

【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 0 7 D 471/04	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 27/06	(2006.01)
A 6 1 P 13/12	(2006.01)
A 6 1 P 5/38	(2006.01)
A 6 1 P 3/00	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 17/02	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/18	(2006.01)
A 6 1 P 19/08	(2006.01)
A 6 1 K 31/437	(2006.01)
A 6 1 K 31/695	(2006.01)
A 6 1 K 31/444	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
C 0 7 F 7/10	(2006.01)
C 0 7 B 61/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04	1 0 1
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 27/06	
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 5/38	
A 6 1 P 3/00	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 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

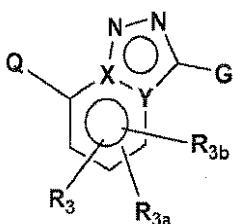
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

【化1】



I

[式中、

QはL、L_aaまたはL_ee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_{4a}aまたはR_{4e}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_aaは-アルケニル-(W₁)_nまたは-アルキル-(W_{2a}a)_nであり；L_eeは-アルケニル-(W_{1e}e)_n、-シクロアルキル-(W₁)_nまたは-アルキル-(W_{2e}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_{8a}、-OCONR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₉SO₂R_{9a}、-NR₉CO₂R_{9a}、-NR₉COR_{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；

$W_{1\text{ee}}$ は独立して、ハロゲン、-OH、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₉SO₂R_{9a}、-NR₉CO₂R_{9a}、-NR₉COR_{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、-CO₂H、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{9a}、-NR₉CO₂R_{9a}、-NR₉COR_{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；

$W_{2\text{aa}}$ は独立して、ハロゲン、-OH、-CO₂H、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{9a}、-NR₉CO₂R_{9a}、-NR₉COR_{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；

$W_{2\text{ee}}$ は独立して、ハロゲン、-OH、-CN、-CO₂H、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{9a}、-NR₉CO₂R_{9a}、-NR₉COR_{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、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されてもよいが；

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

R₃、R_{3a}およびR_{3b}は独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R_{8a}、-CONR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SOR_{8a}、-SO₂R_{8a}、-NR₈SO₂R₆、-NR₈CO₂R₆、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、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されてもよく；

R₄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、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₅COR₆、-NR₅SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCNR₈R_{8a}、-CONR₈R_{8a}、-NR₅CO₂R₆、-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、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールまたはヘテロサイクリルは適宜、R₇、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}はシクロアルキルであって、それは適宜、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₅COR₆、-NR₅SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCNR₈R_{8a}、-CONR₈R_{8a}、-NR₅CO₂R₆、-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、アミノ、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールは適宜、R₇、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}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

、 - O H 、 - O R ₆ 、 - S R ₆ 、 - O C O R ₆ 、 - C N 、 - N R ₅ C O R ₆ 、 - N R ₅ S O ₂ R ₆ 、 - C O R ₆ 、 - C O ₂ R ₆ 、 - C O ₂ H 、 - O C O N R ₈ R _{8a} 、 - C O N R ₈ R _{8a} 、 - N R ₅ C O ₂ R ₆ 、 - S O ₂ 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、C O R _{8a} 、 C O ₂ R _{8a} 、 S O ₂ N R ₈ R _{8a} 、 または S O ₂ R _{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、- O H 、 - C O ₂ R ₈ 、 - C O N R 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、アルキルシリカアルキルオキシ、- S O ₂ R _{9b} 、 - N O ₂ 、 - C N 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になって、N、N H 、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} 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、- O H 、 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、- N O ₂ 、 - C N 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ず；

(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

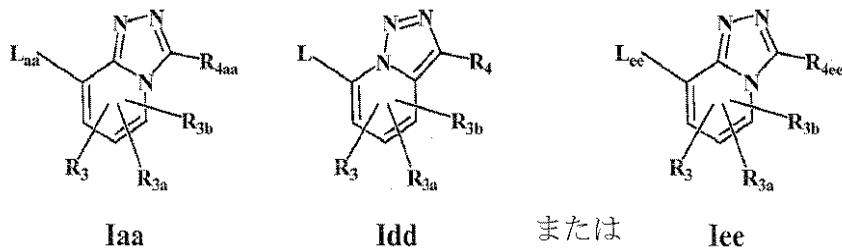
(e) R_{4ee} がアルキルである場合、 W_{2ee} はハロゲン、アルキル、ハロアルキルまたはアリールではない。]

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ず；

(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}

、 - OCONR₈R₈a、 - SO₂NR₈R₈a、 - SOR₆、 - SO₂R₆、 - NR₉SO₂R₉a、 - NR₉CO₂R₉a、 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；

W₂ が独立して、 ハロゲン、 - OH、 - CO₂H、 - CN、 - CO₂R₆、 - CONR₈R₈a、 - OCOR₆、 - OCONR₈R₈a、 - SO₂NR₈R₈a、 - SO-アルキル、 - SO₂-アルキル、 - NR₉SO₂R₉a、 - NR₉CO₂R₉a、 - NR₉COR₉a、 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；

W₂a_a が独立して、 ハロゲン、 - OH、 - CN、 - CO₂H、 - CO₂R₆、 - CONR₈R₈a、 - OCOR₆、 - OCONR₈R₈a、 - SO₂NR₈R₈a、 - SO-アルキル、 - SO₂-アルキル、 - NR₉SO₂R₉a、 - NR₉CO₂R₉a、 - NR₉COR₉a、 - OR₉bOR₉bSi(R₉b)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；

W₂e_e が独立して、 ハロゲン、 - OH、 - CN、 - CO₂H、 - CO₂R₆、 - CONR₈R₈a、 - OCOR₆、 - OCONR₈R₈a、 - SO₂NR₈R₈a、 - SO-アルキル、 - SO₂-アルキル、 - NR₉SO₂R₉a、 - NR₉CO₂R₉a、 - NR₉COR₉a、 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、 R₇、 R₇a、 R₇b、 および R₇c で置換されてもよいが；

