

【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】令和1年11月28日(2019.11.28)

【公表番号】特表2018-531264(P2018-531264A)

【公表日】平成30年10月25日(2018.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2018-041

【出願番号】特願2018-519916(P2018-519916)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/46 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 231/54 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 491/052 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/10 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4152 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 K 31/4162 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/5365 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/46

C 0 7 D 401/04 C S P

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 231/54

C 0 7 D 495/04 1 0 5

C 0 7 D 491/052

C 0 7 D 495/04 1 0 3

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 471/04 1 0 6 Z

C 0 7 D 498/10

C 0 7 D 498/04 1 1 6

C 0 7 D 498/08

C 0 7 D 498/04 1 1 2 Q

C 0 7 D 491/048
 C 0 7 D 405/06
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/4152
 A 6 1 K 31/4155
 A 6 1 K 31/416
 A 6 1 K 31/4162
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/553
 A 6 1 K 31/5365
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】令和1年10月11日(2019.10.11)

【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

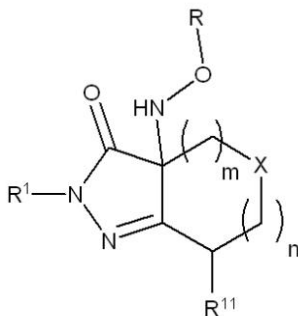
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I e)

【化1】



(Ie)

〔式中、

R^1 は、H、($C_1 - C_6$)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリールまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリールおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_4$)ハロアルキル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)O(5 - \text{メチル} - 2 - \text{オキソ} - 2H - 1,3 - \text{ジオキソール} - 4 - \text{イルメチル})$ 、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O) - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$)アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$)シクロアルキルスル

ホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

Xは、CH₂、O、NH、N(C₁ - C₆)アルキル、N(C=O)(C₁ - C₆)アルキル、N(CO)フェニル、S、SOまたはSO₂であり、ここで該フェニルは、非置換であるか、またはハロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、-C(=O)OH、-C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、-C(=O)NR⁴R⁵、-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

mは、0、1、2、3、4または5であり；

nは、0、1、2、3、4または5であり；

R¹⁻¹は、H、(C₁ - C₆)アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよび該フェニルは、非置換であるか、またはハロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、-C(=O)OH、-C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、-C(=O)NR⁴R⁵、-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、各々独立してHまたは(C₁ - C₆)アルキルであり；R⁸はH、-(C=O)(C₁ - C₆)アルキルまたは-(C=O)(C₁ - C₄)ペルハロアルキルであり；

Rは、水素、-COH、-CO-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-(C₂ - C₄)アルケニル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-シクロペンチル、-CO-シクロヘキシル、-CO-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-CO-ベンジロキシ、-CO-O-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-NH₂、-CO-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-CO-N((C₁ - C₄)アルキル)₂であり、ここで該-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、-O

- (C₁ - C₆)アルキル、- NH - (C₁ - C₄)アルキルまたは - N((C₁ - C₄)アルキル)₂ は、非置換であってもよく、または八口、- (C₁ - C₆)アルキル、- (C₂ - C₄)アルケニル、- (C₂ - C₃)アルキニル、- (5員もしくは6員)ヘテロアリアル、- O - (C₁ - C₆)アルキル、- S - (C₁ - C₆)アルキル、- C(八口)₃、- CH(八口)₂、- CH₂(八口)、- CN、- NO₂、- NH₂、- NH - (C₁ - C₄)アルキル、- N(- (C₁ - C₄)アルキル)₂、- C(O)(C₁ - C₄)アルキル、- C(O)O(C₁ - C₄)アルキル、- OC(O)(C₁ - C₄)アルキル、- OC(O)NH₂、- S(O)(C₁ - C₄)アルキル、- S(O)₂(C₁ - C₄)アルキルまたは5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

R¹がHまたは(C₁ - C₆)アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹がHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

XがCH₂、O、NH、N(C₁ - C₆)アルキル、S、SOまたはSO₂である、請求項1 ~ 3の何れかに記載の化合物。

【請求項5】

mが0、1または2である、請求項1 ~ 4の何れかに記載の化合物。

【請求項6】

nが0、1または2である、請求項1 ~ 5の何れかに記載の化合物。

【請求項7】

R^{1 1}がHまたは(C₁ - C₆)アルキルである、請求項1 ~ 6の何れかに記載の化合物。

【請求項8】

R^{1 1}がHまたはメチルである、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R^{1 1}がHである、請求項7に記載の化合物。

【請求項10】

Rが水素、- CO - (C₁ - C₆)アルキル、- CO - フェニル、- CO - ベンジル、- CO - NH₂または5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イルメチルである、請求項1 ~ 7の何れかに記載の化合物。

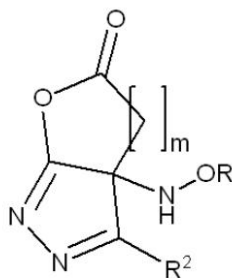
【請求項11】

Rが水素である、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

式(I f)

【化2】



(If)

