

【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21年6月4日(2009.6.4)

【公表番号】特表2008-540547(P2008-540547A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-511281(P2008-511281)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/541	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/497	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/14	1 0 2
C 0 7 D	471/14	C S P
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月14日(2009.4.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

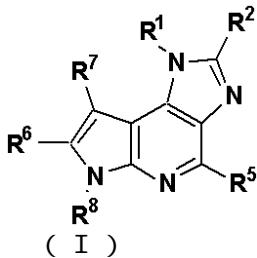
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(I)

〔式中、

R¹は、水素、C₁～₃アルキル、C₂～₃アルケニル、およびC₂～₃アルキニルから選択され、

R²は、水素、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、およびペルフルオロアルキルから選択され、

R⁵は、

(a) 水素およびハロ、

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、およびハロアルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1b}、Z^{2b}およびZ^{3b}によって独立して適宜置換されてもよい)、

(c) -OR¹¹、-SR¹¹および-NR³R⁴

から選択され、

R³およびR⁴は、独立して、

(a) 水素、

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1b}、Z^{2b}およびZ^{3b}によって独立して適宜置換されてもよい)、

(c) -OR¹¹、-NR¹²R¹³、-N(R¹²)C(O)R¹⁴、-N(R¹²)C(O)O R¹⁴、-N(R¹²)SO₂R¹⁴、-N(R¹²)C(O)NR^{12a}R¹³、-N(R¹²)SO₂NR^{12a}R¹³、-C(O)NR¹²R¹³、-SO₂R¹⁴、または-SO₂NR¹²R¹³、

(d) R³およびR⁴は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1b}、Z^{2b}およびZ^{3b}によって独立して適宜置換されてもよい3～8員の複素環を形成すること

から選択され、

R⁶は、

(a) アルキル、アルケニル、アルキニル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1f}によって置換されている)；シクロアルキル、ヘテロシクロ、アリール、ヘテロアリール、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキル、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1d}、Z^{2d}およびZ^{3d}によって独立して適宜置換されてもよい)、あるいは

(b) -SR^{7a}、-SO₂R¹⁰、-SO₂NR^{8b}R^{9b}、C(O)R^{7a}、-C(O)OR^{7a}、または-C(O)NR^{8a}R^{9a}であり、

R⁷は、

(a) 水素、ハロ、またはシアノ、あるいは

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロ、アリール、ヘテロアリール、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキル、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1c} 、 Z^{2c} および Z^{3c} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

R^{7a} は、独立して、

(a) 水素、あるいは

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1c} 、 Z^{2c} および Z^{3c} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

R^{8a} は、

(c) 水素、

(d) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよい)、あるいは

(c) $-SO_2R^{10}$ 、 $-SO_2NR^{8b}R^{9b}$ 、 $-C(O)OR^{7a}$ 、または $-C(O)NR^{8a}R^{9a}$ であり、

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{9a} および R^{9b} は、独立して、

(a) 水素、

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよい)、

(c) R^{8a} および R^{9a} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい3~8員の複素環を形成し、あるいは

(d) R^{8b} および R^{9b} は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい3~8員の複素環を形成し、

R^{10} は、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{12a} および R^{13} は、独立して、

(a) 水素、あるいは

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1e} 、 Z^{2e} および Z^{3e} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

R^{14} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも

原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1e} 、 Z^{2e} および Z^{3e} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

$Z^{1a \sim 1e}$ 、 $Z^{2a \sim 2e}$ 、および $Z^{3a \sim 3e}$ は、各々独立して、 $-W^1 - V^1$ 、 $-W^2 - V^2$ 、 $-W^3 - V^3$ 、 $-W^4 - V^4$ 、 $-W^5 - V^5$ から選択される任意の置換基であり、

上式で、 $W^{1 \sim 5}$ は、独立して、

(1) 結合、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の $V^{1 \sim 5}$ によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、あるいは

上式で、 $V^{1 \sim 5}$ は、独立して、

(1) H、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の $V^{1 \sim 5}$ の(3)~(28)の基によって独立して適宜置換されていてもよい)、

