

【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9月4日(2008.9.4)

【公表番号】特表2008-506719(P2008-506719A)

【公表日】平成20年3月6日(2008.3.6)

【年通号数】公開・登録公報2008-009

【出願番号】特願2007-521757(P2007-521757)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/065 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 5/065

A 6 1 K 37/02

C 0 7 D 413/04 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月15日(2008.7.15)

【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

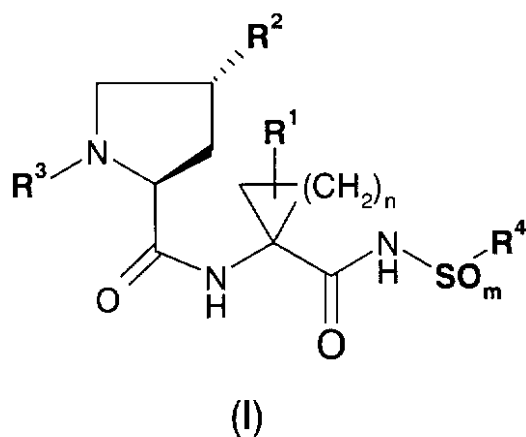
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物、そのラセミ化合物、ジアステレオマー、光学異性体又はその塩。

【化1】



(式中、

nは1又は2であり；

mは1又は2であり；

R¹は(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、又は(C₂₋₆)アルキニルであり(前記(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、及び(C₂₋₆)アルキニルは、任意に1個以上の置換可能な位置

で1～3個のハロゲン原子にて置換されていてもよい)；

R^2 は、 $-NH-R^{20}$ 、 $-O-R^{20}$ 、 $-S-R^{20}$ 、 $-SO-R^{20}$ 、 $-SO_2-R^{20}$ 、 $-OCH_2-R^{20}$ 、及び $-CH_2O-R^{20}$ から選択され(ここで、

R^{20} はアリール又はHetであり、前記アリール及びHetは、任意に R^{200} で置換されていてもよく；このとき、

R^{200} は、H、ハロゲン、シアノ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、アリール- (C_{1-6}) アルキル-、アリール、Het、オキソ、チオキソ、 $-OR^{201}$ 、 $-SR^{201}$ 、 $-SOR^{201}$ 、 $-SO_2R^{201}$ 、 $-N(R^{202})R^{201}$ 、及び $-CON(R^{202})R^{201}$ からそれぞれ独立に選択される1～4個の置換基であり(前記各アルキル、シクロアルキル、アリール及びHetは、任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよい)；

それぞれ R^{201} は、H、 (C_{1-6}) アルキル、アリール、 (C_{2-4}) アルケニル、 (C_{2-4}) アルキニル、 $-CO-(C_{1-6})$ アルキル及び $-CO-O-(C_{1-6})$ アルキルから独立に選択され(前記各アルキル及びアリールは任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよい)；

R^{202} はH又は (C_{1-6}) アルキルであり；

R^{2000} は、ハロゲン、 R^{2003} 、アリール、Het、 $-OR^{2001}$ 、 $-SR^{2001}$ 、 $-SOR^{2001}$ 、 $-SO_2R^{2001}$ 、シアノ及び $-N(R^{2002})(R^{2001})$ からそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基であり(前記アリール及びHetは、それぞれ任意に、 (C_{1-6}) アルキル及び $-O-(C_{1-6})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてもよい)；

それぞれ R^{2001} は、アリール、アリール- (C_{1-6}) アルキル-、 $-C(O)-R^{2003}$ 、 $-C(O)O-R^{2003}$ 、 $-CON(R^{2002})(R^{2004})$ 及び R^{2004} から独立に選択され；

それぞれ R^{2002} は、H及び (C_{1-6}) アルキルから独立に選択され；

それぞれ R^{2003} は、 (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-から独立に選択され(前記 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-は、それぞれ任意に、 (C_{1-3}) アルキルからそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい)；かつ

それぞれ R^{2004} は、H及び R^{2003} から独立に選択される)；

R^3 は、以下の基：

(i) $-C(O)OR^{31}$ (R^{31} は (C_{1-6}) アルキル又はアリールであり、前記 (C_{1-6}) アルキルは任意に1～3個のハロゲン置換基で置換されていてもよい)；

(ii) $-C(O)NR^{32}R^{33}$ (R^{32} 及び R^{33} は、H、 (C_{1-6}) アルキル、及びHetからそれぞれ独立に選択される)；

(iii) $-SO_vR^{34}$ (v は1又は2であり、 R^{34} は、 (C_{1-6}) アルキル、アリール、Het、及び $NR^{32}R^{33}$ (R^{32} 及び R^{33} は上記定義どおり)から選択される)；及び

(iv) $-C(O)-R^{35}$ (R^{35} は、 (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-、アリール、アリール- (C_{1-6}) アルキル-、Het及びHet- (C_{1-6}) アルキルから選択され、それぞれ任意に、ハロ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、アリール、Het、ヒドロキシル、 $-O-(C_{1-6})$ アルキル、 $-S-(C_{1-6})$ アルキル、 $-SO-(C_{1-6})$ アルキル、 $-SO_2-(C_{1-6})$ アルキル、 $-O$ -アリール、 $-S$ -アリール、 $-SO$ -アリール及び $-SO_2$ -アリールからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、前記 $-O$ -アリール、 $-S$ -アリール、 $-SO$ -アリール及び $-SO_2$ -アリールのアリール部分は、それぞれ任意に1～5個のハロ置換基で置換されていてもよい)から選択され；

R^4 は、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{2-6}) アルケニル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-6}) アルキル-、アリール、Het、アリール- (C_{1-4}) アルキル-、又はHet- (C_{1-4}) アルキル-であり(ここで、

a) 前記 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{2-6}) アルケニル、アリール、Het、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-6}) アルキル-、アリール- (C_{1-4}) アルキル-、及びHet- (C_{1-4}) アルキル-は、任意に、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ、 (C_{1-6}) アルキル、 $O-(C_{1-6})$ アルキル、 O -アリール、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_{1-4})$ アルキル、 $-CO-N((C_{1-4})アルキル)_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4})$ アルキル及び $-N((C_{1-4})アルキル)_2$ (前記 (C_{1-6}) アルキル及び $O-(C_{1-6})$ アルキルは、任意に1～3個