〔式中、

R²は、(C₁ - C₆)アルキルまたはフェニルであり、ここで該フェニルは、非置換で

あるか、またはハロ、シアノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $(C_6 - C_{10})$ アリール、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 - フェニル$ 、 $-S(O)_2 - (5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび $N, N - ジ(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており、ここで該 $(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、またはハロまたは $(C_1 - C_6)$ アルキルから独立して選択される1または2置換基で置換されており；

m は1、2または3であり；

R は5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキサール - 4 - イルメチルである。

]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項13】

R^2 がフェニルで置換されている $(C_1 - C_4)$ アルキルであり、ここで該フェニルは、非置換であるか、または独立して選択される1、2または3置換基で置換されている、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

該フェニルが非置換である、請求項12に記載の化合物。

【請求項15】

該フェニルが $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび $N, N - ジ(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから選択される置換基で置換されている、請求項12に記載の化合物。

【請求項16】

該置換基がメチルスルホニル、 $N - メチルアミノスルホニル$ および $N, N - ジメチルアミノスルホニル$ から選択される、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

m が1である、請求項12～16の何れかに記載の化合物。

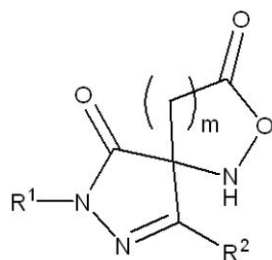
【請求項18】

m が2である、請求項12～16の何れかに記載の化合物。

【請求項19】

式(Ig)

【化3】



(Ig)

[式中、

R^1 は、H、($C_1 - C_6$)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリアルまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリアルおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_4$)ハロアルキル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)O(5 - \text{メチル} - 2 - \text{オキソ} - 2H - 1, 3 - \text{ジオキソール} - 4 - \text{イルメチル})$ 、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O) - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$)アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$)シクロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 - \text{フェニル}$ 、 $-S(O)_2 - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよびN、N - ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立してHまたは($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^8 は、H、 $-C(=O)(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-C(=O)(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^2 は、($C_1 - C_6$)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリアルまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリアルおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_4$)ハロアルキル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O) - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$)アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$)シクロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 - \text{フェニル}$ 、 $-S(O)_2 - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよびN、N - ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

mは、1、2または3である。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項20】

R^1 がH、($C_1 - C_6$)アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよびフェニルが、非置換であるか、または独立して選択される1、2または3置換基で置換されている、請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

R^1 がメチルである、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

R^2 が($C_1 - C_6$)アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよびフェニルが、非置換であるか、または独立して選択される1、2または3置換基で置換されている、請求項19～21の何れかに記載の化合物。

【請求項23】

R^2 がメチルである、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^2 が非置換フェニルである、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^2 が $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6 R^7$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルまたは $N, N - ジ(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから選択される置換基で置換されているフェニルである、請求項 2 2 に記載の化合物。

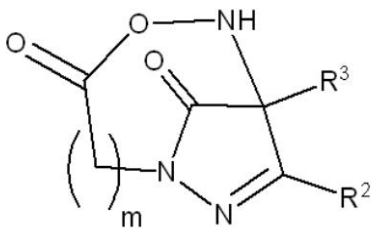
【請求項 2 6】

m が 1 である、請求項 1 9 ~ 2 5 の何れかに記載の化合物。

【請求項 2 7】

式 (I h)

【化 4】



(Ih)

[式中、

R^2 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(5$ 員もしくは 6 員) ヘテロアリールまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリールおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4 R^5$ 、 $-C(=O) - (5$ 員、 6 員もしくは 7 員) ヘテロシクロアルキル、 $(5$ 員、 6 員もしくは 7 員) ヘテロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6 R^7$ 、 $-S(O)_2 - フェニル$ 、 $-S(O)_2 - (5$ 員、 6 員もしくは 7 員) ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4 R^5$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび $N, N - ジ(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから独立して選択される 1、2、3、4 または 5 置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立して H または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^8 は、H、 $-(C=O)(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-(C=O)(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^3 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(5$ 員もしくは 6 員) ヘテロアリール、フェニルまたは $-C(=NOR^9)R^{10}$ であり、ここで、 R^9 は $(C_1 - C_6)$ アルキル、フェニルで置換されている $(C_1 - C_6)$ アルキルまたはフェニルであり、 R^{10} は $(C_1 - C_6)$ アルキルから選択され；

m は、1、2 または 3 である。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 8】

R^2 が ($C_1 - C_6$) アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよびフェニルが、非置換であるか、または独立して選択される 1、2 または 3 置換基で置換されている、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

R^2 が非置換フェニルである、請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R^2 が ($C_1 - C_6$) アルキルスルファニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 $-S(O)_2-NH_2$ 、 $-S(O)_2-NR^6R^7$ 、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルまたは N,N -ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニルから選択される置換基で置換されているフェニルである、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

