

【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23年7月28日 (2011.7.28)

【公表番号】特表2010-540643(P2010-540643A)

【公表日】平成22年12月24日 (2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-528032(P2010-528032)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 5/38 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 19/08 (2006.01)

A 61 K 31/437 (2006.01)

A 61 K 31/695 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

C 07 F 7/10 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 0 1

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 9/12

A 61 P 25/28

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 19/02

A 61 P 27/06

A 61 P 13/12

A 61 P 5/38

A 61 P 3/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 27/02

A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 19/08
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 P 9/10 1 0 3
 A 6 1 K 31/695
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/5377
 C 0 7 F 7/10 C S P V
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月10日(2011.6.10)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

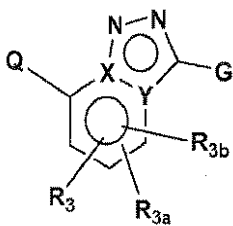
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



I

[式中、

QはL、L_{a a}またはL_{e e}であり；

XはCであって、YはNであるか；

あるいはXはNであって、YはCであり；

GはR₄、R_{4 a a}またはR_{4 e e}であり；Lは - アルケニル - (W₁)_n、 - シクロアルキル - (W₁)_n または - アルキル - (W₂)_n であり；L_{a a}は - アルケニル - (W₁)_n または - アルキル - (W_{2 a a})_n であり；L_{e e}は - アルケニル - (W_{1 e e})_n、 - シクロアルキル - (W₁)_n または - アルキル - (W_{2 e e})_n であり；

nは1～3であり；

W₁は各々独立して、ハロゲン、-OH、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8 a}、
 -OCONR₈R_{8 a}、-SO₂NR₈R_{8 a}、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₉SO₂R_{9 a}、
 -NR₉CO₂R_{9 a}、-NR₉COR_{9 a}、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、
 アルコキシ、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリー
 ルチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノ、アミノアルキル、アリー
 ルアミ

ノまたはヘテロアリールアミノであり；

$W_{1\ e\ e}$ は独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノ、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり；

W_2 は独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり；

$W_{2\ a\ a}$ は独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、 $-OR_{9b}OR_{9b}Si(R_{9b})_3$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり；

$W_{2\ e\ e}$ は独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アミノ、アミノアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよいが；

但し、 $W_{2\ a\ a}$ または $W_{2\ e\ e}$ は、ハロゲンまたはアルキルのみではなく；

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} は独立して、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_{8a}$ 、 $-SO_2R_{8a}$ 、 $-NR_8SO_2R_6$ 、 $-NR_8CO_2R_6$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_4 はアルキル、シクロアルキルまたはヘテロサイクリルであって、それらはいずれも適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-NR_5CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

$R_{4\ a\ a}$ はシクロアルキルであって、それは適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-NR_5CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

$R_{4\ e\ e}$ はアルキルまたはシクロアルキルであって、それらはいずれも適宜、ハロゲン

、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-NR_5CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_5 は各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、 COR_{8a} 、 CO_2R_{8a} 、 $SO_2NR_8R_{8a}$ 、または SO_2R_{8a} であり；

R_6 は各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらはいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} は各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、 $-CO_2R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、アルキルシリカルアルキルオキシ、 $-SO_2R_{9b}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールは適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} は各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらはいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

あるいは R_8 および R_{8a} は、それらが結合している窒素と一緒にあって、 N 、 NH 、 O および S からなる群より独立して選択される1、2、3、または4のヘテロ原子を含むヘテロサイクリル環（それは適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよい）を形成することができる；

R_9 および R_{9a} は各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらはいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} は各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらはいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} は各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであるが；

但し、

(a) n が1であって、 R_{4a} または R_{4e} がシクロアルキルである場合、 W_1 、 W_{1e} 、 W_2 、または W_{2a} はシクロアルキルではなく；

(b) n が1であって、 R_{4e} がシクロアルキルである場合、 W_{2e} はシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルではなく；

(c) (i) L_e がシクロアルキルであって、(ii) R_{4e} がアリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールで置換されたシクロアルキルであって、(iii) 該アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、または R_{7c} で置

換されていて；並びに (iv) R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} がアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルである場合、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} は、少なくとも1つの R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、または R_{10c} で置換されなければならない、

(d) R_{4aa} または R_{4ee} が適宜置換されたアリール部位で置換されている場合、 L_{aa} および L_{ee} は C_{1-3} アルキルまたはハロ C_{1-3} アルキルではなくて；並びに

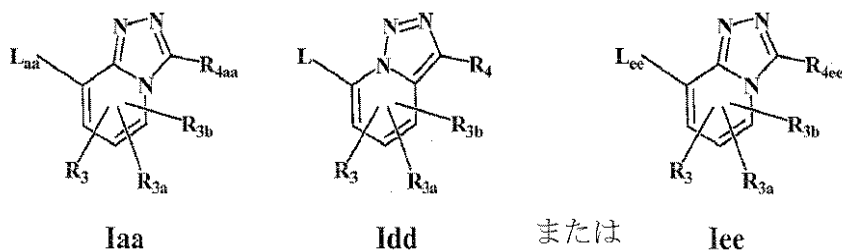
(e) R_{4ee} がアルキルである場合、 W_{2ee} はハロゲン、アルキル、ハロアルキルまたはアリールではない。]

の化合物、あるいはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、または塩。

【請求項2】

化合物が式 Iaa、Idd または Iee：

【化2】



[但し式中、

(a) n が1であって、 R_4 、 R_{4aa} または R_{4ee} がシクロアルキルである場合、 W_1 、 W_{1ee} 、 W_2 、または W_{2aa} はシクロアルキルではなく；

(b) n が1であって、 R_{4ee} がシクロアルキルである場合、 W_{2ee} はシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルではなく；

(c) (i) L_{ee} がシクロアルキルであって、(ii) R_{4ee} がアリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールで置換されたシクロアルキルであって、(iii) 該アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、または R_{7c} で置換されていて；並びに (iv) R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} がアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルである場合、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} は、少なくとも1つの R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、または R_{10c} で置換されなければならない；

