【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成22年3月4日(2010.3.4)

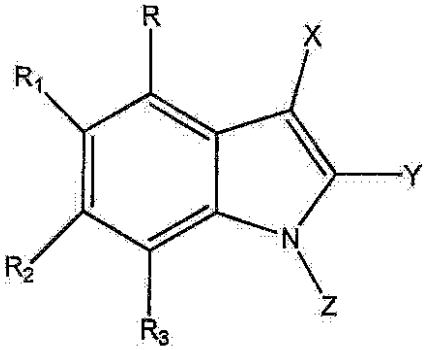
【公表番号】特表2009-523729(P2009-523729A)
【公表日】平成21年6月25日(2009.6.25)
【年通号数】公開・登録公報2009-025
【出願番号】特願2008-550442(P2008-550442)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 209/08 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 209/42 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 491/056 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 209/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/04 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/06 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 209/30 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 209/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/12 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/404 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/407 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4245 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/422 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4155 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/427 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4178 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/423 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/538 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/517 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/433 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4196 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5355 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/454 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/428 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 K 31/664 (2006.01)
C 0 7 F 9/6558 (2006.01)

【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 209/08 ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 209/42
Ｃ０７Ｄ 491/056
Ｃ０７Ｄ 403/12
Ｃ０７Ｄ 413/04
Ｃ０７Ｄ 209/12
Ｃ０７Ｄ 403/04
Ｃ０７Ｄ 417/04
Ｃ０７Ｄ 403/10
Ｃ０７Ｄ 409/04
Ｃ０７Ｄ 417/10
Ｃ０７Ｄ 417/14
Ｃ０７Ｄ 413/10
Ｃ０７Ｄ 405/06
Ｃ０７Ｄ 405/12
Ｃ０７Ｄ 401/12
Ｃ０７Ｄ 209/30
Ｃ０７Ｄ 209/14
Ｃ０７Ｄ 409/12
Ｃ０７Ｄ 403/14
Ｃ０７Ｄ 401/14
Ａ６１Ｋ 31/404
Ａ６１Ｋ 31/407
Ａ６１Ｋ 31/496
Ａ６１Ｋ 31/4245
Ａ６１Ｋ 31/422
Ａ６１Ｋ 31/4155
Ａ６１Ｋ 31/427
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｋ 31/4178
Ａ６１Ｋ 31/423
Ａ６１Ｋ 31/538
Ａ６１Ｋ 31/517
Ａ６１Ｋ 31/433
Ａ６１Ｋ 31/4196
Ａ６１Ｋ 31/5355
Ａ６１Ｋ 31/454
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｋ 31/428
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｐ 31/14
Ａ６１Ｐ 1/16
Ａ６１Ｋ 31/664
Ｃ０７Ｆ 9/6558

【手続補正書】

【提出日】平成22年1月15日(2010.1.15)
【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IIaの化合物
【化１】

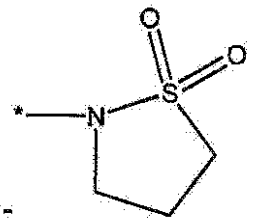


(IIa)

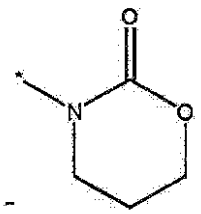
[式中、
Xは、
(a)シアノ、(b)ニトロ、(c)ホルミル、(d)-COOH、(e)-COR_x(R_xはC_1～C_6アルキルである)、(f)-CH=N-(C_1～C_6アルコキシ)、(g)-CH=N-(1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ)、(h)ハロ、(i)1個以上のハロで場合により置換されているアルキル、(j)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上の独立に選択されるハロまたはシアノで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキニル、(k)オキシミル、(l)-SO_2R_x、(m)-SO_2NH_2、(n)-$SO_2NH(R_x)$、(o)-$SO_2N(R_x)_2$、(p)1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/または-C(O)-C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、(q)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(r)5員または6員ヘテロシクロ、(s)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロで場合により置換されている)で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(t)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1)1個以上のハロで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)ハロ、および(3)シアノであり、
Yは、
(a)アミノ(このアミノは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で場合により置換されているベンゾチアゾリル、
(b)窒素上が-SO_2R_xで場合により置換されているインドリル、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1)ハロ、(2)C_1～C_6アルキル、(3)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：(i)1個以上のハロ、および(ii)5員または6員ヘテロシクロ、(4)ヒドロキシ、(5)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ：(i)-SO_2R_x、(ii)1個以上の5員または6員ヘテロアリールで場合によりおよび独立に置換されているC_1～C_6アルキル、および(iii)-PO_2R_x、(6)-$OC(O)NHR_x$、(7)-$OC(O)N(R_x)_2$、(8)-$OC(O)NH(OR_x)$、(9)-$OC(O)NR_x(OR_x)$、(10)-$OC(O)N(OR_x)_2$、(11)-$OC(O)R_{ab}$(R_{ab}は5員または6員ヘテロシクロである)、(12)-NR_oCOR_p(R_pは、(i)C_1～C_6アルキル、(ii)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_6～C_8アリールおよび/またはアルコキシで場合によりおよび独立に置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(iii)1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/もしくはC_6～C_8アリー

ルで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロであり、R_oは、水素、またはC_1～C_6アルキルである)、(13)-$NR_qCONR_qR_r$(R_qは水素であり、R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、および1個以上のハロで場合により置換されているC_6～C_8アリール、(ii)1個以上のハロで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、または(iv)5員または6員ヘテロシクロ、である)、(14)-SO_2R_{aa}(R_{aa}は、(i)ヒドロキシで場合により置換されている5または6ヘテロシクロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、または(iii)C_1～C_6アルキル、である)、(15)-COR_m(R_mは、(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このC_1～C_6アルキルは5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(ii)C_1～C_6アルキル(このアルキルはジアルキル-アミノで場合により置換されている)で場合により置換されている3員～7員ヘテロシクロ、である)、(16)-NR_tCOOR_u(R_tは水素であり、R_uは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のハロおよび/またはハロアルキルで場合により置換されているC_6～C_8アリール、1個以上のアルコキシで場合により置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、ハロ、5員または6員ヘテロアリール、および5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_2～C_6アルケニル、または(iii)ハロで場合により置換されているC_6～C_8アリール、である)、(17)-NHR_{bb}(R_{bb}は、-C(=S)NH_2、または-$PO(OR_x)_2$である)、(18)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは水素であり、R_wは、C_1～C_6アルキル、またはハロで場合により置換されているアルキル-アミノもしくはジアルキル-アミノである)、

