

【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22年2月4日(2010.2.4)

【公表番号】特表2009-528362(P2009-528362A)
 【公表日】平成21年8月6日(2009.8.6)
 【年通号数】公開・登録公報2009-031
 【出願番号】特願2008-557344(P2008-557344)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 231/12 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)
 A 6 1 P 25/22 (2006.01)
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)
 C 0 7 D 409/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
 C 0 7 D 401/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 C 0 7 D 409/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
 C 0 7 D 491/113 (2006.01)
 A 6 1 K 31/438 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4725 (2006.01)
 C 0 7 D 417/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 C 0 7 D 451/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/439 (2006.01)
 C 0 7 D 453/02 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5513 (2006.01)
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)
 A 6 1 K 31/501 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/12 C S P B
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 C 0 7 D 409/04
 A 6 1 K 31/4155

C 0 7 D 401/04
 A 6 1 K 31/4439
 C 0 7 D 409/14
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/4178
 C 0 7 D 491/113
 A 6 1 K 31/438
 A 6 1 K 31/4725
 C 0 7 D 231/12
 C 0 7 D 417/14
 A 6 1 K 31/427
 C 0 7 D 451/06
 A 6 1 K 31/439
 C 0 7 D 453/02
 A 6 1 K 31/5513
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/501

E

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月8日(2009.12.8)

【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

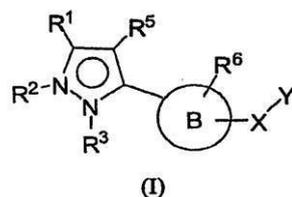
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

動物において1つ以上のMAO酵素を阻害するための医薬の製造における、
 式I:



(式中:

R^1 は、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上の R_e で置換される;

R^2 および R^3 の1つは非存在であり、他は水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、アミノ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルまたはニトロ、Het、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ またはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルから選択される1つ以上の基で置換される;

Bはアリールまたはヘテロアリールである;

Xは、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(R^4)_2-$ 、 $-C(OH)-$ 、または $S(O)_z$ である;

各zは独立して、0、1、または2である;

Yは、 R^4 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、または $-C(R^4)_3$ である;

各 R^4 は独立して、水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、シアノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリールオキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 NR_aR_b 、Het、またはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルからなる群より選択され、非置換または1つ以上の R_d で置換される；あるいは結合している原子と共に2つの R^4 基は、アリール、Het、または炭素原子および任意にO、 $S(O)_2$ 、および NR_c から選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、各環系は任意に1つ以上の R_d で置換される；

各 R_a および R_b は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

各 R_c は独立して、水素、アリール、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、アミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R_d はケトンまたはスピロ環式炭素環式環または複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つの R_d は二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、 NR_fR_g 、 $R_fR_gNC(=O)-$ 、フェニル、またはフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共に R_f および R_g はピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_e は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；

R^5 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；ならびに

各 R^6 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

Xが $-C(=O)$ である場合、YがHでないことを条件とする)

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項2】

Bが6~12員の単環式または二環式ヘテロアリールである、請求項1記載の使用。

【請求項3】

Bが1つより多くのヘテロ原子を有するヘテロアリールである、請求項1記載の使用。

【請求項4】

Bがアリールである、請求項1記載の使用。

【請求項5】

動物において認知機能を改善するための医薬の製造における、請求項 1 記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 6】

動物が健常動物または老化動物である、請求項 1 または 5 記載の使用。

【請求項 7】

動物において CREB 経路を活性化するための医薬の製造における、請求項 1 記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 8】

動物において加齢性記憶障害、認知機能障害、アルツハイマー病またはパーキンソン病を治療するための医薬の製造における、請求項 1 記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 9】

動物が精神医学的障害、精神病性障害、神経学的障害、神経性障害、または中枢神経系の障害を有する、請求項 5 記載の使用。

【請求項 10】

動物が頭部外傷、脳外傷、または脳血管疾患を有する、請求項 5 記載の使用。

【請求項 11】

動物が注意欠陥障害または情動障害を有する、請求項 5 記載の使用。

【請求項 12】

認知機能障害が鬱病と関連する、請求項 8 記載の使用。

【請求項 13】

動物において精神医学的障害を治療するための医薬の製造における、請求項 1 記載の式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

【請求項 14】

精神医学的障害が精神病性障害、神経学的障害、神経性障害、または中枢神経系の障害である、請求項 13 記載の使用。

【請求項 15】

中枢神経系の障害が加齢性記憶障害、軽度認知機能障害、アルツハイマー病またはパーキンソン病である、請求項 14 記載の使用。

【請求項 16】

精神医学的障害が頭部外傷、脳外傷または脳血管疾患と関連する、請求項 13 記載の使用。

【請求項 17】

精神医学的障害が注意欠陥障害、情動障害または鬱病である、請求項 13 記載の使用。

【請求項 18】

精神病性障害が統合失調症である、請求項 9 または 14 記載の使用。

【請求項 19】

脳血管疾患が血管性痴呆である、請求項 10 または 16 記載の使用。

【請求項 20】

R^1 が $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、またはフェニルであり、ハロ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから独立して選択される 1 つ以上の置換基で任意に置換される、請求項 1 ~ 19 いずれか記載の使用。

【請求項 21】

R^1 がトリフルオロメチル、フェニル、メチル、またはイソプロピルである、請求項 1 ~ 20 いずれか記載の使用。

【請求項 22】

R^2 が非存在である、請求項 1 ~ 20 いずれか記載の使用。

【請求項 23】

R³が非存在である、請求項 1 ~ 2 0 いずれか記載の使用。

【請求項 2 4】

R²が(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル、アリール、Het、またはHet(C₁~C₆)アルキルである、請求項 1 ~ 2 1 および 2 3 いずれか1項記載の使用。

【請求項 2 5】

R²が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、フェニル、シクロペンチル、2-ピリジル、2-モルホリノエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、または2-ヒドロキシエチルである、請求項 1 ~ 2 1 および 2 3 ~ 2 4 いずれか1項記載の使用。

【請求項 2 6】

R³が水素、(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル、アリール、Het、アリール(C₁~C₆)アルキル、またはHet(C₁~C₆)アルキルである、請求項 1 ~ 2 2 いずれか記載の使用。

【請求項 2 7】

R³が水素、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、2-ピリジル、シクロペンチル、フェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-ヒドロキシエチル、4-クロロフェニル、ベンジル、4-ニトロフェニル、2-モルホリノエチル、またはシクロヘキシルである、請求項 1 ~ 2 2 および 2 6 いずれか1項記載の使用。

【請求項 2 8】

Bがベンゼン環、チオフェン環、またはピリジン環である、請求項 1 ~ 2 7 いずれか記載の使用。

【請求項 2 9】

Xが-C(=O)である、請求項 1 ~ 2 8 いずれか記載の使用。

【請求項 3 0】

各R⁴が独立して、H、(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルケニル、(C₂~C₆)アルキニル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、(C₃~C₈)シクロアルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ(C₂~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₂~C₆)アルキル、シアノ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルチオ(C₂~C₆)アルキル、アリール、アリール(C₁~C₆)アルキル、アリールオキシ(C₂~C₆)アルキル、ハロ(C₂~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル(C₁~C₆)アルキル、NR_bR_c、Het、またはHet(C₁~C₆)アルキルである、請求項 1 ~ 2 9 いずれか記載の使用。

【請求項 3 1】

各R⁴が独立して、水素、メチル、エチル、ブチル、プロピル、イソプロピル、2-フルオロフェネチル、2-ピロリジノエチル、2-フリルメチル、4-メチルベンジル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、4-メトキシベンジル、4-フルオロベンジル、4-ピリジルメチル、4-クロロベンジル、シクロヘキシル、ベンジル、4-メチルフェニル、3-ピロリジン-1-イルプロピル、3-クロロベンジル、3,5-ジメチルベンジル、2-(エチルチオ)エチル、イソブチル、アリル、2-ヒドロキシエチル、フェニル、3-フルオロ-6-メチルベンジル、3-ピリジルメチル、4-フルオロフェネチル、2-フェノキシエチル、5-メチル-フル-2-イルメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-メトキシエチル、2-メチルブチル、2-イミダゾール-4-イルエチル、フェネチル、2-モルホリノエチル、3-メチルブチル、2-ピペリジノエチル、3-メトキシプロピル、3-クロロベンジル、2-フリルメチル、3,5-ジフルオロベンジル、2-(2-フリル)エチル、3-イミダゾール-1-イルプロピル、2-シアノエチル、2-エチルブチル、2-ピリド-3-イルエチル、S- -ヒドロキシ- -メチルフェネチル、S- -メチルフェネチル、4,4-ジメトキシブチル、3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル、2,2-ジメトキシエチル、4-メチルフェネチル、シアノメチル、3-エトキシプロピル、3-(N,N-ジメチルアミノ)プロピル、3-モルホリノプロピル、2-ヒドロキシプロピル、2-メチルプロピル、エトキシカルボニルメチル、2-メチルフェニル、2-ヒドロキシフェニル、テトラヒドロフラン-2-イルメチル、R-テトラヒドロフラン-2-イルメチル、S-テトラヒドロフラン-2-イルメチル、2-アミノエチル、5-アミノペンチル、4-(4-クロロフェニル)ピペラジ

ン、またはN-ピペリジニルである、請求項 1 ~ 3 0 いずれか記載の使用。

【請求項 3 2】

各 R^4 が独立して水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである、請求項 1 ~ 3 1 いずれか記載の使用。

【請求項 3 3】

結合している原子と共に両方の R^4 は、炭素原子および任意にO、 $S(O)_z$ 、および NR_c から選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含む飽和または部分的に不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系もしくはスピロ環式環系を形成し、環系は任意に1つ以上の R_d で置換される；

z は0、1、または2である；

各 R_c は独立して、水素、アリアル、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 NR_fR_g 、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；ならびに

各 R_f および R_g は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；あるいは結合している窒素と共に R_f および R_g はピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成する、請求項 1 ~ 2 9 いずれか記載の使用。

【請求項 3 4】

結合している原子と共に両方の R^4 は、アジリジン、モルホリン、ピペリジン、4-メチルピペリジン、2-ヒドロキシメチルピロリジン、ピロリジン、アゼチジン、3-ピロリン、4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン、3,5-ジメチルモルホリン、4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン、3,5-ジメチルピペリジン、インドリン、R-3-ヒドロキシピロリジン、1,4-ジオキサ-8-アザ-スピロ[4.5]デカン、1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン、2,3,4,5,6,7-ヘキサヒドロアゼピン、4-ヒドロキシメチルピペリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピペリジン、4-(1-ピロリジニル)ピペリジン、4-フェニルピペリジン、4-ヒドロキシ-4-フェニルピペリジン、4-(カルボキサミド)ピペリジン、4-ヒドロキシピペリジン、4-フェニルピペラジン、4-アセチルピペラジン、3-カルボキサミドピペリジン、2-カルボキシピペリジン、4-トリフルオロメチルピペリジン、3-トリフルオロメチルピペリジン、パーヒドロアゾシン、3,6-ジメチルピペラジン、4-アミノピペリジン、4-ヒドロキシ-4-トリフルオロメチルピペリジン、4-メチルホモピペリジン、チオモルホリン1,1ジオキシド、4-(2'-ピリジル)ピペラジン、4-(2'-メトキシ)エチルピペラジン、4-t-ブトキシカルボニルアミノピペリジン、パーヒドロ-1,2-チアジン1,1-ジオキシド、3-アミノピペリジン、ヘキサヒドロ-ピリダジン、4-ジフルオロメチレン-ピペリジン、3-ヒドロキシピペリジン、4-エチルピペラジン、4-フルオロピペリジン、4,4-ジフルオロピペリジン、3-フルオロピペリジン、3,3-ジフルオロピペリジン、4-イソプロピルピペラジン、4-t-ブトキシカルボニルピペラジン、または4-ベンジルピペリジンを形成する、請求項 1 ~ 2 9 いずれか記載の使用。