(3) $-U^1 - O - Y^5$ 、

(4) $-U^1 - S - Y^5$ 、

(5) $-U^1 - C(O)_t - H$ 、 $-U^1 - C(O)_t - Y^5$ (式中、 t は1または2である)、

(6) $-U^1 - SO_3 - H$ 、または $-U^1 - S(O)_t Y^5$ 、

(7) $-U^1 - \text{ハロ}$ 、

(8) $-U^1 - \text{シアノ}$ 、

(9) $-U^1 - \text{ニトロ}$ 、

(10) $-U^1 - NY^2 Y^3$ 、

(11) $-U^1 - N(Y^4) - C(O) - Y^1$ 、

(12) $-U^1 - N(Y^4) - C(S) - Y^1$ 、

(13) $-U^1 - N(Y^4) - C(O) - NY^2 Y^3$ 、

(14) $-U^1 - N(Y^4) - C(O) - C(O) - NY^2 Y^3$ 、

(15) $-U^1 - N(Y^4) - C(O) - C(O) - OY^5$ 、

(16) $-U^1 - N(Y^4) - C(S) - NY^2 Y^3$ 、

(17) $-U^1 - N(Y^4) - C(O)O - Y^5$ 、

(18) $-U^1 - N(Y^4) - S(O)_2 - Y^1$ 、

(19) $-U^1 - N(Y^4) - S(O)_2 - NY^2 Y^3$ 、

(20) $-U^1 - C(O) - NY^2 Y^3$ 、

(21) $-U^1 - OC(O) - NY^2 Y^3$ 、

(22) $-U^1 - OC(O) - OY^5$ 、

(23) $-U^1 - S(O)_2 - N(Y^4) - Y^1$ 、

(24) $-U^1 - N(Y^4) - C(=NV^{1a}) - NY^2 Y^3$ 、

(25) $-U^1 - N(Y^4) - C(=NV^{1a}) - Y^1$ 、

(26) $-U^1 - C(=NV^{1a}) - NY^2 Y^3$ 、

(27) オキソ、

(28) $-U^1 - Y^5$ であり、

Z^{1f} は、各々独立して、

(1) シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)

) アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1f} の(2)~(25)の基によって置換されていてもよい)、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル、

(3) -U¹-O-Y⁵、

(4) -U¹-S-Y⁵、

(5) -U¹-C(O)_t-H、-U¹-C(O)_t-Y⁵(式中、tは1または2である)、

(6) -U¹-SO₃-H、または-U¹-S(O)_tY⁵、

(7) -U¹-ハロ、

(8) -U¹-シアノ、

(9) -U¹-ニトロ、

(10) -U¹-NY²Y³、

(11) -U¹-N(Y⁴)-C(O)-Y¹、

(12) -U¹-N(Y⁴)-C(S)-Y¹、

(13) -U¹-N(Y⁴)-C(O)-NY²Y³、

(14) -U¹-N(Y⁴)-C(S)-NY²Y³、

(15) -U¹-N(Y⁴)-C(O)O-Y⁵、

(16) -U¹-N(Y⁴)-S(O)₂-Y¹、

(17) -U¹-N(Y⁴)-S(O)₂-NY²Y³、

(18) -U¹-C(O)-NY²Y³、

(19) -U¹-OC(O)-NY²Y³

(20) -U¹-S(O)₂-N(Y⁴)-Y¹、

(21) -U¹-N(Y⁴)-C(=NV^{1a})-NY²Y³、

(22) -U¹-N(Y⁴)-C(=NV^{1a})-Y¹、

(23) -U¹-C(=NV^{1a})-NY²Y³、

(24) オキソ、

(25) -U¹-Y⁵

から選択され、

V^{1a} は、独立して、水素、アルキル、-CN、-C(O)Y¹、-S(O)₂Y⁵、-C

(O)NY²Y³、S(O)₂NY²Y³であり、

Y¹、Y²、Y³、Y⁴およびY⁵は、

(1) それぞれ独立して、水素、アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^4 、 Z^5 および Z^6 によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、あるいは

(2) Y²およびY³は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^4 、 Z^5 および Z^6 によって独立して適宜置換されていてもよい3~8員の複素環を形成し、あるいは

(4) Y²およびY³は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、-N=C Y⁶ Y⁷基(式中、Y⁶およびY⁷は、互いに独立して、Hまたはアルキルである)を形成してもよく、ならびに