【化２】



(19)



(20)

であり、

Zは、C_1～C_6アルキルであり、

Rは水素であり、

R_1は、

(a)水素、

(b)5員または6員ヘテロシクロ、

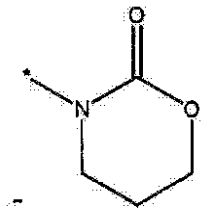
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：(1)ヘテロシクロで場合により置換されているアミノ、(2)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(3)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(4)5員または6員ヘテロアリール、および(5)C_6～C_8アリール、

(d)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルコキシ：(1)ヘテロシクロで場合により置換されているアミノ、(2)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(3)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員ま

たは6員ヘテロシクロ、(4)5員または6員ヘテロアリール、および(5)C_6～C_8アリール、
(e)-(0)-5員または6員ヘテロシクロ、
(f)-(0)-5員または6員ヘテロアリール、
(g)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-SO_2R_x：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)C_6～C_8アリール、および(3)5員または6員ヘテロアリール、または
(h)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルキルチオ：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)C_6～C_8アリール、および(3)5員または6員ヘテロアリール
であり、
R_2は、
(a)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)5員または6員ヘテロアリール、(3)C_6～C_8アリール、(4)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、および(5)(i)ヘテロシクロ、(ii)アルコキシおよび(iii)アルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、
(b)5員または6員ヘテロアリール(このヘテロアリールはアルキルで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキルチオ、
(c)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されているアルキルチオ、
(d)C_6～C_8アリールで場合により置換されているアルキルチオ、
(e)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアルキルチオ、
(f)5員または6員ヘテロアリール(このヘテロアリールは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で場合により置換されている-SO_2R_x、
(g)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されている-SO_2R_x、
(h)C_6～C_8アリールで場合により置換されている-SO_2R_x、
(i)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-SO_2R_x、
(j)5員または6員ヘテロアリールで場合により置換されている-$S(0)R_x$、
(k)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されている-$S(0)R_x$、
(l)C_6～C_8アリールで場合により置換されている-$S(0)R_x$、
(m)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-$S(0)R_x$、
(n)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：(1)ハロ、(2)ヒドロキシ、(3)アルコキシで場合により置換されているアルコキシ、(4)5員または6員ヘテロアリール、5員または6員ヘテロシクロおよびアルキル(このアルキルは以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノ)、から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、(5)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(6)-S-5員または6員ヘテロシクロ、(7)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-S-5員または6員ヘテロアリール、(8)-S-C_1～C_6アルキル、(9)-S-C_6～C_8アリール、(10)スルフィニル-5員または6員ヘテロシクロ、(11)スルフィニル-5員または6員ヘテロアリール、(12)スルフィニル-C_1～C_6アルキル、(13)スルフィニル-C_6～C_8アリール、(14)スルホニル-5員または6員ヘテロシクロ、(15)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているスルホニル-5員または6員ヘテロアリール、(16)スルホニル-C_1～C_6アルキル、(17)スルホニル-C_6～C_8アリール、(18)ヒドロキシおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～7員ヘテロシクロ、(19)1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、および(20)C_6～C_8アリール、
(o)C_6～C_8アリール、
(p)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されている-(0)-5員また

は6員ヘテロアリール、
(q)1個以上のC_6～C_8アリールで場合により置換されている-C(O)-5員または6員ヘテロシクロ、
(r)-C(O)-C_6～C_8アリール、
(s)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：C_1～C_6アルキル、および
(t)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)C_1～C_6アルキル、(3)-SO_2R_x、(4)-C(O)-C_6～C_8アリール、および(5)-C(O)OR_x、または
(u)-OR_{kk}(R_{kk}は、(1)C_6～C_8アリール、(2)C_1～C_6アルキル(このアルキルはC_6～C_8アリールで場合により置換されている)で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(3)ハロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシおよびC_1～C_6ハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(4)-SO_2R_x、または(5)-Si$(R_x)_3$である)
であり、
R_3は水素であり、
但し、X、Y、Z、R_1およびR_2の少なくとも1つは以下から選択される:
Xは、
(a)-COOH、(b)-CH=N-(C_1～C_6アルコキシ)、(c)-CH=N-(1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ)、(d)ハロ、(e)1個以上のハロで場合により置換されているアルキル、(f)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロおよび/またはシアノで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキニル、(g)オキシミル、(h)-SO_2R_x、(i)-SO_2NH_2、(j)-$SO_2NH(R_x)$、(k)-$SO_2N(R_x)_2$、(l)1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/または-C(O)-C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、(m)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(n)5員または6員ヘテロシクロ、(o)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロで置換されている)で置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(p)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_6～C_8アリール：(1)1個以上のハロで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)ハロ、および(3)シアノ、
であり、
Yは、
(a)アミノ(このアミノは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で置換されているベンゾチアゾリル、
(b)窒素上が-SO_2R_xで置換されているインドリル、または
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_6～C_8アリール：(1)以下のもの：-SO_2R_x、および1個以上の5員または6員ヘテロアリールで置換されているC_1～C_6アルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、(2)-OC(O)NHR_x、(3)-OC(O)N$(R_x)_2$、(4)-OC(O)N$H(OR_x)$、(5)-OC(O)N$R_x(OR_x)$、(6)-OC(O)N$(OR_x)_2$、(7)-OC(O)R_{ab}(R_{ab}は5員または6員ヘテロシクロである)、(8)-NR_oCOR_p(R_pは、(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_6～C_8アリールおよび/またはアルコキシで場合によりおよび独立に置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(ii)1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/またはC_6～C_8アリールで置換されている5員または6員ヘテロシクロである)、(9)-$NR_qCONR_qR_r$(R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、および1個以上のハロで置換されているC_6～C_8アリール、(ii)C_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、または(iv)5員または6員ヘテロシクロである)、(10)-NR_tCOOR_u(R_uは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のアルコキシで置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、および5員または6員ヘテロアリール、または(ii)C_2～C_6アルケニル、である)、そして

【化３】



(11)

であり、

R_1は、

(a)以下のもので置換されているC_1～C_6アルキル：(1)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、および/または(2)5員または6員ヘテロアリール、