(d) R_{4aa} または R_{4ee} が適宜置換されたアリール部位で置換されている場合、 L_{aa} および L_{ee} は C_{1-3} アルキルまたはハロ C_{1-3} アルキルではなくて；並びに

(e) R_{4ee} がアルキルである場合、 W_{2ee} はハロゲン、アルキル、ハロアルキルまたはアリールではない。]

である、請求項1の化合物。

【請求項3】

L が - アルケニル - (W_1) $_n$ または - アルキル - (W_2) $_n$ であり；

L_{aa} が - アルケニル - (W_1) $_n$ または - アルキル - (W_{2aa}) $_n$ であり；

L_{ee} が - アルケニル - (W_{1ee}) $_n$ 、- シクロアルキル - (W_1) $_n$ または - アルキル - (W_{2ee}) $_n$ であり；

n が1～3であり；

W_1 が各々独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SOR₆、- SO₂R₆、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉CO₂R_{9a}、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり；

W_{1ee} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}

、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり；

W_2 が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり；

W_{2aa} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、 $-OR_{9b}OR_{9bSi}(R_{9b})_3$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり；

W_{2ee} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO$ -アルキル、 $-SO_2$ -アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9CO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アミノアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよいが；

但し、 W_{2aa} または W_{2ee} は、ハロゲンのみではなく；

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} が独立して、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_{8a}$ 、 $-SO_2R_{8a}$ 、 $-NR_8SO_2R_6$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_4 がアルキルまたはシクロアルキルであって、それらがいずれも適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-NR_5CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4aa} がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4ee} がアルキルまたはシクロアルキルであって、それらがいずれも適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_5COR_6$ 、 $-NR_5SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリル

またはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_5 が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、 CO_2R_{8a} または CO_2R_{8a} であり；

R_6 が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、 $-CO_2R_8$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-SO_2R_{9b}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールが適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

あるいは R_8 および R_{8a} が、それらが結合している窒素と一緒にあって、 N 、 NH 、 O および S からなる群より独立して選択される1、2、3、または4のヘテロ原子を含むヘテロサイクリル環（それは適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよい）を形成することができ；

R_9 および R_{9a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであるが；

但し、

(a) n が1であって、 R_4 、 R_{4a} または R_{4e} がシクロアルキルである場合、 W_1 、 W_{1e} 、 W_2 、または W_{2a} はシクロアルキルではなく；

(b) n が1であって、 R_{4e} がシクロアルキルである場合、 W_{2e} はシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルではなく；

(c) (i) L_e がシクロアルキルであって、(ii) R_{4e} がアリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールで置換されたシクロアルキルであって、(iii) 該アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、または R_{7c} で置換されていて；並びに(iv) R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} がアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルである場合、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} は、少なくとも1つの R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、または R_{10c} で置換されなければならない

;

(d) R_{4a} または R_{4e} が適宜置換されたアリール部位で置換されている場合、 L_a および L_e は C_{1-3} アルキルまたはハロ C_{1-3} アルキルではなくて; 並びに
 (e) R_{4e} がアルキルである場合、 W_{2e} はハロゲン、アルキル、ハロアルキルまたはアリールではない、

請求項 2 の化合物。

【請求項 4】

L が - アルケニル - (W_1)_n または - アルキル - (W_2)_n であり;

L_a が - アルケニル - (W_1)_n または - アルキル - (W_{2a})_n であり;

L_e が - アルケニル - (W_{1e})_n、- シクロアルキル - (W_1)_n または - アルキル - (W_{2e})_n であり;

n が 1 ~ 3 であり;

W_1 が各々独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SOR₆、- SO₂R₆、- NR₉SO₂R_{9a}、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり;

W_{1e} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SOR₆、- SO₂R₆、- NR₉SO₂R_{9a}、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり;

W_2 が独立して、ハロゲン、- OH、- CO₂H、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO-アルキル、- SO₂-アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉COR_{9a}、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり;

W_{2a} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂H、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO-アルキル、- SO₂-アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉COR_{9a}、- OR_{9b}OR_{9b}Si(R_{9b})₃、アルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ、アミノまたはアミノアルキルであり;

W_{2e} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂H、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO-アルキル、- SO₂-アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉CO₂R_{9a}、アルキル、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオまたはアミノアルキルであるが;

但し、 W_{2a} または W_{2e} は、ハロゲンのみではなく;

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} が独立して、水素、ハロゲン、- OH、- CN、- NO₂、- CO₂R_{8a}、- CONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SOR_{8a}、- SO₂R_{8a}、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく;

R_4 がアルキルまたはシクロアルキルであって、それらがいずれも適宜、ハロゲン、- OH、- OR₆、- SR₆、- OCOR₆、- CN、- COR₆、- CO₂R₆、- CO₂H、- OCONR₈R_{8a}、- CONR₈R_{8a}、- SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール(その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい)から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置

換されてもよく；

R_{4a} がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8$ 、 R_{8a} 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4e} がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_6 が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、 $-CO_2R_8$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-SO_2R_{9b}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールが適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

あるいは R_8 および R_{8a} が、それらが結合している窒素と一緒にあって、 N 、 NH 、 O および S からなる群より独立して選択される1、2、3、または4のヘテロ原子を含むヘテロサイクリル環（それは適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよい）を形成することができ；

R_9 および R_{9a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールである、

請求項2の化合物。

【請求項5】

L が $-アルケニル-(W_1)_n$ または $-アルキル-(W_2)_n$ であり；

L_{aa} が - アルケニル - (W_1)_n または - アルキル - (W_{2aa})_n であり ;
 L_{ee} が - シクロアルキル - (W_1)_n または - アルキル - (W_{2ee})_n であり ;
 n が 1 ~ 3 であり ;

W_1 が各々独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、
- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SOR₆、- SO₂R₆、- NR₉
SO₂R_{9a}、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ハロアルコキシ
、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アミノアルキル、アリールアミノ
またはヘテロアリールアミノであり ;

