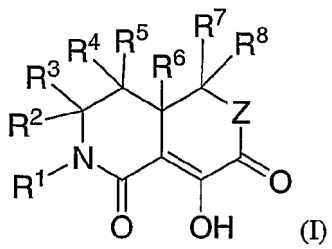
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年4月17日(2008.4.17)

【公表番号】特表2007-528396(P2007-528396A)
【公表日】平成19年10月11日(2007.10.11)
【年通号数】公開・登録公報2007-039
【出願番号】特願2007-502875(P2007-502875)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4375 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/18 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/444 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 471/04 １１３
Ｃ０７Ｄ 471/04 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/4375
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 31/18
Ａ６１Ｋ 31/444
Ａ６１Ｋ 31/506

【手続補正書】
【提出日】平成20年2月29日(2008.2.29)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
下記式Ｉの化合物、または該化合物の個々の光学異性体エナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【化１】



(I)

［式中、
Ｚは、ＯもしくはＮ－Ｒ^{9}であり；
Ｒ^{1}は、Ｒ^{J}で置換された－Ｃ$_{1-6}$アルキルであり、Ｒ^{J}は、
（Ａ）アリールまたは独立にＮ、ＯおよびＳから選択される１～４個のヘテロ原子を含む５員もしくは６員のヘテロ芳香族環に縮合したアリール［前記アリールまたは縮合アリールは、

（ｉ）１～５個の置換基で置換されていても良く［各置換基は独立に、
（１）－ＯＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^A、－ＣＯ$_2$Ｒ^A、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｒ^A、－ＳＯ$_2$Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、－Ｎ（Ｒ^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^B、－Ｎ（Ｒ^A）ＣＯ$_2$Ｒ^B、－Ｎ（Ｒ^A）ＳＯ$_2$Ｒ^B、－Ｎ（Ｒ^A）ＳＯ$_2$Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^{B}もしくは－Ｎ（Ｒ^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^{B}で置換されていても良い－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（２）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（３）－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、
（４）－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、
（５）－ＯＨ、
（６）ハロ、
（７）－ＣＮ、
（８）－ＮＯ$_2$、
（９）－Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、
（１０）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、
（１１）－Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^A、
（１２）－ＣＯ$_2$Ｒ^A、
（１３）－ＳＲ^A、
（１４）－Ｓ（＝Ｏ）Ｒ^A、
（１５）－ＳＯ$_2$Ｒ^A、
（１６）－ＳＯ$_2$Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、
（１７）－Ｎ（Ｒ^A）ＳＯ$_2$Ｒ^B、
（１８）－Ｎ（Ｒ^A）ＳＯ$_2$Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^B、
（１９）－Ｎ（Ｒ^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｒ^B、
（２０）－Ｎ（Ｒ^A）Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^A）Ｒ^{B}もしくは
（２１）－Ｎ（Ｒ^A）ＣＯ$_2$Ｒ^B
である。］および
（ｉｉ）１もしくは２個の置換基で置換されていても良く［各置換基は独立に、
（１）アリール、
（２）アリールで置換された－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（３）－ＨｅｔＡ、
（４）－Ｃ（＝Ｏ）－ＨｅｔＡもしくは
（５）－ＨｅｔＢ
である。］；
各ＨｅｔＡは独立に、Ｃ$_{4-7}$アザシクロアルキルもしくはＣ$_{3-6}$ジアザシクロアルキルであり、これらのいずれもそれぞれが独立にオキソもしくはＣ$_{1-6}$アルキルである１～３個の置換基で置換されていても良く；
各ＨｅｔＢは、独立にＮ、ＯおよびＳから選択される１～４個のヘテロ原子を有する５員もしくは６員のヘテロ芳香族環であり；前記ヘテロ芳香族環は、それぞれが独立にハロ、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキルもしくはヒドロキシである１～４個の置換基で置換されていても良い。］；または
（Ｂ）独立にＮ、ＯおよびＳから選択される１～４個のヘテロ原子を有する５員もしくは６員のヘテロ芳香族環［前記ヘテロ芳香族環は、
（ｉ）それぞれ独立にハロゲン、－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$アルキル、－Ｏ－Ｃ$_{1-6}$ハロアルキルもしくはヒドロキシである１～４個の置換基で置換されていても良く、および
（ｉｉ）それぞれ独立にアリールもしくはアリールで置換された－Ｃ$_{1-6}$アルキルである１個もしくは２個の置換基で置換されていても良い。］