但し、 W₂a_a または W₂e_e は、 ハロゲンのみではなく；

R₃、 R₃a および R₃b が独立して、 水素、 ハロゲン、 - OH、 - CN、 - NO₂、 - CO₂R₈a、 - CONR₈R₈a、 - SO₂NR₈R₈a、 - SOR₈a、 - SO₂R₈a、 - NR₈SO₂R₆、 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が適宜、 R₇、 R₇a、 R₇b、 および R₇c で置換されてもよく；

R₄ 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、 - NR₅COR₆、 - NR₅SO₂R₆、 - COR₆、 - CO₂R₆、 - CO₂H、 - OCONR₈R₈a、 - CONR₈R₈a、 - SO₂R₆、 - NR₅CO₂R₆、 - 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、 R₇、 R₇a、 R₇b、 および R₇c 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；

R₄a_a がシクロアルキルであって、 それが適宜、 ハロゲン、 - OH、 - OR₆、 - SR₆、 - OCOR₆、 - CN、 - NR₅COR₆、 - NR₅SO₂R₆、 - COR₆、 - CO₂R₆、 - CO₂H、 - OCONR₈R₈a、 - CONR₈R₈a、 - 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、 R₇、 R₇a、 R₇b、 および R₇c 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；

R₄e_e 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、 - NR₅COR₆、 - NR₅SO₂R₆、 - COR₆、 - CO₂R₆、 - CO₂H、 - OCONR₈R₈a、 - CONR₈R₈a、 - 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_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、 COR_{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、-CO₂R₈、-CONR₈R_{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、-SO₂R_{9b}-NO₂、-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になって、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、-NO₂、-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_{ee} 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ず

；
 (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_{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、

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_{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、 - NR₉
 SO₂R_{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_{1ee} が独立して、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_{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、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}、 - NR₉COR_{9a}、アルキ
 尔、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}、 - SOR_{8a}、 - SO₂
 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；

$R_{4\text{ a a}}$ がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₈R_{8\text{ a}}、-CONR₈R_{8\text{ a}}、-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、R₇、R_{7\text{ a}}、R_{7\text{ b}}、およびR_{7\text{ c}}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；

$R_{4\text{ e e}}$ 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_{8\text{ a}}、-CONR₈R_{8\text{ a}}、-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、R₇、R_{7\text{ a}}、R_{7\text{ b}}、およびR_{7\text{ c}}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、R₇、R_{7\text{ a}}、R_{7\text{ b}}、およびR_{7\text{ c}}で置換されてもよく；

R₇、R_{7\text{ a}}、R_{7\text{ b}}、およびR_{7\text{ c}} 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、-CO₂R₈、-CONR₈R_{8\text{ a}}、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、-SO₂R_{9\text{ b}}、-NO₂、-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、R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}}で置換されてもよく；

R₈ およびR_{8\text{ a}} 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、R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}}で置換されてもよく；

あるいはR₈ およびR_{8\text{ a}} が、それらが結合している窒素と一緒にになって、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、R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}}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_{9\text{ a}} 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、R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}}で置換されてもよく；

R_{9\text{ b}} 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、R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}}で置換されてもよく；並びに

R₁₀、R_{10\text{ a}}、R_{10\text{ b}}、およびR_{10\text{ c}} 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、-NO₂、-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-(W₁)_n または-アルキル-(W₂)_n であり；

$L_{a,a}$ が - アルケニル - (W_1)_n または - アルキル - ($W_{2,a,a}$)_n であり；
 $L_{e,e}$ が - シクロアルキル - (W_1)_n または - アルキル - ($W_{2,e,e}$)_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_{8,a}、 - OCONR₈R_{8,a}、 - SO₂NR₈R_{8,a}、 - SOR₆、 - SO₂R₆、 - NR₉SO₂R_{9,a}、 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、 - CO₂H、 - CN、 - CO₂R₆、 - CONR₈R_{8,a}、 - OCOR₆、 - OCONR₈R_{8,a}、 - SO₂NR₈R_{8,a}、 - SO - アルキル、 - SO₂ - アルキル、 - NR₉SO₂R_{9,a}、 - NR₉COR_{9,a}、 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；

$W_{2,a,a}$ が独立して、ハロゲン、 - OH、 - CN、 - CO₂H、 - CO₂R₆、 - CONR₈R_{8,a}、 - OCOR₆、 - OCONR₈R_{8,a}、 - SO₂NR₈R_{8,a}、 - SO - アルキル、 - SO₂ - アルキル、 - NR₉SO₂R_{9,a}、 - NR₉COR_{9,a}、 - OR_{9,b}OR_{9,b}Si(R_{9,b})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；

$W_{2,e,e}$ が独立して、ハロゲン、 - OH、 - CN、 - CO₂H、 - CO₂R₆、 - CONR₈R_{8,a}、 - OCOR₆、 - OCONR₈R_{8,a}、 - SO₂NR₈R_{8,a}、 - SO - アルキル、 - SO₂ - アルキル、 - NR₉SO₂R_{9,a}、 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、 $W_{2,a,a}$ または $W_{2,e,e}$ は、ハロゲンのみではなく；

R_3 、 $R_{3,a}$ および $R_{3,b}$ が独立して、水素、ハロゲン、 - OH、 - CN、 - NO₂、 - CO₂R_{8,a}、 - CONR₈R_{8,a}、 - SO₂NR₈R_{8,a}、 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 、 $R_{7,a}$ 、 $R_{7,b}$ 、 および $R_{7,c}$ 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_{8,a}、 - CONR₈R_{8,a}、 - 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 、 $R_{7,a}$ 、 $R_{7,b}$ 、 および $R_{7,c}$ 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；

$R_{4,a,a}$ がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 - OH、 - OR₆、 - SR₆、 - OCOR₆、 - CN、 - COR₆、 - CO₂R₆、 - CO₂H、 - OCONR₈R_{8,a}、 - CONR₈R_{8,a}、 - 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 、 $R_{7,a}$ 、 $R_{7,b}$ 、 および $R_{7,c}$ 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；