Z⁴、Z⁵、およびZ⁶は、

(1) H、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、

アルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル、

(3) - U¹ - O - Y^{5a}、

(4) - U¹ - S - Y^{5a}、

(5) - U¹ - C(O)_t - H、- U¹ - C(O)_t - Y^{5a} (式中、tは1または2である)、

(6) - U¹ - SO₃ - H、または - U¹ - S(O)_t Y^{5a}、

(7) - U¹ - ハロ、

(8) - U¹ - シアノ、

(9) - U¹ - ニトロ、

(10) - U¹ - NY^{2a}Y^{3a}、

(11) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(O) - Y^{1a}、

(12) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(S) - Y^{1a}、

(13) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(O) - NY^{2a}Y^{3a}、

(14) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(S) - NY^{2a}Y^{3a}、

(15) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(O)O - Y^{5a}、

(16) - U¹ - N(Y^{4a}) - S(O)₂ - Y^{1a}、

(17) - U¹ - N(Y^{4a}) - S(O)₂ - NY^{2a}Y^{3a}、

(18) - U¹ - C(O) - NY^{2a}Y^{3a}、

(19) - U¹ - OC(O) - NY^{2a}Y^{3a}

(20) - U¹ - S(O)₂ - N(Y^{4a}) - Y^{1a}、

(21) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(=NV^{1b}) - NY^{2a}Y^{3a}、

(22) - U¹ - N(Y^{4a}) - C(=NV^{1b}) - Y^{1a}、

(23) - U¹ - C(=NV^{1b}) - NY^{2a}Y^{3a}、

(24) オキソ、

(25) - U¹ - Y^{5a}

から各々独立して選択される任意の置換基であり、

V^{1b}は、独立して、水素、アルキル、-CN、-C(O)Y^{1a}、-S(O)₂Y^{5a}、S(O)₂NY^{2a}Y^{3a}であり、

Y^{1a}、Y^{2a}、Y^{3a}、Y^{4a}およびY^{5a}は、

(1) それぞれ独立して、水素、アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキルであり、

U¹は、独立して、

(1) 単結合、

(2) アルキレン、

(3) アルケニレン、あるいは

(4) アルキニレンである】

の化合物およびその塩。

【請求項2】

R³およびR⁴が、独立して、

(a) 水素、

(b) アルキル、ハロアルキル、(ヒドロキシ)アルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ^{1b}、Z^{2b}およびZ^{3b}によって独立して適宜置換されていてもよい)、

(c) -N R¹² R¹³、あるいは

(d) R^3 および R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されてもよい3~8員の複素環を形成する、

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^6 が、

(a) アルキル、アルケニル、アルキニル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1f} によって置換されている)、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されてもよい)、あるいは

(b) $-C(O)R^{7a}$ 、 $-C(O)OR^{7a}$ 、または $-C(O)NR^{8a}R^{9a}$ である、
請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R^{7a} が、独立して、

(a) 水素、あるいは

(b) アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1c} 、 Z^{2c} および Z^{3c} によって独立して適宜置換されてもよい)から選択される、請求項1から3のいずれかに記載の化合物。

【請求項5】

R^3 および R^4 が、独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、(ヒドロキシ)アルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキルまたは(ヘテロアリール)アルキル(これらは原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されてもよい)； $-NR^{12}R^{13}$ であり、

あるいは R^3 および R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、ピペラジニル、およびアゼチジニル(原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されてもよい)から選択される3~6員の複素環を形成し、

R^6 が、

(a) アルキル(原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1f} によって置換されている)；アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されてもよい)、あるいは

(b) $-C(O)R^{7a}$ 、 $-C(O)OR^{7a}$ 、または $-C(O)NR^{8a}R^{9a}$ である、
請求項1から4のいずれかに記載の化合物。

【請求項6】

R^1 が、水素、メチル、エチル、プロピル、*i*-プロピル、プロペ-2-ニル、プロペ-1-ニルであり、ならびに

R^2 が、水素、メチル、トリフルオロメチル、およびフェニルである、
請求項1から5のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

R^1 が、水素および $C_{1~3}$ アルキルから選択され、

R^6 が、

(a) アルキル、アルケニル、アルキニル(これらはいずれも原子価が許す場合には、

1つもしくは複数の Z^{1f} によって置換されている) ; シクロアルキル、ヘテロシクロ、アリール、ヘテロアリール、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキル、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよい)、あるいは

(b) - C(O)R^{7a}、- C(O)OR^{7a}、または - C(O)NR^{8a}R^{9a} であり、
 $Z^{1a} \sim 1e$ 、 $Z^{2a} \sim 2e$ 、および $Z^{3a} \sim 3e$ が、各々独立して、- W¹- V¹、- W²- V²、- W³- V³、- W⁴- V⁴、- W⁵- V⁵ から選択される任意の置換基であり、

上式で、W¹ ~ 5 が、独立して、

(1) 結合、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキルであり、あるいは

上式で、V¹ ~ 5 が、独立して、

(1) H、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の V¹ ~ 5 の(3) ~ (28) の基によって独立して適宜置換されていてもよい)、

