

【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24年9月6日(2012.9.6)

【公表番号】特表2010-514811(P2010-514811A)

【公表日】平成22年5月6日(2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-544316(P2009-544316)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/14 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

C 0 7 D 471/08 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

C 0 7 D 491/044 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 491/052 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 491/20 (2006.01)

C 0 7 D 491/113 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 19/10	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 27/12	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 15/14	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 5/00	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 13/08	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 35/02	
A 6 1 K 31/502	
C 0 7 D 403/04	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/55	
A 6 1 K 31/551	
C 0 7 D 471/04	1 2 1
C 0 7 D 471/04	1 1 3
A 6 1 K 31/517	
C 0 7 D 487/04	1 5 0
C 0 7 D 417/04	
A 6 1 K 31/554	
C 0 7 D 487/04	1 3 7
C 0 7 D 471/08	
C 0 7 D 487/04	1 4 0
C 0 7 D 405/14	
C 0 7 D 487/10	
C 0 7 D 491/044	
C 0 7 D 495/04	1 1 6
C 0 7 D 413/12	
A 6 1 K 31/538	
C 0 7 D 471/04	1 1 1
A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 491/052	
C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 491/20	
C 0 7 D 495/04	1 0 5 Z
C 0 7 D 491/113	

【手続補正書】

【提出日】平成24年7月17日(2012.7.17)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

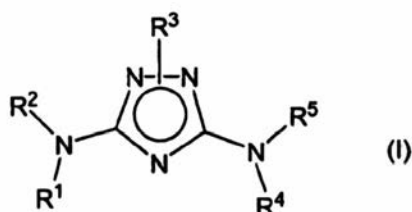
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 3 1】



で表され、単離された立体異性体もしくはその混合物、または互変異性体もしくはその混合物、あるいはその薬学的に受容可能な塩もしくはN-オキシドの形態である化合物であって、式 (I) において、

R^1 、 R^4 および R^5 は、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アラルキル、 $-C(O)R^8$ 、 $-C(O)N(R^6)R^7$ 、および $-C(=NR^6)N(R^6)R^7$ からなる群より選択され；

R^2 および R^3 は、各々独立して、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^8$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されているか；

あるいは R^2 は、上記のような 14 個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、そして R^3 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に

応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されているか；

あるいは R^3 は、上記のような14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、そして R^2 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通

の窒素と一緒に、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリアルもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し；

各R⁸は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、必要に応じて置換されたアリアル、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリアル、必要に応じて置換されたヘテロアリアルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリアルアルケニル、および必要に応じて置換されたヘテロアリアルアルキニルからなる群より選択され；

各R⁹は独立して、直接結合、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルケニレン鎖および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキニレン鎖からなる群より選択され；

各R¹⁰は独立して、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルケニレン鎖および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキニレン鎖からなる群より選択され；

各R¹¹は独立して、水素、アルキル、シアノ、ニトロおよびOR⁸からなる群より選択され；

各R¹²は独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリアル、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリアルおよび必要に応じて置換されたヘテロアリアルアルキルからなる群より選択されるか、または2つのR¹²は、これらの両方が結合する共通の窒素と一緒に、必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロアリアルを形成し；

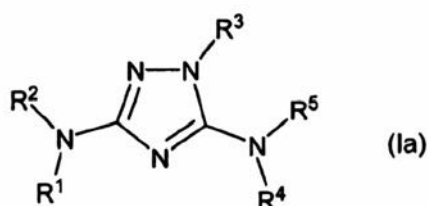
各R¹³は独立して、直接結合、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルケニレン鎖からなる群より選択され；そして

各R¹⁴は独立して、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルケニレン鎖からなる群より選択される、化合物。

【請求項2】

式(Ia)：

【化32】



で表され、式(Ia)において、

R¹、R²、R³、R⁴およびR⁵は、前記式(I)で定義したものと同一である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

前記式(Ia)において、

R^2 および R^3 は、各々独立して、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリアルであり、該多環式ヘテロアリアルは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリアル、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリアル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ (ここで p は0、1もしくは2である)、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここで p は0、1もしくは2である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここで t は1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されている、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