(b)以下のもので置換されているC_1～C_6アルコキシ：(1)ヘテロシクロで場合により置換されているアミノ、(2)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(3)C_1～C_6アルキルで置換されている5員または6員ヘテロシクロ、および/または(4)5員または6員ヘテロアリール、

(c)-(O)-5員または6員ヘテロシクロ、

(d)-(O)-5員または6員ヘテロアリール、

(e)以下のもので場合により置換されている$-SO_2R_x$：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)C_6～C_8アリール、および/もしくは(3)5員または6員ヘテロアリール、または

(f)以下のもので場合により置換されているアルキルチオ：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)C_6～C_8アリール、および/もしくは(3)5員または6員ヘテロアリール

であり、

R_2は、

(a)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)5員または6員ヘテロアリール、(3)C_6～C_8アリール、(4)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、ならびに(5)ヘテロシクロ、アルコキシおよびアルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、

(b)5員または6員ヘテロアリール(このヘテロアリールはアルキルで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキルチオ、

(c)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されているアルキルチオ、

(d)C_6～C_8アリールで場合により置換されているアルキルチオ、

(e)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアルキルチオ、

(f)5員または6員ヘテロアリール(このヘテロアリールは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で場合により置換されている$-SO_2R_x$、

(g)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されている$-SO_2R_x$、

(h)C_6～C_8アリールで場合により置換されている$-SO_2R_x$、

(i)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている$-SO_2R_x$、

(j)5員または6員ヘテロアリールで場合により置換されている$-S(O)R_x$、

(k)5員または6員ヘテロシクロで場合により置換されている$-S(O)R_x$、

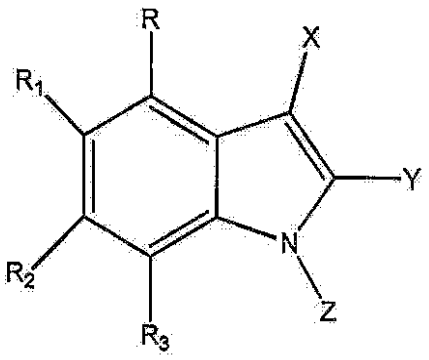
(l)C_6～C_8アリールで場合により置換されている$-S(O)R_x$、

(m)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている$-S(O)R_x$、

(n)以下のもので置換されているアルコキシ：(1)アルコキシ、(2)5員または6員ヘテロアリール、5員または6員ヘテロシクロおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアミノ(このアルキルは以下のもの：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)、(3)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(4)-S-5員または6員ヘテロシクロ、(5)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-S-5員または6員ヘテロアリール、(6)-S-C_1～C_6アルキル、(7)-S-C_6～C_8アリール、(

8)スルフィニル-5員または6員ヘテロシクロ、(9)スルフィニル-5員または6員ヘテロアリール、(10)スルフィニル-C_1～C_6アルキル、(11)スルフィニル-C_6～C_8アリール、(12)スルホニル-5員または6員ヘテロシクロ、(13)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているスルホニル-5員または6員ヘテロアリール、(14)スルホニル-C_1～C_6アルキル、(15)スルホニル-C_6～C_8アリール、(16)ヒドロキシおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員～7員ヘテロシクロ、(17)1個以上のC_1～C_6アルキルで置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(18)C_6～C_8アリール、
(o)1個以上のC_6～C_8アリールで場合により置換されている-C(O)-5員または6員ヘテロシクロ、
(p)-C(O)-C_6～C_8アリール、
(q)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)C_1～C_6アルキル、(3)-SO_2R_x、(4)-C(O)-C_6～C_8アリール、および(5)-C(O)OR_x、
(r)-OR_{kk}(R_{kk}は、(1)C_6～C_8アリール、(2)C_1～C_6アルキルおよび/もしくはC_6～C_8アリールで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、または(3)-$Si(R_x)_3$である)、
(s)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロシクロ、または
(t)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロアリール
である]、
または薬学的に許容されるその塩。

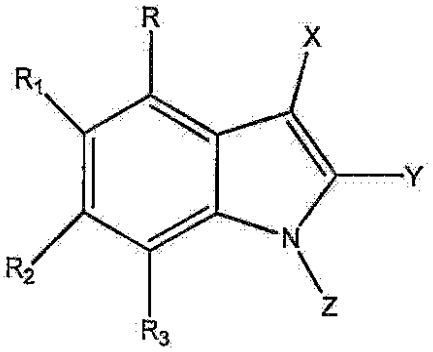
【請求項２】
式IIbの化合物
【化４】



(IIb)

[式中、
Xはシアノであり、
Yは、以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_6～C_8アリール：(a)C_1～C_6アルキル、(b)C_1～C_6アルキルで置換されているアミノ、(c)-NR_tCOOR_u(R_tは水素であり、R_uは1個以上のハロで場合により置換されているC_1～C_{12}アルキルである)、(d)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは水素であり、R_wはC_1～C_6アルキルである)
であり、
ZはC_1～C_6アルキルであり、
Rは水素であり、
R_1は水素であり、
R_2は、
(a)1個以上のハロで置換されているアルコキシ、
(b)5員または6員ヘテロシクロ、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：(1)C_1～C_6アルキル、および(2)-NO_2、

(d)-C(O)-3員～7員ヘテロシクロまたは-C(O)-5員ヘテロシクロ、ならびに
(e)-OR_{kk}(R_{kk}は、(1)シアノ、およびC_1～C_6アルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(2)1個以上の=Oで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロである)
であり、
R_3は水素である]、
または薬学的に許容されるその塩。
【請求項３】
式IIeの化合物
【化５】



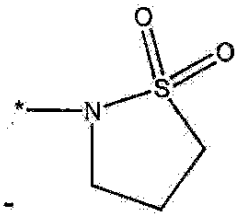
(IIe)