のハロゲン置換基で置換されていてもよい) からそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてもよく; かつ

b) 前記(C₃₋₇)シクロアルキルは、任意に、ニトロ、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、-O-(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₄)アルケニル、-OCF₃、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、トリ(C₁₋₆)アルキルシリル、R⁴¹、-C(=O)-R⁴¹、-C(=O)OR⁴¹、-C(=O)N(R⁴²)R⁴¹、-SO₂R⁴¹、及び-OC(=O)-R⁴¹からそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく;

それぞれR⁴¹は以下の基:

i) H、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)シクロアルケニル、Het、又はアリール-(C₁₋₄)アルキル-O-;

ii) アリール又はアリールオキシ(それぞれ任意に(C₁₋₆)アルキルで置換されていてもよい); 及び

iii) (C₁₋₈)アルキル(任意に、-O-(C₁₋₆)アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、(C₂₋₁₀)アルケニル、(C₂₋₁₀)アルキニル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)シクロアルケニル、アリール、Het、アリールオキシ、及びアリール-(C₁₋₄)アルキル-O-からそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、前記各アリール及びアリールオキシは、任意に(C₁₋₆)アルキルで置換されていてもよい)

から独立に選択され; かつ

R⁴²は、H及び(C₁₋₆)アルキルから選択される); 或いは

R⁴が-N(R^{N2})(R^{N1})であり(ここで、R^{N1}及びR^{N2}は、H、(C₁₋₆)アルキル、-O-(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル-(C₁₋₆)アルキル-、アリール及びアリール-(C₁₋₆)アルキル-からそれぞれ独立に選択され; 前記(C₁₋₆)アルキル、-O-(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル-(C₁₋₆)アルキル-、アリール及びアリール-(C₁₋₆)アルキル-は、それぞれ任意に、ハロゲン、(C₁₋₆)アルキル、ヒドロキシ、シアノ、O-(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-CO-NH₂、-CO-NH(C₁₋₄)アルキル、-CO-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-COOH、及び-COO(C₁₋₆)アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく; 或いは

R^{N2}とR^{N1}が、それらが結合している窒素と一緒に結合して3-員~7-員単環式飽和若しくは不飽和ヘテロ環(任意に、少なくとも1個の他の環に縮合してヘテロ多環を形成していてもよく、前記ヘテロ環及びヘテロ多環は、それぞれ任意に、N、S及びOからそれぞれ独立に選択される1~3個のさらなるヘテロ原子を含んでよく、かつ任意に、ハロゲン、(C₁₋₆)アルキル、ヒドロキシ、シアノ、O-(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-CO-NH₂、-CO-NH(C₁₋₄)アルキル、-CO-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-COOH、及び-COO(C₁₋₆)アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい)を形成している);

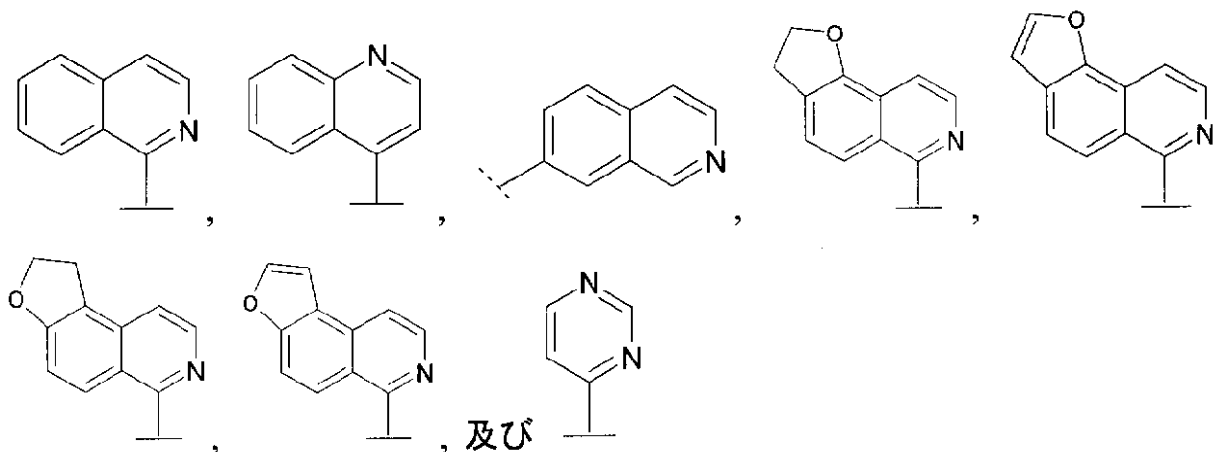
ここで、Hetは、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~4個のヘテロ原子を有する3-員~7-員ヘテロ環として定義され、このHetは、飽和、不飽和又は芳香族でよく、かつ任意に、少なくとも1個の他の環に縮合して4-員~14-員ヘテロ多環(可能な場合どこでも、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~5個のヘテロ原子を有しうる)を形成していてもよく、前記ヘテロ多環は、飽和、不飽和又は芳香族でよく;

但し、

nが1であり; mが2であり; R¹がエチル又はエテニルであり; かつ

R²が-O-R²⁰であり(ここで、R²⁰はHetで、該Hetは以下の基:

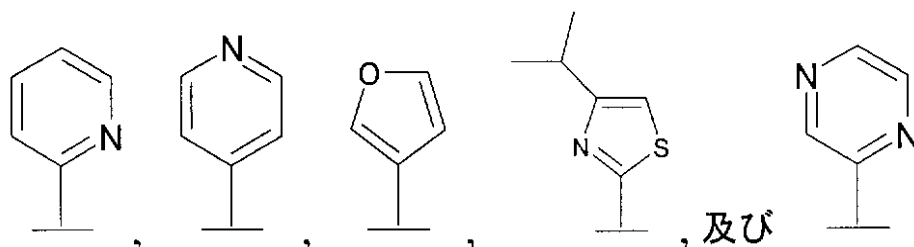
【化 2】



から選択され；

前記Hetは、任意に R^{200} で置換されていてもよく、前記 R^{200} は、メチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、フェニル、4-メトキシフェニル、4-(ジメチルアミノ)フェニル、4-シアノフェニル、並びに以下の基：

【化 3】



から選択される基からそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基である)；かつ

R^4 がシクロプロピル(任意にプロピル、シクロプロピルメチル又はフェニルメチルで置換されていてもよい)であり；かつ

R^3 が $-\text{COOR}^{31}$ の場合；

R^{31} は、1,1-ジメチルエチルでない。))