$R_{4,e,e}$ 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_{8,a}、 - CONR₈R_{8,a}、 - 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 、 $R_{7,a}$ 、 $R_{7,b}$ 、 および $R_{7,c}$ 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

つて、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、-CO₂R₈、-CONR₈R_{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、-SO₂R_{9b}、-NO₂、-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、-NO₂、-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、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCONR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SOR₆、-SO₂R₆、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、-CO₂H、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-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、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCONR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{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、-CO₂H、-CO₂R₆、-CO

$\text{NR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{OCOR}_6$ 、 $-\text{OCONR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{SO}$ -アルキル、 $-\text{SO}_2$ -アルキル、 $-\text{NR}_9\text{SO}_2\text{R}_{9\text{a}}$ 、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、 $\text{W}_{2\text{a}\text{a}}$ または $\text{W}_{2\text{e}\text{e}}$ は、ハロゲンのみではなく；

R_3 、 $\text{R}_{3\text{a}}$ および $\text{R}_{3\text{b}}$ が独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、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 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ 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、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、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 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ 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；

$\text{R}_{4\text{a}\text{a}}$ がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、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 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ 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；

$\text{R}_{4\text{e}\text{e}}$ がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OR}_6$ 、 $-\text{SR}_6$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COR}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}_6$ 、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 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ 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 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ で置換されてもよく；

R_7 、 $\text{R}_{7\text{a}}$ 、 $\text{R}_{7\text{b}}$ 、および $\text{R}_{7\text{c}}$ 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、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_8$ 、 $-\text{CONR}_8\text{R}_{8\text{a}}$ 、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、 $-\text{SO}_2\text{R}_{9\text{b}}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 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} 、 $\text{R}_{10\text{a}}$ 、 $\text{R}_{10\text{b}}$ 、および $\text{R}_{10\text{c}}$ で置換されてもよく；

R_8 および $\text{R}_{8\text{a}}$ 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} 、 $\text{R}_{10\text{a}}$ 、 $\text{R}_{10\text{b}}$ 、および $\text{R}_{10\text{c}}$ で置換されてもよく；

R_9 および $\text{R}_{9\text{a}}$ 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} 、 $\text{R}_{10\text{a}}$ 、 $\text{R}_{10\text{b}}$ 、および $\text{R}_{10\text{c}}$ で置換されてもよく；

$\text{R}_{9\text{b}}$ 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} 、 $\text{R}_{10\text{a}}$ 、 $\text{R}_{10\text{b}}$ 、および $\text{R}_{10\text{c}}$ 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、-NO₂、-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-(W₂)_nであり；

L_{aa}が-アルケニル-(W₁)_nまたは-アルキル-(W_{2aa})_nであり；

L_{ee}が-シクロアルキル-(W₁)_nまたは-アルキル-(W_{2ee})_nであり；

nが1～2であり；

W₁が各々独立して、ハロゲン、-OH、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SOR₆、-SO₂R₆、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；

W₂が独立して、ハロゲン、-OH、-CO₂H、-CN、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{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、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{8a}、-SO₂NR₈R_{8a}、-SO-アルキル、-SO₂-アルキル、-NR₉SO₂R_{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、-CO₂H、-CO₂R₆、-CONR₈R_{8a}、-OCOR₆、-OCNR₈R_{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；

R₃、R_{3a}およびR_{3b}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、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、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されてもよく；

R₄がシクロアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-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、R₇、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、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-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、R₇、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；

$R_{4\text{ee}}$ がアルキルであって、それが適宜、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-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、R₇、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；

R₆ 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、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されてもよく；

R₇、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、-CO₂R₈、-CONR₈R_{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、-SO₂R_{9b}、-NO₂、-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、R₁₀、R_{10a}、R_{10b}、およびR_{10c} で置換されてもよく；

R₈ 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、R₁₀、R_{10a}、R_{10b}、およびR_{10c} で置換されてもよく；

R₉ 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、R₁₀、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、R₁₀、R_{10a}、R_{10b}、およびR_{10c} で置換されてもよく；並びに

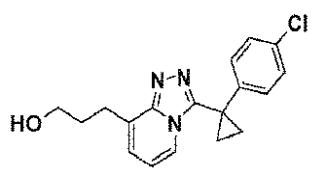
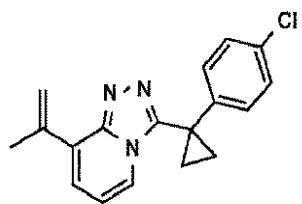
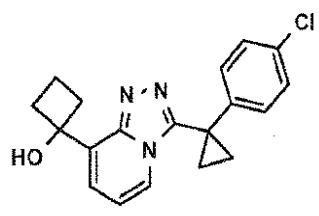
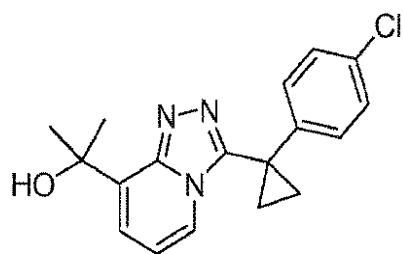
R₁₀、R_{10a}、R_{10b}、およびR_{10c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN またはチオールである。