R^3 が ($C_1 - C_6$) アルキル、フェニルまたは $-C(=NOR^9)R^{10}$ である、請求項 27 ~ 30 の何れかに記載の化合物。

【請求項 32】

R^3 がメチルである、請求項 27 ~ 30 の何れかに記載の化合物。

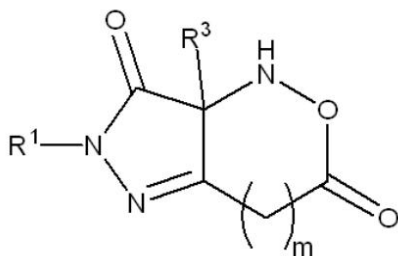
【請求項 33】

m が 2 である、請求項 27 ~ 32 の何れかに記載の化合物。

【請求項 34】

式 (I i)

【化 5】



(Ii)

〔式中、

R^1 は、 H 、($C_1 - C_6$) アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリールまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリールおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)O(5 - \text{メチル} - 2 - \text{オキソ} - 2H - 1, 3 - \text{ジオキソール} - 4 - \text{イルメチル})$ 、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O) - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$) ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ペルハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2-NH_2$ 、 $-S(O)_2-NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2$ -フェニル、 $-S(O)_2 - (5 \text{員、} 6 \text{員もしくは} 7 \text{員})$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび N,N -ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニルから独立して選択される 1、2、3、4 または 5 置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立して H または ($C_1 - C_6$) アルキルであり；

R^8 は H、 $-(C=O)(C_1-C_6)$ アルキルまたは $-(C=O)(C_1-C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^3 は、 (C_1-C_6) アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリアル、フェニルまたは $-C(=NOR^9)R^{10}$ であり、ここで、 R^9 は (C_1-C_6) アルキル、フェニルで置換されている (C_1-C_6) アルキルまたはフェニルであり、 R^{10} は (C_1-C_6) アルキルから独立して選択され；

m は、0、1または2であり、ここで、 m が2であるとき、ラクトン環は場合によりフェニル環に縮合し、ここで該縮合フェニル環は、非置換であるか、またはハロ、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ペルハロアルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1-C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル$ 、 $(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル$ 、 (C_1-C_6) アルキルスルファニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルファニル、 (C_1-C_4) ペルハロアルキルスルファニル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_3-C_6) シクロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) ペルハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2-NH_2$ 、 $-S(O)_2-NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2$ -フェニル、 $-S(O)_2-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル$ 、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1-C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび N,N -ジ (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されている。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項35】

R^1 が H、 (C_1-C_6) アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよびフェニルが独立して選択される1、2または3置換基で置換されている、請求項34に記載の化合物。

【請求項36】

R^1 がメチルである、請求項34に記載の化合物。

【請求項37】

R^3 が (C_1-C_6) アルキル、フェニルまたは $-C(=NOR^9)R^{10}$ である、請求項34~36の何れかに記載の化合物。

【請求項38】

R^3 がメチルである、請求項37に記載の化合物。

【請求項39】

m が1である、請求項34~38の何れかに記載の化合物。

【請求項40】

m が2である、請求項34~38の何れかに記載の化合物。

【請求項41】

該ラクトン環が、フェニル環に縮合しており、ここで該縮合フェニル環が非置換である、請求項40に記載の化合物。

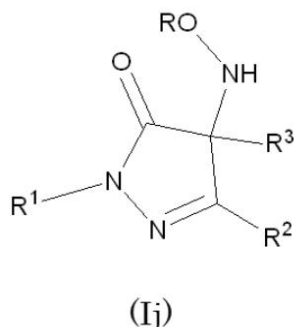
【請求項42】

該ラクトン環が、フェニル環に縮合しており、ここで該縮合フェニル環は、 (C_1-C_6) アルキルスルファニル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 $-S(O)_2-NH_2$ 、 $-S(O)_2-NR^6R^7$ 、 $N-(C_1-C_6)$ アルキルアミノスルホニルまたは N,N -ジ (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニルから選択される置換基で置換されている、請求項40に記載の化合物。

【請求項43】

式(Ij)

【化6】



〔式中、

R^1 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^2 は、フェニルであり、ここで該フェニルは、非置換であるか、またはハロ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2-NH_2$ 、 $-S(O)_2-NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2$ -フェニル、 $-S(O)_2-(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N-(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび N,N -ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立してHまたは $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^8 は、H、 $-(C=O)(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-(C=O)(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^3 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

Rは、5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキサール-4-イルメチルである。

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項44】

R^1 がメチルである、請求項43に記載の化合物。

【請求項45】

R^2 が非置換フェニルである、請求項43または44に記載の化合物。

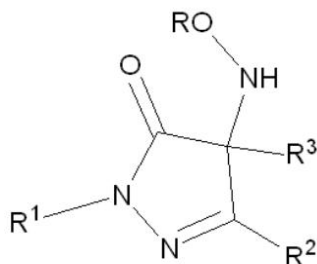
【請求項46】

R^3 がメチルである、請求項43～45の何れかに記載の化合物。

【請求項47】

式(Ik)

【化7】



(Ik)

〔式中、

R^1 は、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキルであり；

R^2 は、フェニルであり、ここで該フェニルは非置換であるか、またはハロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、-C(=O)OH、-C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、-C(=O)NR⁴R⁵、-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立してHまたは(C₁ - C₆)アルキルであり；

