請求項 1 0 8】**

請求項1～99の何れか1項に記載の化合物；および  
包装材料、を含むことを特徴とする、製品。

【請求項109】

該包装材料が、該化合物を収納するための容器を含む、請求項108記載の製品。

【請求項110】

該容器が、該化合物を投与すべき疾患状態、該化合物の保存に関する情報、用量に関する情報、および/または該化合物を投与する方法に関する指示からなる群から選択される、1種以上の情報を示すラベル含む、請求項109記載の製品。

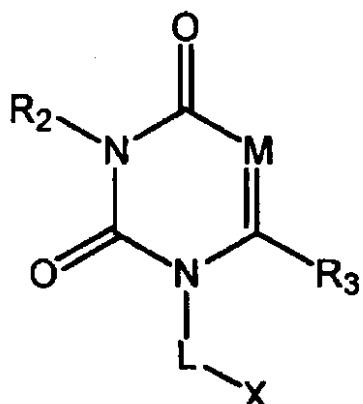
【請求項111】

該製品が、多重投与剤形にある該化合物を含む、請求項108記載の製品。

【請求項112】

以下の式で表されるピリミジン-ジオン：

【化26】



ここで、MはNまたはCR<sub>4</sub>であり；

R<sub>2</sub>は水素原子であるか、または(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

R<sub>3</sub>はパー-ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)および置換または無置換の3、4、5、6または7-員のリングからなる群から選択される基であり；

R<sub>4</sub>は水素原子であるか、あるいはハロ、パー-ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、シアノ、チオ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基であり；

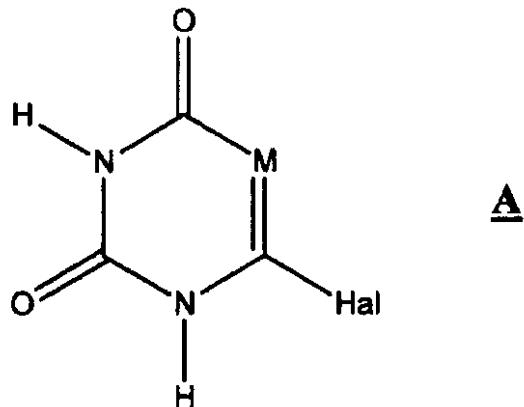
Lは、Xと、Lが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーハーであり、ここで該分離を与える該リンカーハーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄か

らなる群から選択され；および

Xは( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビシクロアリール、ヘテロ( $C_{4-12}$ )ビシクロアリール、カルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-3}$ )アルキル、イミノ( $C_{1-3}$ )アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である。

の製法であって、該製法が、(i) 以下の式Aで表される化合物：

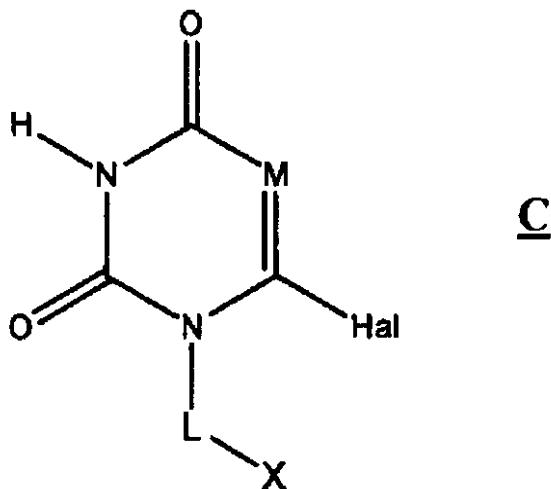
【化 2 7】



(ここで、 $\text{Hal}$ はハロゲン原子である)と、以下の式Bで表される化合物：

X-L-LG B  
 (ここでLGは脱離基であり；LはXと、Lが結合しているリングとの間に、1、2または3原子分の分離をもたらすリンカーであり、但し該分離を与える該リンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択されることを条件とし；およびXは(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である)とを、以下の式Cで表される化合物を製造するのに十分な条件下で接触させる工程：

【化 2 8】

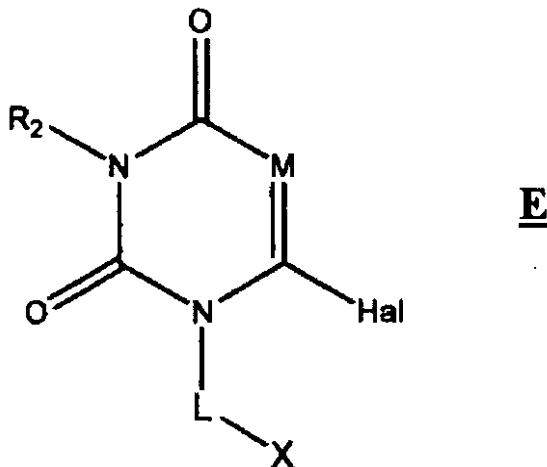


(ii) 得られた式Cの化合物と、以下の式Dで表される化合物：



(ここでLG'は脱離基である)とを、以下の式Eで表される化合物を製造するのに十分な条件下で接触させる工程：

【化29】



(ここで、R<sub>2</sub>は(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される基である)、および