【請求項 2】

式中、 R^1 が (C_{2-6}) アルケニル又は (C_{2-6}) アルキルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式中、 R^2 が $-\text{O}-R^{20}$ 及び $-\text{S}-R^{20}$ から選択され、前記 R^{20} は請求項 1 の定義どおりであり、該 R^{20} は任意に R^{200} (R^{200} は請求項 1 の定義どおり)で置換されていてもよい、請求項 1 又は 2 記載の化合物。

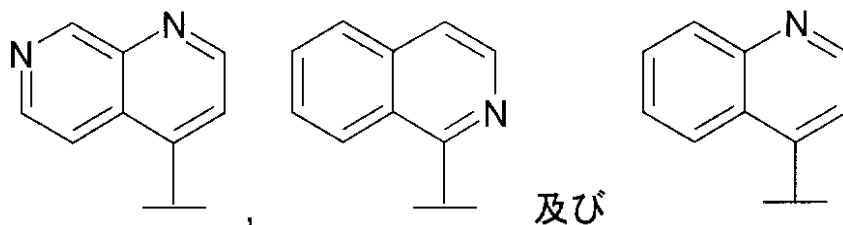
【請求項 4】

式中、 R^2 が $-\text{O}-R^{20}$ であり、前記 R^{20} は請求項 3 の定義どおりであり、該 R^{20} は、任意に R^{200} (R^{200} は請求項 3 の定義どおり)で置換されていてもよい、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

式中、 R^{20} が、以下の基：

【化 4】



から選択されるHetであり、該Hetは、任意に R^{200} (R^{200} は請求項4の定義どおり)で置換されていてもよい、請求項4記載の化合物。

【請求項 6】

R^{200} が、H、ハロゲン、シアノ、 (C_{1-6}) アルキル、アリール、Het、 $-OR^{201}$ 、 $-SR^{201}$ 、 $-SOR^{201}$ 及び $-SO_2R^{201}$ からそれぞれ独立に選択される1~4個の置換基であり； (C_{1-6}) アルキル、アリール及びHetは、それぞれ任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよく；

R^{201} が、それぞれ独立に (C_{1-6}) アルキル（任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよい）から選択され；

R^{2000} が、それぞれ独立に、ハロゲン、 R^{2003} 、アリール、Het、 $-OR^{2001}$ 、 $-SR^{2001}$ 、 $-SOR^{2001}$ 、 $-SO_2R^{2001}$ 、シアノ、及び $-N(R^{2002})(R^{2001})$ からそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基であり；前記アリール及びHetは、それぞれ任意に、 (C_{1-6}) アルキル及び $-O-(C_{1-6})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてもよく；

R^{2001} が、それぞれ独立にアリール、アリール- (C_{1-6}) アルキル-、 $-C(O)-R^{2003}$ 、 $-C(O)O-R^{2003}$ 、 $-CON(R^{2002})(R^{2004})$ 及び R^{2004} から選択され；

R^{2002} が、それぞれ独立にH及び (C_{1-6}) アルキルから選択され；

R^{2003} が、それぞれ独立に (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-から選択され、前記 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-は、それぞれ任意に、 (C_{1-3}) アルキルからそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく；

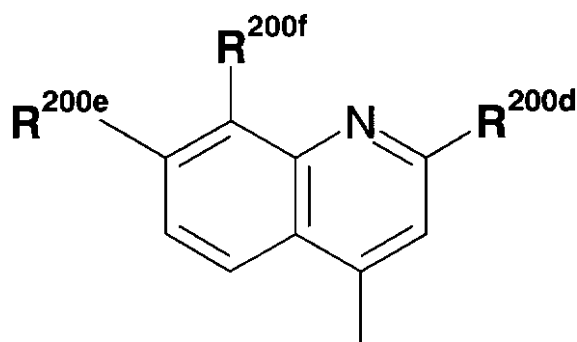
R^{2004} が、それぞれ独立にH及び R^{2003} から選択され；かつ

Hetが、それぞれ独立に、N、O及びSからそれぞれ独立に選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5-、6-又は7-員単環式飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ環である、請求項5記載の化合物。

【請求項 7】

R^{20} が下記式のHetである、請求項5記載の化合物。

【化 5】



(式中、

R^{200d} はH、アリール、Het、又は $-OR^{201}$ であり、前記Hetは、N、O及びSからそれぞれ独立に選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5-、6-又は7-員単環式飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ環であり、かつ前記アリール及びHetは、それぞれ任意に R^{2000} でさらに置

換されていてもよく；

R^{200e} はH又は $-OR^{201}$ であり；かつ

R^{200f} はH、 (C_{1-6}) アルキル、ハロゲン、 $-SR^{201}$ 、 $-SO_2R^{201}$ 、又は $-OR^{201}$ であり；前記 (C_{1-6}) アルキルは、任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよく；

R^{201} は、それぞれ独立に (C_{1-6}) アルキル（任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよい）から選択され；

R^{2000} は、それぞれ独立に、ハロゲン、 (C_{3-7}) シクロアルキル、アリール、 $-OR^{2001}$ 、シアノ、及び $-N(R^{2002})(R^{2001})$ からそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基であり；

R^{2001} は、それぞれ独立にH、 (C_{1-6}) アルキル及び $-COR^{2003}$ から選択され；

R^{2002} は、それぞれ独立にH及び (C_{1-6}) アルキルから選択され；かつ

R^{2003} は、それぞれ独立に (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-から選択される。）

【請求項 8】

R^{31} が、任意に1～3個のハロゲン置換基で置換されていてもよい (C_{1-6}) アルキルである、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

式中、 R^3 が、 $-C(O)NR^{32}R^{33}$ (R^{32} 及び R^{33} は請求項 1 の定義どおり) である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

式中、 R^3 が SO_vR^{34} (v 及び R^{34} は請求項 1 の定義どおり) である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

式中、 R^3 が $-C(O)-R^{35}$ (R^{35} は請求項 1 の定義どおり) である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

R^{35} が、それぞれ任意にヒドロキシルで置換されていてもよい (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-、フェニル- (C_{1-6}) アルキル-及びHet- (C_{1-6}) アルキル-から選択される、請求項 11 記載の化合物。

【請求項 13】

式中、 R^4 が、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、フェニル、ナフチル、Het、フェニルメチル、ナフチルメチル及びHet-メチルから選択され；