[式中、
Xは、
(a)水素、(b)シアノ、(c)ニトロ、(d)ホルミル、(e)-COOH、(f)-COR_x(R_xはC_1～C_6アルキルである)、(g)-CH=N-(C_1～C_6アルコキシ)、(h)-CH=N-(1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ)、(i)ハロ、(j)1個以上のハロで場合により置換されているアルキル、(k)シアノまたはC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキニル、(l)オキシミル、(m)-SO_2R_x、(n)-SO_2NH_2、(o)-$SO_2NH(R_x)$、(p)-$SO_2N(R_x)_2$、(q)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルおよび/または-C(O)-C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、(r)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(s)5員または6員ヘテロシクロ、(t)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロで場合により置換されている)で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(u)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1)1個以上のハロで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)ハロ、および(3)シアノ
であり、
Yは、
(a)アミノ(このアミノは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で場合により置換されているベンゾチアゾリル、
(b)窒素上が-SO_2R_xで場合により置換されているインドリル、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1)ハロ、(2)C_1～C_6アルキル、(3)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：(i)ハロ、(ii)5員または6員ヘテロシクロ、(iii)C_6～C_8アルキルで場合により置換されている-$C(O)NH_2$、(iv)-C(O)NH-(C_1～C_6)-アルキル、(4)ヒドロキシ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)ニトロ、(8)-COOH、(9)-N=$CHN(R_x)_2$、(10)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ：(i)-SO_2R_x、(ii)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、-COR_xおよびハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール、(iii)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、およびC_6～C_8アリール（これはハロで場合により置換されている）から

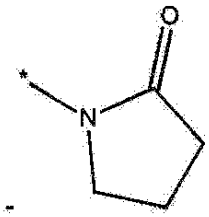
独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(iv)ヒドロキシ、=O、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(v)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_7アルキル：アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、そしてアルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、そしてアルコキシ、およびハロ、ならびに(vi)-PO_2R_x、(11)-$OC(O)NHR_x$(R_xはビニルで場合により置換されている)、(12)-$OC(O)N(R_u)_2$(R_uはアルキルまたはC_6～C_8アリールであり、このアルキルまたはアリールはジアルキルアミノで場合により置換されている)、(13)-$OC(O)NH(OR_{uu})$(R_{uu}はジアルキルアミノで場合により置換されているC_6～C_8アリールである)、(14)-$OC(O)NR_x(OR_x)$、(15)-$OC(O)N(OR_x)_2$、(16)-$OC(O)R_{ab}$(R_{ab}はヘテロアリールで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロであり、このヘテロアリールはアルキルまたはハロアルキルで場合により置換されている)、(17)-$NR_oC(O)R_p$(R_pは、(i)C_1～C_6アルキル、(ii)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルはC_6～C_8アリールおよびアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(iii)C_1～C_6アルキルおよびC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロであり、R_oは、水素、またはC_1～C_6アルキルである)、(18)-$NR_qCONR_qR_r$(R_qは水素であり、R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびハロで場合により置換されているC_6～C_8アリール、(ii)1個以上のハロで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、または(v)アルキルで場合により置換されている5員～6員ヘテロアリール、である)、(19)-SO_2R_{aa}(R_{aa}は、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、およびC_1～C_6アルキル、または(ii)アルキルで場合により置換されているアミノ(このアルキルは以下のもの：アルコキシ、ヒドロキシ、ハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)である)、(20)-COR_m(R_mは、(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは5員または6員ヘテロシクロまたはC_6～C_8アリールで場合により置換されており、このヘテロシクロまたはアリールはハロおよびアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(ii)ヒドロキシで場合により置換されているヘテロシクロ、(iii)C_1～C_6アルキル(このアルキルはジアルキル-アミノで場合により置換されている)で場合により置換されている3員～7員ヘテロシクロ、である)、(21)-NR_tCOOR_u(R_tは水素であり、R_uは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のハロおよび/またはハロアルキルで場合により置換されているC_6～C_8アリール、1個以上のアルコキシで場合により置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、ハロ、-SO_2R_w、-SO_2R_x、5員または6員ヘテロアリール、および5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_2～C_6アルケニル、(iii)ハロで場合により置換されているC_6～C_8アリール、(iv)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている4員～7員ヘテロシクロ：=O、-SO_2R_w、-COR_p、および-(CO)O-(C_1～C_4アルキル)-O-(C_1～C_4アルキル)である)、(22)-NHR_{bb}(R_{bb}は、(i)-C(=S)NH_2、(ii)-C(=S)NHR_x、(iii)-C(=S)NR_xR_x、(iv)-C(=N-CN)NHR_x、または(v)-$PO(OR_x)_2$である)、(23)-$N(CONHR_w)_2$、(24)-$NH(SOR_w)$、(25)-$N(SO_2R_w)_2$、(26)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは水素、または4員～7員ヘテロシクロで場合により置換されているアルキルであり、R_wは、(i)C_6～C_8アリール(このアリールは、ハロアルキル、ハロ、アルコキシおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)C_6～C_8アリール、(iii)C_6～C_8ヘテロアリール、または(iv)ヘテロシクロもしくはアルキルで場合により置換されているアミノ(このヘテロシクロまたはアルキルは、ハロ、C_1

～C_6アルコキシ、アルコキシカルボニル、(CO)O-(C_1～C_6)アルキル)、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)である)、

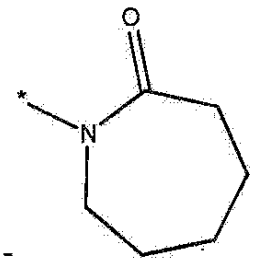
【化６】



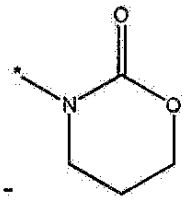
(27)



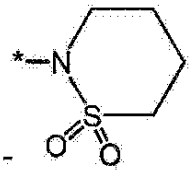
(28)



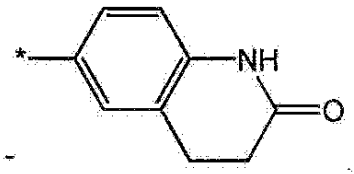
(29)



(30)

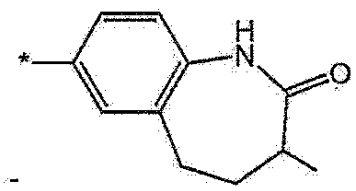


(31)



または

(32)

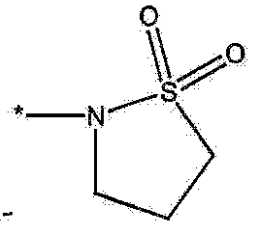


(33)

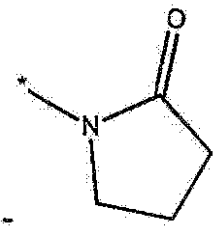
(34)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～