請求項2の化合物。

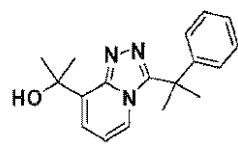
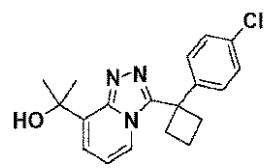
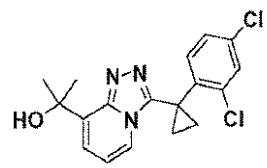
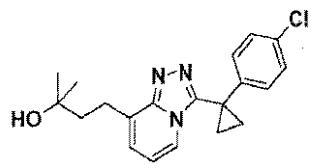
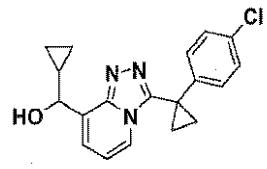
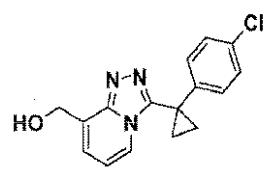
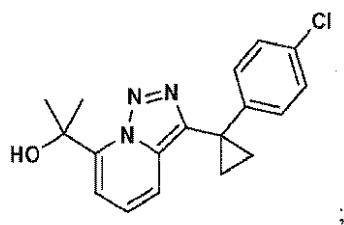
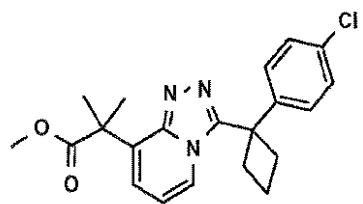
【請求項8】

以下：

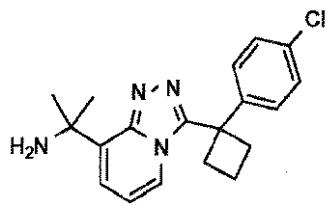
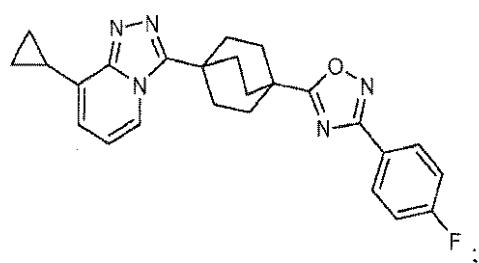
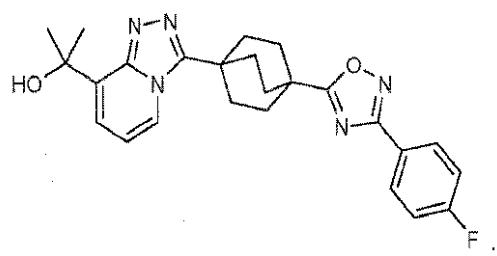
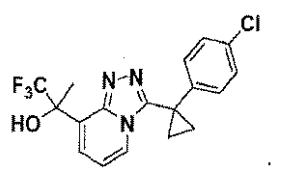
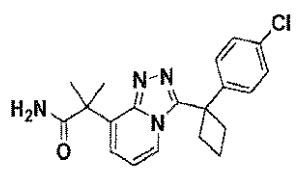
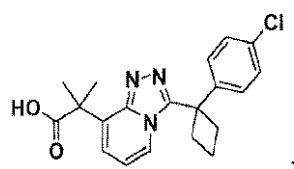
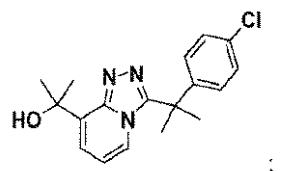
【化 3】



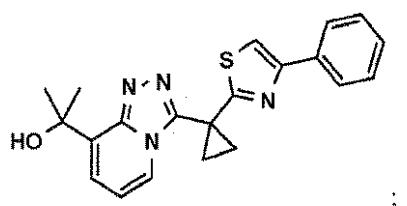
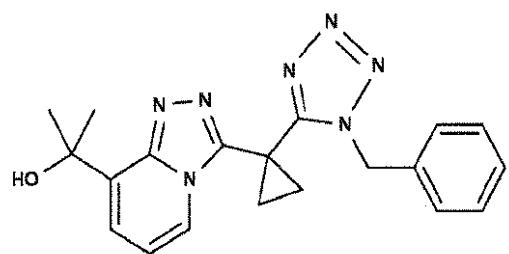
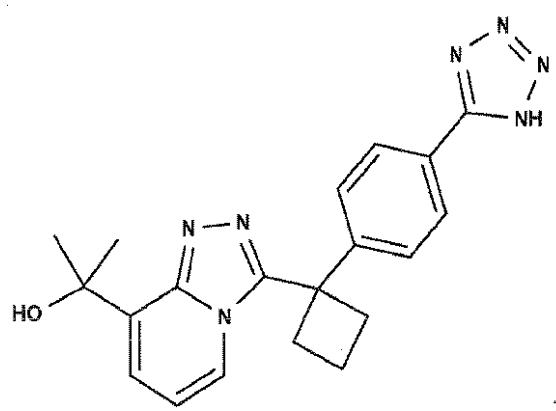
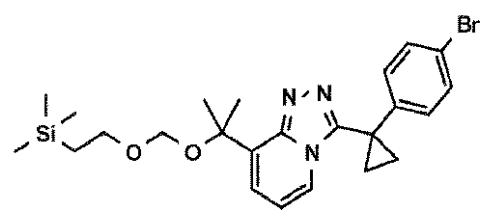
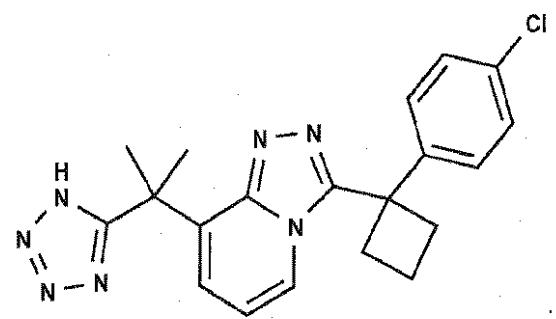
【化 4】