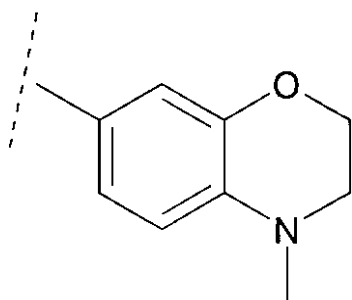
a) それぞれ任意に、フルオロ及びメチルからそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基で置換されていてもよく；かつ

b) それぞれ任意に、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メトキシ、フェノキシ及びトリフルオロメトキシからそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ

c) それぞれ任意に、クロロ、ブロモ、シアノ、ニトロ、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NHCH_3$ 、 $-CO-N(CH_3)_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 及び $-N(CH_3)_2$ から選択される置換基で置換されていてもよく；

このときHetは、チエニル、フリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリジニル、イソインドリル、3H-インドリル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロフリル、チアジアゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、ペピリジニル、ペピラジニル、モルフォリニル、トリアゾリル、テトラゾリル、及び下記基から選択される、請求項 1 ～ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【化 6】



【請求項 1 4】

式中、 R^4 がシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシルから選択され；

- a) それぞれ任意に、1、2又は3個のフルオロ置換基で置換されていてもよく；かつ
- b) それぞれ任意に、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メトキシ及びトリフルオロメトキシからそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ
- c) それぞれ任意に、クロロ、ブロモ、シアノ、ニトロ、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 及び $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ から選択される置換基で置換されていてもよく；かつ
- d) それぞれ任意に (C_{1-8}) アルキルで置換されていてもよい（前記 (C_{1-8}) アルキルは、任意に、 $-\text{O}-(\text{C}_{1-6})$ アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、 (C_{2-10}) アルケニル、 (C_{2-10}) アルキニル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{4-7}) シクロアルケニル、アリール、アリールオキシ、及びアリール $-(\text{C}_{1-4})$ アルキル $-\text{O}-$ からそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、前記各アリール及びアリールオキシは任意に (C_{1-6}) アルキルで置換されていてもよい）、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

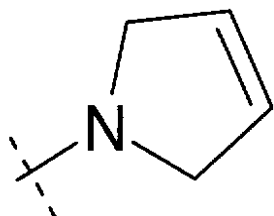
【請求項 1 5】

式中、 R^4 が $-\text{N}(\text{R}^{\text{N}2})(\text{R}^{\text{N}1})$ であり、 $\text{R}^{\text{N}1}$ 及び $\text{R}^{\text{N}2}$ が、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル及びフェニルメチルからそれぞれ独立に選択され（前記メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル及びフェニルメチルは、任意に、ハロゲン、 (C_{1-4}) アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 $\text{O}-(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{N}((\text{C}_{1-4})\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{CO}-\text{N}((\text{C}_{1-4})\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、及び $-\text{COO}(\text{C}_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい）；或いは $\text{R}^{\text{N}2}$ と $\text{R}^{\text{N}1}$ が、それらが結合している窒素と一緒に結合して3-、4-、5-又は6-員単環式飽和若しくは不飽和ヘテロ環（任意に、N、S及びOからそれぞれ独立に選択される1~3個のさらなるヘテロ原子を含んでよく、かつ任意に、ハロゲン、 (C_{1-4}) アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 $\text{O}-(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{N}((\text{C}_{1-4})\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(\text{C}_{1-4})$ アルキル、 $-\text{CO}-\text{N}((\text{C}_{1-4})\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、及び $-\text{COO}(\text{C}_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてもよい）を形成している、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

式中、 R^4 が、メチル、エチル、1-メチルエチル、プロピル、エテニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、Het、フェニル、下記基：

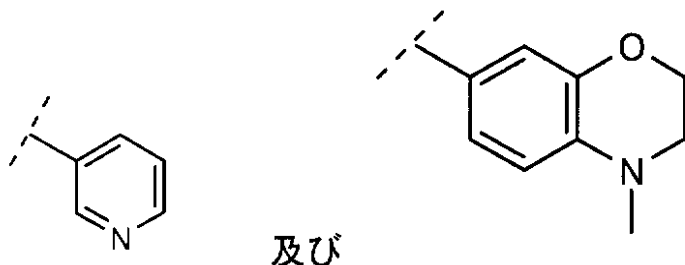
【化 7】



-N(CH₃)-OCH₃ 及び -N(CH₃)₂ から選択され；

このときHetは以下の基：

【化 8】



から選択され、前記Hetは、任意にフェノキシで置換されていてもよく；前記フェニルは、任意にハロゲンで置換されていてもよく；前記シクロプロピルは、任意に、その1-位でメチル、エチル、プロピル又はブチル（各メチル、エチル、プロピル及びブチルは、任意にフェニル、(C₃₋₆)シクロアルキル、(C₂₋₆)アルケニル又は(C₁₋₄)アルコキシでさらに置換されていてもよい）にて置換されていてもよい、請求項 1 ～ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】

式中、

nが1又は2であり；

mが1又は2であり；

R¹が(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、又は(C₂₋₆)アルキニルであり；前記(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、及び(C₂₋₆)アルキニルは、任意に、1個以上の置換可能な位置で1～3個のハロゲン原子にて置換されていてもよく；

R²が、-NH-R²⁰、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-SO-R²⁰、-SO₂-R²⁰、-OCH₂-R²⁰、及び-CH₂O-R²⁰から選択され（このとき、

R²⁰はアリール又はHetであり、前記アリール及びHetは、任意にR²⁰⁰で置換されていてもよく、

R²⁰⁰は、H、ハロゲン、シアノ、(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、アリール-(C₁₋₆)アルキル-、アリール、Het、オキソ、チオキソ、-OR²⁰¹、-SR²⁰¹、-SOR²⁰¹、-SO₂R²⁰¹、-N(R²⁰²)R²⁰¹、及び-CON(R²⁰²)R²⁰¹からそれぞれ独立に選択される1～4個の置換基であり；前記アルキル、シクロアルキル、アリール及びHetは、それぞれ任意にR²⁰⁰⁰でさらに置換されていてもよく；

R²⁰¹は、それぞれ独立にH、(C₁₋₆)アルキル、アリール、(C₂₋₄)アルケニル、(C₂₋₄)アルキニル、-CO-(C₁₋₆)アルキル及び-CO-O-(C₁₋₆)アルキルから選択され、前記各アルキル及びアリールは、任意にR²⁰⁰⁰でさらに置換されていてもよく；