6員ヘテロアリール：(i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルキル、(iii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：ハロ、5員または6員ヘテロシクロ、およびC_6～C_8アルキルで場合により置換されている-C(O)NH_2、(iv)ヒドロキシ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)ニトロ、(viii)-COOH、(ix)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ：-SO_2R_x、アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、COR_xおよびハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール；アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、および-C_6～C_8アリール（これはハロで場合により置換されている）から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール；ヒドロキシ、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロシクロ、ならびに以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_7アルキル：1個以上のアルキル、ハロおよび/またはハロアルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール；アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール；アルコキシ、ならびにハロ、(35)-NR_oCOR_p(R_pは、(i)C_1～C_6アルキル、(ii)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_6～C_8アリールおよび/またはアルコキシで場合によりおよび独立に置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(iii)1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/またはC_6～C_8アリールで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロであり、R_oは、水素、またはC_1～C_6アルキルである)、(36)-$NR_qCONR_qR_r$(R_qは水素であり、R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびハロで場合により置換されているC_6～C_8アリール、(ii)1個以上のハロで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、または(v)アルキルで場合により置換されている5員～6員ヘテロアリールである)、(37)-NR_tCOOR_u(R_tは水素であり、R_uは、以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のハロおよび/またはハロアルキルで場合により置換されているC_6～C_8アリール、1個以上のアルコキシで場合により置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、ハロ、-SO_2R_w、-SO_2R_x、5員または6員ヘテロアリール、および5員または6員ヘテロシクロ、である)、および(38)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは水素または4員～7員ヘテロシクロで場合により置換されているアルキルであり、R_wは、C_6～C_8アリール(このアリールは、ハロアルキル、ハロ、アルコキシおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、C_6～C_8アリール、C_6～C_8ヘテロアリール、ヘテロシクロもしくはアルキルで場合により置換されているアミノ(このヘテロシクロまたはアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)、

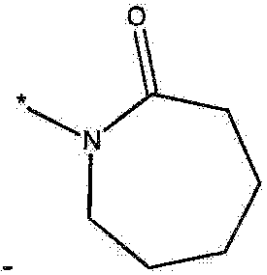
【化７】



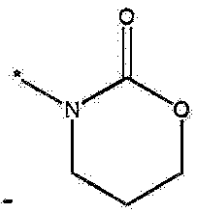
(d)



(e)



(f) または



(g)

であり、

ZはC$_1$～C$_6$アルキルであり、

Rは水素であり、

R$_1$は、

(a)水素、

(b)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)C$_1$～C$_6$アルキル、(3)-SO$_2$R$_x$、(4)-C(O)-C$_6$～C$_8$アリール、(5)-COR$_p$、および(6)-C(O)OR$_x$、

(c)以下から独立に選択される1個以上で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：(1)ハロ、C$_1$～C$_6$アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC$_1$～C$_6$アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)アルキル(このアルキルは、(i)ハロ、(ii)C$_1$～C$_6$アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)シアノ、(v)5員または6員ヘテロシクロおよび(vi)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO

$_2R_x$、(13)-COR_x、(14)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、(i)C_1～C_6アルコキシ、(ii)ヒドロキシ、(iii)5員または6員ヘテロシクロおよび(iv)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-C(O)NH_2、(15) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、(v)5員または6員ヘテロアリールおよび(vi)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、

(d)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：(1) (i)ヘテロシクロ、(ii)アルコキシおよび(iii)アルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、(2)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(3)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(4)5員または6員ヘテロアリール、および(5)C_6～C_8アリール、(6)-SO_2R_x、

(e)-SO_2R_xで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、

(f)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルコキシ：(1)ハロ、(2)ヒドロキシ、(3)シアノ、(4)アルコキシで場合により置換されているアルコキシ、(5) (i)5員または6員ヘテロアリール、(ii)5員または6員ヘテロシクロおよび(iii)アルキルから独立に選択される1個以上で場合により置換されているアミノ(このアルキルは以下のもの：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)、(6)ヘテロシクロで場合により置換されているアミノ、(7)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(8)ヒドロキシおよびC_1～C_6アルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～7員ヘテロシクロ(このアルキルは以下のもの：C_1～C_6アルコキシ、およびC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)、(9)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：C_1～C_6アルキル、および4員～7員ヘテロシクロ、(10)アルコキシ、および(11)C_6～C_8アリール、

(g)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている(O)-5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)C_1～C_6アルキル、(3)-SO_2R_x、(4)-C(O)-C_6～C_8アリール、(5)-COR_p、および(6)-C(O)OR_x、

(h)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロアリール：(1) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)アルキル(このアルキルは、ハロ、(i)C_1～C_6アルコキシ、(ii)ヒドロキシ、(iii)シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび(iv)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO_2R_x、(13)-COR_x、(14)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-C(O)NH_2：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、ならびに(ii)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリールおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、

(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-C(O)NH_2、

(j)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-C(O)-

3員～7員ヘテロシクロ：(i)C_6～C_8アリール、(ii)5員または6員ヘテロアリール、および(iii)ヒドロキシで置換されている1個以上でさらに場合により置換されているC_1～C_6アルキ、
(k)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-SO_2R_x：(i)5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_6～C_8アリール、および(iii)5員または6員ヘテロアリール、または
(l)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルキルチオ：(i)5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_6～C_8アリール、および(iii)5員または6員ヘテロアリール、
(m)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)アルキル(このアルキルは、(i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)シアノ、(v)5員または6員ヘテロシクロおよび(vi)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO_2R_x、(13)-COR_x、(14)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、(i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、および(15) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、(v)5員または6員ヘテロアリールおよび(vi)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(n)-C(O)-5員または6員ヘテロアリール、
(o)-C(O)-C_6～C_8アリール、
(p)-COOH、または
(q)-OR_{kk}(R_{kk}は、(1)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)-CO_2R_x、(xiii)-COR_x、(xiv)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、および(xv)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、である)、
であり、
R_2は、
(a)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル：(1)5員または6員ヘテロシクロ、(2)5員または6員ヘテロアリール、(3)C_6～C_8アリール、(4)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、および(5) (i)ヘテロシクロ、(ii)アルコキシおよび(iii)アルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されて