W_2 が独立して、ハロゲン、- OH、- CO₂H、- CN、- CO₂R₆、- CONR₈R_{8a}、
- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO - アル
キル、- SO₂ - アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉COR_{9a}、アルキル、ハ
ロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノ
またはアミノアルキルであり ;

W_{2aa} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂H、- CO₂R₆、- CO
NR₈R_{8a}、- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO -
アルキル、- SO₂ - アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、- NR₉COR_{9a}、- OR₉
bOR{9b}Si(R_{9b})₃、アルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、ア
ルキルチオ、アルキルアミノまたはアミノアルキルであり ;

W_{2ee} が独立して、ハロゲン、- OH、- CN、- CO₂H、- CO₂R₆、- CO
NR₈R_{8a}、- OCOR₆、- OCONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、- SO -
アルキル、- SO₂ - アルキル、- NR₉SO₂R_{9a}、アルキル、アルケニル、ハロア
ルコキシ、アルキルチオまたはアミノアルキルであるが ;

但し、 W_{2aa} または W_{2ee} は、ハロゲンのみではなく ;

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} が独立して、水素、ハロゲン、- OH、- CN、- NO₂、
- CO₂R_{8a}、- CONR₈R_{8a}、- SO₂NR₈R_{8a}、アルキル、ハロアルキル
、シクロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリ
ールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘ
テロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その
中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、
および R_{7c} で置換されてもよく ;

R_4 がアルキルまたはシクロアルキルであって、それらがいずれも適宜、ハロゲン、-
OH、- OR₆、- SR₆、- OCOR₆、- CN、- COR₆、- CO₂R₆、- CO
₂H、- OCONR₈R_{8a}、- CONR₈R_{8a}、- SO₂R₆、アルキル、アルコキ
シ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール (その中でアルキル、ア
ルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、
および R_{7c} で置換されてもよい) から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置
換されてもよく ;

R_{4aa} がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、- OH、- OR₆、- S
R₆、- OCOR₆、- CN、- COR₆、- CO₂R₆、- CO₂H、- OCONR₈
R_{8a}、- CONR₈R_{8a}、- SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ
、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール (その中でアルキル、アルコキシ、アリール、
ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で
置換されてもよい) から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置換されてもよく ;

R_{4ee} がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、- OH、- OR₆、- SR₆、
- OCOR₆、- CN、- COR₆、- CO₂R₆、- CO₂H、- OCONR₈R_{8a}
、- CONR₈R_{8a}、- SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテ
ロサイクリルまたはヘテロアリール (その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテ
ロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換さ
れてもよい) から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置換されてもよく ;

R_6 が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであ

って、それらがいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、 $-CO_2R_8$ 、 $-CONR_8$ 、 R_{8a} 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-SO_2R_{9b}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールが適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_9 および R_{9a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールである、

請求項2の化合物。

【請求項6】

L が $-アルキル-(W_2)_n$ であり；

L_{aa} が $-アルケニル-(W_1)_n$ または $-アルキル-(W_{2aa})_n$ であり；

L_{ee} が $-シクロアルキル-(W_1)_n$ または $-アルキル-(W_{2ee})_n$ であり；

n が1～2であり；

W_1 が各々独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アミノアルキル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり；

W_2 が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO-$ アルキル、 $-SO_2-$ アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、 $-NR_9COR_{9a}$ 、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはアミノアルキルであり；

W_{2aa} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO-$ アルキル、 $-SO_2-$ アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、アルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはアミノアルキルであり；

W_{2ee} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO$

NR_8R_{8a} 、 $-\text{OCOR}_6$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8a}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}_8\text{R}_{8a}$ 、 $-\text{SO}-$ アルキル、 $-\text{SO}_2-$ アルキル、 $-\text{NR}_9\text{SO}_2\text{R}_{9a}$ 、アルキル、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオまたはアミノアルキルであるが；

但し、 W_{2a} または W_{2e} は、ハロゲンのみではなく；

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} が独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{8a}$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_4 がアルキルまたはシクロアルキルであって、それらがいずれも適宜、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8a}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4a} がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8a}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4e} がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8a}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_6 が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリーロキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_8$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8a}$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリーロキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリーロキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-\text{SO}_2\text{R}_{9b}-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールが適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_9 および R_{9a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールである、

請求項2の化合物。

【請求項7】

L が $-アルキル-(W_2)_n$ であり；

L_{aa} が $-アルケニル-(W_1)_n$ または $-アルキル-(W_{2aa})_n$ であり；

L_{ee} が $-シクロアルキル-(W_1)_n$ または $-アルキル-(W_{2ee})_n$ であり；

n が1～2であり；

W_1 が各々独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アリールアミノまたはヘテロアリールアミノであり；

W_2 が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO-$ アルキル、 $-SO_2-$ アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アルキルアミノまたはアミノアルキルであり；

W_{2aa} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO-$ アルキル、 $-SO_2-$ アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、アルキル、アルコキシ、アルケニル、ハロアルコキシまたはアルキルチオであり；

W_{2ee} が独立して、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-OCONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2NR_8R_{8a}$ 、 $-SO-$ アルキル、 $-SO_2-$ アルキル、 $-NR_9SO_2R_{9a}$ 、アルキル、アルケニル、ハロアルコキシまたはアルキルチオであるが；

但し、 W_{2aa} または W_{2ee} は、ハロゲンのみではなく；

R_3 、 R_{3a} および R_{3b} が独立して、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルであって、その中でアリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_4 がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4aa} がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される1またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_{4e} がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、 $-SO_2R_6$ 、アルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール（その中でアルキル、アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロサイクリルが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよい）から選択される 1 またはそれ以上の置換基で置換されてもよく；

R_6 が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されてもよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、 $-CO_2R_8$ 、 $-CONR_8R_{8a}$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-SO_2R_{9b}$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールであって、その中でアリールまたはヘテロアリールが適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_8 および R_{8a} が各々独立して、水素、アルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_9 および R_{9a} が各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；