R²⁰²はH又は(C₁₋₆)アルキルであり；

R²⁰⁰⁰は、ハロゲン、R²⁰⁰³、アリール、Het、-OR²⁰⁰¹、-SR²⁰⁰¹、-SOR²⁰⁰¹、-SO₂R²⁰⁰¹、シアノ及び-N(R²⁰⁰²)(R²⁰⁰¹)からそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基であり；前記アリール及びHetは、任意に、(C₁₋₆)アルキル及び-O-(C₁₋₆)アルキルからそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてもよく；

R²⁰⁰¹は、それぞれ独立にアリール、アリール-(C₁₋₆)アルキル-、-C(O)-R²⁰⁰³、-C(O)O

$-R^{2003}$ 、 $-\text{CON}(R^{2002})(R^{2004})$ 及び R^{2004} から選択され；

R^{2002} は、それぞれ独立に H 及び (C_{1-6}) アルキルから選択され；

R^{2003} は、それぞれ独立に (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル又は (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル- から選択され、前記 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル- は、任意に、 (C_{1-3}) アルキルからそれぞれ独立に選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよく；かつ

R^{2004} は、それぞれ独立に H 又は R^{2003} から選択される)；

R^3 が、以下の基：

(i) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{31}$ (R^{31} は (C_{1-6}) アルキル又はアリールであり、前記 (C_{1-6}) アルキルは 1~3 個のハロゲン置換基で置換されている)；

(ii) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{32}\text{R}^{33}$ (R^{32} 及び R^{33} は、それぞれ独立に H、 (C_{1-6}) アルキル、及び Het から選択される)；

(iii) $-\text{SO}_v\text{R}^{34}$ (v は 1 又は 2 であり、かつ R^{34} は、 (C_{1-6}) アルキル、アリール、Het、及び $\text{NR}^{32}\text{R}^{33}$ から選択され、 R^{32} 及び R^{33} は上記定義どおり)；及び

(iv) $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{35}$ (R^{35} は、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル-、アリール及びアリール- (C_{1-6}) アルキル- から選択され、それぞれ任意に、1~3 個の置換可能な位置で、ハロ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、Het、 $-\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、ヒドロキシ、及びアリールからそれぞれ独立に選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい)

から選択され；

R^4 が、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{2-6}) アルケニル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-6}) アルキル-、アリール、Het、アリール- (C_{1-4}) アルキル-、又は Het- (C_{1-4}) アルキル- であり (このとき、

a) 前記 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{2-6}) アルケニル、アリール、Het、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-6}) アルキル-、アリール- (C_{1-4}) アルキル-、及び Het- (C_{1-4}) アルキル- は、任意にニトロで置換されていてもよく、又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 (C_{1-6}) アルキル、 $\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、 O -アリール、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NH}(C_{1-4})$ アルキル、 $-\text{CO}-\text{N}((C_{1-4}) \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(C_{1-4})$ アルキル及び $-\text{N}((C_{1-4}) \text{ アルキル})_2$ からそれぞれ独立に選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよく (ここで、前記 (C_{1-6}) アルキル及び $\text{O}-(C_{1-6})$ アルキルは、任意に 1~3 個のハロゲン置換基で置換されていてもよい)；かつ

b) 前記 (C_{3-7}) シクロアルキルは、任意に、ニトロ、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $-\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、 (C_{2-4}) アルケニル、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(C_{1-4})$ アルキル、 $-\text{N}((C_{1-4}) \text{ アルキル})_2$ 、トリ (C_{1-6}) アルキルシリル、 R^{41} 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{41}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{41}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(R^{42})R^{41}$ 、 $-\text{SO}_2R^{41}$ 、及び $-\text{OC}(=\text{O})-\text{R}^{41}$ からそれぞれ独立に選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく；

R^{41} は、それぞれ独立に以下の基：

i) H、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{4-7}) シクロアルケニル、Het、又はアリール- (C_{1-4}) アルキル- O -；

ii) アリール又はアリールオキシ (それぞれ任意に (C_{1-6}) アルキルで置換されていてもよい)；及び

iii) (C_{1-8}) アルキル (任意に、 $-\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、 (C_{2-10}) アルケニル、 (C_{2-10}) アルキニル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{4-7}) シクロアルケニル、アリール、Het、アリールオキシ、及びアリール- (C_{1-4}) アルキル- O - からそれぞれ独立に選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、前記各アリール及びアリールオキシは任意に (C_{1-6}) アルキルで置換されていてもよい)

から選択され；かつ

R^{42} は、H 及び (C_{1-6}) アルキルから選択される)；或いは

R^4 が $-\text{N}(R^{N2})(R^{N1})$ であり (ここで、 R^{N1} 及び R^{N2} は、H、 (C_{1-6}) アルキル、 $-\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-6}) アルキル-、アリール及びアリール- (C_{1-6}) アルキル- (前記 (C_{1-6}) アルキル、 $-\text{O}-(C_{1-6})$ アルキル、 (C_{3-7}) シクロアル

キル、(C₃₋₇)シクロアルキル-(C₁₋₆)アルキル-、アリール及びアリール-(C₁₋₆)アルキル-は、それぞれ任意に、ハロゲン、(C₁₋₆)アルキル、ヒドロキシ、シアノ、O-(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-CO-NH₂、-CO-NH(C₁₋₄)アルキル、-CO-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-COOH、及び-COO(C₁₋₆)アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい)からそれぞれ独立に選択され；或いは

R^{N2}とR^{N1}が、それらが結合している窒素と一緒に結合して3-員~7-員単環式飽和若しくは不飽和ヘテロ環(任意に、少なくとも1個の他の環に縮合してヘテロ多環を形成していてもよく、前記ヘテロ環及びヘテロ多環は、任意に、N、S及びOからそれぞれ独立に選択される1~3個のさらなるヘテロ原子を含んでよく、かつ任意に、ハロゲン、(C₁₋₆)アルキル、ヒドロキシ、シアノ、O-(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-CO-NH₂、-CO-NH(C₁₋₄)アルキル、-CO-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-COOH、及び-COO(C₁₋₆)アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい)を形成している)；