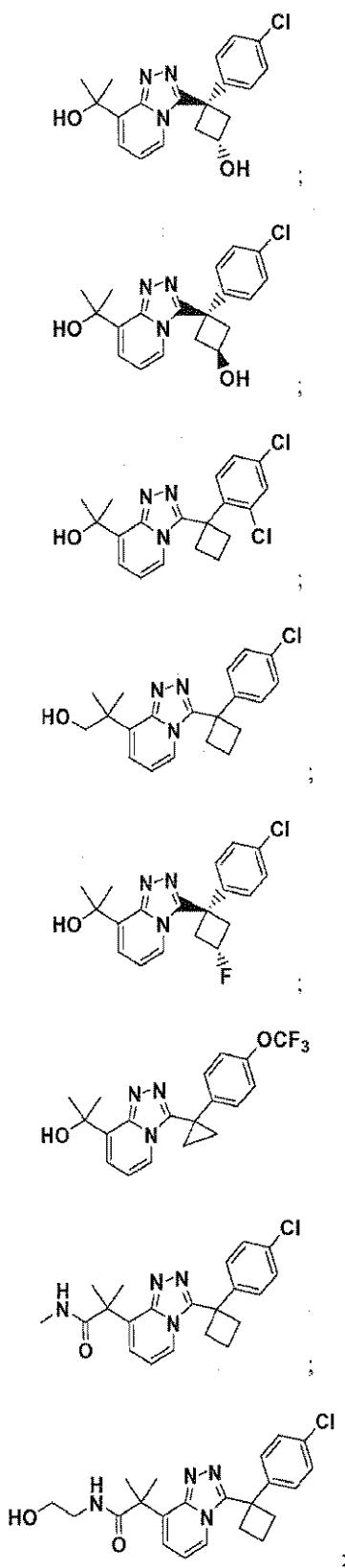
【化 5】



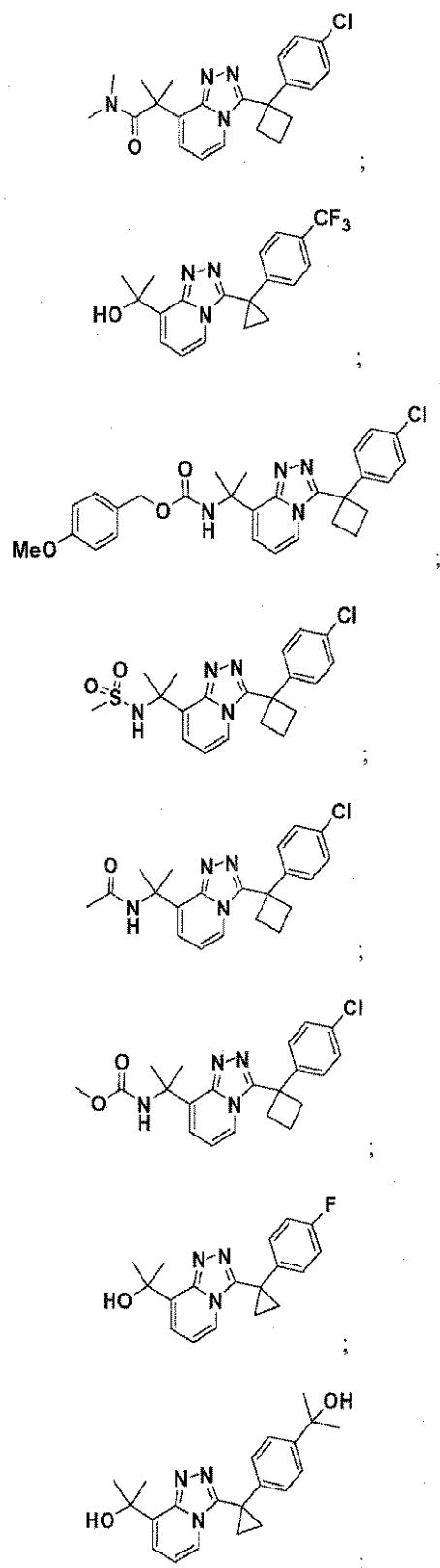
【化 6】



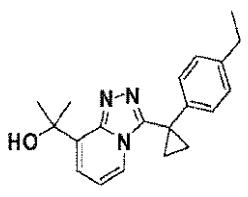
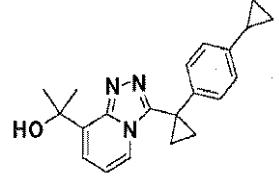
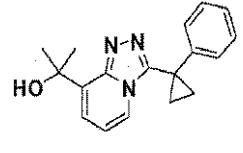
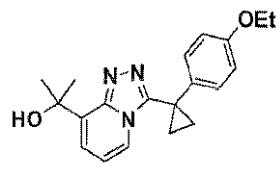
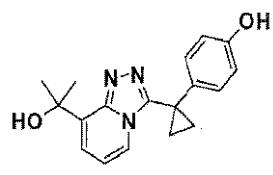
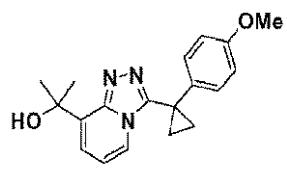
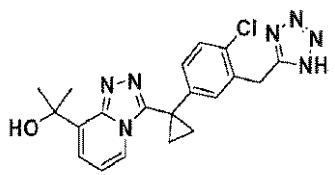
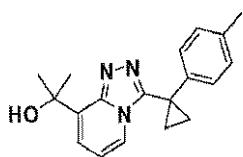
【化 7】



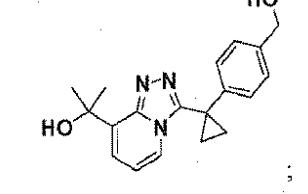
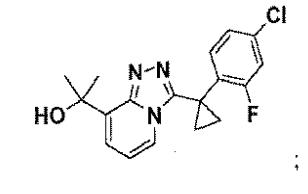
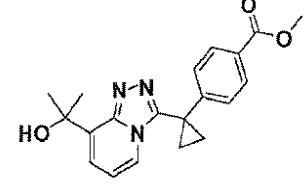
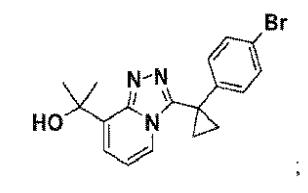
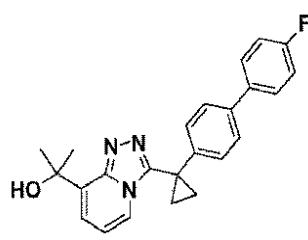
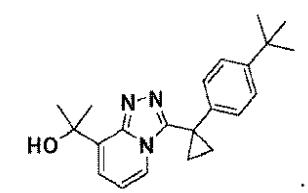
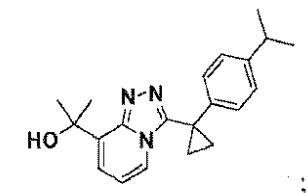
【化 8】