R_{9b} が各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであって、それらがいずれも適宜、 R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} で置換されてもよく；並びに

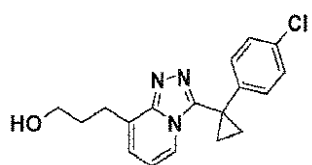
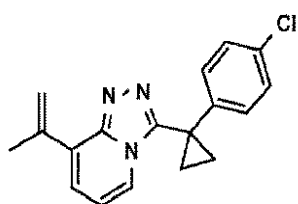
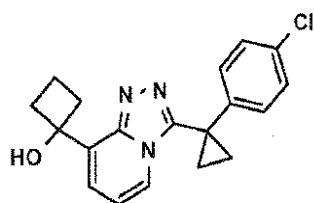
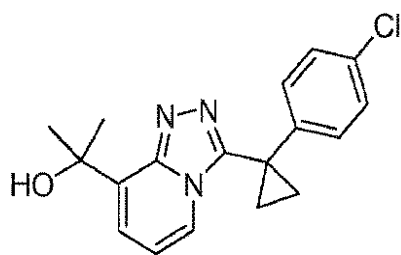
R_{10} 、 R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ またはチオールである、

請求項 2 の化合物。

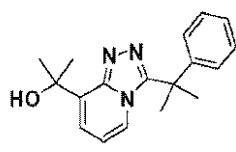
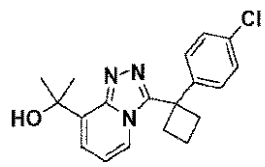
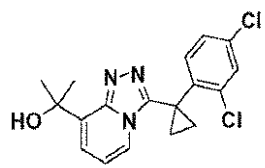
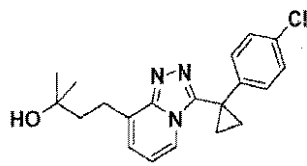
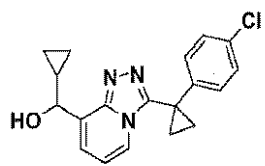
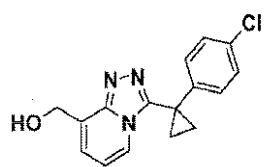
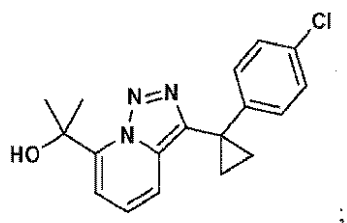
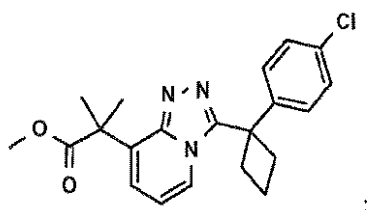
【請求項 8】