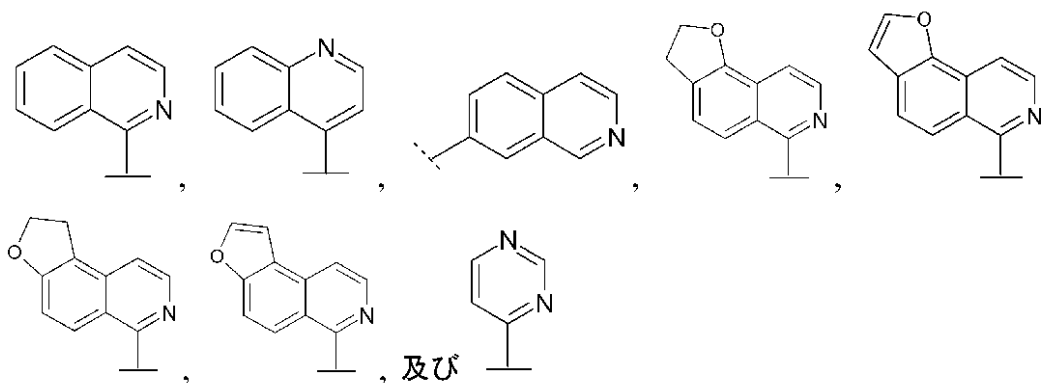
このときHetは、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~4個のヘテロ原子を有する3-員~7-員ヘテロ環として定義され、このHetは、飽和、不飽和又は芳香族でよく、かつ任意に、少なくとも1個の他の環に縮合して4-員~14-員ヘテロ多環(可能な場合どこでも、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~5個のヘテロ原子を有する)を形成していてもよく、前記ヘテロ多環は、飽和、不飽和又は芳香族でよく；

但し、

nが1であり；mが2であり；R¹がエチル又はエテニルであり；かつ

R²が-O-R²⁰であり(ここで、R²⁰はHetで、該Hetは以下の基：

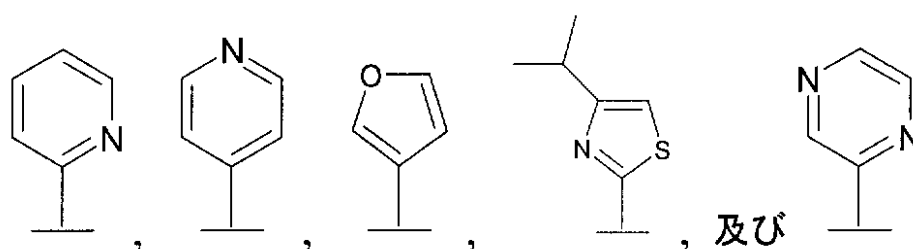
【化9】



から選択され；

前記Hetは、任意にR²⁰⁰(R²⁰⁰は、メチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、フェニル、4-メトキシフェニル、4-(ジメチルアミノ)フェニル、4-シアノフェニル、並びに以下の基：

【化10】



から選択される基からそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基である)で置換されていてもよい)；かつ

R⁴がシクロプロピル(任意にプロピル、シクロプロピルメチル又はフェニルメチルで置換されていてもよい)であり；かつ

R^3 が $-\text{COOR}^{31}$ の場合 ;

R^{31} は、1,1-ジメチルエチルでない、

請求項 1 記載の化合物、そのラセミ化合物、ジアステレオマー、光学異性体又はその医薬的に許容しうる塩。

【請求項 18】

式中、

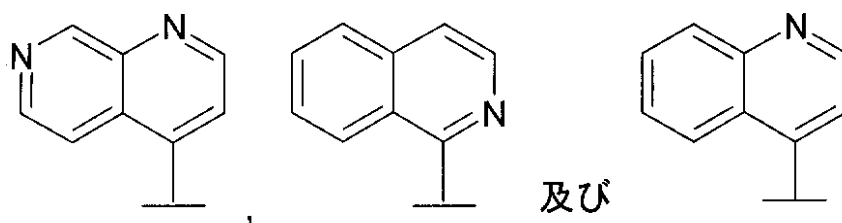
m が 2 であり ;

n が 1 であり ;

R^1 が (C_{2-6}) アルケニル又は (C_{2-6}) アルキルであり ;

R^2 が $-\text{O}-\text{R}^{20}$ であり、かつ R^{20} が、以下の基 :

【化 11】



から選択される Het であり ;

前記 Het は無置換又は R^{200} で置換され、

R^{200} は、H、ハロゲン、シアノ、 (C_{1-6}) アルキル、アリール、Het、 $-\text{OR}^{201}$ 、 $-\text{SR}^{201}$ 、 $-\text{SOR}^{201}$ 及び $-\text{SO}_2\text{R}^{201}$ からそれぞれ独立に選択される 1~4 個の置換基であり (このとき (C_{1-6}) アルキル、アリール及び Het は、それぞれ任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよく ;

R^{201} は、それぞれ独立に (C_{1-6}) アルキル (任意に R^{2000} でさらに置換されていてもよい) から選択され ;

R^{2000} は、それぞれ独立に、ハロゲン、 R^{2003} 、アリール、Het、 $-\text{OR}^{2001}$ 、 $-\text{SR}^{2001}$ 、 $-\text{SOR}^{2001}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{2001}$ 、シアノ、及び $-\text{N}(\text{R}^{2002})(\text{R}^{2001})$ からそれぞれ独立に選択される 1~3 個の置換基であり (前記アリール及び Het は、それぞれ任意に、 (C_{1-6}) アルキル及び $-\text{O}-(\text{C}_{1-6})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される 1、2 又は 3 個の置換基で置換されていてもよい) ;

R^{2001} は、それぞれ独立にアリール、アリール- (C_{1-6}) アルキル-、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{2003}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{R}^{2003}$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^{2002})(\text{R}^{2004})$ 及び R^{2004} から選択され ;

R^{2002} は、それぞれ独立に H 及び (C_{1-6}) アルキルから選択され ;

R^{2003} は、それぞれ独立に (C_{1-8}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル- から選択され (前記 (C_{3-7}) シクロアルキル及び (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル- は、それぞれ任意に、 (C_{1-3}) アルキルからそれぞれ独立に選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよい) ;

R^{2004} は、それぞれ独立に H 及び R^{2003} から選択され ; かつ

Het は、それぞれ独立に、N、O 及び S からそれぞれ独立に選択される 1~4 個のヘテロ原子を含有する 5-、6- 又は 7- 員単環式飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ環である) ;

R^3 が以下の基 :

(i) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{31}$ (R^{31} は、任意に 1~3 個のハロゲン置換基で置換されていてもよい (C_{1-6}) アルキルである) ;

(ii) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{32}\text{R}^{33}$ (R^{32} 及び R^{33} は、それぞれ独立に H、 (C_{1-6}) アルキル、及び Het から選択され、Het は、N、O 及び S からそれぞれ独立に選択される 1~3 個のヘテロ原子を含有する 5- 又は 6- 員飽和、不飽和若しくは芳香族単環式ヘテロ環である) ;