【請求項 3 5】

結合している原子と共に両方の R^4 は、ピペリジン環を形成し、任意にハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、 NR_fR_g 、 $R_fR_gNC(=O)-$ 、フェニル、またはフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキルの1つ以上で置換され、任意のフェニルは任意に1つ以上の R_d で置換される；各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；ならびに各 R_f および R_g は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；あるいは結合している窒素と共に R_f および R_g

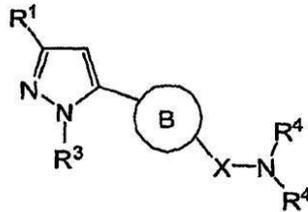
gはピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成する、請求項 1 ~ 29 いずれか記載の使用。

【請求項 36】

結合している原子と共に両方のR⁴がピペリジン環を形成する、請求項 1 ~ 29 いずれか記載の使用。

【請求項 37】

式Iの化合物が式II

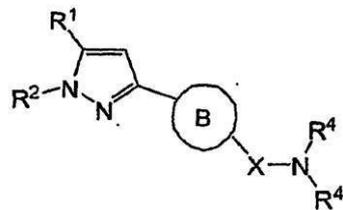


(II)

の化合物である、請求項 1 ~ 22 および 26 ~ 27 いずれか1項記載の使用。

【請求項 38】

式Iの化合物が式III

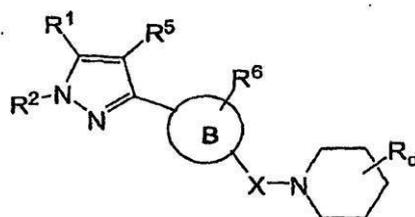


(III)

の化合物である、請求項 1 ~ 21 および 23 ~ 25 いずれか1項記載の使用。

【請求項 39】

式Iの化合物が式IIIa

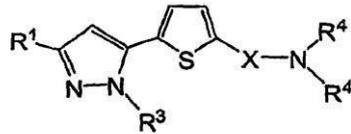


(IIIa)

の化合物である、請求項 1 ~ 2 1、2 3 ~ 2 5 および 3 8 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 4 0】

式 I の化合物が式 IV

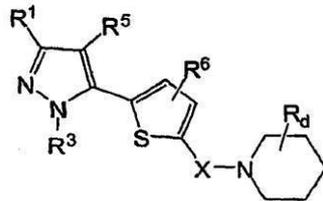


(IV)

の化合物である、請求項 1 ~ 2 2、2 6 ~ 2 7 および 3 7 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 4 1】

式 I の化合物が式 IVa

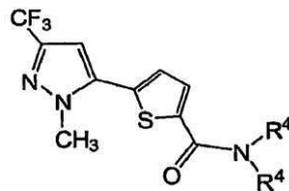


(IVa)

の化合物である、請求項 1 ~ 2 2、2 6 ~ 2 7、3 7 および 4 0 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 4 2】

式 I の化合物が式 V

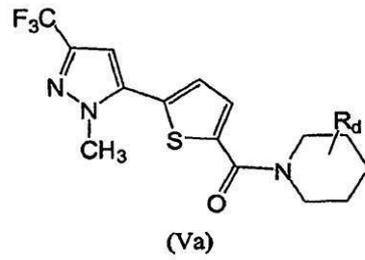


(V)

の化合物である、請求項 1 ~ 2 2、2 6 ~ 2 7、3 7 および 4 0 ~ 4 1 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 4 3】

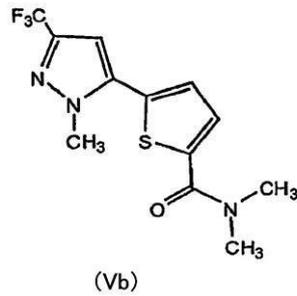
式 I の化合物が式 Va



の化合物である、請求項 1 ~ 22、26 ~ 27、37 および 40 ~ 42 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 44】

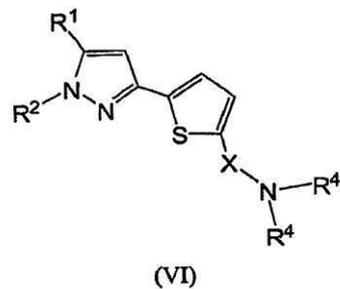
式 I の化合物が式 Vb



の化合物である、請求項 1 ~ 22、26 ~ 27、40 および 42 いずれか記載の使用。

【請求項 45】

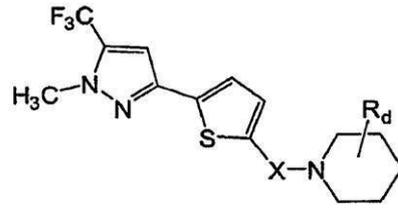
式 I の化合物が式 VI



の化合物である、請求項 1 ~ 21、23 ~ 25、および 38 ~ 39 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 46】

式 I の化合物が式 VIa

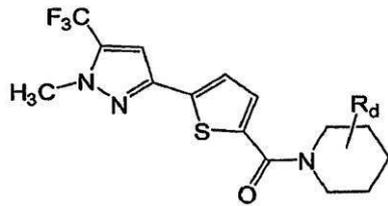


(VIa)

の化合物である、請求項 1 ~ 21、23 ~ 25、38 ~ 39、43 および 45 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 47】

式 I の化合物が式 VIb

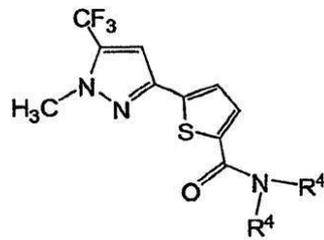


(VIb)

の化合物である、請求項 1 ~ 21、23 ~ 25、38 ~ 39、43 および 45 ~ 46 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 48】

式 I の化合物が式 VII

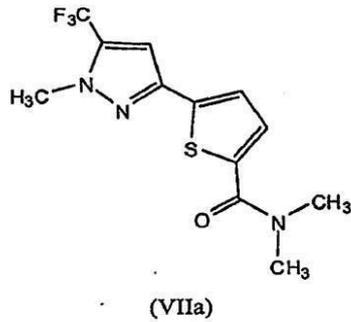


(VII)

の化合物である、請求項 1 ~ 21、23 ~ 25、38 ~ 39 および 45 いずれか 1 項記載の使用。

【請求項 49】

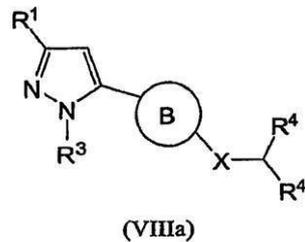
式 I の化合物が式 VIIa



の化合物である、請求項 1 ~ 2 1、2 3 ~ 2 5、3 8 ~ 3 9、4 5 および 4 7 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 5 0】

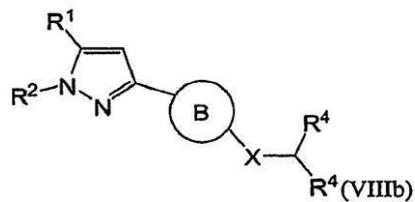
式 I の化合物が式 VIIIa



の化合物である、請求項 1 ~ 2 2 および 2 6 ~ 2 7 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 5 1】

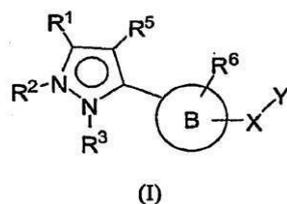
式 I の化合物が式 VIIIb



の化合物である、請求項 1 ~ 2 1 および 2 3 ~ 2 5 いずれか 1 項記載の 使用。

【請求項 5 2】

式 I :



(式中:

R¹は(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、またはアリーールであり、非置換または

1つ以上の R_e で置換される；

R^2 および R^3 の1つは非存在であり、他は水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、アミノ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ もしくはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルから選択される1つ以上の基で置換される；

Bはアリールまたはヘテロアリールである；

Xは $-C(=O)$ 、 $-C(=S)$ 、 $-C(R^4)_2$ 、または $-S(O)_z$ である；

各zは独立して、0、1、または2である；

Yは R^4 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、または $-C(R^4)_3$ である；

各 R^4 は独立して、水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、シアノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリールオキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 NR_aR_b 、Het、またはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルからなる群より選択され、各アルキル、アリール、またはHetは非置換または1つ以上の R_d で置換される；あるいは結合している原子と共に2つの R^4 基はアリール、Het、または炭素原子および任意にO、 $S(O)_z$ 、および NR_c から選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、各環系は任意に1つ以上の R_d で置換される；

各 R_a および R_b は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

各 R_c は独立して、水素、アリール、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、アミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R_d は、ケトンまたはスピロ環式炭素環式環または複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つの R_d は二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、 NR_fR_g 、 $R_fR_gNC(=O)-$ 、フェニル、またはフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共に R_f および R_g はピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_e は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；

R^5 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；ならびに

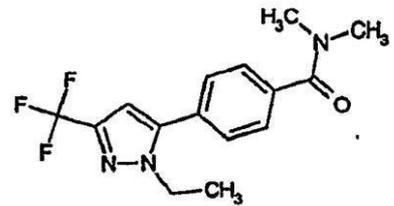
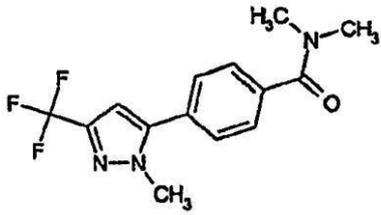
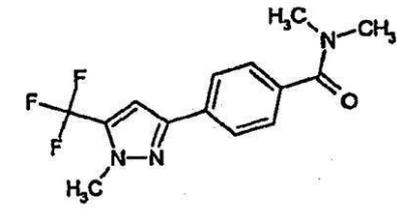
各 R^6 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキ

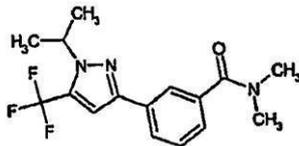
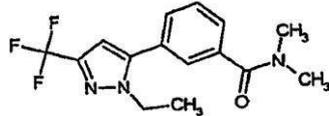
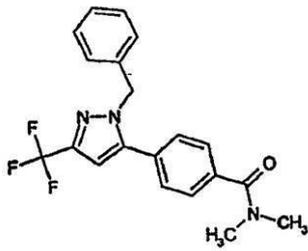
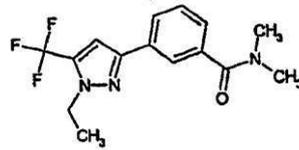
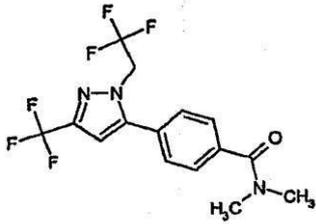
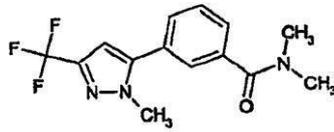
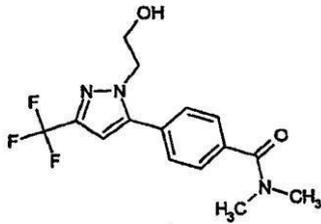
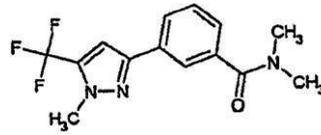
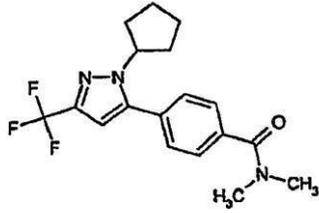
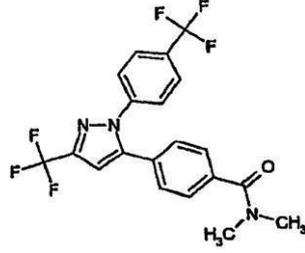
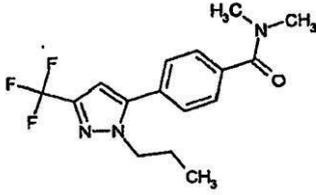
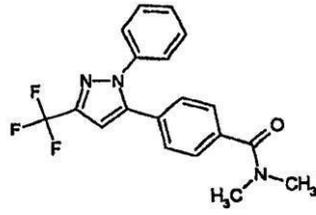
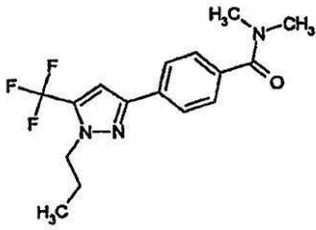
ルである；

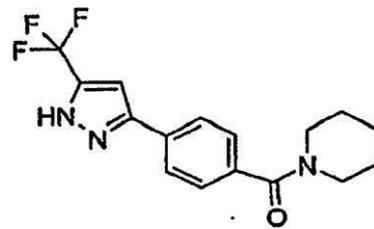
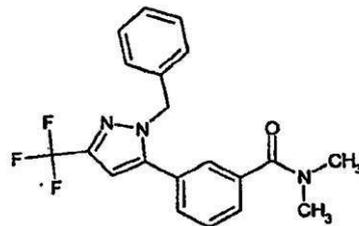
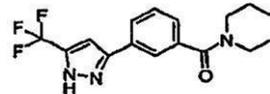
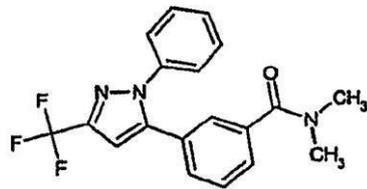
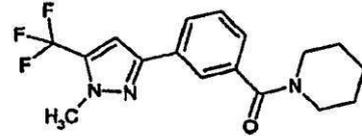
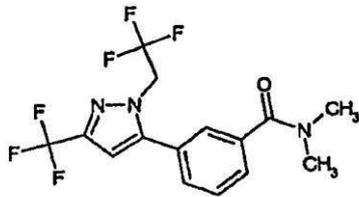
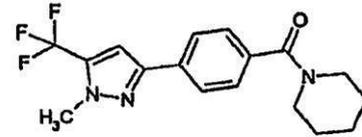
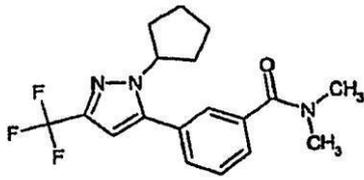
Bがチオフェンであり、R¹がトリフルオロメチルであり、R²がメチルであり、R³およびR⁶が非存在であり、R⁵がHであり、XがC(=O)であり、YがN(R⁴)₂である場合、両方のR⁴がメチルでないことを条件とする)

の化合物。

【請求項53】



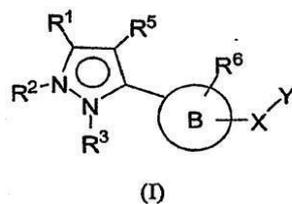




からなる群より選択される、請求項 5 2 記載の化合物。

【請求項 5 4】

式 I :



(式中:

R^1 は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上の R_e で置換される;

R^2 および R^3 の1つは非存在であり、他は水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、アミノ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ もしくはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルから選択される1つ以上の基で置換される;

Bは6~12員単環式または二環式ヘテロアリールである;

Xは $-C(=O)$ 、 $-C(=S)$ 、 $-C(R^4)_2$ 、または $-S(O)_z$ である;

各zは独立して、0、1、または2である;

Yは R^4 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、または $-C(R^4)_3$ である;

各 R^4 は独立して、水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、シアノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリールオキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 NR_aR_b 、Het、またはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルからなる群より選択され、非置換または1つ以上の R_d で置換される；あるいは結合している原子と共に2つの R^4 基は、アリール、Het、または炭素原子および任意にO、 $S(O)_2$ 、および NR_c から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、各環系は任意に1つ以上の R_d で置換される；

各 R_a および R_b は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

各 R_c は独立して、水素、アリール、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、アミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R_d はケトンまたはスピロ環式炭素環式環または複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つの R_d は二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、 NR_fR_g 、 $R_fR_gNC(=O)-$ 、フェニル、またはフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共に R_f および R_g はピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

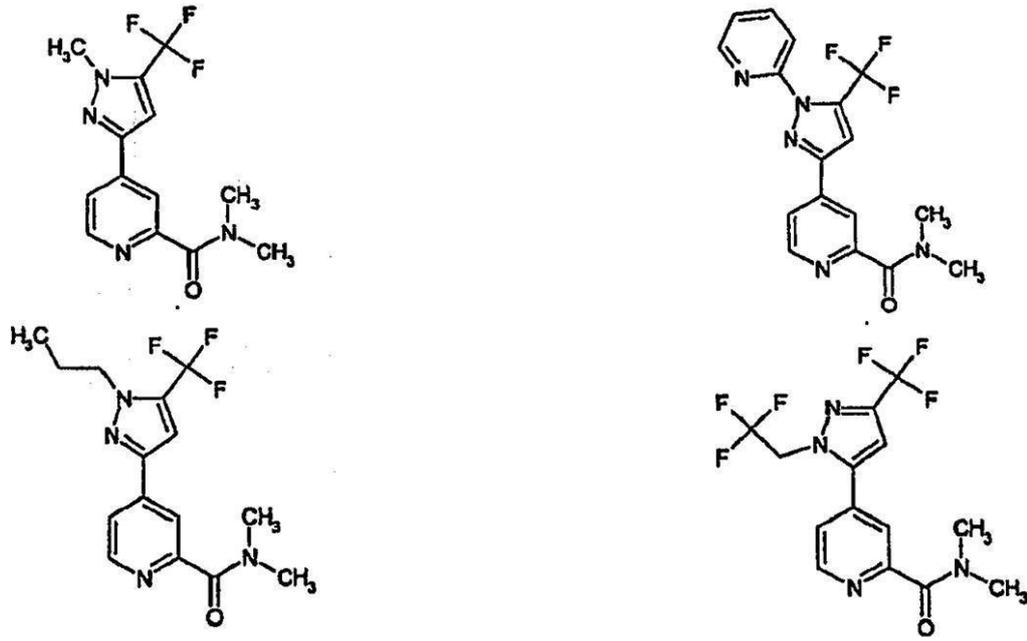
各 R_e は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；

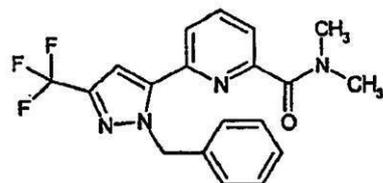
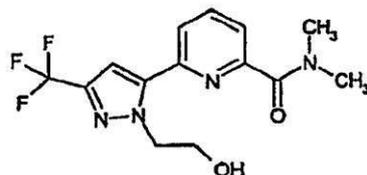
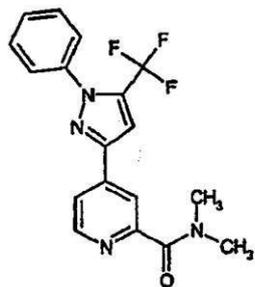
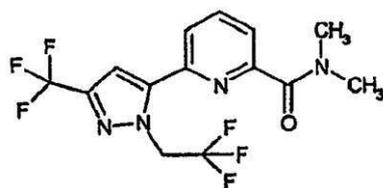
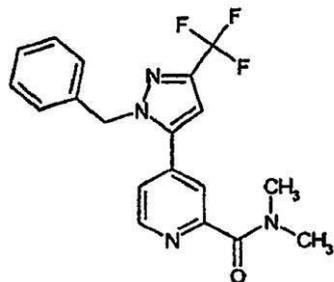
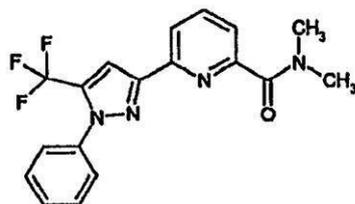
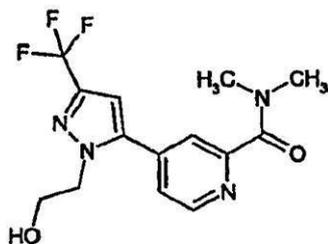
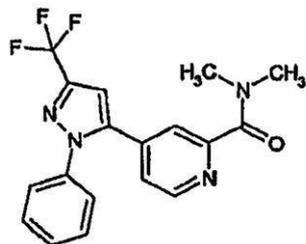
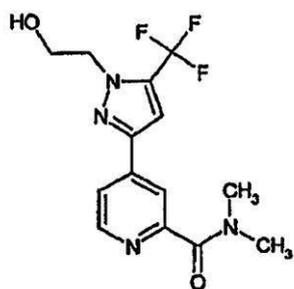
R^5 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

各 R^6 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 5 5】

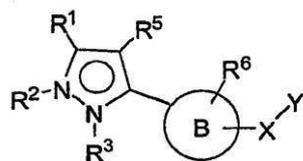




からなる群より選択される、請求項 5 4 記載の化合物。

【請求項 5 6】

式 I :



(I)

(式中 :

R¹は(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上のR_eで置換される;

R^2 および R^3 の1つは非存在であり、他は水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、アミノ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ もしくはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルから選択される1つ以上の基で置換される；

Bはチオフェン、フラン、またはピロールである；

Xは $-C(=O)$ 、 $-C(=S)$ 、 $-C(R^4)_2$ 、または $-S(O)_z$ である；

各zは独立して、0、1、または2である；

Yは $-N(R^4)_2$ である；

結合しているNと共に両方の R^4 基は、炭素原子および任意にO、 $S(O)_z$ 、および NR_c から選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、非置換または1つ以上の R_d で置換される、ただし両方の R^4 基は2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジンを形成するように結合しないことを条件とし、環系が単環式5~7員環系である場合、ハロまたはアルキル以外の1つ以上の R_d で置換される；

各 R_c は独立して、水素、アリール、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

各 R_d は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、アミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R_d はケトンまたはスピロ環式炭素環式環または複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つの R_d は二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、 NR_fR_g 、 $R_fR_gNC(=O)-$ 、フェニル、もしくはフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共に R_f および R_g はピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される；