いるアミノ、および(6)-SO_2R_x、
(b)-SO_2R_xで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルキルチオ：(1)アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(2)5員または6員ヘテロシクロ、(3)C_6～C_8アリール、および(4)C_1～C_6アルキル、
(d)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-SO_2R_x：(1)1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(2)5員または6員ヘテロシクロ、(3)C_6～C_8アリール、および(4)C_1～C_6アルキル、
(e)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-$S(O)R_x$：(1)5員または6員ヘテロアリール、(2)5員または6員ヘテロシクロ、(3)C_6～C_8アリール、および(4)C_1～C_6アルキル、
(f)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：(1)ハロ、(2)ヒドロキシ、(3)シアノ、(4)アルコキシで場合により置換されているアルコキシ、(5) (i)-SO_2-C_1～C_4アルキル、(ii)5員または6員ヘテロアリール、(iii)5員ヘテロシクロまたは(iv)6員ヘテロシクロ、およびアルキル(このアルキルは以下のもの：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、(6)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(7)-S-5員または6員ヘテロシクロ、(8)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-S-5員または6員ヘテロアリール、(9)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-S-C_1～C_6アルキル：(i)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、および(ii)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(10)-S-C_6～C_8アリール、(11)スルフィニル-5員または6員ヘテロシクロ、(12)スルフィニル-5員または6員ヘテロアリール、(13)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているスルフィニル-C_1～C_6アルキル：(i)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、および(ii)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(14)スルフィニル-C_6～C_8アリール、(15)スルホニル-5員または6員ヘテロシクロ、(16)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているスルホニル-5員または6員ヘテロアリール、(17)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているスルホニル-C_1～C_6アルキル：(i)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、および(ii)アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(18)スルホニル-C_6～C_8アリール、(19)ヒドロキシ、=O、ヘテロシクロおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは以下のもの：C_1～C_6アルコキシ、およびC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～7員ヘテロシクロ、(20)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：(i)1個以上のアルコキシで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)4員～7員ヘテロシクロ、および(iii)アルコキシ、ならびに(21)C_6～C_8アリール、
(g)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(1) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換

されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO_2R_x、(13)-COR_x、(14)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、(i)ハロ、(i)C_1～C_6アルコキシ、(i)ヒドロキシ、(ii)5員または6員ヘテロシクロ、および(iii)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、および(15) (i)ハロ、(i)C_1～C_6アルコキシ、(ii)ヒドロキシ、(iii)5員または6員ヘテロシクロ、(iv)5員または6員ヘテロアリールおよび(v)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(h)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)=O、(3)C_1～C_6アルキル、(4)-SO_2R_x、(5)-C(O)-C_6～C_8アリール、(6)-COR_p、および(7)-C(O)OR_x、
(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロアリール：(1) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、(iii)5員または6員ヘテロシクロおよび(iv)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO_2R_x、(13)-COR_x、(14)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルはハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、および(15)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(j)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-C(O)-3員～7員ヘテロシクロ：(1)C_6～C_8アリール、(2)5員または6員ヘテロアリール、および(3)1個以上のヒドロキシで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、
(k)-C(O)-5員または6員ヘテロアリール、
(l)-C(O)-C_6～C_8アリール、
(m)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ：(1)-SO_2R_x、(2) (i)アルキル、(ii)ハロ、(iii)ハロアルキル、(iv)シアノ、(v)アルコキシ、(vi)COR_xおよび(vii)ハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール、(3) (i)アルキル、(ii)ハロ、(iii)ハロアルキル、(iv)シアノ、(v)アルコキシ、(vi)ハロアルコキシ、および(vii)ハロで場合により置換されている-C_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(4)ヒドロキシ、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロシクロ、(5)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_7アルキル：(i)アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(ii)アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、(iii)アルコキシ、および(iv)ハロ、
(n)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：(1) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(2)アルコキシ、(3)ハロ、(4)アルキルチオ、(5)ハロアルキル、(6)シアノ、(7)1個以上のアルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5

員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(8)ヘテロシクロ、(9)ニトロ、(10)ヒドロキシ、(11)-COOH、(12)-CO_2R_x、(13)-COR_x、(14)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、(i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、(iii)ヒドロキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロおよび(v)5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、(15) (i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、(iii)5員または6員ヘテロシクロ、(iv)5員または6員ヘテロアリールおよび(v)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、

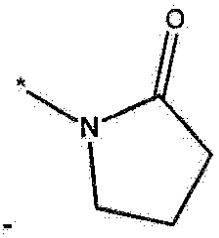
(o)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(1)ヒドロキシ、(2)=O、(3)C_1～C_6アルキル、(4)-SO_2R_x、(5)-C(O)-C_6～C_8アリール、(6)-COR_p、および(7)-$C(O)OR_x$、

(p)-OR_{kk}(R_{kk}は、(1)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)-CO_2R_x、(xiii)-COR_x、(xiv)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、および(xv)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、(2)C_1～C_6アルキル(このアルキルはC_6～C_8アリールで場合により置換されている)で場合により置換されている5員～6員ヘテロシクロ、または(3)ハロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシおよびC_1～C_6ハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～6員ヘテロアリール、(4)-SO_2R_x、または(5)-$Si(R_x)_3$、である)、

(q)-$OC(O)NHR_x$(R_xは-C_6～C_8アリールで場合により置換されている)、

(r)-$OC(O)N(R_x)_2$、または

【化８】



(s)

であり、

R_3は、水素、またはニトロであり、

但し、X、Y、Z、R_1、R_2およびR_3の少なくとも1つは以下から選択される:

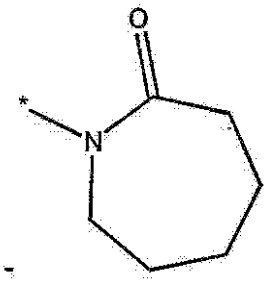
Xは、

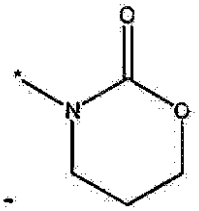
(a)-CH=N-(C_1～C_6アルコキシ)、(b)-CH=N-(1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ)、(c)ハロ、(d)1個以上のハロで場合により置換されているアルキル、(e)C_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロおよび/またはシアノで場合により置換されている)で場合により置換されているアルキニル、(f)オキシミル、(g)-SO_2R_x、(h)-SO_2