であり；
R^2、R^3、R^4およびR^5は下記で定義の通りであり、すなわち
（Ａ）R^2、R^3、R^4およびR^5はそれぞれ独立に、
（１）－Ｈ、
（２）－C_{1-6}アルキル［－ＯＨ、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－ＣＮ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－CO_2R^A、－Ｓ（Ｏ）$_n R^A$、－SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）R^B、－Ｎ（R^A）CO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bもしくは－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bで置換されていても良い。］、
（３）－C_{1-6}ハロアルキル、
（４）ＣｙｃＡ、
（５）ＡｒｙＡ、
（６）ＨｅｔＣ、または
（７）ＣｙｃＡ、ＡｒｙＡもしくはＨｅｔＣで置換された－C_{1-6}アルキル
であり；
（Ｂ）R^2およびR^4がそれぞれが結合している炭素原子とともに、炭素－炭素二重結合を形成しており；R^3およびR^5がそれぞれ独立に、上記のパートＡで定義の通りであり；
（Ｃ）R^2およびR^3が、これら両方が結合している炭素原子とともに、それぞれが独立に－ＯＨ、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}アルキルもしくは－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキルである１～４個の置換基で置換されていても良い３～８員の飽和炭素環を形成しており；R^4およびR^5はそれぞれ独立に、上記のパートＡで定義の通りであり；または
（Ｄ）R^4およびR^5が、これら両方が結合している炭素原子とともに、それぞれが独立に－ＯＨ、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}アルキルもしくは－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキルである１～４個の置換基で置換されていても良い３～８員の飽和炭素環を形成しており；R^2およびR^3がそれぞれ独立に、上記のパートＡで定義の通りであり；
R^6は、
（１）－Ｈ、
（２）－ＯＨ、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－ＣＮ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－CO_2R^A、－Ｓ（Ｏ）$_n R^A$、－SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）R^B、－Ｎ（R^A）CO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bもしくは－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bで置換されていても良い－C_{1-6}アルキル、
（３）－C_{1-6}ハロアルキル、
（４）ＣｙｃＡ、
（５）ＡｒｙＡ、
（６）ＨｅｔＣまたは
（７）ＣｙｃＡ、ＡｒｙＡもしくはＨｅｔＣで置換された－C_{1-6}アルキル
であり；
R^7およびR^8はそれぞれ独立に、
（１）－Ｈ、
（２）－ＯＨ、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－ＣＮ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－CO_2R^A、－Ｓ（Ｏ）$_n R^A$、－SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）R^B、－Ｎ（R^A）CO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2Ｎ（R^A）R^B、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bもしくは－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bで置換されていても良い