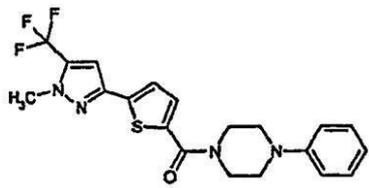
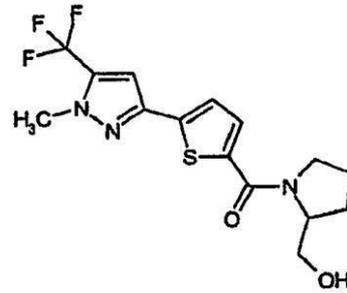
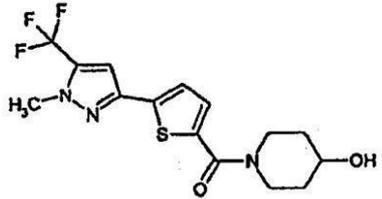
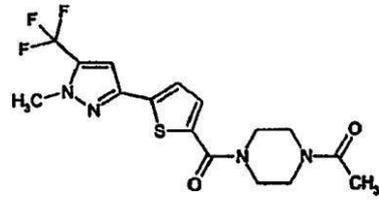
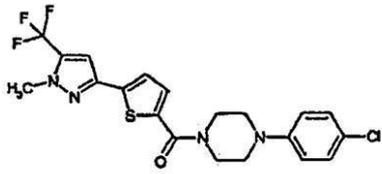
各 R_e は独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、および $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシから選択される；

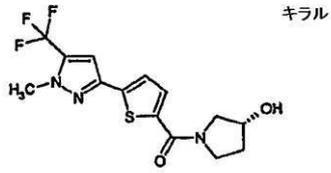
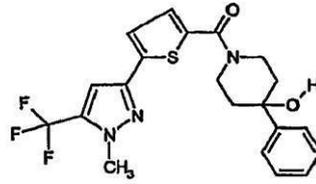
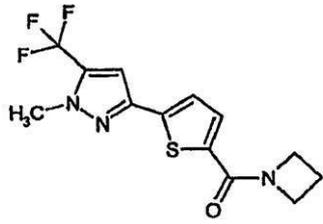
R^5 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキニル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

各 R^6 はH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである；

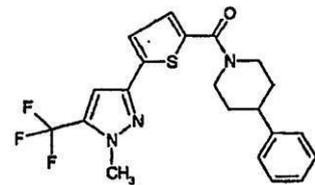
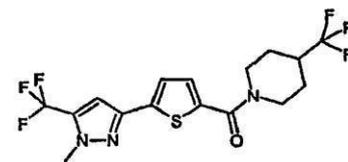
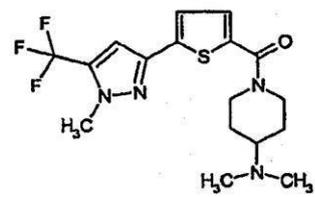
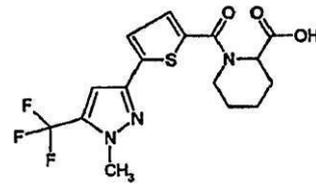
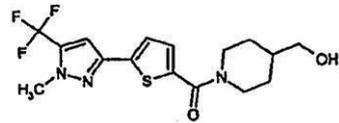
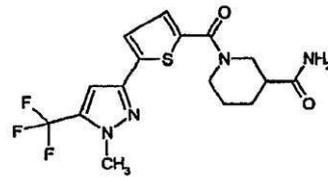
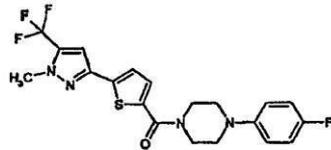
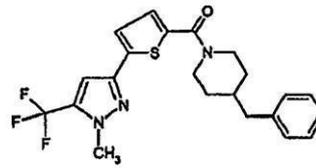
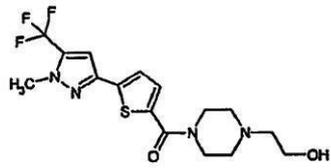
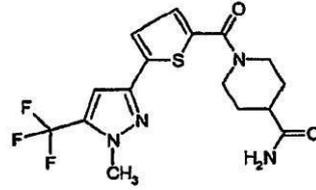
の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

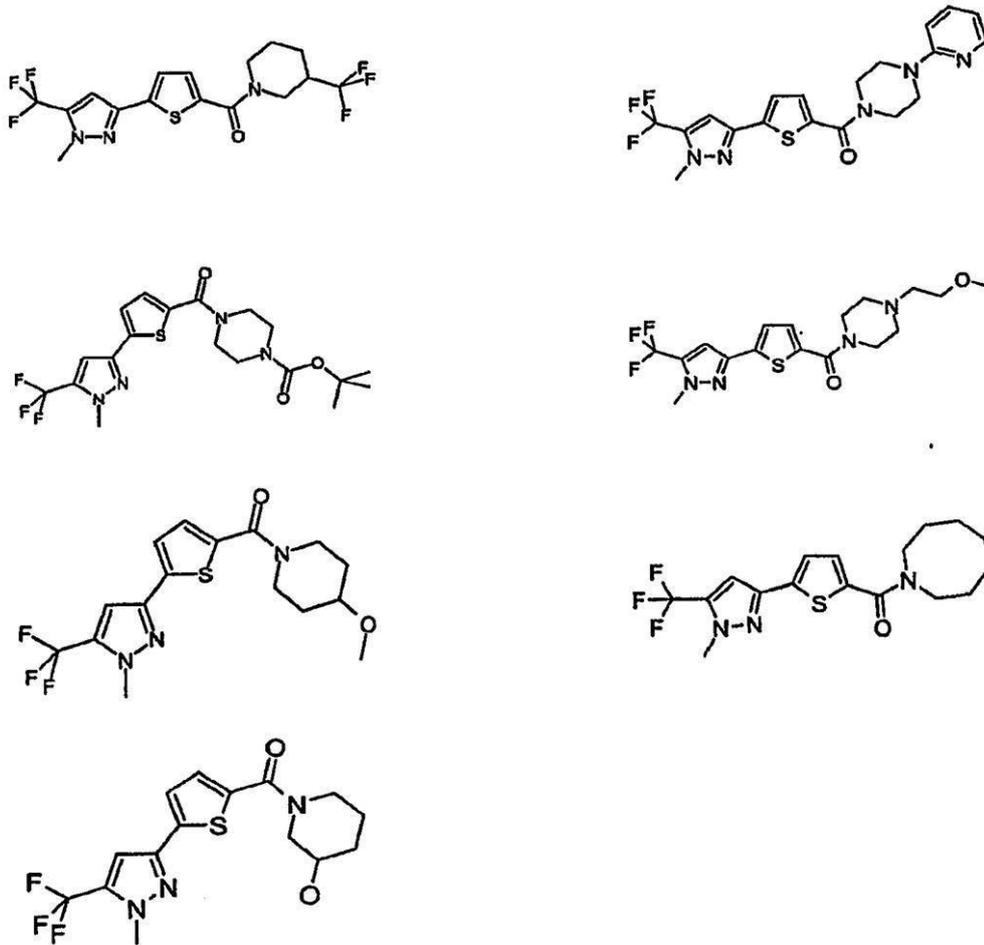
【請求項57】





キラル

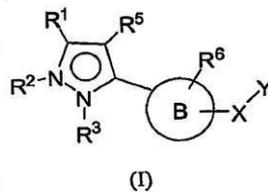




からなる群より選択される、請求項56記載の化合物。

【請求項58】

式I：



(式中：

R¹は(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上のR₆で置換される；

R²およびR³の1つは非存在であり、他は水素、(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル、アミノ(C₂~C₆)アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、(C₃~C₈)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、アリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)もしくはHet(C₁~C₆)アルキルから選択される1つ以上の基で置換される；

Bはチオフェン、フランまたはピロールである；

Xは-C(=O)、-C(=S)、-C(R⁴)₂、または-S(O)_zである；

zは0、1、または2である；

YはR⁴、-N(R⁴)₂、-OR⁴、-SR⁴、または-C(R⁴)₃である；

各R⁴は独立して、水素、(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルケニル、(C₂~C₆)アルキニル、アミノ、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコシカルボニル

、(C₃~C₈)シクロアルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ(C₂~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₂~C₆)アルキル、シアノ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルチオ(C₂~C₆)アルキル、アリール、アリール(C₁~C₆)アルキル、アリールオキシ(C₂~C₆)アルキル、ハロ(C₂~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル(C₁~C₆)アルキル、NR_bR_c、Het、またはHet(C₁~C₆)アルキルからなる群より選択され、それぞれは非置換または1つ以上のR^dで置換される；少なくとも1つのR^dはアルケニル、アルキニル、またはアミノであることを条件とする；

各R_bおよびR_cは独立して、水素または(C₁~C₆)アルキルである；

各R_dは独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、(C₁~C₆)アルキルアミノ、アミノ(C₁~C₆)アルキル、アミド、(C₁~C₆)アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het(C₁~C₆)アルキル、またはアリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される、あるいは結合している原子と共に2つのR_dはケトンまたはスピロ環式炭素環式環または複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つのR_dは二環式炭素環式環もしくは複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、NR_fR_g、R_fR_gNC(=O)-、フェニル、もしくはフェニル(C₁~C₆)アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共にR_fおよびR_gはピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される；

各R_eは独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、Het、アリール、(C₁~C₆)アルキルHet、(C₁~C₆)アルキルアリール、(C₁~C₆)アルキルHet(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、および(C₁~C₆)アルカノイルオキシから選択される；

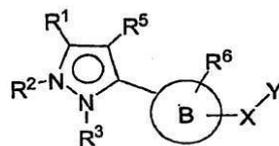
R⁵はH、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルケニル、(C₁~C₆)アルキニル、アリール(C₁~C₆)アルキルである；ならびに

各R⁶はH、(C₁~C₆)アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール(C₁~C₆)アルキルである)

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項59】

式I：



(I)

(式中：

R¹は(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上のR_eで置換される；

R²およびR³の1つは非存在であり、他は水素、(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル、アミノ(C₂~C₆)アルキル、

またはアリアルであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、(C₃~C₆)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、アリアル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)もしくはHet(C₁~C₆)アルキルから選択される1つ以上の基で置換される；

Bはチオフェン、フラン、またはピロールである；

Xは-C(=S)または-C(R⁴)₂である；

YはR⁴、-N(R⁴)₂、-OR⁴、-SR⁴、または-C(R⁴)₃である；ここでXは-C(R⁴)₂である場合、Yは-SR⁴である；

各R⁴は独立して、水素、(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルケニル、(C₂~C₆)アルキニル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、(C₃~C₈)シクロアルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ(C₂~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₂~C₆)アルキル、シアノ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルチオ(C₂~C₆)アルキル、アリアル、アリアル(C₁~C₆)アルキル、アリアルオキシ(C₂~C₆)アルキル、ハロ(C₂~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル(C₁~C₆)アルキル、NR_aR_b、Het、またはHet(C₁~C₆)アルキルからなる群より選択され、非置換または1つ以上のR_dで置換される、あるいは結合している原子と共に2つのR⁴基は、炭素原子および任意にO、S(O)₂、およびNR_cから選択される1つ以上のヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、各環系は任意に1つ以上のR_dで置換される；

zは0、1、または2である；

各R_aおよびR_bは独立して、水素または(C₁~C₆)アルキルである；

各R_cは独立して、水素、アリアル、S(O)₂、(C₁~C₆)アルカノイル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、アルコキシ(C₁~C₆)アルキル、Het、(C₁~C₆)アルコキシカルボニルまたは(C₁~C₆)アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される；

