

【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

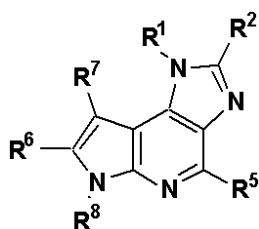
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

[式中、

R^1 は、水素、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_2 \sim 3$ アルケニル、および $C_2 \sim 3$ アルキニルから選択され、

R^2 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、

R^5 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いてもよい）、

(c) $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ および $-NR^3R^4$

から選択され、

R^3 および R^4 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いてもよい）、

(c) $-OR^{11}$ 、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-N(R^{12})C(O)R^{14}$ 、 $-N(R^{12})C(O)OR^{14}$ 、 $-N(R^{12})SO_2R^{14}$ 、 $-N(R^{12})C(O)NR^{12a}R^{13}$ 、 $-N(R^{12})SO_2NR^{12a}R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{12}R^{13}$ 、 $-SO_2R^{14}$ 、または $-SO_2NR^{12}R^{13}$ 、

(d) R^3 および R^4 は、それらが結合している窒素原子と一緒に、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こと

から選択され、

R^6 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いてもよい）、あるいは

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

R^7 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^8 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あって、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あって、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） $-U^1-O-Y^5$ 、

（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 $-U^1-S(O)_tY^5$ 、

（7） $-U^1$ -ハロ、

（8） $-U^1$ -シアノ、

（9） $-U^1$ -ニトロ、

（10） $-U^1-NY^2Y^3$ 、

（11） $-U^1-N(Y^4)-C(O)-Y^1$ 、

（12） $-U^1-N(Y^4)-C(S)-Y^1$ 、

（13） $-U^1-N(Y^4)-C(O)-NY^2Y^3$ 、

（14） $-U^1-N(Y^4)-C(S)-NY^2Y^3$ 、

（15） $-U^1-N(Y^4)-C(O)O-Y^5$ 、

（16） $-U^1-N(Y^4)-S(O)_2-Y^1$ 、

（17） $-U^1-N(Y^4)-S(O)_2-NY^2Y^3$ 、

（18） $-U^1-C(O)-NY^2Y^3$ 、

（19） $-U^1-OC(O)-NY^2Y^3$

（20） $-U^1-S(O)_2-N(Y^4)-Y^1$ 、

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

（22） $-U^1-N(Y^4)-C(=NV^{1a})-Y^1$ 、

（23） $-U^1-C(=NV^{1a})-NY^2Y^3$ 、

（24）オキソ、

（25） $-U^1-Y^5$

から選択され、

V^{1a} は、独立して、水素、アルキル、 $-CN$ 、 $-C(O)Y^1$ 、 $-S(O)_2Y^5$ 、 $-C(O)NY^2Y^3$ 、 $S(O)_2NY^2Y^3$ であり、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 および Y^5 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） Y^2 および Y^3 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、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） Y^2 および Y^3 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $-N=CY^6Y^7$ 基（式中、 Y^6 および Y^7 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

Z^4 、 Z^5 、および Z^6 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) - $U^1 - O - Y^{5a}$ 、

(4) - $U^1 - S - Y^{5a}$ 、

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

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

(7) - U^1 - ハロ、

(8) - U^1 - シアノ、

(9) - U^1 - ニトロ、

(10) - $U^1 - NY^{2a}Y^{3a}$ 、

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

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

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

(14) - $U^1 - N(Y^{4a}) - C(S) - NY^{2a}Y^{3a}$ 、

(15) - $U^1 - N(Y^{4a}) - C(O)O - Y^{5a}$ 、

(16) - $U^1 - N(Y^{4a}) - S(O)_2 - Y^{1a}$ 、

(17) - $U^1 - N(Y^{4a}) - S(O)_2 - NY^{2a}Y^{3a}$ 、

(18) - $U^1 - C(O) - NY^{2a}Y^{3a}$ 、

(19) - $U^1 - OC(O) - NY^{2a}Y^{3a}$

(20) - $U^1 - S(O)_2 - N(Y^{4a}) - Y^{1a}$ 、

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

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

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

(24) オキソ、

(25) - $U^1 - Y^{5a}$

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、

U^1 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】

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、(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る)、

(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あって、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 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 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いてもよい）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いてもよい）；
 $-NR^{12}R^{13}$ 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あって、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) 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 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 $C_1 \sim 3$ 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) $-U^1-O-Y^5$ 、

(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 $-U^1-S(O)_tY^5$ 、

(7) $-U^1$ -ハロ、

(8) $-U^1$ -シアノ、

(9) $-U^1$ -ニトロ、

(10) $-U^1-NY^2Y^3$ 、

(11) $-U^1-N(Y^4)-C(O)-Y^1$ 、

(12) $-U^1-N(Y^4)-C(S)-Y^1$ 、

(13) $-U^1-N(Y^4)-C(O)-NY^2Y^3$ 、

(14) $-U^1-N(Y^4)-C(S)-NY^2Y^3$ 、

(15) $-U^1-N(Y^4)-C(O)O-Y^5$ 、

(16) $-U^1-N(Y^4)-S(O)_2-Y^1$ 、

(17) $-U^1-N(Y^4)-S(O)_2-NY^2Y^3$ 、

(18) $-U^1-C(O)-NY^2Y^3$ 、

(19) $-U^1-OC(O)-NY^2Y^3$ 、

(20) $-U^1-S(O)_2-N(Y^4)-Y^1$ 、

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

(22) $-U^1-N(Y^4)-C(=NV^{1a})-Y^1$ 、

(23) $-U^1-C(=NV^{1a})-NY^2Y^3$ 、

(24) オキソ、

(25) $-U^1-Y^5$

から選択され、

V^{1a} が、独立して、水素、アルキル、 $-CN$ 、 $-C(O)Y^1$ 、 $-C(O)NY^2Y^3$ 、 $-S(O)_2Y^5$ 、 $S(O)_2NY^2Y^3$ であり、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 および Y^5 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 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) Y^2 および Y^3 が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、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) Y^2 および Y^3 が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $-N=CY^6Y^7$ 基(式中、 Y^6 および Y^7 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あって、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 $V^{1\sim 5}$ 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る)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、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る)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、 $-OH$ 、 $-OY$ 、 $-U^{1-}NY^2Y^3$ 、 $-C(O)_tH$ 、 $-C(O)_tY$ 、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る)により置換されているアルキニル、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るアリール、

(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るヘテロアリール、あるいは

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

上式で、 U^1 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、

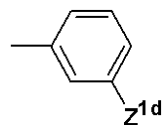
(a) 水素、あるいは

(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る)

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る

【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 $-NR^3R^4$ である、請求項1から14のいずれかに記載の化合物。