－C_{1-6}アルキル、
（３）－C_{1-6}ハロアルキル、
（４）－Ｃ（＝Ｏ）R^A、
（５）－CO_2R^A、
（６）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、
（７）－Ｎ（R^A）$SO_2N(R^A)R^B$、
（８）－R^K、
（９）－Ｃ（＝Ｏ）－R^K、
（１０）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）－R^K、
（１１）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）－C_{1-6}アルキレン－R^Kまたは
（１２）－R^K、－Ｃ（＝Ｏ）－R^K、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）－R^Kもしくは－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）－C_{1-6}アルキレン－R^Kで置換された－C_{1-6}アルキル
であり；
あるいはR^7とR^8が、これら両方が結合している炭素原子とともに、それぞれが独立にハロゲン、－ＯＨ、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}アルキルもしくは－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキルである１～４個の置換基で置換されていても良い３～８員の飽和炭素環を形成しており；
R^9は、
（１）－Ｈ、
（２）－ＯＨ、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－ＣＮ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－CO_2R^A、－Ｓ（Ｏ）$_nR^A$、－$SO_2N(R^A)R^B$、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）R^B、－Ｎ（R^A）CO_2R^B、－Ｎ（R^A）SO_2R^B、－Ｎ（R^A）$SO_2N(R^A)R^B$、－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bもしくは－ＯＣ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bで置換されていても良い－C_{1-6}アルキル、
（３）－C_{1-6}ハロアルキル、
（４）ＣｙｃＡ、
（５）ＡｒｙＡ、
（６）ＨｅｔＣまたは
（７）ＣｙｃＡ、ＡｒｙＡもしくはＨｅｔＣで置換された－C_{1-6}アルキル
であり；
各ｎは独立に、０、１もしくは２に等しい整数であり；
各R^Aは独立に、ＨもしくはC_{1-6}アルキルであり；
各R^Bは独立に、ＨもしくはC_{1-6}アルキルであり；
各R^Kは独立に、ＣｙｃＡ、ＡｒｙＡもしくはＨｅｔＣであり；
各ＣｙｃＡは独立に、それぞれがハロゲン、－ＯＨ、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}アルキルもしくは－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキルである１～４個の置換基で置換されていても良いC_{3-8}シクロアルキルであり；
各ＡｒｙＡは独立にアリールであり、該アリールは
（ａ）それぞれが独立に－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}アルキレン－ＯＨ、－C_{1-6}アルキレン－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}アルキレン－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－C_{1-6}アルキレン－Ｎ（R^A）R^B、－C_{1-6}アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－C_{1-6}アルキレン－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－C_{1-6}アルキレン－CO_2R^A、－C_{1-6}アルキレン－Ｓ（Ｏ）$_nR^A$、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、－ＯＨ、ハロ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）R^A、－CO_2R^A、－Ｓ（Ｏ）$_nR^A$もしくは－$SO_2N(R^A)R^B$である１～５個の置換基で置換されていても良く、
（ｂ）C_{3-8}シクロアルキル、アリール、ＨｅｔＤまたはC_{3-8}シクロアルキル、アリールもしくはＨｅｔＤで置換された－C_{1-6}アルキルで置換されていても良く；
各ＨｅｔＣは独立に、少なくとも１個の炭素原子および独立にＮ、ＯおよびＳから選択

される１～４個のヘテロ原子を含む４～７員の飽和もしくは不飽和複素環であり；この複素環は、

（ａ）それぞれがハロゲン、－C_{1-6}アルキル、－C_{1-6}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-6}アルキル、－Ｏ－C_{1-6}ハロアルキル、ＯＨもしくはオキソである１～４個の置換基で置換されていても良く、

（ｂ）C_{3-8}シクロアルキル、アリール、ＨｅｔＤまたはC_{3-8}シクロアルキル、アリールもしくはＨｅｔＤで置換された－C_{1-6}アルキルで置換されていても良く；

各ＨｅｔＤは独立に、少なくとも１個の炭素原子および独立にＮ、ＯおよびＳから選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～７員の飽和もしくは不飽和複素環であり；

各アリールは独立に、

（ｉ）フェニルまたは

（ｉｉ）少なくとも１個の環が芳香族である９員もしくは１０員の二環式縮合炭素環系である。］

【請求項２】

ＺがＮ－R^9である請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項３】

R^1がCH_2－R^Jであり；R^Jが、フェニル、ピリジル、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニルもしくはキナゾリニルであり、これらのいずれも

（ａ）それぞれが独立に

（１）－C_{1-4}アルキル、

（２）－Ｏ－C_{1-4}アルキル、

（３）－C_{1-4}ハロアルキル、

（４）－Ｏ－C_{1-4}ハロアルキル、

（５）ハロ、

（６）－ＣＮ、

（７）－Ｎ（R^A）R^B、

（８）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B、

（９）－Ｓ（＝Ｏ）R^A、

（１０）－SO_2R^A、

（１１）－Ｎ（R^A）SO_2R^B、

（１２）－Ｎ（R^A）SO_2Ｎ（R^A）R^B、

（１３）－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）R^Bもしくは

（１４）－Ｎ（R^A）Ｃ（＝Ｏ）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^B

である１～４個の置換基で置換されていても良く、

（ｂ）フェニル、ベンジル、－ＨｅｔＡもしくは－Ｃ（＝Ｏ）－ＨｅｔＡで置換されていても良く；

各ＨｅｔＡが独立に、C_{4-7}アザシクロアルキルもしくはC_{3-6}ジアザシクロアルキルであり：これらはいずれもそれぞれが独立にオキソもしくはC_{1-4}アルキルである１～３個の置換基で置換されていても良く；ただし、ＨｅｔＡが－Ｃ（＝Ｏ）－部分を介して化合物の残りの部分に結合している場合、そのＨｅｔＡは環Ｎ原子を介して－Ｃ（＝Ｏ）－に結合している請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項４】