各R_dは独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、(C₁~C₆)アルキルアミノ、アミノ(C₁~C₆)アルキル、アミド、(C₁~C₆)アルキルアミド、アリアルアミド、カルボン酸、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、Het、アリアル、Het(C₁~C₆)アルキル、またはアリアル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリアル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される、あるいは結合している原子と共に2つのR_dはケトンまたはスピロ環式炭素環式環もしくは複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つのR_dは二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、NR_fR_g、R_fR_gNC(=O)-、フェニル、またはフェニル(C₁~C₆)アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共にR_fおよびR_gはピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される；

各R_eは独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、Het、アリアル、(C₁~C₆)アルキルHet、(C₁~C₆)アルキルアリアル、(C₁~C₆)アルキルHet(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリアル(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、および(C₁~C₆)アルカノイルオキシから選択される；

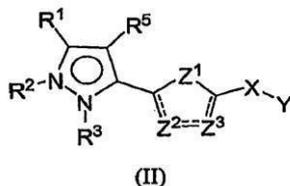
R⁵はH、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルケニル、(C₁~C₆)アルキニル、アリアル(C₁~C₆)アルキルである；

各R⁶はH、(C₁~C₆)アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリアル(C₁~C₆)アルキルである；

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 60】

式II:



(式中:

R^1 は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上の R_e で置換される;

R^2 および R^3 の1つは非存在であり、他は水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、アミノ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ もしくはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルから選択される1つ以上の基で置換される;

各 Z^1 、 Z^2 、および Z^3 は独立して $C(R^6)_p$ 、 $N(R^6)_q$ 、O、またはSであり、 Z^1 は $N(R^6)_q$ 、O、またはSである場合、少なくとも1つの Z^1 または Z^2 は $N(R^6)_q$ 、O、またはSでなければならない;

各 p は独立して、0、1、または2である;

各 q は独立して、0または1である;

Xは $-C(=O)$ 、 $-C(=S)$ 、 $-C(R^4)_2$ 、または $-S(O)_z$ である;

各 z は独立して、0、1、または2である;

Yは R^4 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、または $-C(R^4)_3$ である;

各 R^4 は独立して、水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、シアノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アリールオキシ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 NR_aR_b 、Het、またはHet $(C_1 \sim C_6)$ アルキルからなる群より選択され、各アルキル、アリール、またはHetは非置換または1つ以上の R_d で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R^4 基はアリール、Het、または炭素原子および任意にO、 $S(O)_z$ 、および NR_c から選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含む飽和または不飽和の3~8員単環式環系または8~12員二環式環系を形成し、各環系は任意に1つ以上の R_d で置換される;

各 R_a および R_b は独立して、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルである;

各 R_c は独立して水素、アリール、 $S(O)_2$ 、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、Het、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルまたは $(C_1 \sim C_6)$ アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される;

各 R_d は独立してハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、アミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、アミド、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、またはアリール $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基 R_e で置換される、あるいは結合している原子と共に2つの R_d はケトンまたはスピロ環式炭素環

式環もしくは複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つのR_gは二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、NR_fR_g、R_fR_gNC(=O)-、フェニル、またはフェニル(C₁~C₆)アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共にR_fおよびR_gはピペリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される；

各R_eは独立してハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、Het、アリール、(C₁~C₆)アルキルHet、(C₁~C₆)アルキルアリール、(C₁~C₆)アルキルHet(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、および(C₁~C₆)アルカノイルオキシから選択される；

R⁵はH、(C₁~C₆)アルキル、アリール(C₁~C₆)アルキルである；ならびに

各R⁶はH、(C₁~C₆)アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール(C₁~C₆)アルキルである；

Xは-C(=O)であり、Yは-N(R⁴)₂であり、Z¹はOであり、Z²はNであり、Z³はCHである場合、Yの両方のR⁴はHでないことを条件とする)

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項61】

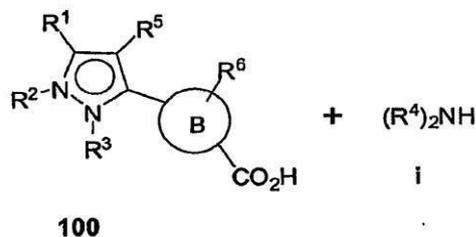
請求項52~60いずれか記載の化合物、および薬学的に許容され得る希釈剤または担体を含む医薬組成物。

【請求項62】

a)1つ以上の保護基を含む対応化合物を脱保護して式Iの化合物を提供する工程；

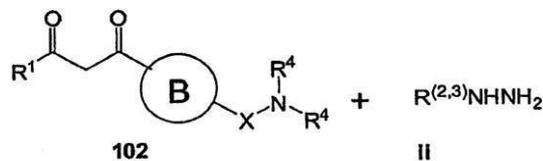
b)式Iの化合物から薬学的に許容され得る塩を形成する工程；

c)Xが-C(=O)-である式Iの化合物について、式100の中間体酸を式iのアミンと反応させて



式Iの化合物を提供する工程；または

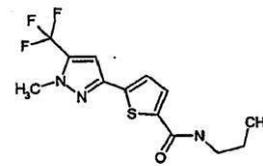
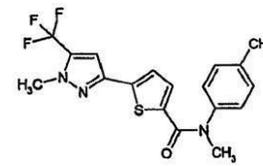
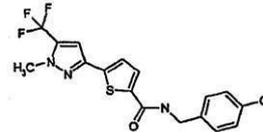
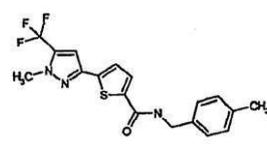
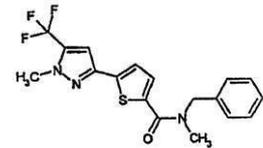
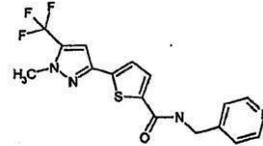
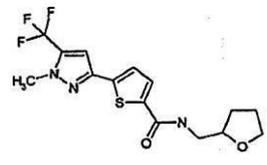
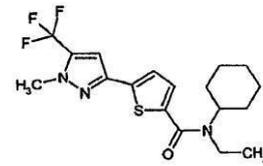
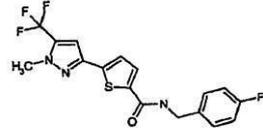
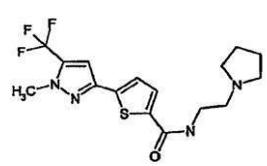
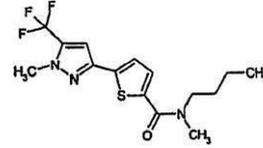
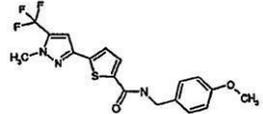
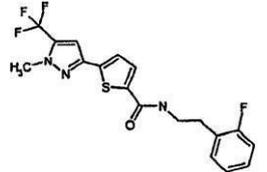
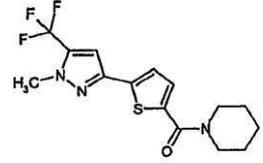
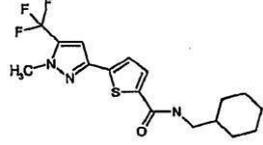
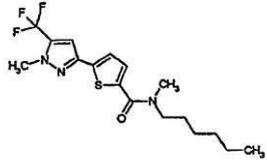
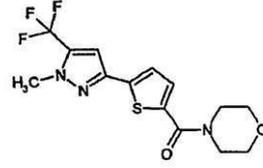
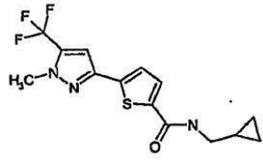
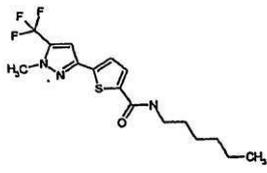
d)R²が非存在である式Iの化合物について、式102の中間体ジケトンと式iiのヒドラジンと反応させて

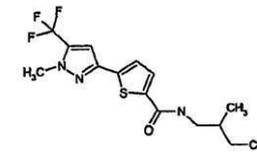
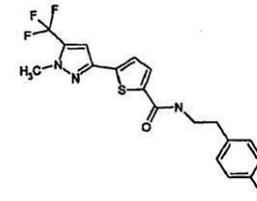
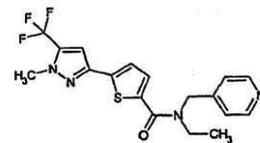
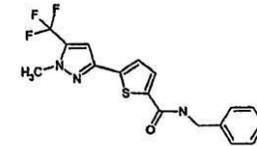
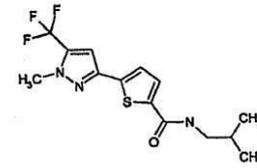
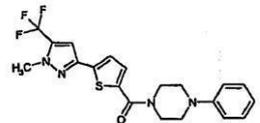
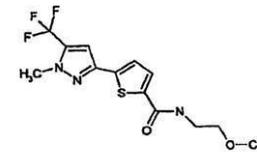
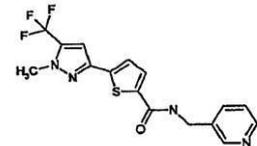
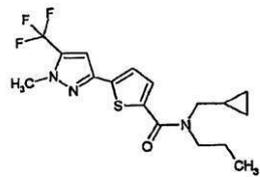
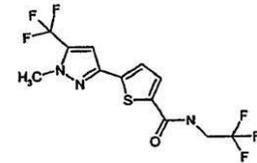
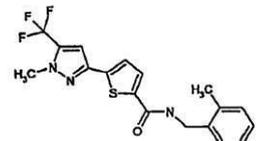
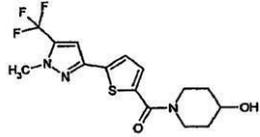
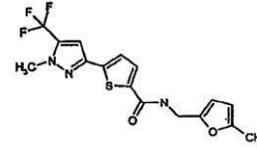
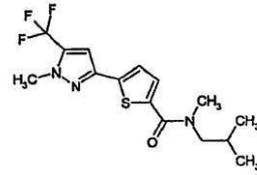
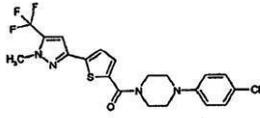
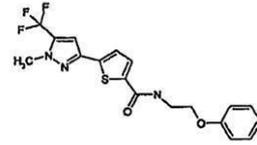
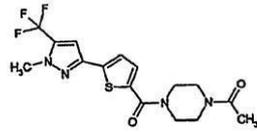
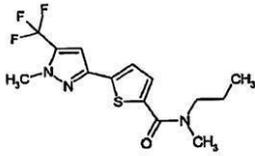