前記式 (I a) において、

R^1 、 R^4 および R^5 は、各々水素であり；

R^2 および R^3 は、各々独立して、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-c] ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [4, 5] チエノ [2, 3-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] アゼピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ [b, f] [1, 4] チアゼピン-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [4, 5-c] ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] オキセピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、スピロ [クロメノ [4, 3-c] ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [ベンゾ [7] アヌレン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-6, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン] -3-イル および 6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリアルであり、各々が必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリアル、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリアル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここで p は0、1もしくは2である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここで t は1もしくは2である) か

らなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され； 各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；そして

各 R^{11} は独立して、水素、アルキル、シアノ、ニトロおよび $-OR^8$ からなる群より選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

前記式(Ia)において、

R^2 は、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ （ここで p は0、1もしくは2である）、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここで t は1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここで t は1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここで p は0、1もしくは2である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここで t は1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

R^3 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたアラールケニル、必要に応じて置換されたアラールキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換さ

れたヘテロアリーールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されている、請求項2に記載の化合物。

【請求項6】

前記式(Ia)において、

R^1 、 R^4 および R^5 は、各々水素であり；

R^2 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]アゼピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ[b, f][1, 4]チアゼピン-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[4, 5-c]ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]オキセピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、スピロ[クロメノ[4, 3-c]ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ[シクロオクタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ[ベンゾ[7]アヌレン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ[シクロヘプタ[b]ピリジン-6, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]チエピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ[シクロヘプタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ[シクロオクタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イルおよび6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-b]ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリーールであり、各々が必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリーール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリーール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーール、必要に応じて置換された

ヘテロアリーールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換された N -ヘテロアリーールもしくは必要に応じて置換された N -ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリーール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーール、および必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；

各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各 R^{13} は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；そして

各 R^{14} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記式 (I a) において、

R^3 は、ピリジニル、ピリミジニル、4, 5-ジヒドロ-1H-ベンゾ [b] アゼピン-2 (3H)-オン-8-イル、ベンゾ [d] イミダゾリル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ピリド [3, 2-d] アゼピン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ピリド [3, 2-c] アゼピン-3-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1, 6-ナフチリジン-3-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリン-3-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロベンゾ [b] オキセピン-7-イル、3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [b] [1, 4] ジオキセピン-7-イル、ベンゾ [d] オキサゾール-5-イル、3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン-7-イル、ベンゾ [b] チオフェニル、チエノ [3, 2-d] ピリミジニルおよび 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [b] ピリジン-3-イルからなる群より選択されるヘテロアリーールであり、各々が必要に応じて、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリーール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリーール、必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリーールアルケニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されている、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記式 (I a) において、

R^2 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここで p は 0、1 もしくは 2 である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により必要に応じて置換されており；

R^3 は、14 個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ （ここで p は 0、1 もしくは 2 である）、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここで p は 0、1 もしくは 2 である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここで t は 1 もしくは 2 である）からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されている、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 9】

前記式 (I a) において、

R^1 、 R^4 および R^5 は各々独立して、水素であり；

R^2 は、アリールであり、該アリールは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシ

クリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されておる；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；

各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各 R^{11} は独立して、水素、アルキル、シアノ、ニトロおよび $-OR^8$ からなる群より選択され；

各 R^{13} は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；そして

各 R^{14} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

前記式(Ia)において、

R^2 は、フェニルおよび6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルからなる群より選択されるアリールであり、各々が必要に応じて、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリ

ール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される 1つ以上の置換基により置換されており；

R^3 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]アゼピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ[b, f][1, 4]チアゼピノ-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[4, 5-c]ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]オキセピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、スピロ[クロメノ[4, 3-c]ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ[シクロオクタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ[ベンゾ[7]アヌレン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ[シクロヘプタ[b]ピリジン-6, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]チエピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ[シクロヘプタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ[シクロオクタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イルおよび6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-b]ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される 1つ以上の置換基により置換されている、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