以下：

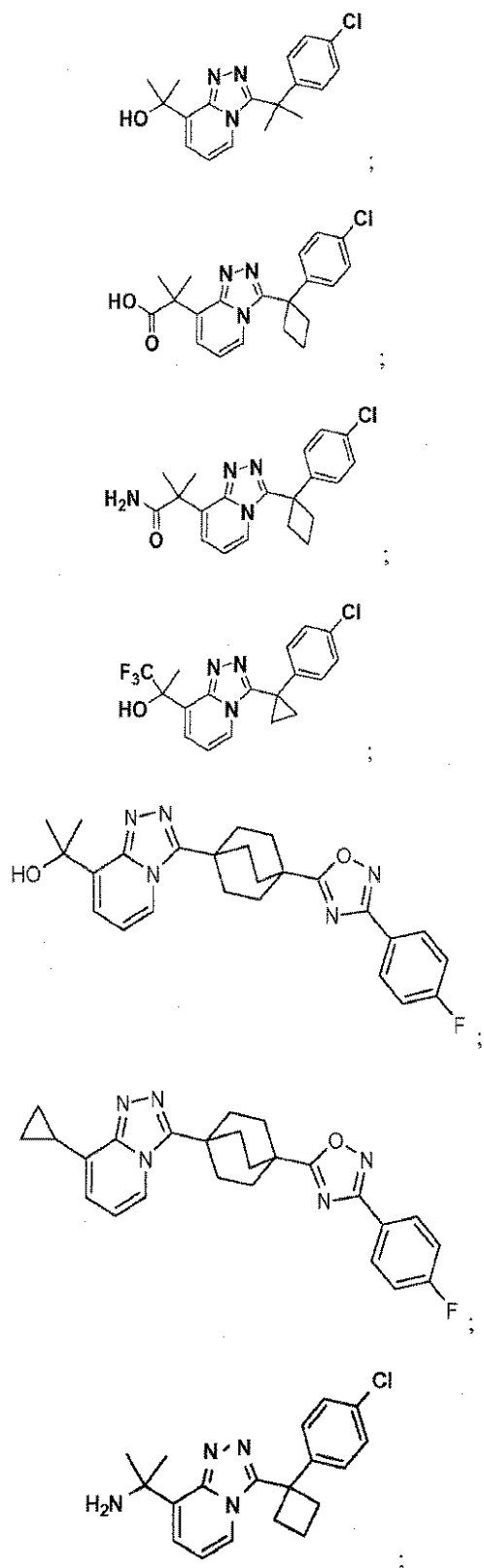
【化 3】



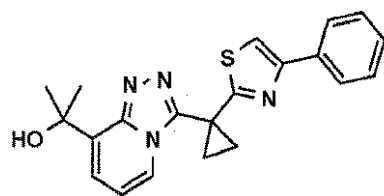
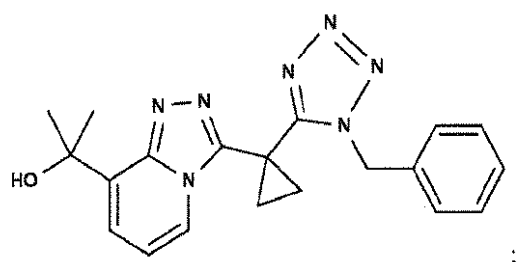
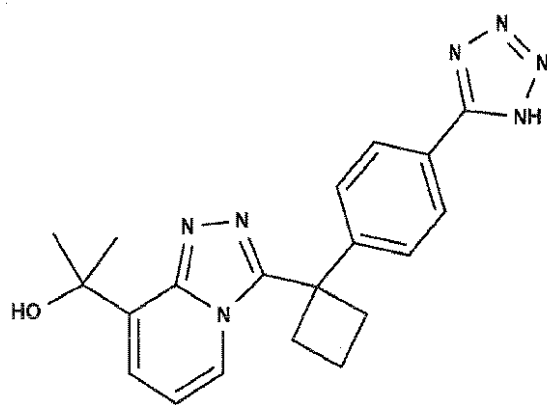
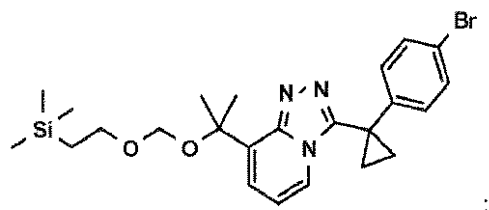
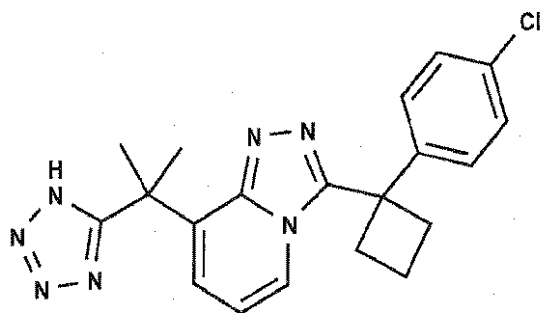
【化 4】



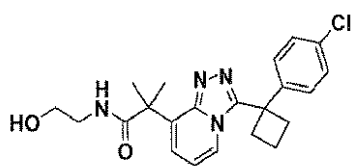
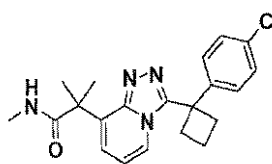
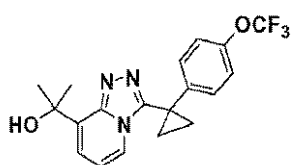
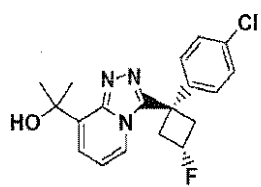
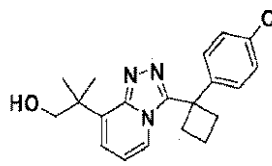
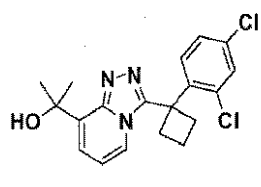
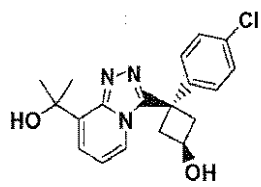
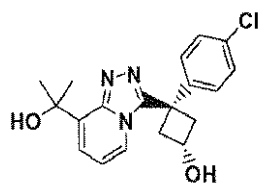
【化 5】



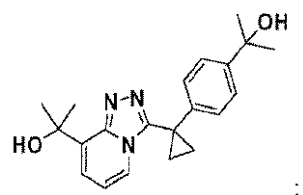
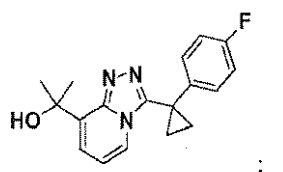
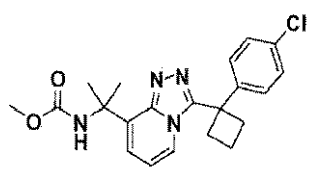
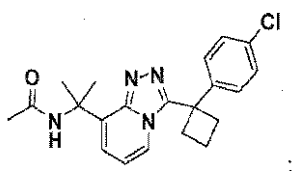
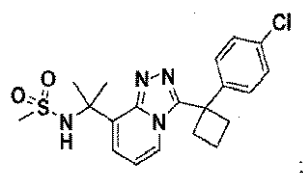
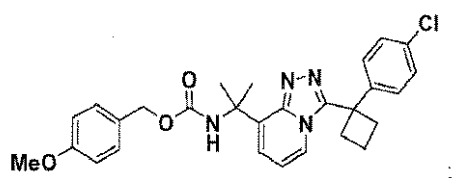
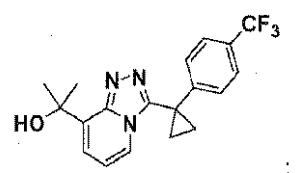
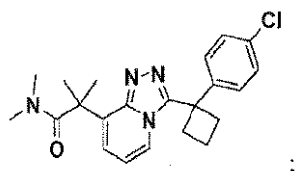
【化 6】



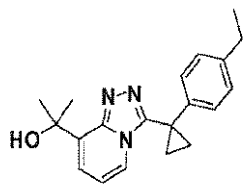
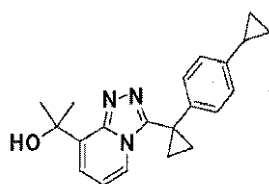
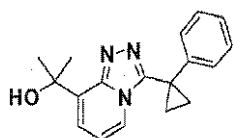
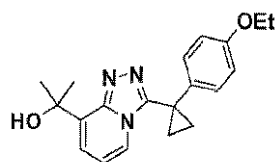
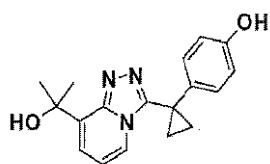
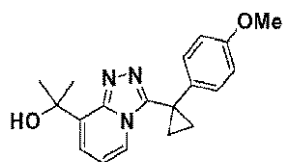
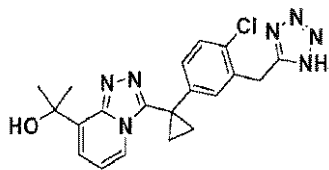
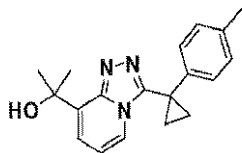
【化 7】