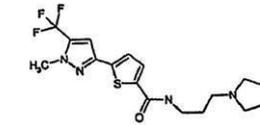
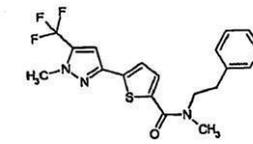
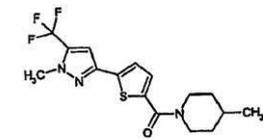
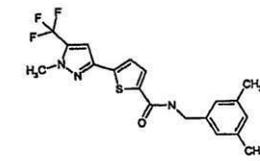
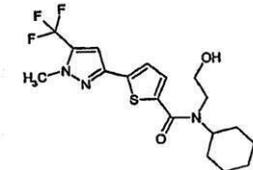
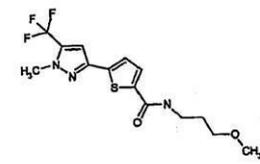
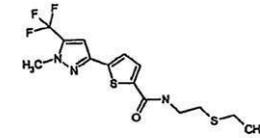
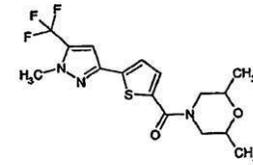
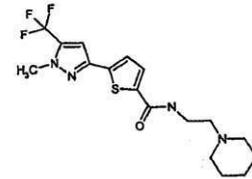
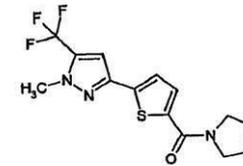
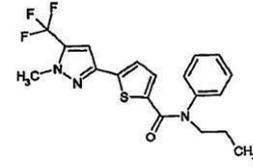
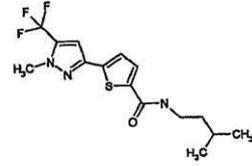
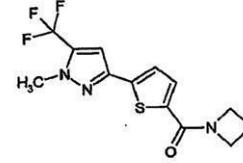
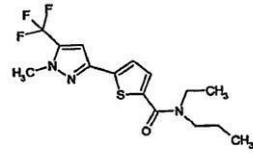
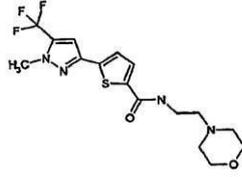
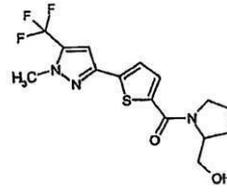
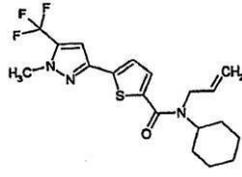
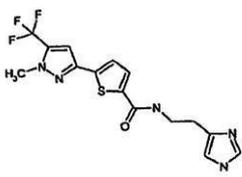
式Iの化合物を提供する工程

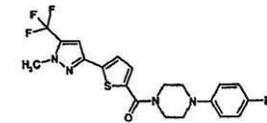
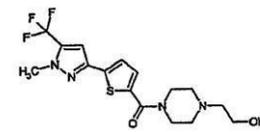
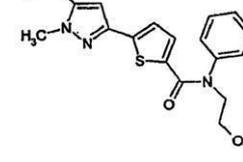
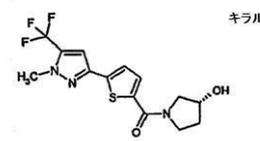
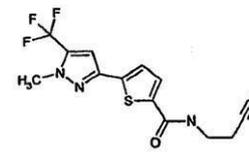
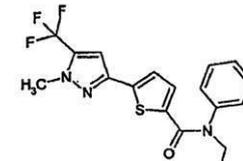
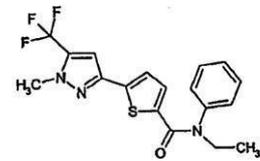
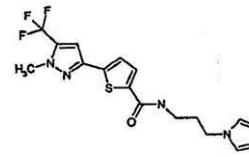
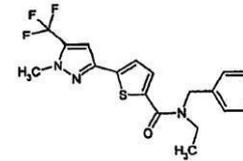
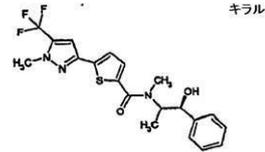
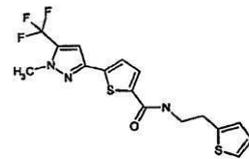
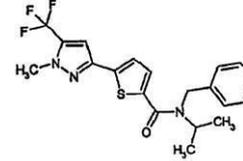
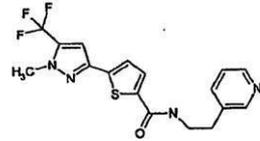
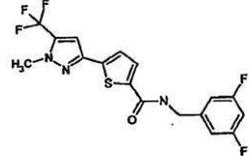
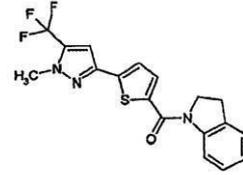
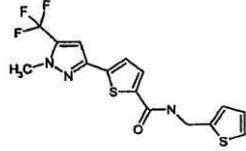
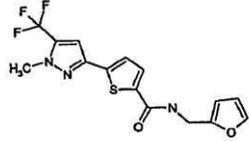
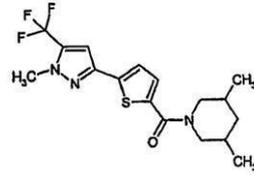
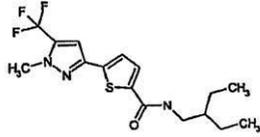
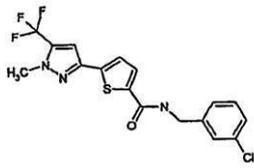
を含む、請求項52~60いずれか記載の式Iの化合物またはその塩を製造する方法。

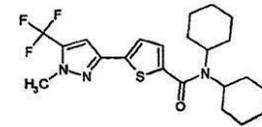
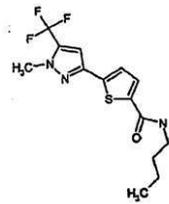
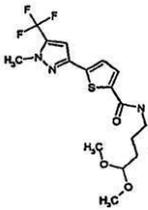
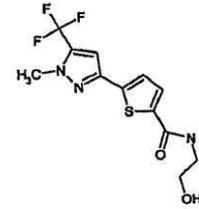
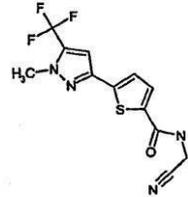
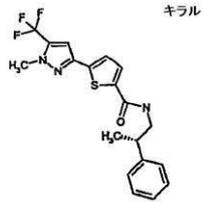
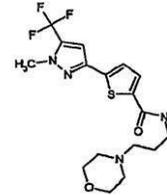
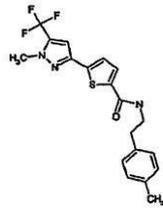
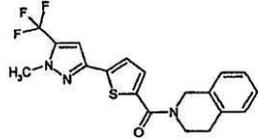
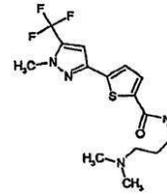
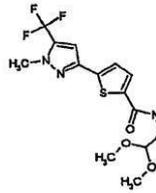
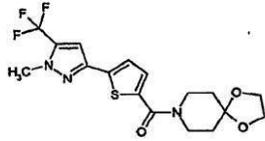
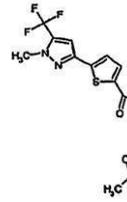
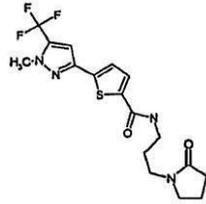
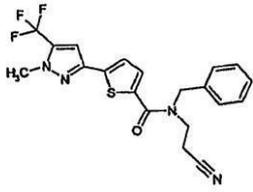
【請求項 6 3】

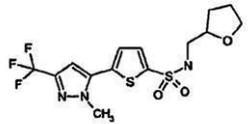
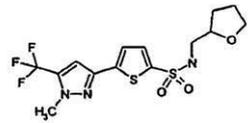
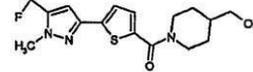
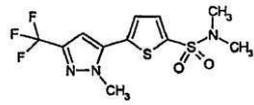
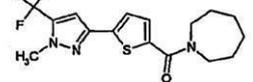
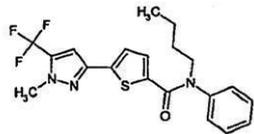
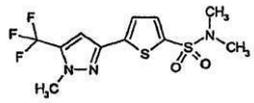
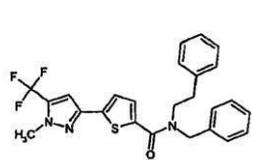
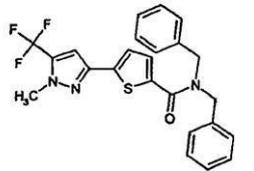
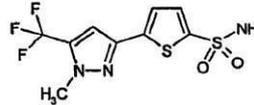
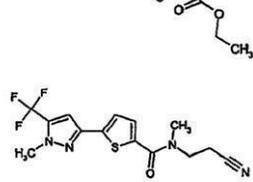
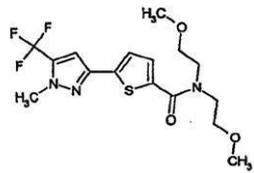
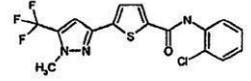
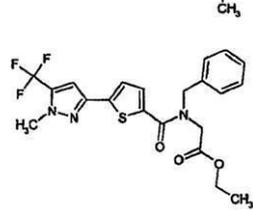
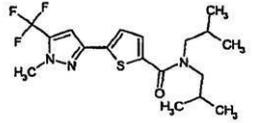
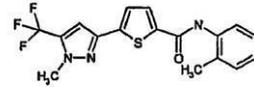
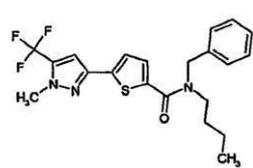
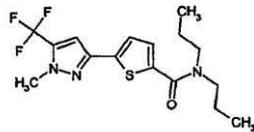
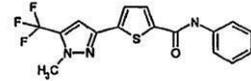
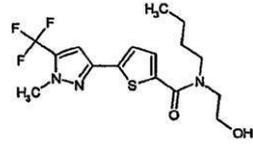
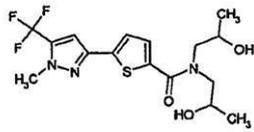


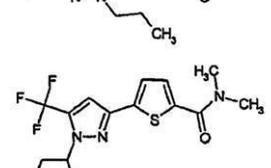
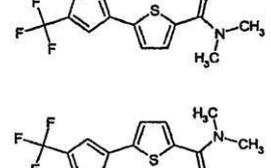
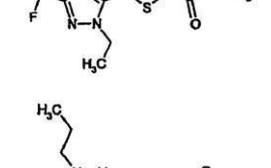
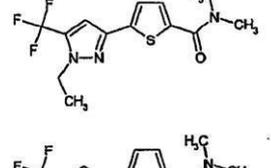
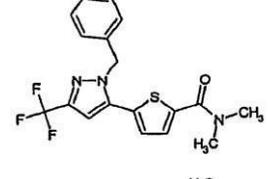
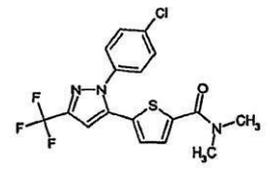
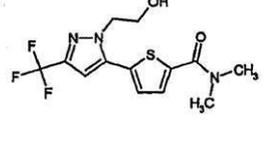
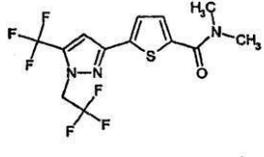
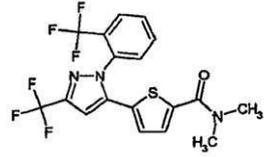
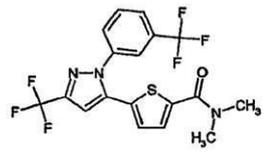
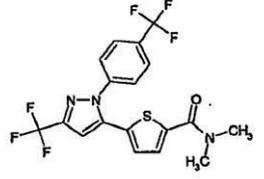
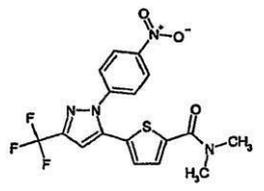
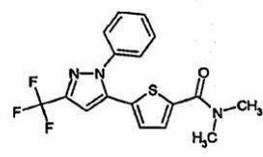
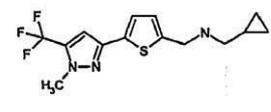
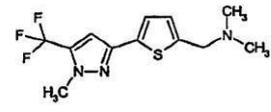
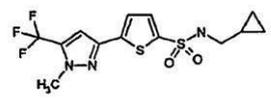
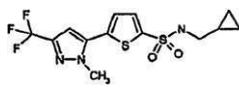
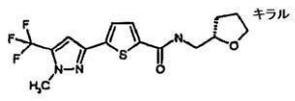
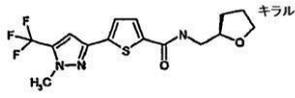