前記式(Ia)において、

R^1 、 R^4 および R^5 は各々独立して、水素であり；

R^2 は、ヘテロアリールであり、該ヘテロアリールは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたアラールケニル、必要に応じて置換されたアラールキニル、必要に応じて

て置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；

各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各 R^{13} は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；そして

各 R^{14} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項8に記載の化合物。

【請求項12】

前記式(Ia)において、

R^2 は、ピリジニル、ピリミジニル、4, 5-ジヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オン-8-イル、ベンゾ[d]イミダゾリル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ピリド[3, 2-d]アゼピン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ピリド[3, 2-c]アゼピン-3-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-1, 6-ナフチリジン-3-イル、5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノリン-3-イル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル、2, 3, 4, 5-テトラヒドロベンゾ[b]オキセピン-7-イル、3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1, 4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル、3, 4-ジヒドロ-2H

ーベンゾ [b] [1, 4] オキサジン-7-イル、ベンゾ [b] チオフェニル、および 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [b] ピリジン-3-イルからなる群より選択されるヘテロアリールであり、各々が必要に応じて、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ (ここでpは0、1もしくは2である)、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ (ここでtは1もしくは2である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されており；

R^3 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-c] ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [4, 5] チエノ [2, 3-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] アゼピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ [b, f] [1, 4] チアゼピノ-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [4, 5-c] ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] オキセピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、スピロ [クロメノ [4, 3-c] ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [ベンゾ [7] アヌレン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-6, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン] -3-イルおよび 6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここでpは0、1もしくは2である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここでtは1もしくは2である) からなる群より選択される 1 つ以上の置

換基により置換されている、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

1 - (6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル) - N³ - (7 - (ピロリジン-1-イル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イル) - 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3, 5-ジアミンである、請求項 2 に記載の化合物。

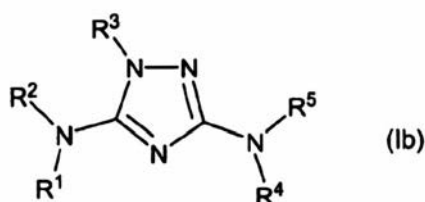
【請求項 1 4】

(1 - (6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル) - N³ - (7 - (S) - (ピロリジン-1-イル) - 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イル) - 1H-1, 2, 4-トリアゾール-3, 5-ジアミンである、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

式 (I b) :

【化 3 3】



で表され、式 (I b) において、

R¹、R²、R³、R⁴ および R⁵ は、前記式 (I) で定義したものと同一である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 6】

前記式 (I b) において、

R² および R³ は、各々独立して、14 個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、-R⁹-OR⁸、-R⁹-O-R¹⁰-OR⁸、-R⁹-O-R¹⁰-O-R¹⁰-OR⁸、-R⁹-O-R¹⁰-CN、-R⁹-O-R¹⁰-C(O)OR⁸、-R⁹-O-R¹⁰-C(O)N(R⁶)R⁷、-R⁹-O-R¹⁰-S(O)_pR⁸ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、-R⁹-O-R¹⁰-N(R⁶)R⁷、-R⁹-O-R¹⁰-C(NR¹¹)N(R¹¹)H、-R⁹-OC(O)-R⁸、-R⁹-N(R⁶)R⁷、-R⁹-C(O)R⁸、-R⁹-C(O)OR⁸、-R⁹-C(O)N(R⁶)R⁷、-R⁹-N(R⁶)C(O)OR¹²、-R⁹-N(R⁶)C(O)R⁸、-R⁹-N(R⁶)S(O)_tR⁸ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、-R⁹-S(O)_tOR⁸ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、-R⁹-S(O)_pR⁸ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および -R⁹-S(O)_tN(R⁶)R⁷ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されている、請求項 1 5 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

前記式 (I b) において、

R¹、R⁴ および R⁵ は、各々水素であり；

R² および R³ は、各々独立して、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]アゼピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、(Z)