(3) - U¹- O - Y⁵、

(4) - U¹- S - Y⁵、

(5) - U¹- C(O)_t- H、- U¹- C(O)_t- Y⁵ (式中、t は 1 または 2 である)、

(6) - U¹- SO₃- H、または - U¹- S(O)_tY⁵、

(7) - U¹- ハロ、

(8) - U¹- シアノ、

(9) - U¹- ニトロ、

(10) - U¹- NY²Y³、

(11) - U¹- N(Y⁴) - C(O) - Y¹、

(12) - U¹- N(Y⁴) - C(S) - Y¹、

(13) - U¹- N(Y⁴) - C(O) - NY²Y³、

(14) - U¹- N(Y⁴) - C(O) - C(O) - NY²Y³、

(15) - U¹- N(Y⁴) - C(O) - C(O) - OY⁵、

(16) - U¹- N(Y⁴) - C(S) - NY²Y³、

(17) - U¹- N(Y⁴) - C(O)O - Y⁵、

(18) - U¹- N(Y⁴) - S(O)₂ - Y¹、

(19) - U¹- N(Y⁴) - S(O)₂ - NY²Y³、

(20) - U¹- C(O) - NY²Y³、

(21) - U¹- OC(O) - NY²Y³、

(22) - U¹- OC(O) - OY⁵、

(23) - U¹- S(O)₂- N(Y⁴) - Y¹、

(24) - U¹- N(Y⁴) - C(=NV^{1a}) - NY²Y³、

(25) - U¹- N(Y⁴) - C(=NV^{1a}) - Y¹、

(26) - U¹- C(=NV^{1a}) - NY²Y³、

(27) オキソ、

(28) - U¹- Y⁵ であり、

Z^{1f} が、各々独立して、

(1) シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(原子価が許す場合には、(2)～(25)の基によって適宜置換されていてもよい)、

(2) アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル、

(3) -U¹-O-Y⁵、

(4) -U¹-S-Y⁵、

(5) -U¹-C(O)_t-H、-U¹-C(O)_t-Y⁵(式中、tは1または2である)、

(6) -U¹-SO₃-H、または-U¹-S(O)_tY⁵、

(7) -U¹-ハロ、

(8) -U¹-シアノ、

(9) -U¹-ニトロ、

(10) -U¹-NY²Y³、

(11) -U¹-N(Y⁴)-C(O)-Y¹、

(12) -U¹-N(Y⁴)-C(S)-Y¹、

(13) -U¹-N(Y⁴)-C(O)-NY²Y³、

(14) -U¹-N(Y⁴)-C(S)-NY²Y³、

(15) -U¹-N(Y⁴)-C(O)O-Y⁵、

(16) -U¹-N(Y⁴)-S(O)₂-Y¹、

(17) -U¹-N(Y⁴)-S(O)₂-NY²Y³、

(18) -U¹-C(O)-NY²Y³、

(19) -U¹-OC(O)-NY²Y³

(20) -U¹-S(O)₂-N(Y⁴)-Y¹、

(21) -U¹-N(Y⁴)-C(=NV^{1a})-NY²Y³、

(22) -U¹-N(Y⁴)-C(=NV^{1a})-Y¹、

(23) -U¹-C(=NV^{1a})-NY²Y³、

(24) オキソ、

(25) -U¹-Y⁵

から選択され、

V^{1a}が、独立して、水素、アルキル、-CN、-C(O)Y¹、-C(O)NY²Y³、-S(O)₂Y⁵、S(O)₂NY²Y³であり、Y¹、Y²、Y³、Y⁴およびY⁵が、

(1) それぞれ独立して、水素、アルキル、(ヒドロキシ)アルキル、(アルコキシ)アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、シクロアルケニル、(シクロアルケニル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ⁴、Z⁵およびZ⁶によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、あるいは

(2) Y²およびY³が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数のZ⁴、Z⁵およびZ⁶によって独立して適宜置換されていてもよい3～8員の複素環を形成し、あるいは

(4) Y²およびY³が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、-N=C(Y⁶Y⁷基(式中、Y⁶およびY⁷は、互いに独立して、Hまたはアルキルである)を形成してもよい、

請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

R^3 および R^4 が、独立して、

(a) 水素、

(b) アルキル、ハロアルキル、(ヒドロキシ)アルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキルまたは(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい)、

(c) $-NR^{12}R^{13}$ 、あるいは

(d) R^3 および R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい3~8員の複素環を形成する、