R^8 は、H、-(C=O)(C₁ - C₆)アルキルまたは-(C=O)(C₁ - C₄)ペルハロアルキルであり；

R^3 は、(C₁ - C₆)アルキルであり；

R は、水素、-COH、-CO-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-(C₂ - C₄)アルケニル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-シクロペンチル、-CO-シクロヘキシル、-CO-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-CO-ベンジロキシ、-CO-O-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-NH₂、-CO-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-CO-N((C₁ - C₄)アルキル)₂であり、ここで該-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-N((C₁ - C₄)アルキル)₂は、非置換であつてもよく、またはハロ、-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、-(C₂ - C₃)アルキニル、-(5員もしくは6員)ヘテロアリール、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-S-(C₁ - C₆)アルキル、-C(ハロ)₃、-CH(ハロ)₂、-CH₂(ハロ)、-CN、-NO₂、-NH₂、-NH-(C₁ - C₄)アルキル、-N(-(C₁ - C₄)アルキル)₂、-C(O)(C₁ - C₄)アルキル、-C(O)O(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)NH₂、-S(O)(C₁ - C₄)アルキル、-S(O)₂(C₁ - C₄)アルキルまたは5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4 8】

R¹ が (6 員)ヘテロシクロアルキルである、請求項 4 7 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R¹ がピペリジニルである、請求項 4 7 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

R² が非置換フェニルであるか、または独立して選択される 1、2 または 3 置換基で置換されているフェニルである、請求項 4 7 ~ 4 9 の何れかに記載の化合物。

【請求項 5 1】

R² が独立して選択される 1、2 または 3 置換基で置換されているフェニルである、請求項 5 0 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

R³ がメチルである、請求項 4 7 ~ 5 0 の何れかに記載の化合物。

【請求項 5 3】

R が水素、-CO-(C₁-C₆)アルキル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-NH₂ または 5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキサール-4-イルメチルである、請求項 4 7 ~ 5 2 の何れかに記載の化合物。

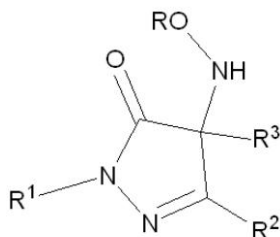
【請求項 5 4】

R が水素である、請求項 5 3 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

式 (I a)

【化 8】



(Ia)

〔式中、

R¹ は、フェニルであり、ここで該フェニルは、非置換であるか、またはハロ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ペルハロアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)ペルハロアルコキシ、-C(=O)OH、-C(=O)O(C₁-C₆)アルキル、-C(=O)NR⁴R⁵、-C(=O)-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁-C₆)アルキルスルファニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁-C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル、(C₁-C₆)アルキルスルホニル、(C₃-C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁-C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される 1、2、3、4 または 5 置換基で置換されており；

R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は、各々独立して H または (C₁-C₆)アルキルであり；

R⁸ は、H、-(C=O)(C₁-C₆)アルキルまたは -(C=O)(C₁-C₄)ペルハロアルキルであり；

R² は、(C₁-C₆)アルキルであり；

R^3 は、 $-C(=NOR^9)R^{10}$ であり、ここで、 R^9 は $(C_1 - C_6)$ アルキルであり、 R^{10} はフェニルであり；

R は、水素、 $-COH$ 、 $-CO-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CO-(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $-CO$ -フェニル、 $-CO$ -ベンジル、 $-CO$ -シクロペンチル、 $-CO$ -シクロヘキシル、 $-CO$ -(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $-CO$ -ベンジロキシ、 $-CO-O-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH-(C_1 - C_4)$ アルキルまたは $-CO-N((C_1 - C_4)$ アルキル) $_2$ であり、ここで該 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_2 - C_4)$ アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、 $-(5員、6員もしくは7員)$ ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、 $-O-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NH-(C_1 - C_4)$ アルキルまたは $-N((C_1 - C_4)$ アルキル) $_2$ は、非置換であつてもよく、または八口、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_3)$ アルキニル、 $-(5員もしくは6員)$ ヘテロアリール、 $-O-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-S-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(八口)_3$ 、 $-CH(八口)_2$ 、 $-CH_2(八口)$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-N(-(C_1 - C_4)$ アルキル) $_2$ 、 $-C(O)(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-C(O)O(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-OC(O)(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-OC(O)NH_2$ 、 $-S(O)(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-S(O)_2(C_1 - C_4)$ アルキルまたは5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキサール-4-イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項56】

R^1 が非置換フェニルである、請求項55に記載の化合物。

【請求項57】

R^2 がメチルである、請求項55または56に記載の化合物。

【請求項58】

R^9 がメチルである、請求項55～57の何れかに記載の化合物。

【請求項59】

R が水素、 $-CO-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-CO$ -フェニル、 $-CO$ -ベンジル、 $-CO-NH_2$ または5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキサール-4-イルメチルである、請求項55～58の何れかに記載の化合物。