ージベンゾ [b, f] [1, 4] チアゼピン-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [4, 5-c] ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] オキセピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、スピロ [クロメノ [4, 3-c] ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [ベンゾ [7] アヌレン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-6, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン] -3-イル および 6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{1,2}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{1,0}-OR^8$ 、 $-R^{1,0}-CN$ 、 $-R^{1,0}-NO_2$ 、 $-R^{1,0}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{1,0}-C(O)OR^8$ および $-R^{1,0}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換された N-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換された N-ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；そして

各 $R^{1,0}$ は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記式 (I b) において、

R^2 は、14 個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアル

キルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

R^3 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されている、請求項15に記載の化合物。

【請求項19】

前記式(Ib)において、

R^1 、 R^4 および R^5 は、各々水素であり；

R^2 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-c]ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[1, 2-d]ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]アゼピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ[b, f][1, 4]チアゼピン-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[6, 7]シクロヘプタ[4, 5-c]ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ[2, 3]オキセピノ[4, 5-c]ピリダジン-3-イル、スピロ[クロメノ[4, 3-c]ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ[シクロオクタ[b]ピリジン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ[ベンゾ[7]アヌレン-7, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ[シクロヘプタ[b]ピリジン-6, 2'-[1, 3]ジオキサラン]-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H

ーベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン]-3-イルおよび6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{1,2}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^9-S(O)_pR^8$ (ここでpは0、1もしくは2である)、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ (ここでtは1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{1,0}-OR^8$ 、 $-R^{1,0}-CN$ 、 $-R^{1,0}-NO_2$ 、 $-R^{1,0}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{1,0}-C(O)OR^8$ および $-R^{1,0}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒にあって、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し；

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され；

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；

各 $R^{1,0}$ は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり；

各 $R^{1,3}$ は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され；そして

各 $R^{1,4}$ は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

前記式(Ib)において、

R^2 は、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され、該アリールおよび該ヘテロアリールは、各々独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に

応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されており；

R^3 は、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、該多環式ヘテロアリールは、必要に応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-O-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-CN$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、 $-R^9-O-R^{10}-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-O-R^{10}-C(NR^{11})N(R^{11})H$ 、 $-R^9-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)OR^8$ 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{12}$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^9-S(O)_pR^8$ （ここでpは0、1もしくは2である）、および $-R^9-S(O)_tN(R^6)R^7$ （ここでtは1もしくは2である）からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

請求項15に記載の化合物。

【請求項21】

前記式(Ib)において、

R^1 、 R^4 および R^5 は各々独立して、水素であり；

R^2 は、アリールであり、該アリールは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ （ここでtは1もしくは2である）

$-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により必要に応じて置換されており;

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒に、必要に応じて置換された N -ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換された N -ヘテロシクリルを形成し;

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され;

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され;

各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり;

各 R^{13} は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され;そして

各 R^{14} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

前記式 (I b) において、

R^2 は、フェニルおよび 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ [7] アヌレン-2-イルからなる群より選択されるアリールであり、各々が必要に応じて、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラールキル、必要に応じて置換されたアラールケニル、必要に応じて置換されたアラールキニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})S(O)_tR^{12}$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{12}$ (ここで t は 1 もしくは 2 である)、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ (ここで p は 0、1 もしくは 2 である)、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ (ここで t は 1 もしくは 2 である) からなる群より選択される 1 つ以上の置換基により置換されており;