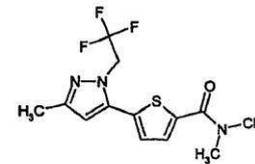
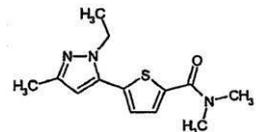
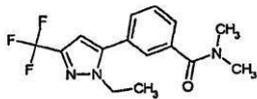
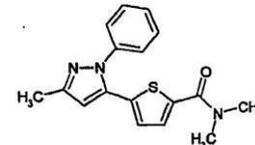
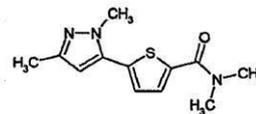
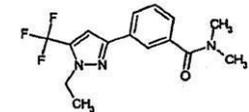
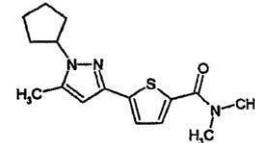
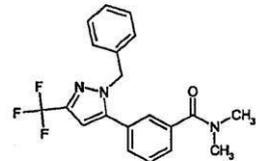
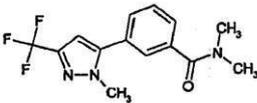
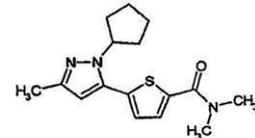
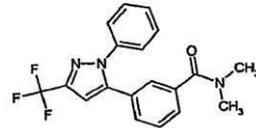
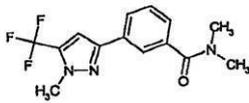
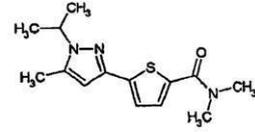
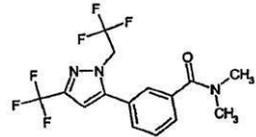
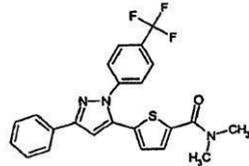
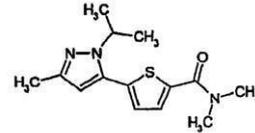
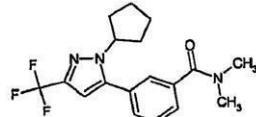
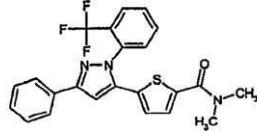
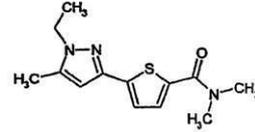
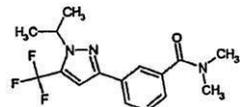
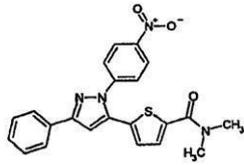


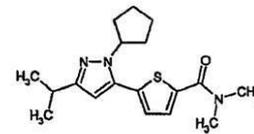
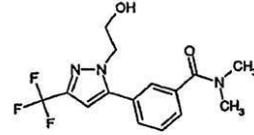
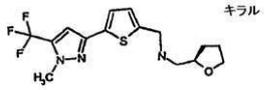
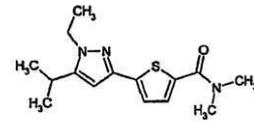
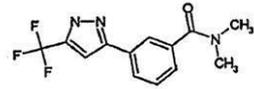
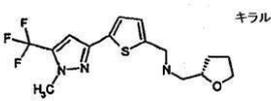
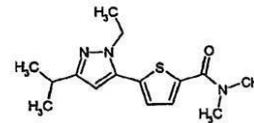
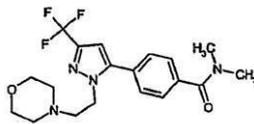
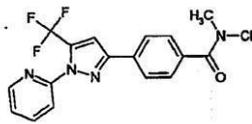
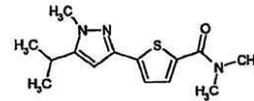
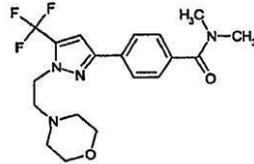
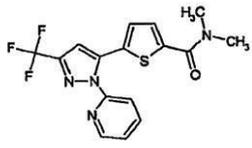
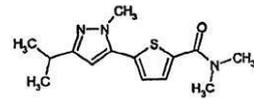
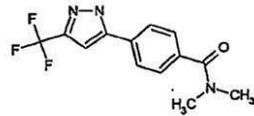
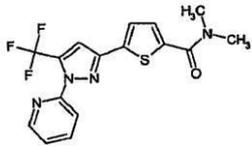
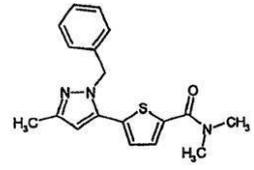
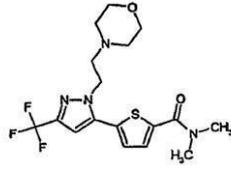
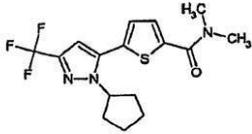
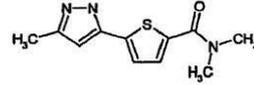
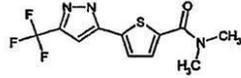
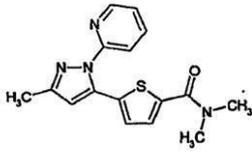


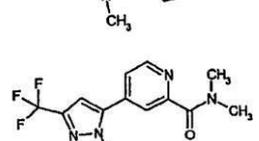
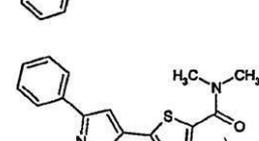
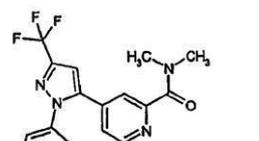
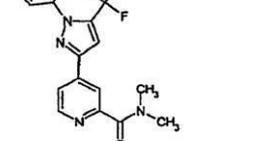
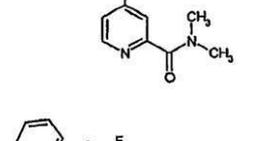
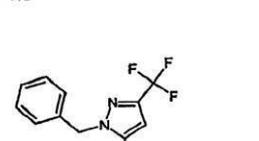
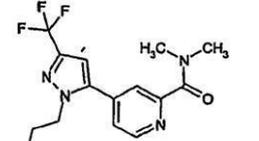
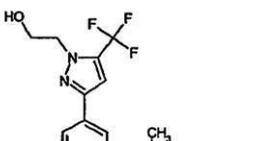
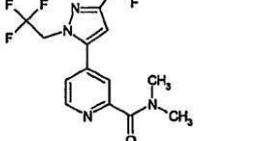
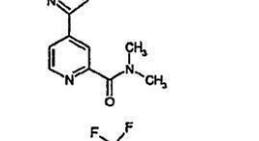
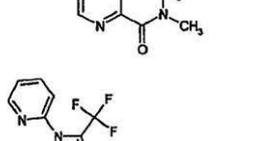
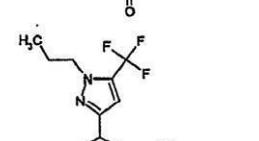
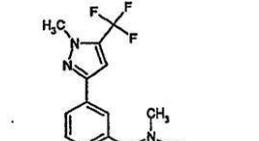
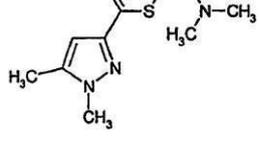
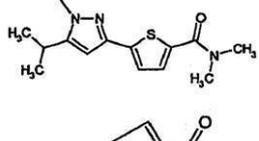
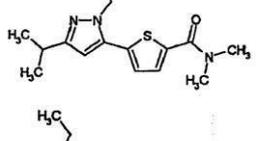
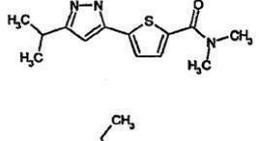
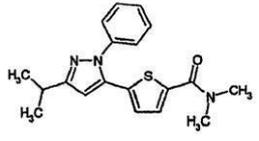
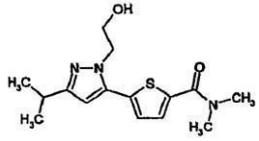
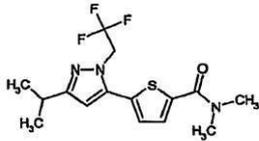


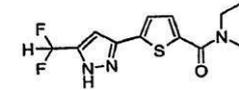
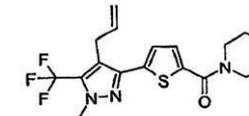
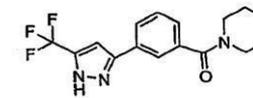
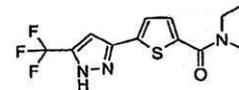
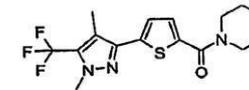
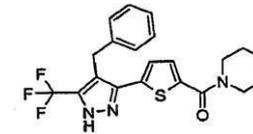
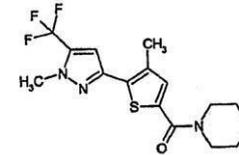
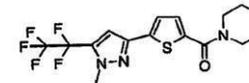
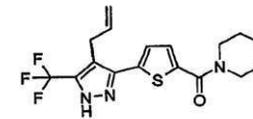
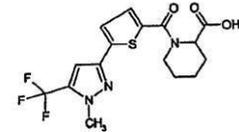
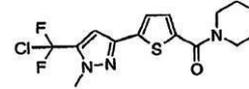
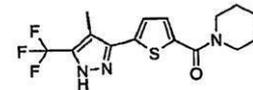
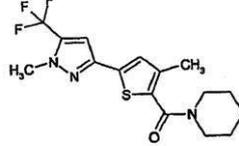
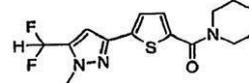
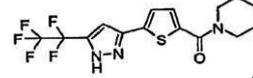
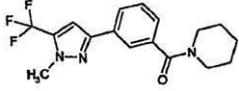
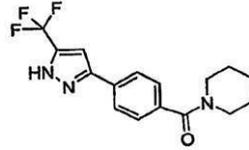
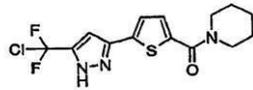
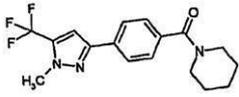