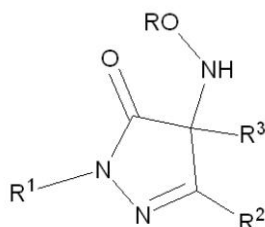
【請求項60】

R が水素である、請求項55～58の何れかに記載の化合物。

【請求項61】

式(Ib)

【化9】



(Ib)

〔式中、

R^1 は、H、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリールまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリールおよびフェニルは、非置換であるか、または八口、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ 八口アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペル八口アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ 八口アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペル八口アルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)O(5-メ$

チル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イルメチル)、 - C(=O)NR⁴R⁵、 - C(=O) - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、 - S(O)₂ - NH₂、 - S(O)₂ - NR⁶R⁷、 - S(O)₂ - フェニル、 - S(O)₂ - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 - S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、 - NR⁴R⁵、N - (C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN, N - ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、各々独立してHまたは(C₁ - C₆)アルキルであり；

R⁸は、H、 - (C=O)(C₁ - C₆)アルキルまたは - (C=O)(C₁ - C₄)ペルハロアルキルであり；

R²は、(C₁ - C₆)アルキルまたはフェニルであり、ここで該アルキルおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、 - C(=O)OH、 - C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、 - C(=O)NR⁴R⁵、 - C(=O) - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、 - S(O)₂ - NH₂、 - S(O)₂ - NR⁶R⁷、 - S(O)₂ - フェニル、 - S(O)₂ - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 - S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、 - NR⁴R⁵、N - (C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN, N - ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R³は、 - OH、 - C(=O)OH、 - C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、 - C(=O)O(5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イルメチル)、 - C(=O)NR⁴R⁵、 - NR⁴R⁵、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、 - C(=O) - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、 - S(O)₂ - NH₂、 - S(O)₂ - NR⁶R⁷、 - S(O)₂ - フェニル、 - S(O)₂ - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 - S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、N - (C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、N, N - ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(5員もしくは6員)ヘテロアリーールまたはフェニルから独立して選択される1、2または3置換基で置換されている(C₁ - C₆)アルキルであり、ここで該ヘテロアリーールまたはフェニルは、非置換であるか、またはハロ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、(C₁ - C₄)ペルハロアルコキシ、 - C(=O)OH、 - C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、 - C(=O)NR⁴R⁵、 - C(=O) - (5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロ

アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

Rは、水素、-COH、-CO-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-(C₂ - C₄)アルケニル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-シクロペンチル、-CO-シクロヘキシル、-CO-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-CO-ベンジロキシ、-CO-O-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-NH₂、-CO-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-CO-N((C₁ - C₄)アルキル)₂であり、ここで該-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-N((C₁ - C₄)アルキル)₂は、非置換であつてもよく、またはハロ、-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、-(C₂ - C₃)アルキニル、-(5員もしくは6員)ヘテロアリール、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-S-(C₁ - C₆)アルキル、-C(ハロ)₃、-CH(ハロ)₂、-CH₂(ハロ)、-CN、-NO₂、-NH₂、-NH-(C₁ - C₄)アルキル、-N(-(C₁ - C₄)アルキル)₂、-C(O)(C₁ - C₄)アルキル、-C(O)O(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)NH₂、-S(O)(C₁ - C₄)アルキル、-S(O)₂(C₁ - C₄)アルキルまたは5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項62】

R¹がH、(C₁ - C₄)アルキルまたは非置換フェニルである、請求項61に記載の化合物。

【請求項63】

R²がメチルである、請求項61または62に記載の化合物。

【請求項64】

R²がフェニルであり、ここで該フェニルは、非置換であるか、または(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2または3置換基で置換されている、請求項61または63に記載の化合物。

【請求項65】

R³がC(=O)OH、-C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、-C(=O)O(5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチル)またはOHで置換されている(C₁ - C₂)アルキルである、請求項61~63の何れかに記載の化合物。

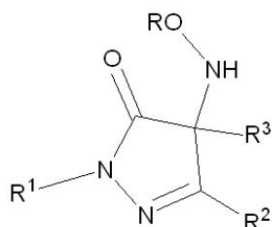
【請求項66】

Rが水素である、請求項61~65の何れかに記載の化合物。

【請求項67】

式(Ic)

【化10】



(Ic)

〔式中、

R^1 は、H、($C_1 - C_6$)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリーールまたはフェニルであり、ここで該アルキル、ヘテロアリーールおよびフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_4$)ハロアルキル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(5\text{-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチル})$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5\text{員、6員もしくは7員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$)アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$)シクロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 - \text{フェニル}$ 、 $-S(O)_2 - (5\text{員、6員もしくは7員})$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、N-($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立してHまたは($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^8 は、H、 $-(C=O)(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-(C=O)(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^2 は、 $-OH$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)-(5\text{員、6員もしくは7員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、($C_1 - C_6$)アルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルファニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$)アルキルスルホニル、($C_3 - C_6$)シクロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 - \text{フェニル}$ 、 $-S(O)_2 - (5\text{員、6員もしくは7員})$ ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、N-($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニル、N,N-ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノスルホニル、(5員もしくは6員)ヘテロアリーールまたはフェニルから独立して選択される1、2または3置換基で置換されている($C_1 - C_6$)アルキルであり；