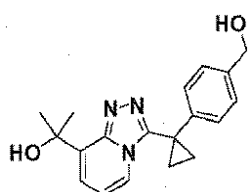
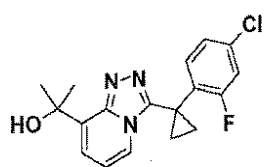
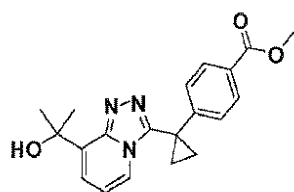
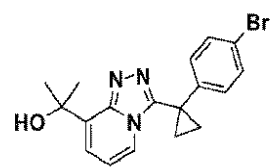
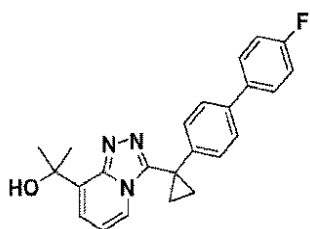
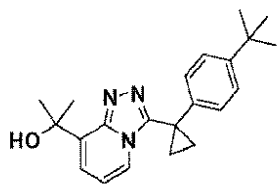
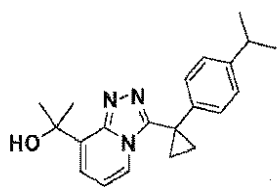
【化 8】



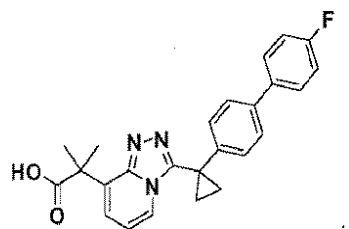
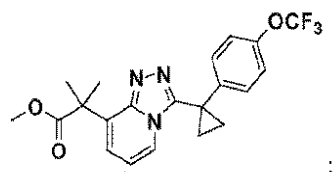
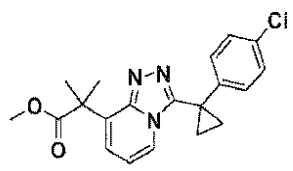
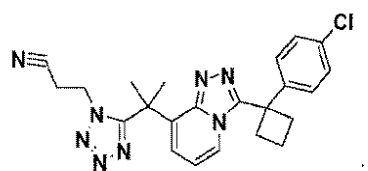
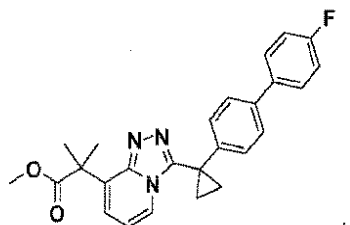
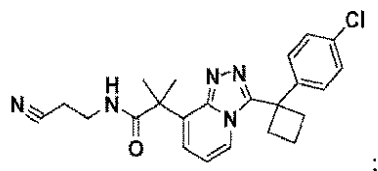
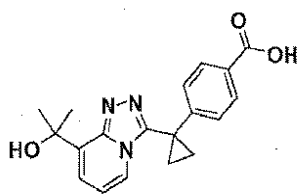
【化 9】



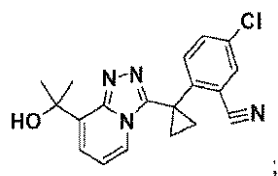
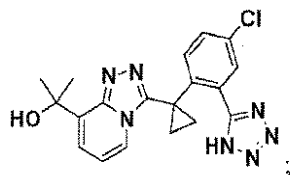
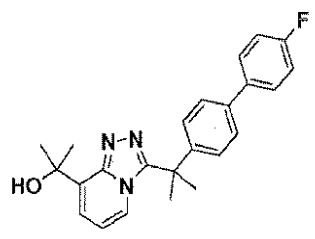
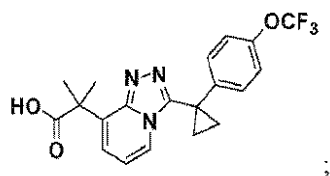
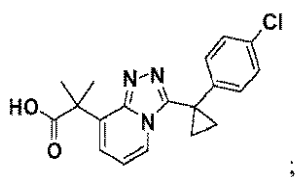
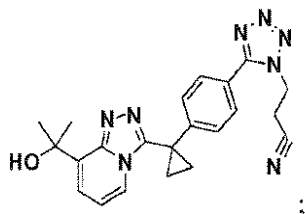
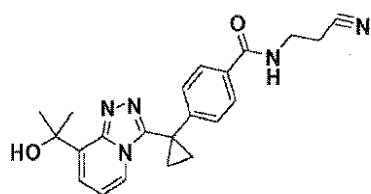
【化 1 0】



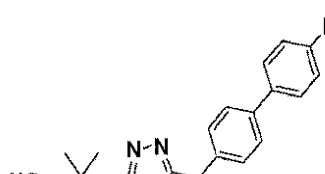
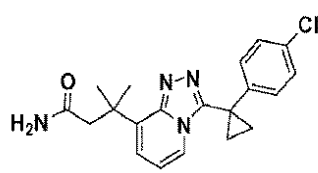
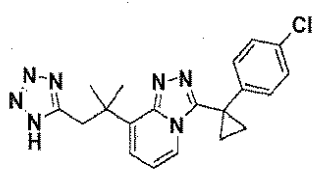
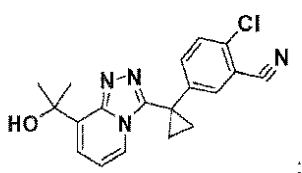
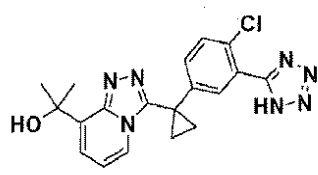
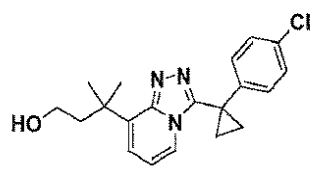
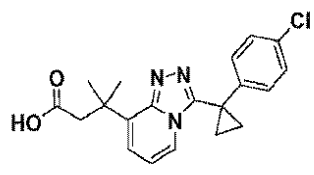
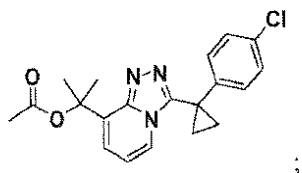
【化 1 1】