(iii) SO_vR^{34} (v は 2 であり、かつ R^{34} は (C_{1-6}) アルキル及び $\text{NR}^{32}\text{R}^{33}$ から選択され、 R^{32} 及び R^{33} は、それぞれ独立に H 及び (C_{1-6}) アルキルから選択される) ; 及び

(iv) $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{35}$ (R^{35} は、以下の基 :

(a) (C_{1-8}) アルキル (任意に、ハロ、ヒドロキシル、 $-\text{O}-(\text{C}_{1-6})$ アルキル、 $-\text{S}-(\text{C}_{1-6})$ ア

ルキル、 $-\text{SO}-(\text{C}_{1-6})$ アルキル、 $-\text{SO}_2-(\text{C}_{1-6})$ アルキル、 $-\text{O}-$ フェニル、 $-\text{S}-$ フェニル、 $-\text{SO}-$ フェニル及び $-\text{SO}_2-$ フェニルからそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく、前記 $-\text{O}-$ フェニル、 $-\text{S}-$ フェニル、 $-\text{SO}-$ フェニル及び $-\text{SO}_2-$ フェニルのフェニル部分は、それぞれ任意に1~5個のハロ置換基で置換されていてもよい)；

(b) (C_{3-7}) シクロアルキル又は (C_{3-7}) シクロアルキル- (C_{1-4}) アルキル- (それぞれ任意に、ハロ、 (C_{1-6}) アルキル、アリール及びヒドロキシルからそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)；及び

(c) フェニル、テトラヒドロナフチル、フェニル- (C_{1-6}) アルキル-又はHet- (C_{1-6}) アルキル- (それぞれ任意に、 (C_{1-6}) アルキル及びヒドロキシルからそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく；かつHetは、N、O及びSからそれぞれ独立に選択される1~3個のヘテロ原子を含有する、飽和、不飽和又は芳香族である5-又は6-員単環式ヘテロ環である)から選択される)

から選択され；

R^4 が、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、フェニル、ナフチル、Het、フェニルメチル、ナフチルメチル及びHet-メチル(

a) それぞれ任意に、フルオロ及びメチルからそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく；かつ

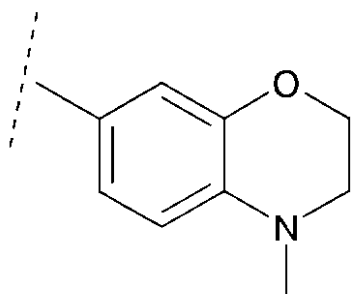
b) それぞれ任意に、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メトキシ、フェノキシ及びトリフルオロメトキシからそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ

c) それぞれ任意に、クロロ、ブromo、 CF_3 、シアノ、ニトロ、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 及び $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ から選択される置換基で置換されていてもよい)

から選択され；

このときHetは、チエニル、フリル、チアゾリル、ベンゾチアゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリジニル、イソインドリル、3H-インドリル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロフリル、チアジアゾリル、イソキサゾリル、ベンゾチエニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルフォリニル、トリアゾリル、テトラゾリル、及び下記基；

【化 1 2】



から選択され；

或いは、 R^4 が、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル(

a) それぞれ任意に1~3個のフルオロ置換基で置換されていてもよく；かつ

b) それぞれ任意に、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メトキシ及びトリフルオロメトキシからそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ

c) それぞれ任意に、クロロ、ブromo、シアノ、ニトロ、 $-\text{CO}-\text{NH}_2$ 、 $-\text{CO}-\text{NHCH}_3$ 、 $-\text{CO}-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{CH}_3)$ 及び $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ から選択される置換基で置換されていてもよく；かつ

d) それぞれ任意に (C_{1-8}) アルキルで置換されていてもよく、前記 (C_{1-8}) アルキルは、

任意に、 $-O-(C_{1-6})$ アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、 (C_{2-10}) アルケニル、 (C_{2-10}) アルキニル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 (C_{4-7}) シクロアルケニル、アリール、アリールオキシ、及びアリール- (C_{1-4}) アルキル- $O-$ （前記アリール及びアリールオキシは、それぞれ任意に (C_{1-6}) アルキルで置換されていてよい）からそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてよい）

から選択され；

或いは、 R^4 が $-N(R^{N2})(R^{N1})$ であり（ R^{N1} 及び R^{N2} は、それぞれ独立にH、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル及びフェニルメチルから選択され；前記メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル及びフェニルメチルは、任意に、ハロゲン、 (C_{1-4}) アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 $O-(C_{1-4})$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4})$ アルキル、 $-N((C_{1-4})$ アルキル) $_2$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_{1-4})$ アルキル、 $-CO-N((C_{1-4})$ アルキル) $_2$ 、 $-COOH$ 、及び $-COO(C_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1個以上の置換基で置換されていてよく；或いは

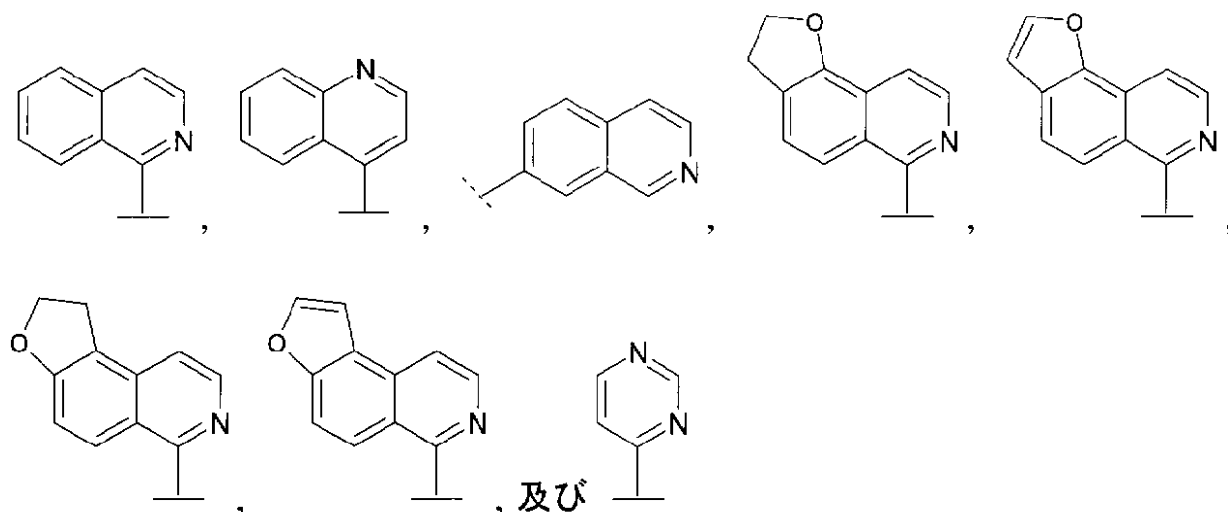
R^{N2} と R^{N1} が、それらが結合している窒素と一緒に結合して3-、4-、5-又は6-員単環式飽和若しくは不飽和ヘテロ環（任意に、N、S及びOからそれぞれ独立に選択される1~3個のさらなるヘテロ原子を含んでよく、かつ任意に、ハロゲン、 (C_{1-4}) アルキル、ヒドロキシ、シアノ、 $O-(C_{1-4})$ アルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4})$ アルキル、 $-N((C_{1-4})$ アルキル) $_2$ 、 $-CO-NH_2$ 、 $-CO-NH(C_{1-4})$ アルキル、 $-CO-N((C_{1-4})$ アルキル) $_2$ 、 $-COOH$ 、及び $-COO(C_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1、2又は3個の置換基で置換されていてよい）を形成している）；