R^2、R^3、R^4およびR^5が、下記に定義の通りである、すなわち

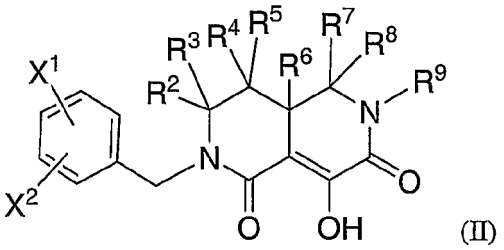
（Ａ）R^2およびR^4が請求項１のパートＡで定義の通りであり；R^3およびR^5がいずれもＨであり；

（Ｂ）R^2およびR^4が請求項１のパートＢで定義の通りであり；R^3およびR^5がいずれもＨであり；

（Ｃ）R^2およびR^3が請求項１のパートＣで定義の通りであり；R^4およびR^5がい

ずれもＨであり；または
（Ｄ）Ｒ^{4}およびＲ^{5}が請求項１のパートＤで定義の通りであり；Ｒ^{2}およびＲ^{3}がいずれもＨである請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項５】
Ｒ^{6}が、
（１）－Ｈ、
（２）－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（３）－Ｃ$_{1-6}$フルオロアルキル、
（４）ＣｙｃＡ、
（５）ＡｒｙＡもしくは
（６）ＡｒｙＡで置換された－Ｃ$_{1-6}$アルキル
である請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項６】
Ｒ^{6}がＨである請求項５に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項７】
Ｒ^{7}およびＲ^{8}がそれぞれ独立に、
（１）－Ｈ、
（２）－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（３）－ＣＯ$_{2}$Ｒ^{A}、
（４）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{A}）Ｒ^{B}、
（５）－Ｒ^{K}、
（６）－Ｃ（＝Ｏ）－Ｒ^{K}、
（７）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{A}）－Ｒ^{K}もしくは
（８）－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（Ｒ^{A}）－Ｃ$_{1-6}$アルキレン－Ｒ^{K}
であり；
あるいはＲ^{7}およびＲ^{8}が、これら両方が結合している炭素原子とともに、３～７員の飽和炭素環を形成している請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項８】
Ｒ^{9}が、
（１）－Ｈ、
（２）－Ｃ$_{1-6}$アルキル、
（３）－Ｃ$_{1-6}$フルオロアルキル、
（４）ＣｙｃＡまたは
（５）ＣｙｃＡ、ＡｒｙＡもしくはＨｅｔＣで置換された－Ｃ$_{1-6}$アルキル
である請求項１に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項９】
下記式（ＩＩ）の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。

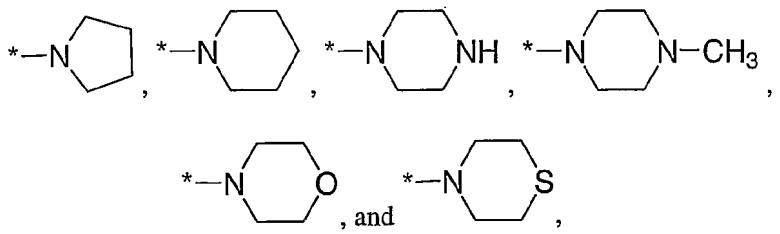
【化２】



(II)