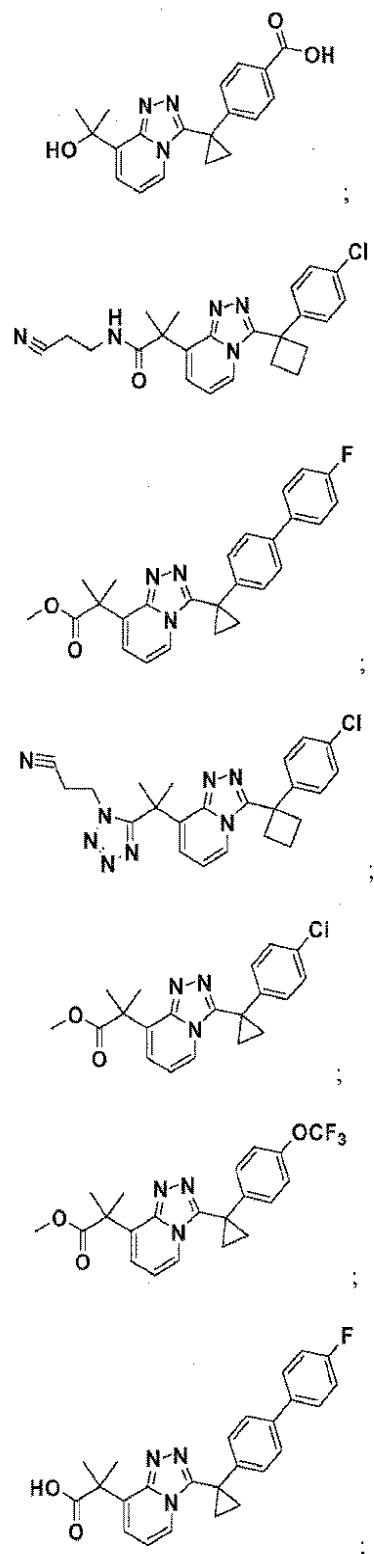
【化 9】



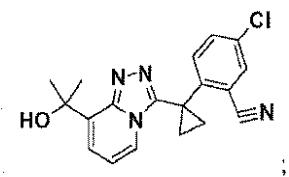
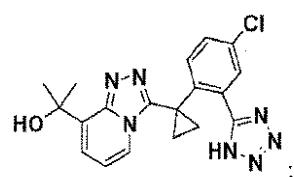
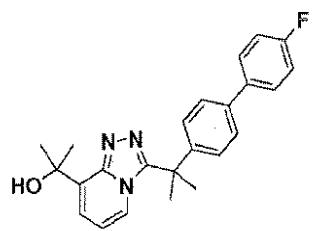
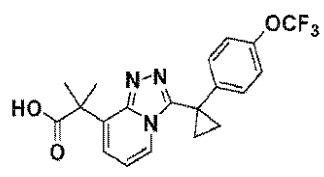
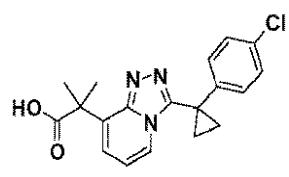
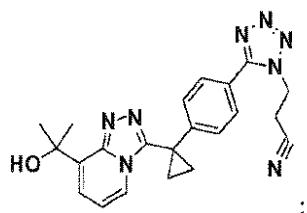
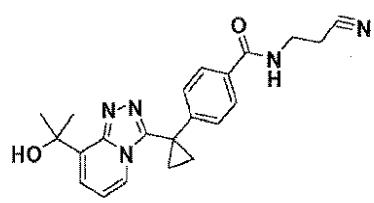
【化 10】