(iii) 得られた式Eの化合物と式：R<sub>3</sub>-Hで表される化合物とを、上記ピリミジン-ジオンを製造するのに十分な条件下で接触させる工程を含むことを特徴とする、上記方法。

【請求項113】

該ピリミジン-ジオン生成物を、更に酸付加塩に転化する、請求項112記載の方法。

【請求項114】

該酸付加塩が、酢酸塩、クエン酸塩、塩酸塩、L-乳酸塩、琥珀酸塩、硫酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、ナフチレン-2-スルホン酸塩、プロピオン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、R-マンデル酸塩、およびL-酒石酸塩からなる群から選択される、請求項113記載の方法。

【請求項115】

該Halが上記式Aにおいて、Br、ClおよびFからなる群から選択される、請求項112記載の方法。

【請求項116】

該脱離基LGが、Br、ClおよびIからなる群から選択される、請求項112記載の方法。

【請求項117】

上記工程(ii)が、更に塩基を添加する工程をも含む、請求項112記載の方法。

【請求項118】

該塩基が、炭酸カリウムである、請求項117記載の方法。

【請求項119】

該生成物Eを、上記工程(iii)にかける前に、更に精製する工程を含む、請求項112記載の方法。

【請求項120】

該生成物Eの精製を、溶媒洗浄および/またはクロマトグラフィーによって行う、請求項119記載の方法。

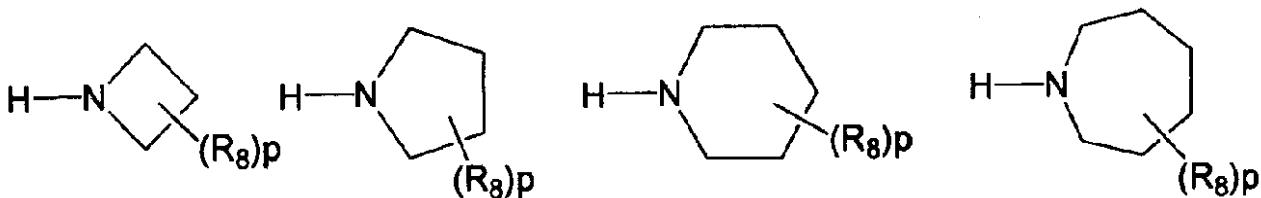
**【請求項121】**

該R<sub>3</sub>-Hが、第二アミンまたはアミンの塩酸塩である、請求項112記載の方法。

**【請求項122】**

該R<sub>3</sub>-Hの化合物が、以下の式で表される化合物またはそのモノ-またはジ-塩酸塩からなる群から選択される、請求項112記載の方法：

**【化30】**



ここで、pは0-12であり、かつ各R<sub>8</sub>は独立にハロ、パーハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、CF<sub>3</sub>、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択される。

**【請求項123】**

上記工程(iii)が、更に該生成物の有機溶媒または溶媒混合物による洗浄および/またはカラムクロマトグラフィーによる精製工程をも含む、請求項112記載の方法。

**【請求項124】**

該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-、-O-、-OCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>O-、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>-、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-N(CH<sub>3</sub>)-、-NHCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>-、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-、-NHC(O)-、-N(CH<sub>3</sub>)C(O)-、-C(O)NH-、-C(O)N(CH<sub>3</sub>)-、-NHC(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)NHCH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>NHC(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)NH-、-NHCH<sub>2</sub>C(O)-、-S-、-SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>S-、-SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S-、-C(O)S-、-C(O)SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)S-、-C(O)CH<sub>2</sub>S-、および-CH<sub>2</sub>SC(O)-からなる群から選択される、請求項112記載の方法。

**【請求項125】**

該Lが、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>C(O)-、-C(O)CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(O)CH<sub>2</sub>-、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-および-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)-からなる群から選択される、請求項124記載の方法。

**【請求項126】**

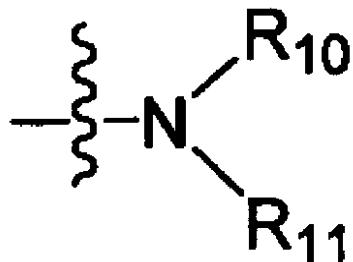
該-L-Xが一緒に、各々置換または無置換であり得る-CH<sub>2</sub>-(2-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-シアノ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルケニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アルキニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-メトキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ニトロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-カルボキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキシ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-カルボキサミド)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-テトラゾリル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アミノメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヒドロキシメチル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-フェニル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ハロ)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CONH(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-7</sub>)ア

ルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-NH<sub>2</sub>)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)アルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-(C<sub>3-7</sub>)シクロアルキル)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-アリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヘテロアリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-(3-ヘテロアリール)フェニル、-CH<sub>2</sub>-2-ブロモ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-5-フルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジクロロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,5-ジブロモフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-ブロモ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-ブロモ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-3,5-ジフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-2-シアノ-3,5,6-トリフルオロフェニル、-CH<sub>2</sub>-(2-ヘテロシクロアルキル)フェニル、および-CH<sub>2</sub>-(3-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項112記載の方法。

## 【請求項127】

MがCHであり、かつR<sub>3</sub>が以下の式で表されるものである、請求項112記載の方法：

## 【化31】



ここでR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は各々独立に、水素原子、パーアロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、ヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリール、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、スルホニル基およびスルフィニル基(これらは各々置換または無置換であり得る)からなる群から選択され、あるいはR<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は一緒に、置換または無置換の4、5、6または7員のリングを生成する。

## 【請求項128】

MがCHであり、かつR<sub>3</sub>が各々置換または無置換であり得る、3-アミノピペリジン-1-イル、3-アミノメチル-ピロリジン-1-イル、3-アミノアゼチジン-1-イル、3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル、3-アミノシクロペント-1-イル、3-アミノメチルシクロペント-1-イル、3-アミノメチルシクロヘクス-1-イル、3-アミノヘキサヒドロアゼピン-1-イル、3-アミノシクロヘクス-1-イル、ピペラジン-1-イル、ホモピペラジン-1-イル、3-アミノピロリジン-1-イル、R-3-アミノピペリジン-1-イル、R-3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル、3-アミノシクロヘクス-1-イル、3-アミノシクロペント-1-イルおよび3-アミノピロリジン-1-イルからなる群から選択される、請求項112記載の方法。

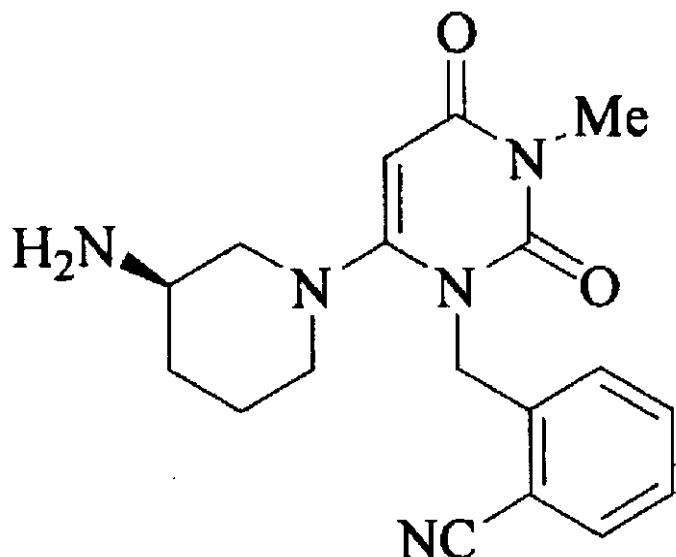
## 【請求項129】

MがCHであり、かつR<sub>2</sub>が置換または無置換の(C<sub>1-10</sub>)アルキルである、請求項112記載の方法。

## 【請求項130】

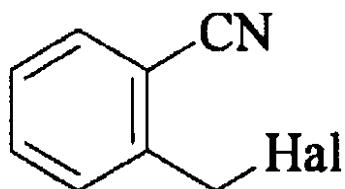
以下の式で表されるピリミジン-ジオンを製造するための請求項112記載の方法であって：

【化32】

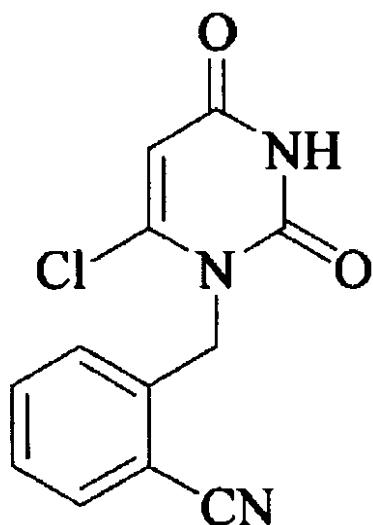


(i) 6-クロロ-1H-ピリミジン-2,4-ジオンと、以下の式で表されるアリールハライド：

【化33】

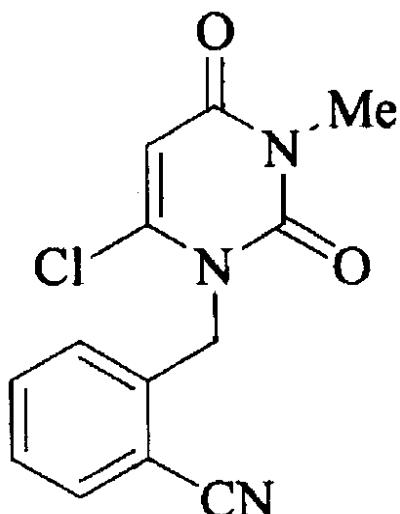
(ここで、 $\text{Hal}$ はBr、ClまたはIである)とを、以下の式で表される化合物を製造するのに十分な条件下で混合する工程：