［式中、
X^1およびX^2はそれぞれ独立に、－Ｈ、－C_{1-4}アルキル、－Ｏ－C_{1-4}アルキル、－C_{1-4}ハロアルキル、－Ｏ－C_{1-4}ハロアルキル、ハロ、－ＣＮ、－Ｎ（R^A）R^B、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）R^Bもしくは－Ｓ（Ｏ）$_n$$R^A$であり；ｎは０、１もしくは２に等しい整数であり；
R^2、R^3、R^4およびR^5は、下記に定義の通りである、すなわち
（Ａ）R^2およびR^4はそれぞれ独立に、－Ｈ、－C_{1-4}アルキル、－C_{1-4}フルオロアルキル、C_{3-6}シクロアルキル、フェニルもしくはベンジルであり；R^4およびR^5はいずれもＨであり；
（Ｂ）R^2およびR^4がそれぞれが結合している炭素原子とともに、炭素－炭素二重結合を形成しており；R^3およびR^5はいずれもＨであり；
（Ｃ）R^2およびR^3がそれらが両方結合している炭素原子とともに、シクロプロピルを形成しており；R^4およびR^5はいずれもＨであり；または
（Ｄ）R^4およびR^5がそれらが両方結合している炭素原子とともに、シクロプロピルを形成しており；R^2およびR^3はいずれもＨであり；
R^6は、Ｈ、－C_{1-4}アルキル、CF_3、シクロプロピル、フェニルもしくはベンジルであり；
R^7は、Ｈもしくは－C_{1-4}アルキルであり；
R^8は、－Ｈ、－C_{1-4}アルキル、－CO_2－C_{1-4}アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（C_{1-4}アルキル）、－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（C_{1-4}アルキル）$_2$、C_{3-6}シクロアルキル、ＨｅｔＦ、－Ｃ（＝Ｏ）－ＨｅｔＥもしくは－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（R^A）－（CH_2）$_{1-2}$－ＨｅｔＦであり；
ＨｅｔＥは、少なくとも１個の炭素原子および１～４個のＮ原子、０もしくは１個の酸素原子および０もしくは１個の硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～７員の飽和複素環であり；この飽和複素環はそれぞれが独立にオキソもしくはC_{1-4}アルキルである１～３個の置換基で置換されていても良く；ただし、前記飽和複素環は環Ｎ原子を介して－Ｃ（＝Ｏ）－に結合しており；
ＨｅｔＦは、独立にＮ、ＯおよびＳから選択される１～４個のヘテロ原子を有する５員もしくは６員のヘテロ芳香族環であり；このヘテロ芳香族環は、それぞれが独立にC_{1-4}アルキルである１もしくは２個の置換基で置換されていても良く；
あるいはR^7およびR^8がそれらが両方結合している炭素原子とともに、３～６員の飽和炭素環を形成しており；
R^9は、－Ｈ、－C_{1-4}アルキル、－CH_2CF_3、－C_{3-6}シクロアルキル、－CH_2－C_{3-6}シクロアルキルもしくは－CH_2－フェニルであり；
各R^Aは独立に、ＨもしくはC_{1-4}アルキルであり；
各R^Bは独立に、ＨもしくはC_{1-4}アルキルである。］
【請求項１０】
X^1およびX^2がそれぞれ独立に、Ｈ、フルオロ、クロロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ＣＮ、－SO_2CH_3、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ（CH_3）もしくは－Ｃ（＝Ｏ）Ｎ（CH_3）$_2$であり；
R^2、R^3、R^4およびR^5がいずれもＨであり；

R^6が、H、メチル、シクロプロピルもしくはフェニルであり；
R^7が、Hもしくはメチルであり；
R^8が、－H、－C_{1-4}アルキル、－CO_2－C_{1-4}アルキル、－C（＝O）NH（C_{1-4}アルキル）、－C（＝O）N（C_{1-4}アルキル）$_2$、C_{3-6}シクロアルキル、HetF、－C（＝O）－HetEもしくは－C（＝O）N（R^A）－（CH_2）$_{1-2}$－HetFであり；
HetEが、
【化３】