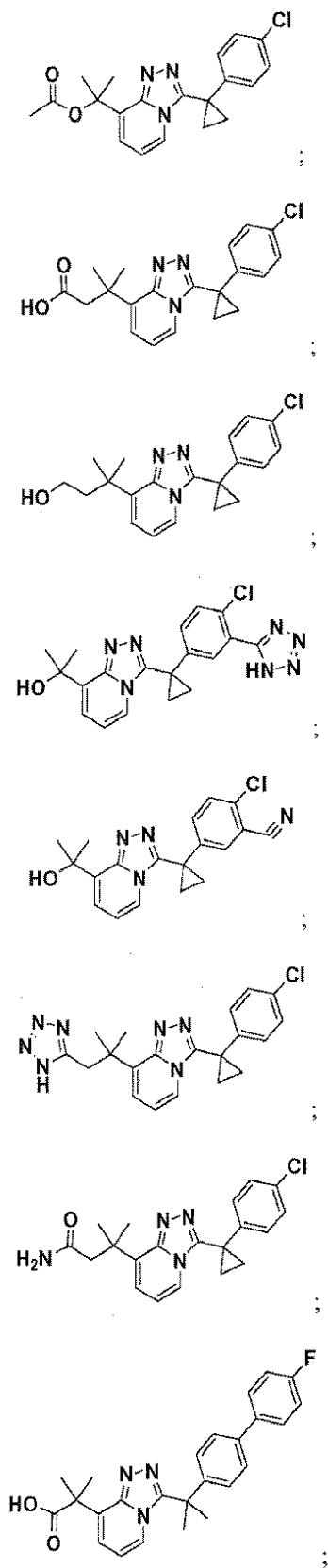
【化 11】



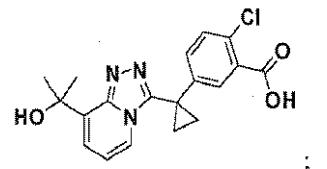
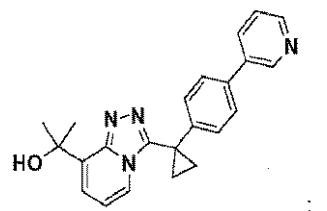
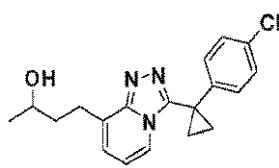
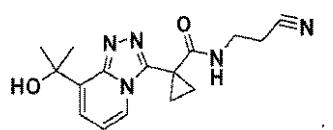
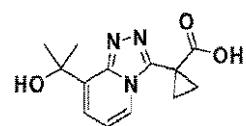
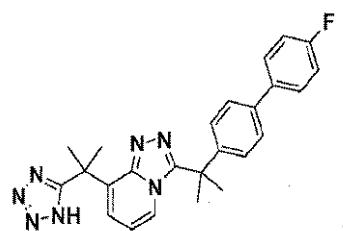
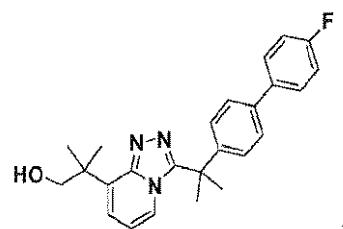
【化 1 2】



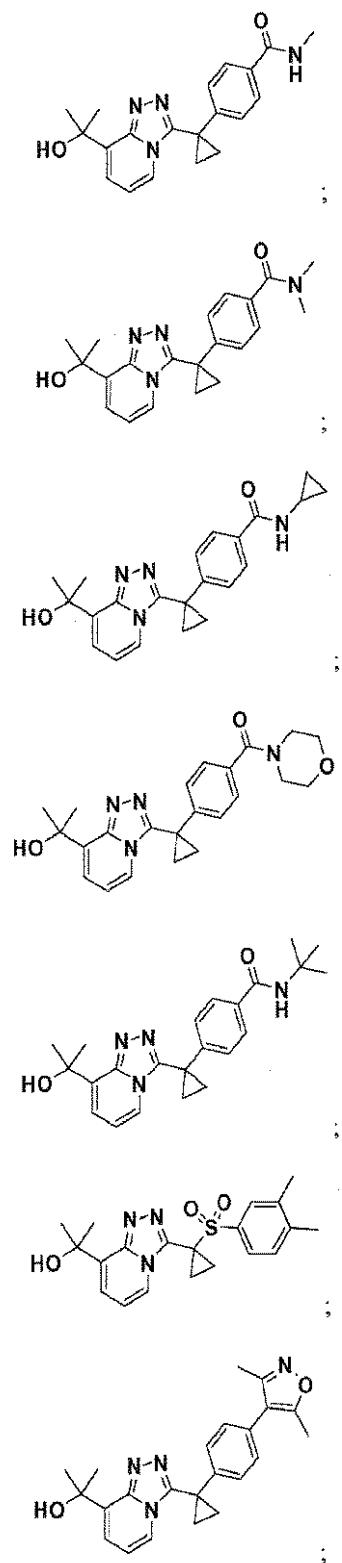
【化 1 3】



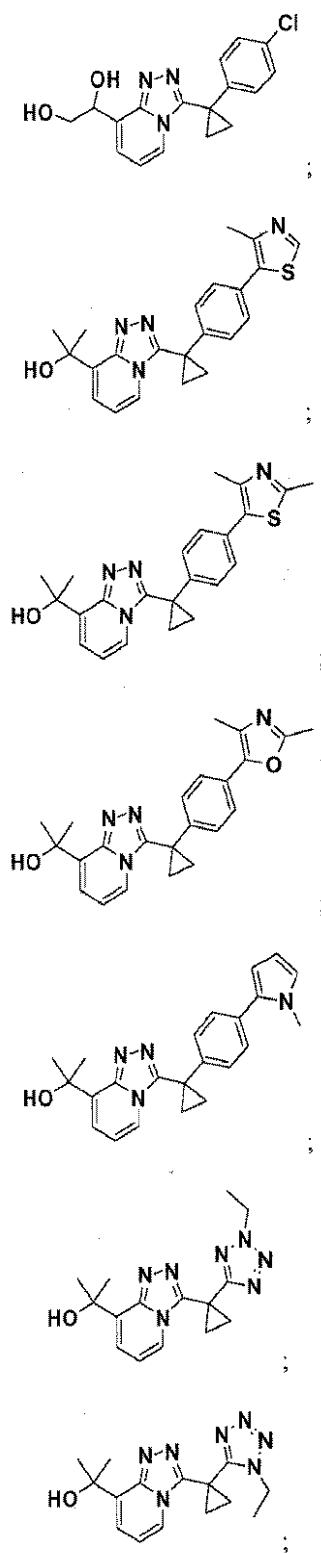
【化 1 4】



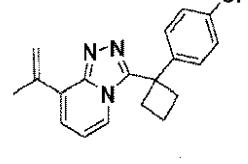
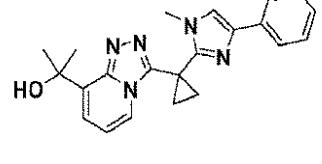
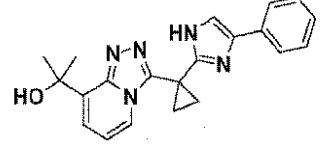
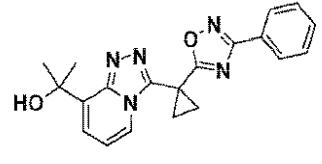
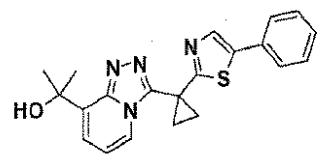
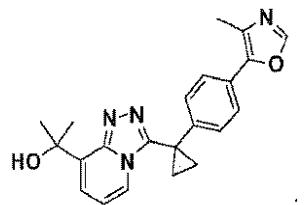
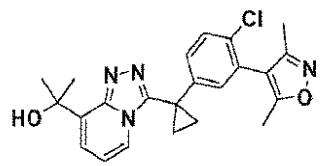
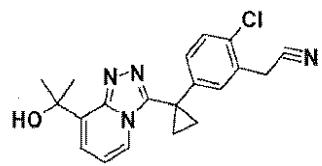
【化 15】