ここで該ヘテロアリーールまたはフェニルは、非置換であるか、またはハロ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_4$)ハロアルキル、($C_1 - C_4$)ペルハロアルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、($C_1 - C_4$)ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$)ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5\text{員、6員もしくは7員})$ ヘテロシクロアルキル、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロ

アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、各々独立してHまたは(C₁ - C₆)アルキルであり；

R⁸は、H、-(C=O)(C₁ - C₆)アルキルまたは-(C=O)(C₁ - C₄)ペルハロアルキルであり；

R³は、(C₁ - C₆)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリール、フェニルまたは-C(=NOR⁹)R¹⁰であり、ここで、R⁹は(C₁ - C₆)アルキル、フェニルで置換されている(C₁ - C₆)アルキルまたはフェニルであり、R¹⁰は(C₁ - C₆)アルキルから選択され；

Rは、水素、-COH、-CO-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-(C₂ - C₄)アルケニル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-シクロペンチル、-CO-シクロヘキシル、-CO-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-CO-ベンジロキシ、-CO-O-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-NH₂、-CO-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-CO-N((C₁ - C₄)アルキル)₂であり、ここで該-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-N((C₁ - C₄)アルキル)₂は、非置換であつてもよく、またはハロ、-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、-(C₂ - C₃)アルキニル、-(5員もしくは6員)ヘテロアリール、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-S-(C₁ - C₆)アルキル、-C(ハロ)₃、-CH(ハロ)₂、-CH₂(ハロ)、-CN、-NO₂、-NH₂、-NH-(C₁ - C₄)アルキル、-N(-(C₁ - C₄)アルキル)₂、-C(O)(C₁ - C₄)アルキル、-C(O)O(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)NH₂、-S(O)(C₁ - C₄)アルキル、-S(O)₂(C₁ - C₄)アルキルまたは5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい；

ただし、R¹がHであるとき、R³は(C₁ - C₆)アルキルではない。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項68】

R¹がメチルである、請求項67に記載の化合物。

【請求項69】

R²が(5員もしくは6員)ヘテロアリールまたはフェニルで置換されている(C₁ - C₂)アルキルである、請求項67または68に記載の化合物。

【請求項70】

R³がメチルである、請求項67～69の何れかに記載の化合物。

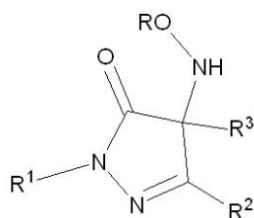
【請求項71】

Rが水素である、請求項67～70の何れかに記載の化合物。

【請求項72】

式(I d)

【化 1 1】



(Id)

〔式中、

R^1 は、 $-OH$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)O$ (5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イルメチル)、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)-(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 -$ フェニル、 $-S(O)_2 - (5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、 $N, N -$ ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、 $(5$ 員もしくは6員)ヘテロアリーールまたはフェニルから独立して選択される1、2または3置換基で置換されている $(C_1 - C_6)$ アルキルであり、

ここで該ヘテロアリーールまたはフェニルは、非置換であるか、またはハロ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルホニル、 $-S(O)_2 - NH_2$ 、 $-S(O)_2 - NR^6R^7$ 、 $-S(O)_2 -$ フェニル、 $-S(O)_2 - (5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $-S(=O)(=NR^8)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-NR^4R^5$ 、 $N - (C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルおよび $N, N -$ ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、各々独立してHまたは $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^8 は、H、 $-C(=O)(C_1 - C_6)$ アルキルまたは $-C(=O)(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルであり；

R^2 は、フェニルであり、ここで該フェニルは、非置換であるか、またはハロ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルコキシ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(=O)NR^4R^5$ 、 $-C(=O)-(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(5$ 員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_4)$ ペルハロアルキルスルファニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル

、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルフィニル、(C₁ - C₄)ペルハロアルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、-S(O)₂-フェニル、-S(O)₂-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-S(=O)(=NR⁸)(C₁ - C₆)アルキル、-NR⁴R⁵、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから独立して選択される1、2、3、4または5置換基で置換されており；

R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、各々独立してHまたは(C₁ - C₆)アルキルであり；

R⁸は、H、-(C=O)(C₁ - C₆)アルキルまたは-(C=O)(C₁ - C₄)ペルハロアルキルであり；

R³は、(C₁ - C₆)アルキル、(5員もしくは6員)ヘテロアリール、フェニルまたは-C(=NOR⁹)R¹⁰であり、ここで、R⁹は(C₁ - C₆)アルキル、フェニルで置換されている(C₁ - C₆)アルキルまたはフェニルであり、R¹⁰は(C₁ - C₆)アルキルから選択され；