からなる群から選択され；星印*は、前記－C（＝O）部分への結合箇所を示し；
HetFが、ピロリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピリジル、ピリミジニルおよびピラジニルからなる群から選択され；
あるいはR^7およびR^8がそれらが両方結合している炭素原子とともに、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルもしくはシクロヘキシルを形成しており；
R^9が、H、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、－CH_2CF_3、シクロプロピルもしくは－CH_2－シクロプロピルである請求項９に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項１１】
２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（＋）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（－）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－４ａ－フェニル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（＋）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－４ａ－フェニル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（－）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－４ａ－フェニル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
５－（ｔｅｒｔ－ブチルオキシカルボニル）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
５－エチル－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
６－（シクロプロピルメチル）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５－ジメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；

５－（ジメチルアミノカルボニル）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（＋）－２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（－）－２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
６′－（４－フルオロベンジル）－４′－ヒドロキシ－２′－メチル－６′，７′，８′，８ａ′－テトラヒドロ－２′Ｈ－スピロ［シクロペンタン－１，１′－［２，６］ナフチリジン］－３′，５′－ジオン；
（＋）－６′－（４－フルオロベンジル）－４′－ヒドロキシ－２′－メチル－６′，７′，８′，８ａ′－テトラヒドロ－２′Ｈ－スピロ［シクロペンタン－１，１′－［２，６］ナフチリジン］－３′，５′－ジオン；
（－）－６′－（４－フルオロベンジル）－４′－ヒドロキシ－２′－メチル－６′，７′，８′，８ａ′－テトラヒドロ－２′Ｈ－スピロ［シクロペンタン－１，１′－［２，６］ナフチリジン］－３′，５′－ジオン；
２－（３，４－ジフルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－５，５，６－トリメチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
６′－（４－フルオロベンジル）－４′－ヒドロキシ－２′－メチル－６′，７′，８′，８ａ′－テトラヒドロ－２′Ｈ－スピロ［シクロブタン－１，１′－［２，６］ナフチリジン］－３′，５′－ジオン；
５－［（２－メチルプロピル）アミノカルボニル］－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
５－（ｔｅｒｔ－ブチルアミノカルボニル）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
５－［（２－ピリジルメチル）アミノカルボニル］－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
５－（ピリミジン－２－イル）－２－（４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－メチル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオンならびに該化合物のジアステレオマーおよびエナンチオマー；
２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－シクロプロピル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；
（＋）－２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－シクロプロピル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン；ならびに
（－）－２－（３－クロロ－４－フルオロベンジル）－８－ヒドロキシ－６－シクロプロピル－２，３，４，４ａ，５，６－ヘキサヒドロ－２，６－ナフチリジン－１，７－ジオン
からなる群から選択される化合物もしくは該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項１２】

有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩、および

製薬上許容される担体を含む医薬組成物。
【請求項１３】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶインテグラーゼを阻害するための請求項１２に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶ感染を予防もしくは治療、またはＡＩＤＳを予防、治療もしくは発症遅延するための請求項１２に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶインテグラーゼを阻害するための医薬の製造における、請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩の使用。
【請求項１６】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶ感染を予防もしくは治療、またはＡＩＤＳを予防、治療もしくは発症遅延するための医薬の製造における、請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩の使用。
【請求項１７】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶインテグラーゼ阻害用の医薬製造で使用される、請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項１８】
処置を必要とする被験者におけるＨＩＶ感染の予防もしくは治療、またはＡＩＤＳの予防、治療もしくは発症遅延用の医薬製造で使用される、請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩。
【請求項１９】
（ｉ）請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物、または該化合物の個々のエナンチオマーもしくはジアステレオマー、または該化合物の製薬上許容される塩、ならびに（ｉｉ）ＨＩＶプロテアーゼ阻害薬、非ヌクレオシドＨＩＶ逆転写酵素阻害薬およびヌクレオシドＨＩＶ逆転写酵素阻害薬からなる群から選択されるＨＩＶ感染／ＡＩＤＳ抗ウィルス薬である医薬組み合わせ剤であって、（ｉ）の化合物またはそれの製薬上許容される塩および（ｉｉ）のＨＩＶ感染／ＡＩＤＳ抗ウィルス薬をそれぞれ、ＨＩＶインテグラーゼ阻害、ＨＩＶ感染の予防もしくは治療、あるいはＡＩＤＳの予防、治療もしくは発症遅延に有効な組み合わせとなる量で使用する、前記医薬組み合わせ剤。