R^3 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-c] ピリ

ダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [4, 5] チエ
 ノ [2, 3-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シ
 クロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2
 , 3] アゼピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ [b, f] [1
 , 4] チアゼピノ-1-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘ
 プタ [4, 5-c] ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] オ
 キセピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、スピロ [クロメノ [4, 3-c] ピリダ
 ジン-5, 1'-シクロペンタン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H
 -スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン]-3-イ
 ル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [ベンゾ [7] アヌレン-7, 2'-[1, 3
] ジオキソラン]-3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b
] ピリジン-6, 2'-[1, 3] ジオキソラン]-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H
 -ベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-
 5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8
 , 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキ
 ソラン]-3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b
] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン]-3-イルおよび6, 7-ジヒドロ-
 5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より
 選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に
 応じて、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、アルキル、必要に応
 じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要
 に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換さ
 れたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $-R^9-OR^8$ 、 $-R^9$
 $-OC(O)-R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-C(O)R^8$ 、 $-R^9-C(O)$
 OR^8 、 $-R^9-C(O)N(R^6)R^7$ 、 $-R^9-N(R^6)C(O)OR^{1,2}$ 、 $-$
 $R^9-N(R^6)C(O)R^8$ 、 $-R^9-N(R^6)S(O)_tR^8$ (ここでtは1もし
 くは2である)、 $-R^9-S(O)_tOR^8$ (ここでtは1もしくは2である)、 $-R^9$
 $-S(O)_pR^8$ (ここでpは0、1もしくは2である)、および $-R^9-S(O)_tN$
 $(R^6)R^7$ (ここでtは1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置
 換基により置換されている、請求項21に記載の化合物。

【請求項23】

前記式 (I b) において、

R^1 、 R^4 および R^5 は各々独立して、水素であり；

R^2 は、ヘテロアリールであり、該ヘテロアリールは、アルキル、アルケニル、アルキ
 ニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シア
 ノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必
 要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたアラルキニル、必要に応
 じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要
 に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル
 アルキニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシク
 リルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換さ
 れたヘテロシクリルアルキニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて
 置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル
 、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキニル、 $-R^{1,3}-OR^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-$
 $OC(O)-R^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-O-R^{1,4}-N(R^{1,2})_2$ 、 $-R^{1,3}-N(R^{1,2})$
 $_2$ 、 $-R^{1,3}-C(O)R^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-C(O)OR^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-C(O)N$
 $(R^{1,2})_2$ 、 $-R^{1,3}-C(O)N(R^{1,2})-R^{1,4}-N(R^{1,2})R^{1,3}$ 、 $-R^{1,3}$
 $-C(O)N(R^{1,2})-R^{1,4}-OR^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-N(R^{1,2})C(O)OR^{1,2}$
 、 $-R^{1,3}-N(R^{1,2})C(O)R^{1,2}$ 、 $-R^{1,3}-N(R^{1,2})S(O)_tR^{1,2}$ (こ
 こでtは1もしくは2である)、 $-R^{1,3}-S(O)_tOR^{1,2}$ (ここでtは1もしく

は2である)、 $-R^{13}-S(O)_pR^{12}$ (ここでpは0、1もしくは2である)、および $-R^{13}-S(O)_tN(R^{12})_2$ (ここでtは1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置換基により必要に応じて置換されており;

各 R^6 および R^7 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、 $-R^{10}-OR^8$ 、 $-R^{10}-CN$ 、 $-R^{10}-NO_2$ 、 $-R^{10}-N(R^8)_2$ 、 $-R^{10}-C(O)OR^8$ および $-R^{10}-C(O)N(R^8)_2$ からなる群より選択されるか、または任意の R^6 および R^7 は、これらの両方が結合している共通の窒素と一緒に、必要に応じて置換されたN-ヘテロアリールもしくは必要に応じて置換されたN-ヘテロシクリルを形成し;

各 R^8 は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、および必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキルからなる群より選択され;

各 R^9 は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され;

各 R^{10} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖であり;

各 R^{13} は独立して、直接結合、および必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖からなる群より選択され;そして

各 R^{14} は、必要に応じて置換された直鎖もしくは分枝鎖のアルキレン鎖である、請求項20に記載の化合物。

【請求項24】

前記式(Ib)において、

R^2 は、ピリジニル、ピリミジニル、4,5-ジヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オン-8-イル、ベンゾ[d]イミダゾリル、6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ピリド[3,2-d]アゼピン-3-イル、6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ピリド[3,2-c]アゼピン-3-イル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリン-3-イル、1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル、2,3,4,5-テトラヒドロベンゾ[b]オキセピン-7-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-7-イル、ベンゾ[b]チオフェニル、および6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ[b]ピリジン-3-イルからなる群より選択されるヘテロアリールであり、各々が必要に応じて、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、オキソ、チオキソ、シアノ、ニトロ、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたアラルケニル、必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールアルケニル、 $-R^{13}-OR^{12}$ 、 $-R^{13}-OC(O)-R^{12}$ 、 $-R^{13}-O-R^{14}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{12}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})-R^{14}-N(R^{12})R^{13}$ 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{12})$