【化34】



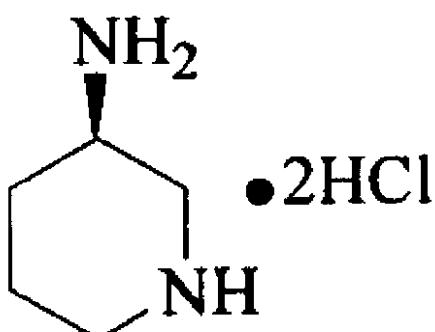
(ii) 以下の式で表される化合物を製造するのに十分な条件下で、上記生成物を、メチルハライドでアルキル化する工程：

【化35】



および(iii) 上記生成物を、以下の式で表される化合物と縮合する工程を含む：

【化36】



【請求項131】

更に、酸付加塩を形成する工程をも含む、請求項130記載のピリミジン-ジオンを製造する方法。

【請求項132】

該酸付加塩が、安息香酸塩である、請求項131記載の方法。

【請求項133】

該ピリミジン-ジオンが、以下に列挙する化合物からなる群から選択される、請求項112記載の方法：2-(6-クロロ-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル)-ベンゾニトリル；2-(6-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル)-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-5-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-5-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-プロモベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-ヨードベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；2-{6-[アゼパン-3(±)-イルアミノ]-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル(14)；2-{6-[3(±)-アミノアゼパン-1-イル]-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピ

リミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-[6-(2-アミノエチルアミノ)-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(3-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(4-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(1H-ベンズイミダゾール-2-イルメチル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3-(4-ピラゾール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；2-[6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-2,4-ジオキソ-3-(3-ピロール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-ベンゾニトリル；6-[(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-チオフェン-3-カルボニトリル；3-[4-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-安息香酸メチルエステル；3-[4-(3-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-安息香酸；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2,5-ジクロロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-3,6-ジフルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；(R)-2-((6-(3-アミノ-3-メチルピペリジン-1-イル)-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)メチル)-4-フルオロベンゾニトリル；および6-(3-アミノピペリジン-1-イル)-1,3-ビス-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン。

#### 【請求項 1 3 4】

該ピリミジン-ジオンが、以下に列挙する化合物からなる群から選択される、請求項112記載の方法：2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-エチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-5-クロロ-3-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-ヨードベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-クロロ-4-フルオロベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1-(2-プロモベンジル)-3-メチル-1H-ピリミジン-2,4-ジオン；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(3-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(4-ピラゾール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(4-シアノベンジル)-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；2-{6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-2,4-ジオキソ-3-(3-ピロール-1-イルベンジル)-3,4-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-ベンゾニトリル；6-[(3(R)-アミノピペリジン-1-イル)-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル]-チオフェン-3-カルボニトリル；3-{4-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-

イルメチル}-安息香酸メチルエステル；3-{4-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-3-(2-シアノベンジル)-2,6-ジオキソ-3,6-ジヒドロ-2H-ピリミジン-1-イルメチル}-安息香酸；および6-[3(R)-アミノピペリジン-1-イル]-1,3-ビス-(2-プロモ-5-フルオロベンジル)-1H-ピリミジン-2,4-ジオン。

【請求項 1 3 5】

該ピリミジン-ジオンが立体異性体混合物として存在する、請求項112記載の方法。

【請求項 1 3 6】

該ピリミジン-ジオンが、単一の立体異性体を含む、請求項112記載の方法。

【請求項 1 3 7】

医薬として使用するための請求項1～99の何れか1項に記載の化合物。

【請求項 1 3 8】

DPP-IVを阻害するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 3 9】

DPP-IVが疾患状態の病理および/または症候に寄与する活性を持つ、該疾患状態を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 0】

癌を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 1】

タイプIまたはタイプII糖尿病を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 2】

自己免疫疾患を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 3】

リンパ細胞または造血細胞の活性化またはその濃度が不十分なことにより特徴付けられる状態を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 4】

HIV感染を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4 5】

免疫不全症候群によって特徴付けられる状態を治療するための医薬の製造における、請求項1～99の何れか1項に記載の化合物の使用。