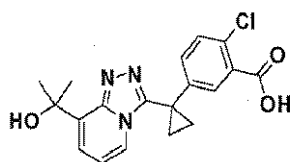
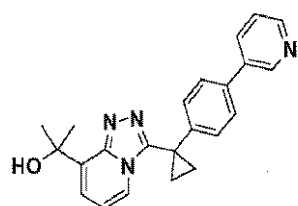
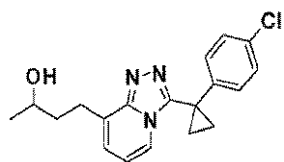
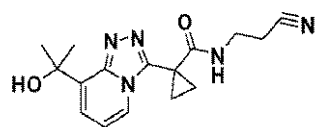
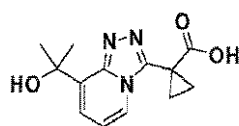
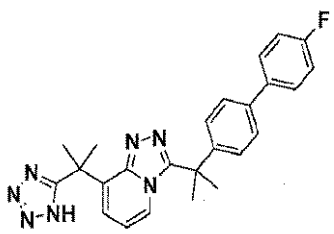
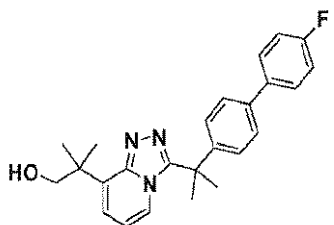
【化 1 2】



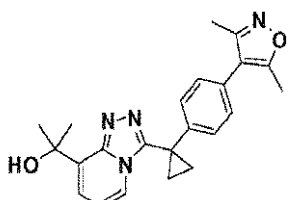
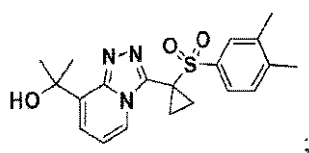
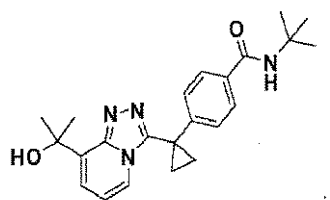
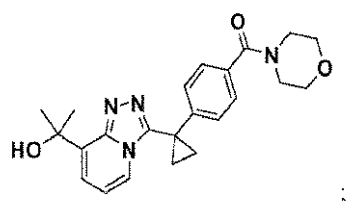
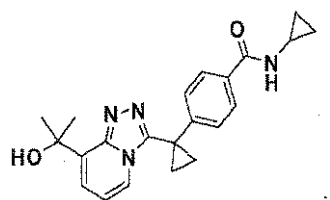
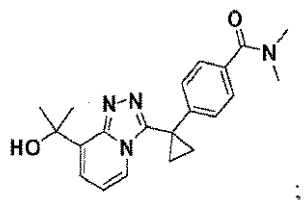
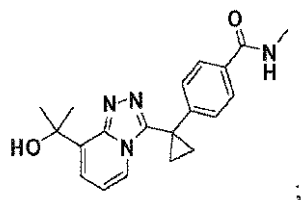
【化 1 3】



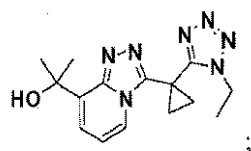
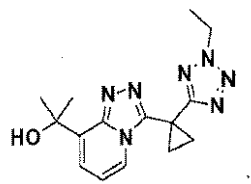
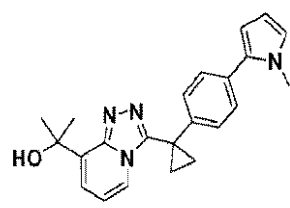
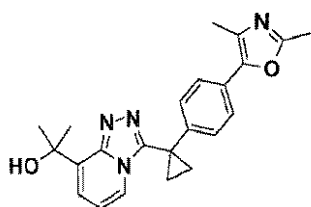
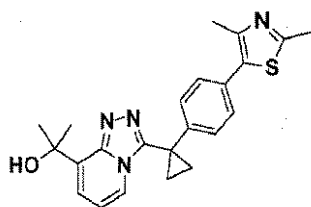
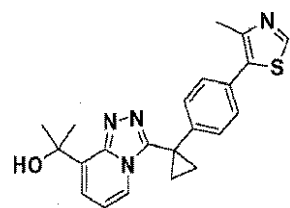
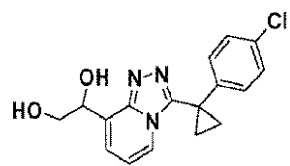
【化 1 4】



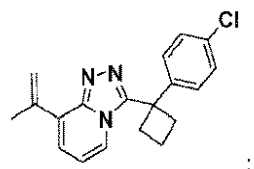
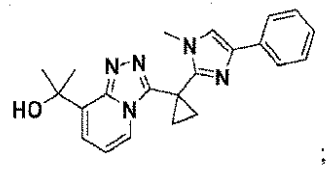
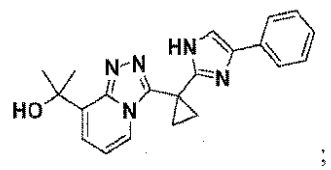
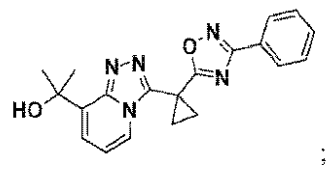
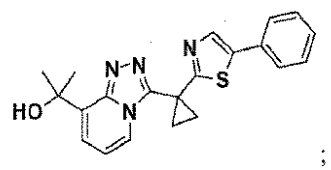
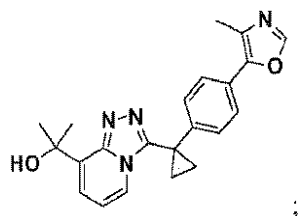
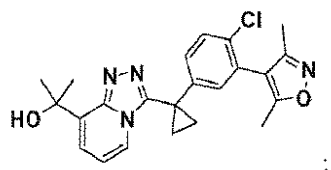
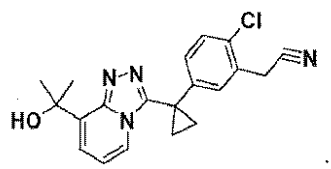
【化 1 5】