$^1 2) - R^{1 4} - O R^{1 2}$ 、 $- R^{1 3} - N (R^{1 2}) C (O) O R^{1 2}$ 、 $- R^{1 3} - N (R^{1 2}) C (O) R^{1 2}$ 、 $- R^{1 3} - N (R^{1 2}) S (O) \text{ }_t R^{1 2}$ (ここで t は1もしくは2である)、 $- R^{1 3} - S (O) \text{ }_t O R^{1 2}$ (ここで t は1もしくは2である)、 $- R^{1 3} - S (O) \text{ }_p R^{1 2}$ (ここで p は0、1もしくは2である)、および $- R^{1 3} - S (O) \text{ }_t N (R^{1 2}) \text{ }_2$ (ここで t は1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されており；

R^3 は、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-c] ピリダジン-3-イル、6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-シクロヘプタ [4, 5] チエノ [2, 3-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-4-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] アゼピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、(Z)-ジベンゾ [b, f] [1, 4] チアゼピン-11-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [4, 5-c] ピリダジン-2-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] オキセピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、スピロ [クロメノ [4, 3-c] ピリダジン-5, 1'-シクロペンタン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [ベンゾ [7] アヌレン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、5, 7, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-6, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [2, 3] チエピノ [4, 5-c] ピリダジン-3-イル、6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-d] ピリミジン-2-イル、5, 6, 8, 9-テトラヒドロスピロ [シクロヘプタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキソラン] -3-イル、6, 8, 9, 10-テトラヒドロ-5H-スピロ [シクロオクタ [b] ピリジン-7, 2'-[1, 3] ジオキサン] -3-イルおよび6, 7-ジヒドロ-5H-ベンゾ [6, 7] シクロヘプタ [1, 2-b] ピリジン-2-イルからなる群より選択される、14個より多くの環原子を含む多環式ヘテロアリールであり、各々が必要に応じて置換されたシクロアルキル、必要に応じて置換されたシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、必要に応じて置換されたヘテロシクリル、 $- R^9 - O R^8$ 、 $- R^9 - O C (O) - R^8$ 、 $- R^9 - N (R^6) R^7$ 、 $- R^9 - C (O) R^8$ 、 $- R^9 - C (O) O R^8$ 、 $- R^9 - C (O) N (R^6) R^7$ 、 $- R^9 - N (R^6) C (O) O R^{1 2}$ 、 $- R^9 - N (R^6) C (O) R^8$ 、 $- R^9 - N (R^6) S (O) \text{ }_t R^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $- R^9 - S (O) \text{ }_t O R^8$ (ここで t は1もしくは2である)、 $- R^9 - S (O) \text{ }_p R^8$ (ここで p は0、1もしくは2である)、および $- R^9 - S (O) \text{ }_t N (R^6) R^7$ (ここで t は1もしくは2である) からなる群より選択される1つ以上の置換基により置換されている、請求項23に記載の化合物。

【請求項25】

薬学的に受容可能な賦形剤および請求項1から24のいずれか一項に記載の化合物を、単離された立体異性体もしくはその混合物として、または互変異性体もしくはその混合物として、あるいはその薬学的に受容可能な塩もしくはN-オキシドとして含有する、薬学的組成物。

【請求項26】

哺乳動物において、A x 1 活性に関連する疾患または状態を処置する方法であって、該方法は、該哺乳動物に、治療有効量の請求項1から24のいずれか一項に記載の化合物を、単離された立体異性体もしくはその混合物として、または互変異性体もしくはその混合物として、あるいはその薬学的に受容可能な塩もしくはN-オキシドとして、投与する工程を包含する、方法。