Rは、水素、-COH、-CO-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-(C₂ - C₄)アルケニル、-CO-フェニル、-CO-ベンジル、-CO-シクロペンチル、-CO-シクロヘキシル、-CO-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、-CO-ベンジロキシ、-CO-O-(C₁ - C₆)アルキル、-CO-NH₂、-CO-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-CO-N((C₁ - C₄)アルキル)₂であり、ここで該-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、フェニル、ベンジル、シクロペンチル、シクロヘキシル、-(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキル、ベンジロキシ、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-NH-(C₁ - C₄)アルキルまたは-N((C₁ - C₄)アルキル)₂は、非置換であつてもよく、またはハロ、-(C₁ - C₆)アルキル、-(C₂ - C₄)アルケニル、-(C₂ - C₃)アルキニル、-(5員もしくは6員)ヘテロアリール、-O-(C₁ - C₆)アルキル、-S-(C₁ - C₆)アルキル、-C(ハロ)₃、-CH(ハロ)₂、-CH₂(ハロ)、-CN、-NO₂、-NH₂、-NH-(C₁ - C₄)アルキル、-N(-(C₁ - C₄)アルキル)₂、-C(O)(C₁ - C₄)アルキル、-C(O)O(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)(C₁ - C₄)アルキル、-OC(O)NH₂、-S(O)(C₁ - C₄)アルキル、-S(O)₂(C₁ - C₄)アルキルまたは5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチルから選択される1、2または3置換基で置換されていてもよい；

ただし、R¹が-C(=O)OHで置換されている(C₁ - C₆)アルキルであり、R³が(C₁ - C₆)アルキルまたは-C(=NOR⁹)R¹⁰であり、R⁹が(C₁ - C₆)アルキルであるとき、R¹⁰は(C₁ - C₆)アルキルではない。]

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項73】

R¹が-C(=O)O(C₁ - C₆)アルキル、-C(=O)O(5-メチル-2-オキソ-2H-1,3-ジオキソール-4-イルメチル)、(5員、6員もしくは7員)ヘテロシクロアルキルまたは-C(=O)NR⁴R⁵で置換されている(C₁ - C₂)アルキルである、請求項72に記載の化合物。

【請求項74】

R²が非置換フェニルまたは(C₁ - C₆)アルキルスルファニル、(C₁ - C₆)アルキルスルフィニル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニル、-S(O)₂-NH₂、-S(O)₂-NR⁶R⁷、N-(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルおよびN,N-ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニルから選択される置換基で置換されているフェニルである、請求項72または73に記載の化合物。

【請求項75】

R³がメチルである、請求項72～74の何れかに記載の化合物。

【請求項76】

R が水素である、請求項 7 2 ~ 7 5 の何れかに記載の化合物。

【請求項 7 7】

次のものからなる群から選択される、化合物：

- 4 - [(1) - (メトキシイミノ)(フェニル)メチル] - 3 - メチル - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 5 - オール；
- 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 5 - オキソ - 1 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]酢酸；
- (1, 4 - ジメチル - 5 - オキソ - 3 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)アミノ 2, 2 - ジメチルプロパノエート；
- (1, 4 - ジメチル - 5 - オキソ - 3 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)アミノベンゾエート；
- 3 - ベンジル - 4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 4 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- 1, 4 - ジメチル - 4 - {[(5 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ]アミノ} - 3 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- エチル 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]アセテート；
- 3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 5 H, 6 H - シクロペンタ[c]ピラゾール - 3 - オン；
- エチル 4 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]ブタノエート；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 3 - (ピリジン - 3 - イル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- 2 - {3 - [4 - (ジメチルスルファモイル)フェニル] - 4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル}酢酸；
- エチル 2 - {3 - [4 - (ジメチルスルファモイル)フェニル] - 4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル}アセテート；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - フェニル - 4 - (プロパン - 2 - イル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- メチル 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンスルホニルフェニル) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]アセテート；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 1 - メチル - 3 - フェニル - 4 - (プロパン - 2 - イル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- エチル 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンスルホニルフェニル) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]アセテート；
- 3 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル]ピリジン - 1 - イウム - 1 - オレート；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 4 - (ヒドロキシアミノ) - 3, 4 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 4 - ジメチル - 3 - (プロパン - 2 - イル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- 4 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - N - メチルベンゼン - 1 - スルホンアミド；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1, 3 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；
- 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンスルホニルフェニル) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル]アセトアミド；
- 4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - (2 - ヒドロキシエチル) - 3 - メチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン；