但し、

R^1 がエチル又はエテニルであり；かつ

R^2 が $-O-R^{20}$ であり（ R^{20} はHetで、該Hetは以下の基：

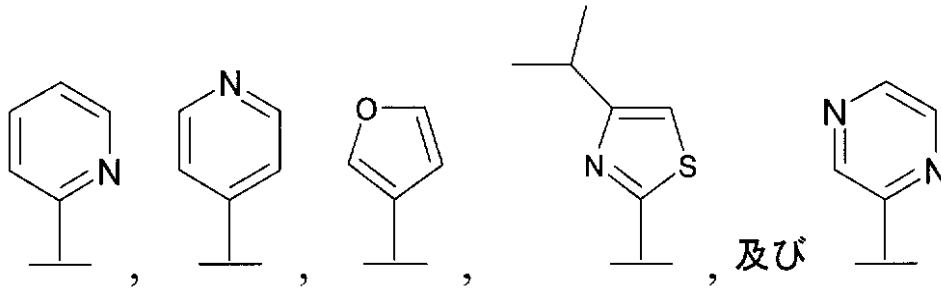
【化13】



から選択され；

かつ前記Hetは、任意に R^{200} で置換されていてよく、 R^{200} は、メチル、メトキシ、クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、フェニル、4-メトキシフェニル、4-(ジメチルアミノ)フェニル、4-シアノフェニル、並びに以下の基：

【化 1 4】



から選択される基からそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基である) ;

R^4 が、任意にプロピル、シクロプロピルメチル又はフェニルメチルで置換されていてもよいシクロプロピルであり ; かつ

R^3 が $-\text{COOR}^{31}$ の場合 ;

R^{31} は1,1-ジメチルエチルでない、請求項1記載の化合物。

【請求項 1 9】

抗-C型肝炎ウイルスとして有効な量の請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩と、医薬的に許容しうる分散媒又は補助薬とを含んでなる医薬組成物。

【請求項 2 0】

治療的に有効な量の少なくとも1種の他の抗ウイルス薬をさらに含む、請求項19記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

哺乳類のC型肝炎ウイルス感染症の治療又は予防用医薬組成物であって、抗-C型肝炎ウイルスとして有効な量の請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、その医薬的に許容しうる塩、又はその組成物を含む、前記医薬組成物。

【請求項 2 2】

抗-C型肝炎ウイルスとして有効な量の請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩を含有する、哺乳類におけるC型肝炎ウイルスの複製を阻害するための医薬組成物。

【請求項 2 3】

請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩の、薬物製造のための使用。

【請求項 2 4】

請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩の、哺乳類のC型肝炎ウイルス感染症の治療又は予防用薬物製造のための使用。

【請求項 2 5】

請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩の、C型肝炎ウイルスの複製を阻害するための薬物製造のための使用。

【請求項 2 6】

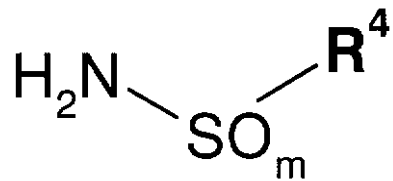
HCV感染症を治療するため又はHCVのNS3プロテアーゼを阻害するために有効な組成物と、この組成物を用いて、C型肝炎ウイルスによる感染症を治療できることを示す標識を含むパッケージング材料とを含む製品であって、前記組成物が、請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物又はその医薬的に許容しうる塩を含む、前記製品。

【請求項 2 7】

以下の工程 :

a) 下記式(II) :

【化 1 5】

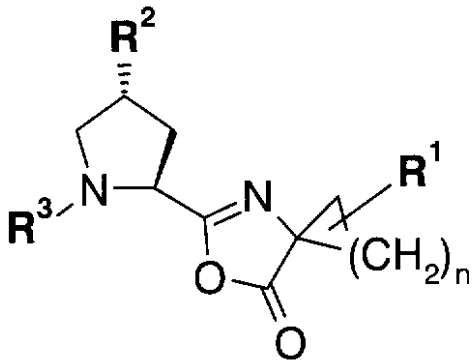


(II)

(式中、 R^4 及び m は、請求項1の定義どおり)の化合物を強塩基と反応させて対応するアミドアニオンを形成する工程；及び

b) 下記式(III)：

【化 1 6】



(III)

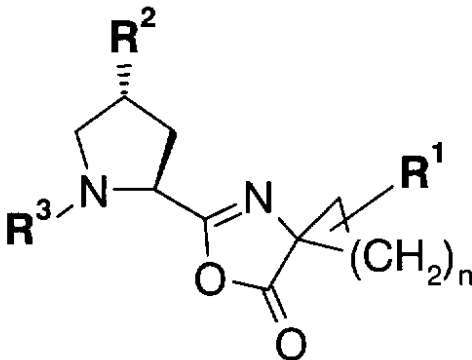
(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び n は、請求項1の定義どおり)のアザラクトンを、工程a)で形成されたアミドアニオンと反応させる工程

を含む、請求項1～18のいずれか1項に記載の化合物の製造方法。

【請求項28】

下記式(III)のアザラクトン中間体化合物。

【化 1 7】



(III)

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び n は、請求項1の定義どおりである。)

【請求項29】

請求項28記載のアザラクトン中間体化合物の、HCV NS3プロテアーゼインヒビターペ

プチド類似体の製造での使用。