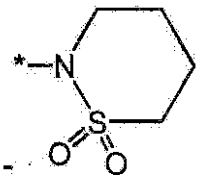
NH_2、(i)-$SO_2NH(R_x)$、(j)-$SO_2N(R_x)_2$、(k)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルおよび/または-C(O)-C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、(l)1個以上の独立に選択されるC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(m)5員または6員ヘテロシクロ、(n)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のハロで場合により置換されている)で置換されている5員または6員ヘテロアリール、または(o)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_6～C_8アリール：(i)1個以上のハロで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)ハロ、および(iii)シアノ
であり、
Yは、
(a)アミノ(このアミノは1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている)で置換されているベンゾチアゾリル、
(b)窒素上が-SO_2R_xで場合により置換されているインドリル、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_6～C_8アリール：(1)以下のもの：C_6～C_8アルキルで場合により置換されている-C(O)NH_2、および-C(O)NH-(C_1～C_6)-アルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアルコキシ、(2)ハロアルキル、(3)シアノ、(4)-COOH、(5)-N=CHN$(R_x)_2$、(6)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアミノ：(i)-SO_2R_x、(i)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、COR_xおよびハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール、(iii)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、およびハロで場合により置換されているC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(iv)ヒドロキシ、=O、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(v)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_7アルキル：アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール；アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール；アルコキシ、およびハロ、ならびに(vi)-PO_2R_x、(7)-OC(O)NHR_x(R_xはビニルで場合により置換されている)、(8)-OC(O)N$(R_u)_2$(R_uはアルキルまたはC_6～C_8アリールであり、このアルキルまたはアリールはジアルキルアミノで場合により置換されている)、(9)-OC(O)NH(OR_{uu})(R_{uu}はジアルキルアミノで場合により置換されている-C_6～C_8アリールである)、(10)-OC(O)$NR_x(OR_x)$、(11)-OC(O)N$(OR_x)_2$、(12)-OC(O)R_{ab}(R_{ab}はヘテロアリールで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロであり、このヘテロアリールはアルキルまたはハロアルキルで場合により置換されている)、(13)-$NR_oC(O)R_p$(R_pは、(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルはC_6～C_8アリールおよびアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、または(ii)C_1～C_6アルキルおよびC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員または6員ヘテロシクロである)、(14)-$NR_qCONR_qR_r$(R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびハロで置換されているC_6～C_8アリール、(ii)1個以上のハロで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、または(v)アルキルで場合により置換されている5員～6員ヘテロアリールである)、(15)-SO_2R_{aa}(R_{aa}は、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：ヒドロキシ、C_1～C_6アルコキシ、およびC_1～C_6アルキル、または(ii)アルキル(このアルキルは以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている：アルコキシ、ヒドロキシ、ハロ)で場合により置換されているアミノ、である)、(16)-COR_m(R_mは、(i)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは5員または6員ヘテロシクロまたはC_6～C_8アリールで置換されており、このヘテロシクロは1個以上のハロおよび/またはアルコキシで置換されており、このアリールは1個以上のハロおよび/またはアルコキシで

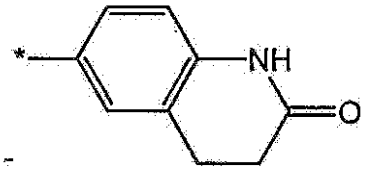
場合により置換されている)で置換されているアミノ、または(ii)ヒドロキシで置換されているヘテロシクロ、である)、(17)-NR_tCOOR_u(R_uは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のハロおよび/またはハロアルキルで置換されているC_6～C_8アリール、1個以上のアルコキシで置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、$-SO_2R_w$、$-SO_2R_x$、および5員または6員ヘテロアリール、(ii)C_2～C_6アルケニル、(iii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている4員～7員ヘテロシクロ：=O、$-SO_2R_w$、$-COR_p$、および-(CO)O-(C_1～C_4アルキル)-O-(C_1～C_4アルキル)、(iv)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている4員または7員ヘテロシクロ：=O、$-SO_2R_w$、$-COR_p$、および-(CO)O-(C_1～C_4アルキル)-O-(C_1～C_4アルキル)、である)、(18)-NHR_{bb}(R_{bb}は、(i)-C(=S)NHR_x、(ii)-C(=S)NR_xR_x、または(iii)-C(=N-CN)NHR_xである)、(19)-$N(CONHR_w)_2$、(20)-$NH(SOR_w)$、(21)-$N(SO_2R_w)_2$、(22)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは4員または7員ヘテロシクロで置換されているアルキルであり、またはR_wは、(i)C_6～C_8アリール(このアリールは、ハロアルキル、ハロ、アルコキシおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている)で置換されているC_1～C_6アルキル、または(ii)ヘテロシクロもしくはアルキルで場合により置換されているアミノ(このヘテロシクロまたはアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、アルコキシカルボニル、(CO)O-(C_1～C_6)アルキル)、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)、である)、

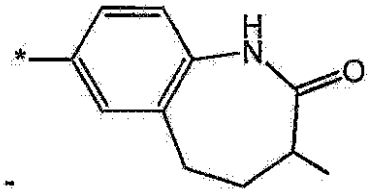
【化９】

(23) 

(24) 

(25) 

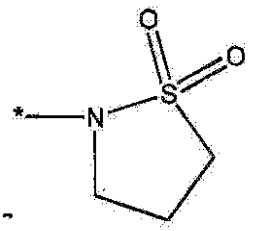
(26)  または

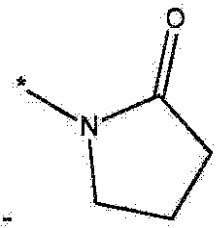
(27) 

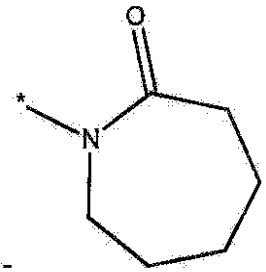
(28)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～6員ヘテロアリール：(i)ハロ、(ii)C_1～C_6アルキル、(iii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルコキシ：ハロ、5員または6員ヘテロシクロ、およびC_6～C_8アルキルで場合により置換されている-C(O)NH_2、(iv)ヒドロキシ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)ニトロ、(viii)-COOH、(ix)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ：-SO_2R_x；アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、COR_xおよびハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール；アルキル、ハロ、