3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 6 H, 7 H - チオピラノ[4, 3 - c]ピラゾール - 3 - オン ;
 3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 6 H, 7 H - 5⁶ - チオピラノ[4, 3 - c]ピラゾール - 3, 5, 5 - トリオン ;
 3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 5 H, 7 H - ピラノ[3, 4 - c]ピラゾール - 3 - オン ;
 3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 6 H - 5⁶ - チエノ[3, 4 - c]ピラゾール - 3, 5, 5 - トリオン ;
 (5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メチル 2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 4 - メチル - 3 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル)アセテート ;
 (5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メチル 2 - (4 - メチル - 4 - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 3 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル)アセテート ;
 4 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 4 - ジメチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - N - メチルベンゼン - 1 - スルホンアミド ;
 3 a - (ヒドロキシアミノ) - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 5 H, 6 H, 7 H - ピラゾロ[3, 4 - c]ピリジン - 3 - オン ;
 メチル 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンズルホニルフェニル) - 1 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]アセテート ;
 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンズルホニルフェニル) - 1 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]酢酸 ;
 2 - {3 - [4 - (ジメチルスルファモイル)フェニル] - 4 - (ヒドロキシアミノ) - 1 - メチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル}酢酸 ;
 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 1 - メチル - 5 - オキソ - 3 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]酢酸 ;
 9 - (4 - メタンズルホニルフェニル) - 7 - メチル - 2 - オキサ - 1, 7, 8 - トリアザスピロ[4.4]ノン - 8 - エン - 3, 6 - ジオン ;
 N, N - ジメチル - 4 - {8 - メチル - 3, 9 - ジオキソ - 2 - オキサ - 1, 7, 8 - トリアザスピロ[4.4]ノン - 6 - エン - 6 - イル}ベンゼン - 1 - スルホンアミド ;
 7 - メチル - 9 - フェニル - 2 - オキサ - 1, 7, 8 - トリアザスピロ[4.4]ノン - 8 - エン - 3, 6 - ジオン ;
 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 3 - ジメチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]酢酸 ;
 2 - {4 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 4 - ジメチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル]ベンゼンスルホニル} - 2 - メチルプロパン酸 ;
 2 - [4 - (ヒドロキシアミノ) - 1, 4 - ジメチル - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 5 - メタンズルホニル安息香酸 ;
 1 2 - メタンズルホニル - 4, 6 - ジメチル - 8 - オキサ - 3, 4, 7 - トリアザトリシクロ[8.4.0.0²,⁶]テトラデカ - 1(1 4), 2, 1 0, 1 2 - テトラエン - 5, 9 - ジオン ;
 4, 6 - ジメチル - 8 - オキサ - 3, 4, 7 - トリアザトリシクロ[8.4.0.0²,⁶]テトラデカ - 1(1 4), 2, 1 0, 1 2 - テトラエン - 5, 9 - ジオン ;
 8 - (4 - メタンズルホニルフェニル) - 7 - メチル - 5 - オキサ - 1, 6, 9 - トリアザピシクロ[5.2.1]デカ - 8 - エン - 4, 1 0 - ジオン ;
 N, N - ジメチル - 4 - {7 - メチル - 4, 1 0 - ジオキソ - 5 - オキサ - 1, 6, 9 - トリアザピシクロ[5.2.1]デカ - 8 - エン - 8 - イル}ベンゼン - 1 - スルホンアミド ;
 2, 3 a - ジメチル - 2 H, 3 H, 3 a H, 4 H, 6 H, 7 H - ピラゾロ[4, 3 - c][1, 2]オキサジン - 3, 6 - ジオン ;

3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 3 - フェニル - 3 a H - フロ[2, 3 - c]ピラゾール - 5 (4 H) - オン ;

3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 3 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 3 a H - フロ[2, 3 - c]ピラゾール - 5 (4 H) - オン ;

N - メチル - 4 - (3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 3 a H - フロ[2, 3 - c]ピラゾール - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;

N, N - ジメチル - 4 - (3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 5 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 3 a H - フロ[2, 3 - c]ピラゾール - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;

3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 3 - フェニル - 4, 5 - ジヒドロピラノ[2, 3 - c]ピラゾール - 6 (3 a H) - オン ;

3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 3 - (4 - (メチルスルホニル)フェニル) - 4, 5 - ジヒドロピラノ[2, 3 - c]ピラゾール - 6 (3 a H) - オン ;

N - メチル - 4 - (3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 6 - オキソ - 3 a, 4, 5, 6 - テトラヒドロピラノ[2, 3 - c]ピラゾール - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;

N, N - ジメチル - 4 - (3 a - (((5 - メチル - 2 - オキソ - 1, 3 - ジオキソール - 4 - イル)メトキシ)アミノ) - 6 - オキソ - 3 a, 4, 5, 6 - テトラヒドロピラノ[2, 3 - c]ピラゾール - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;

4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンスルホニルフェニル) - 4 - メチル - 1 - (ピペリジン - 4 - イル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン ; および

4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - (4 - メタンスルホニルフェニル) - 4 - メチル - 1 - (オキサ - 4 - イルメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾール - 5 - オン ;

またはこの薬学的に許容される塩。

【請求項 7 8】

請求項 1 ~ 7 7 の何れかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、および少なくとも一つの薬学的に許容される添加物を含む、医薬組成物。

【請求項 7 9】

請求項 1 ~ 7 7 の何れかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、心血管疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 8 0】

心血管疾患が心不全である、請求項 7 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 8 1】

心血管疾患が急性非代償性心不全である、請求項 7 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 8 2】

請求項 1 ~ 7 7 の何れかに記載の化合物または請求項 7 8 に記載の医薬組成物、およびキットの使用指示書を含む、ニトロキシル治療に応答性である疾患または状態の処置および/または予防のためのキット。

【請求項 8 3】

疾患または状態が心血管疾患、虚血 / 再灌流障害、癌性疾患および肺高血圧から選択される、請求項 8 2 に記載のキット。

【請求項 8 4】

心血管疾患が心不全である、請求項 8 3 に記載のキット。