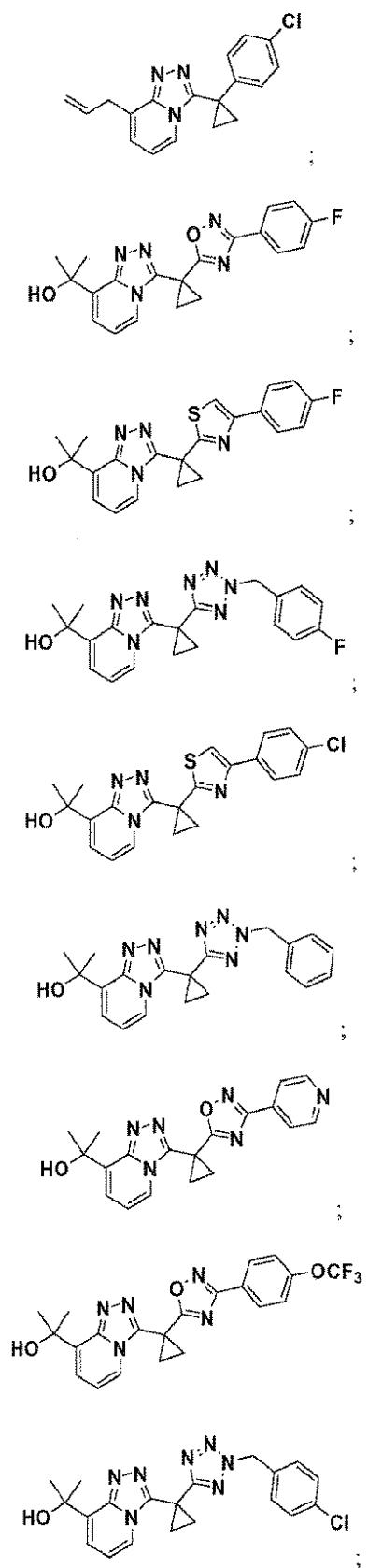
【化 16】



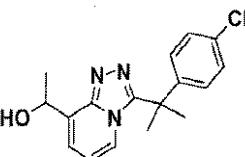
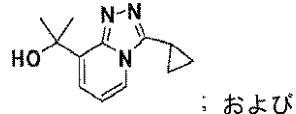
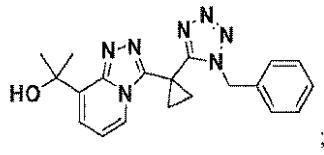
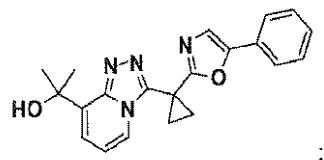
【化 17】



【化 18】



【化19】

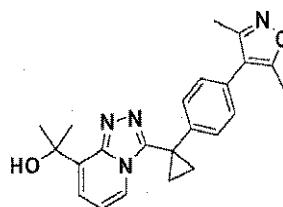
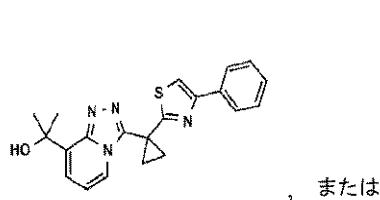
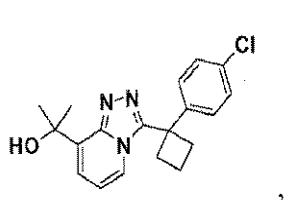
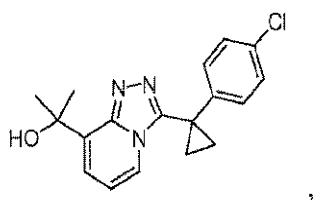


からなる群より選択される化合物あるいは、そのエナンチオマー、ジアステレオマー、または塩。

【請求項9】

以下：

【化20】



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10】

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11】

前記の塩酸塩または硫酸水素塩が結晶形である、請求項1～10のいずれか1つの化合物。

【請求項12】

請求項1～11のいずれか1つの化合物を含む医薬組成物。

【請求項13】

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12の医薬組成物。

【請求項14】

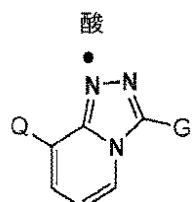
少なくとも1つの請求項1～11の化合物を含む、糖尿病、高血糖、肥満症、脂質異常

症、高血圧症、認知障害、関節リウマチ、骨関節炎、縁内障、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 1 5】

式 (VII - f) :

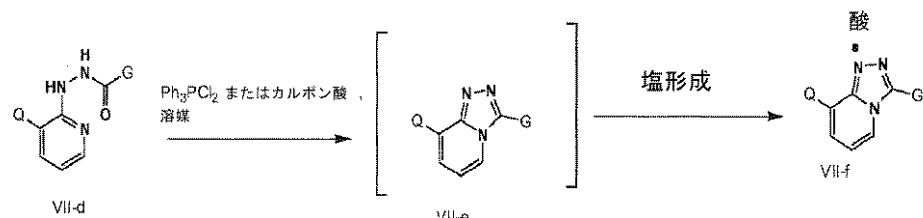
【化 2 1】



(VII-f)

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Ph₃PCl₂ / 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 2 2】



を特徴とする製造方法。