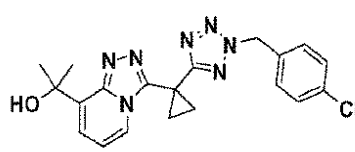
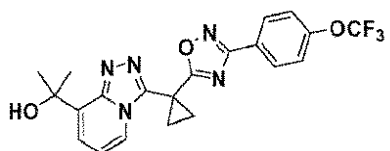
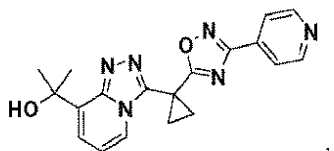
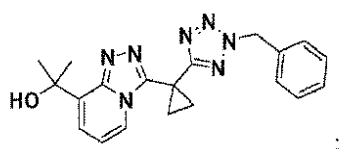
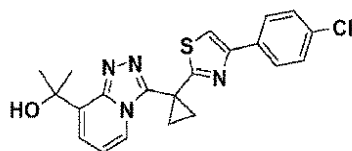
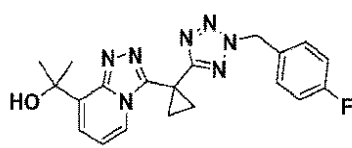
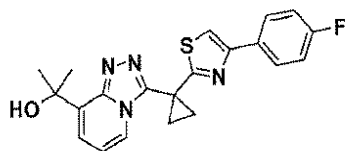
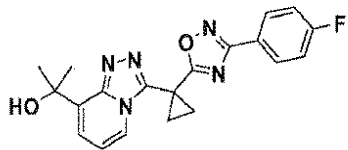
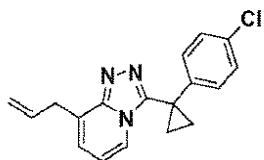
【化 1 6】



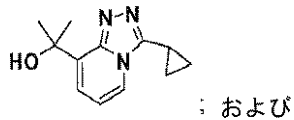
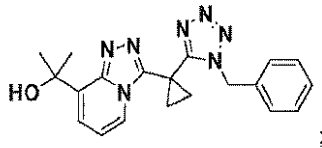
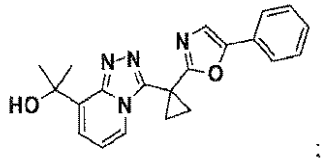
【化 17】



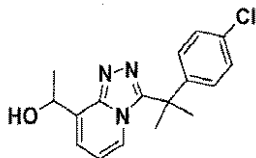
【化 1 8】



【化 1 9】



; および

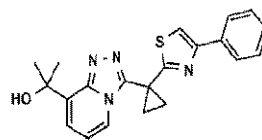
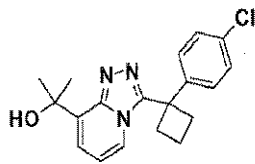
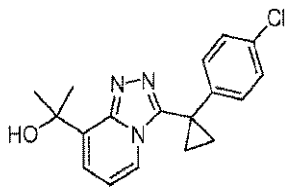


からなる群より選択される化合物あるいは、そのエナンチオマー、ジアステレオマー、または塩。

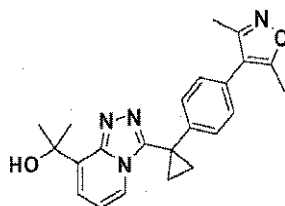
【請求項 9】

以下：

【化 2 0】



, または



の化合物あるいは、そのエナンチオマー、ジアステレオマー、または塩。

【請求項 1 0】

化合物が塩酸塩または硫酸水素塩である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 つの化合物。

【請求項 1 1】

前記の塩酸塩または硫酸水素塩が結晶形である、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つの化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 つの化合物を含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

医薬的に許容される担体、および適宜含まれる少なくとも 1 つの他の治療薬をさらに含む、請求項 1 2 の医薬組成物。

【請求項 1 4】

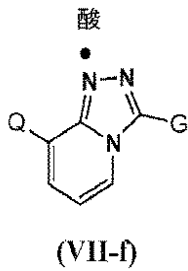
少なくとも 1 つの請求項 1 ~ 1 1 の化合物を含む、糖尿病、高血糖、肥満症、脂質異常

症、高血圧症、認知障害、関節リウマチ、骨関節炎、緑内障、クッシング病およびメタボリックシンドロームの治療剤、予防剤、または進行の遅延剤。

【請求項 15】

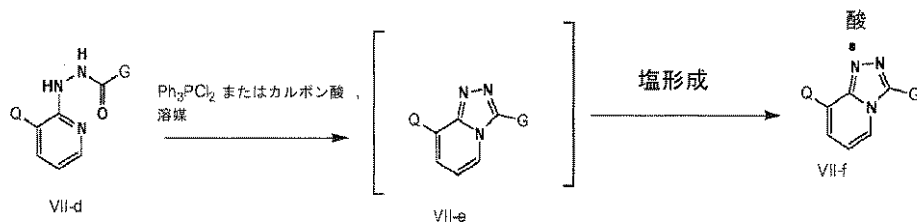
式 (VII-f) :

【化 21】



を有する化合物の製造方法であって、高温で溶媒の存在下、式 VII-d のヒドラジドをカルボン酸化合物または Ph_3PCl_2 / ジイソプロピルエチルアミンと反応させ、式 VII-e の 1, 2, 4 - トリアゾロピリジンを得て、次いで式 VII-e の 1, 2, 4 - トリアゾロピリジンを適当な酸と接触させ、式 (VII-f) の化合物を提供すること：

【化 22】



を特徴とする製造方法。