請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R^6 が、

(a) アルキル、アルケニル、アルキニル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1f} によって置換されている)；アリール、ヘテロアリール、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキル、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよい)、あるいは

(b) $-C(O)R^{7a}$ 、 $-C(O)OR^{7a}$ 、または $-C(O)NR^{8a}R^{9a}$ である、

請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

R^{7a} が、独立して、

(a) 水素、あるいは

(b) アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、アリール、(アリール)アルキル、ヘテロシクロ、(ヘテロシクロ)アルキル、ヘテロアリール、または(ヘテロアリール)アルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1c} 、 Z^{2c} および Z^{3c} によって独立して適宜置換されていてもよい)から選択される、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} が、アルキル、ヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-O-Y^5$ 、 $-U^1-NY^2Y^3$ 、 $-C(O)_tH$ 、 $-C(O)_tY^5$ から独立して選択される任意の置換基であり、 Z^{1c} が、

(a) $-OH$ 、 $-OY^5$ 、あるいは

(b) $-OH$ または $-OY^5$ によって適宜置換されていてもよいアリールであり、 Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} が、

(a) シアノ、ハロ、 $-OH$ 、 $-OY^5$ 、 $-U^1-NY^2Y^3$ 、 $-C(O)_tH$ 、 $-C(O)_tY^1$ 、 $-U^1-C(O)-NY^2Y^3$ 、 $-S(O)_tY^5$ 、

(b) 1つもしくは複数のシアノ、ハロ、 $-OH$ 、 $-OY^5$ 、 $-U^1-NY^2Y^3$ 、 $-C(O)_tH$ 、 $-C(O)_tY^1$ 、 $-U^1-C(O)-NY^2Y^3$ 、 $-OC(O)-NY^2Y^3$ 、 $OC(O)-OY^5$ 、 $-U^1-N(Y^4)$ 、 $-C(O)-Y^1$ 、 $-U^1-N(Y^4)$ 、 $-C(O)-NY^2Y^3$ 、 $-U^1-N(Y^4)$ 、 $-C(O)-O-Y^5$ 、 $-N(Y^4)-S(O)_2-Y^1$ 、 $-N(Y^4)-C(O)-C(O)-NY^2Y^3$ 、 $-N(Y^4)-C(O)-C(O)-OY^5$ 、 $-U^1-N(Y^4)-C(=NV^{1a})-NY^2Y^3$ 、 $-U^1-N(Y^4)-C(=NV^{1a})-Y^1$ 、 $-S(O)_tY$ 、 $-U^1$ 、ヘテロアリール、または U^1 、ヘテロシクロによって適宜置換されていてもよいアルキルまたはアルコキシ(式中、ヘテロアリールおよびヘテロシクロは、原子価が許す場合には、1つもしくは複数の $V^{1~5}$ の(3)~(28)の基によって置換されている)

から独立して選択される任意の置換基である、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

R^3 が水素であり、

R^4 が、アルキル、ハロアルキル、(ヒドロキシ)アルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、(ヘテロシクロ)アルキル、(アリール)アルキルまたは(ヘテロアリール)アルキル(これらは原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい)であり、

あるいは R^3 および R^4 が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、およびアゼチジニル(原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい)から選択される3~6員の複素環を形成し、

R^6 が、

(a) Z^{1d} (式中、 Z^{1d} は、1つもしくは複数のシアノ、ハロ、-OH、-OY、-U¹-NY²Y³、-C(O)_tH、-C(O)_tY、または-S(O)_tYによってさらに独立して適宜置換されていてもよいアリールである)によって置換されていてもよいアルキニル、あるいは

(b) 原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよいアリール、

(c) 原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によって独立して適宜置換されていてもよいヘテロアリール、あるいは

(d) -C(O)OR^{7a}、または-C(O)NR^{8a}R^{9a}であり、

上式で、U¹が、結合またはアルキレンである、

請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

R^1 がアルキルであり、

R^2 が水素である、

請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

R^5 が、

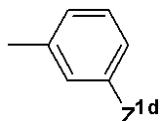
(a) 水素、あるいは

(b) アルキル、アルケニル、アルキニル、およびハロアルキル(これらはいずれも原子価が許す場合には、1つもしくは複数の Z^{1b} 、 Z^{2b} および Z^{3b} によって独立して適宜置換されていてもよい)

から選択され、

R^6 が、1つもしくは複数の Z^{1d} 、 Z^{2d} および Z^{3d} によってさらに置換されていてもよい

【化2】



である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項15】

R^5 が-NR³R⁴である、請求項1から14のいずれかに記載の化合物。