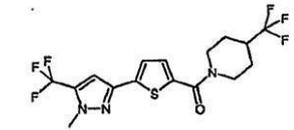
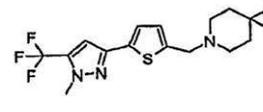
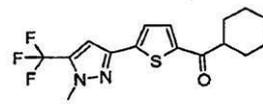
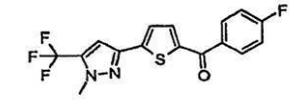
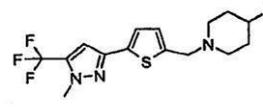
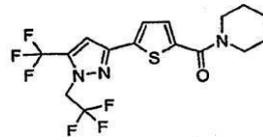
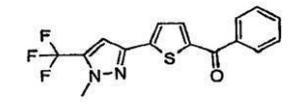
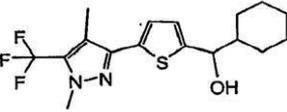
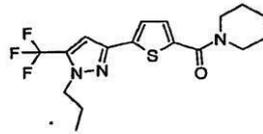
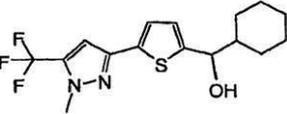
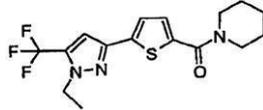
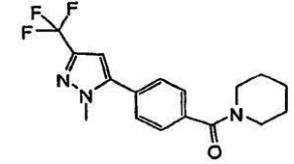
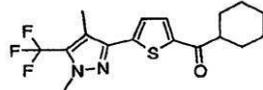
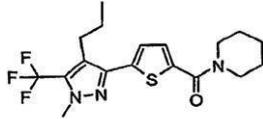
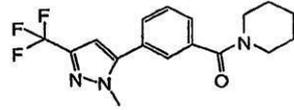
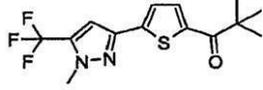
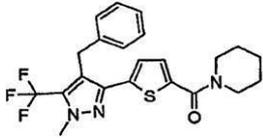


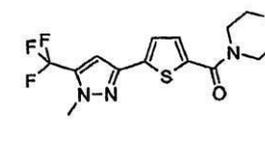
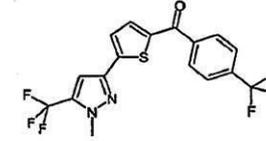
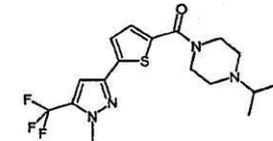
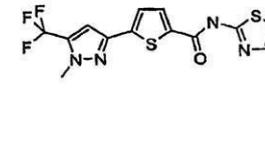
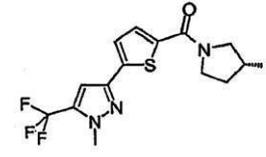
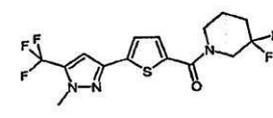
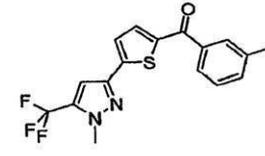
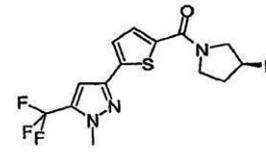
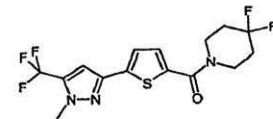
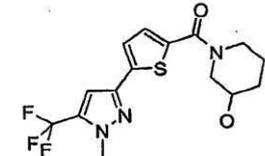
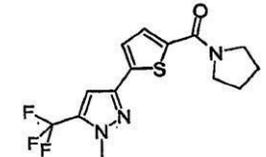
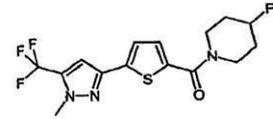
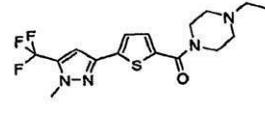
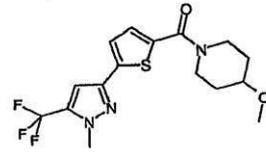
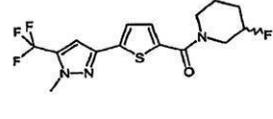
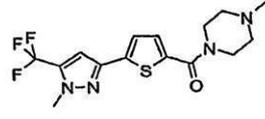
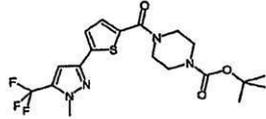
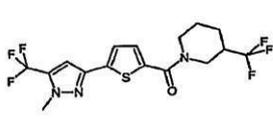


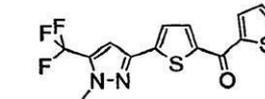
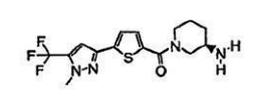
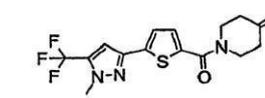
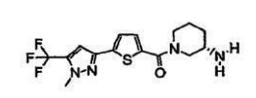
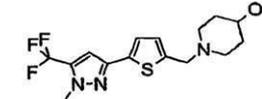
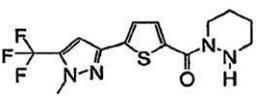
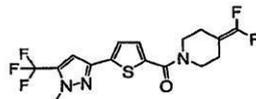
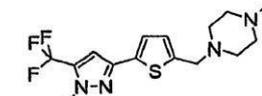
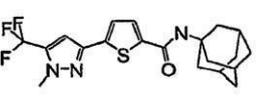
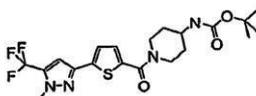
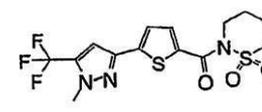
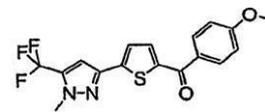
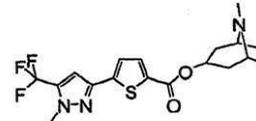
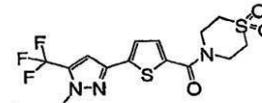
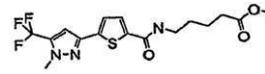
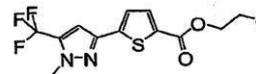
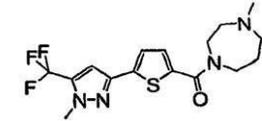
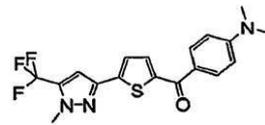
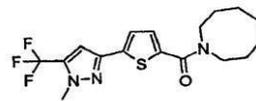
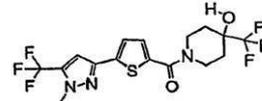
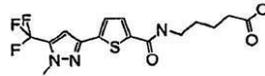
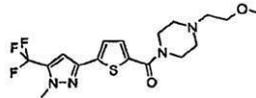
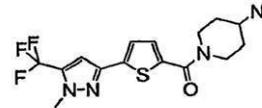
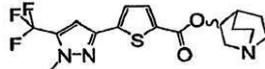
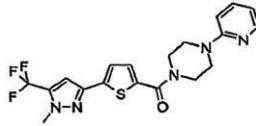
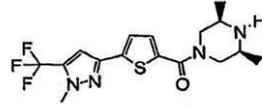
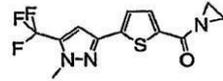
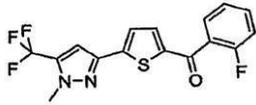












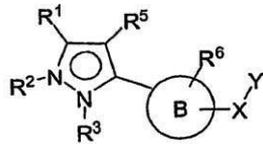
からなる群より選択される化合物。

【請求項 6 4】

式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩が請求項 6 3 記載の化合物である、請求項 1 記載の使用。

【請求項 6 5】

式 I :



(I)

(式中:

R¹は(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、またはアリールであり、非置換または1つ以上のR_eで置換される;

R²およびR³の一つは非存在であり、他は水素、(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₈)シクロアルキル、アミノ(C₂~C₆)アルキル、またはアリールであり、それぞれは非置換またはアルキル、ハロ、ハロアルキルもしくはニトロ、Het、(C₃~C₈)シクロアルキル(C₁~C₆)アルキル、アリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)もしくはHet(C₁~C₆)アルキルから選択される1つ以上の基で置換される;

Bは5~12員の単環式または二環式Hetである;

Xは-C(=O)である;

Yは-OR⁴である;

R⁴は炭素原子および任意にO、S(O)_z、およびNR_cから選択される1つ以上のヘテロ原子を含む8~12員の二環式環系であり、各環系は任意に1つ以上のR_dで置換される;

zは0、1、または2である;

各R_cは独立して、水素、アリール、S(O)₂、(C₁~C₆)アルカノイル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、アルコキシ(C₁~C₆)アルキル、Het、(C₁~C₆)アルコキシカルボニルまたは(C₁~C₆)アルキルであり、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される;

各R_dは独立してハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アミノ、(C₁~C₆)アルキルアミノ、アミノ(C₁~C₆)アルキル、アミド、(C₁~C₆)アルキルアミド、アリールアミド、カルボン酸、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、Het、アリール、Het(C₁~C₆)アルキル、またはアリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリール、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートであり、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される、あるいは結合している原子と共に2つのR_dはケトンまたはスピロ環式炭素環式環もしくは複素環式環を形成する、あるいは結合している原子と共に2つのR_dは二環式炭素環式環または複素環式環を形成する、ここで各スピロ環式環または二環式環は非置換またはハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁~C₆)アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、(C₁~C₆)アルカノイルオキシ、NR_fR_g、R_fR_gNC(=O)-、フェニル、またはフェニル(C₁~C₆)アルキル、スルホニル、スルホンアミド、尿素、カーバメートの1つ以上で置換され、結合している窒素と共にR_fおよびR_gはペリリジノ環、ピロリジノ環、モルホリノ環、またはチオモルホリノ環を形成し、非置換または1つ以上の置換基R_eで置換される;

各R_eは独立して、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アジド、(C₁~C₆)アルキル、He

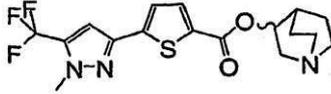
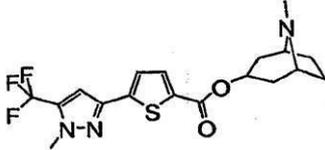
t、アリール、(C₁~C₆)アルキルHet、(C₁~C₆)アルキルアリール、(C₁~C₆)アルキルHet (C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルキルアリール(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)ハロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、(C₁~C₆)ハロアルコキシ、(C₁~C₆)アルカノイル、(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、カルボキシ、および(C₁~C₆)アルカノイルオキシから選択される；

R⁵はH、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルケニル、(C₁~C₆)アルキニル、アリール(C₁~C₆)アルキルである；ならびに

各R⁶はH、(C₁~C₆)アルキル、アミノ、アミド、ケト、またはアリール(C₁~C₆)アルキルである)

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項 6 6】



からなる群より選択される、請求項 6 5 記載の化合物。

【請求項 6 7】

Y=R⁴である、請求項 5 2 記載の化合物。