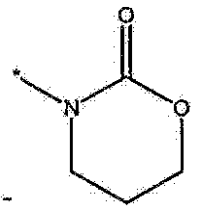
ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、および、ハロで場合により置換されているC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール；ヒドロキシ、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロシクロ、および以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_7アルキル：1個以上のアルキル、ハロおよび/またはハロアルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール；アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール；アルコキシ、ならびにハロ、(28)-NR_oCOR_p(R_pは、1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_6～C_8アリールおよび/またはアルコキシで場合によりおよび独立に置換されている)で場合により置換されているアミノ、または1個以上のC_1～C_6アルキルおよび/またはC_6～C_8アリールで場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロである)、(29)-$NR_qCONR_qR_r$(R_rは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：ヒドロキシ、アルコキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、および、ハロで置換されているC_6～C_8アリール、(ii)1個以上のハロで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、(iii)C_1～C_6アルコキシ、(iv)5員または6員ヘテロシクロ、または(v)アルキルで場合により置換されている5員～6員ヘテロアリール、である)、(30)-NR_tCOOR_u(R_uは、(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_{12}アルキル：1個以上のハロおよび/またはハロアルキルで置換されているC_6～C_8アリール、1個以上のアルコキシで置換されているアルコキシ、1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミノ、-SO_2R_w、-SO_2R_x、および5員または6員ヘテロアリールである)、(31)-$NR_vSO_2R_w$(R_vは、4員～7員ヘテロシクロで置換されているアルキルであり、またはR_wは、(i)C_6～C_8アリール(このアリールは、ハロアルキル、ハロ、アルコキシおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている)で置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)C_6～C_8アリール、(iii)ヘテロシクロまたはアルキルで置換されているアミノ(このヘテロシクロは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されており、このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、アルコキシカルボニル、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている)、である)

【化１０】

(d) 

(e) 

(f)  または

(g) 

であり、

Zは、C_1～C_6アルキルであり、

R_1は、

(a)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(i)ヒドロキシ、(ii)C_1～C_6アルキル、(iii)-SO_2R_x、(iv)-C(O)-C_6～C_8アリール、(v)-COR_p、および(vi)-C(O)OR_x、

(b)以下から独立に選択される1個以上で置換されている5員または6員ヘテロアリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)-CO_2R_x、(xiii)-COR_x、(xiv)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-C(O)NH_2、(x

v)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：(i)ヘテロシクロ、アルコキシおよびアルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、(ii)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(iii)C_1～C_6アルキルで置換されている5員または6員ヘテロシクロ、(iv)5員または6員ヘテロアリール、および(v)C_6～C_8アリール、(vi)$-SO_2R_x$、
(d)$-SO_2R_x$で場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、
(e)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルコキシ：(i)ヒドロキシ、(ii)シアノ、(iii)アルコキシで場合により置換されているアルコキシ、(iv)5員または6員ヘテロアリール、5員または6員ヘテロシクロおよびアルキル(このアルキルは以下のもの：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノ、から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)から独立に選択される1個以上で場合により置換されているアミノ、(v)ヘテロシクロで場合により置換されているアミノ、(vi)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、(vii)ヒドロキシおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている：C_1～C_6アルコキシ、およびC_6～C_8アリール)から独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員～7員ヘテロシクロ、(viii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：C_1～C_6アルキル、および4員～7員ヘテロシクロ、および(ix)アルコキシ、
(f)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロシクロ：(i)ヒドロキシ、(ii)C_1～C_6アルキル、(iii)$-SO_2R_x$、(iv)-C(O)-C_6～C_8アリール、(v)$-COR_p$、および(vi)$-C(O)OR_x$、または
(g)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-(O)-5員または6員ヘテロアリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)$-CO_2R_x$、(xiii)$-COR_x$、(xiv)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている$-C(O)NH_2$：ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、およびハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリールおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(h)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている$-C(O)NH_2$、
(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC(O)-3員～7員ヘテロシクロ：(i)C_6～C_8アリール、(ii)5員または6員ヘテロアリール、および(iii)ヒドロキシで置換されている1個以上でさらに場合により置換されているC_1～C_6アルキ、
(j)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている$-SO_2R_x$

：(i)5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_6～C_8アリール、および(iii)5員または6員ヘテロアリール、
(k)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルキルチオ：(i)5員または6員ヘテロシクロ、(ii)C_6～C_8アリール、および(iii)5員または6員ヘテロアリール、
(l)-C(O)-5員または6員ヘテロアリール、
(m)-C(O)-C_6～C_8アリール、
(n)-COOH、および
(o)-OR_{kk}(R_{kk}は、ハロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシおよびC_1～C_6ハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリールである)であり、
R_2は、
(a)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているC_1～C_6アルキル：(i)5員または6員ヘテロシクロ、(ii)5員または6員ヘテロアリール、(iii)C_6～C_8アリール、(iv)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているアミド、および(v)ヘテロシクロ、アルコキシおよびアルキル(このアルキルは1個以上のアルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミノ、ならびに(vi)-SO_2R_x、
(b)SO_2R_xで場合により置換されているC_2～C_6アルケニル、
(c)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアルキルチオ：(i)アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(ii)5員または6員ヘテロシクロ、(iii)C_6～C_8アリール、および(iv)C_1～C_6アルキル、
(d)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-SO_2R_x：(i)1個以上のC_1～C_6アルキルで場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(ii)5員または6員ヘテロシクロ、(iii)C_6～C_8アリール、および(iv)C_1～C_6アルキル、
(e)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-S(O)R_x：(i)5員または6員ヘテロアリール、(ii)5員または6員ヘテロシクロ、(iii)C_6～C_8アリール、および(iv)C_1～C_6アルキル、
(f)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアルコキシ：(i)ハロ、(ii)ヒドロキシ、(iii)シアノ、(iv)アルコキシで場合により置換されているアルコキシ、(v)-SO_2-C_1～C_4アルキルおよびアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアミノ(このアルキルは以下のもの：5員または6員ヘテロシクロ、および1個以上のアルキルで場合により置換されているアミノ、から独立に選択される1個以上の置換基で置換されている)、(vi)C_1～C_6アルキルで置換されているアミド、(vii)-S-5員または6員ヘテロシクロ、(viii)C_1～C_6アルキルで場合により置換されている-S-5員または6員ヘテロアリール、(ix)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-S-C_1～C_6アルキル：アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、ならびにアルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(x)-S-C_6～C_8アリール、(xi)スルフィニル-5員または6員ヘテロシクロ、(xii)スルフィニル-5員または6員ヘテロアリール、(xiii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているスルフィニル-C_1～C_6アルキル：アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、ならびにアルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(xiv)スルフィニル-C_6～C_8アリール、(xv)スルホニル-5員または6員ヘテロシクロ、(xvi)C_1～C_6アルキルで場合により置換されているスルホニル-5員または6員ヘテロアリール、(xvii)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているスルホニル-C_1～C_6アルキル：アルキル、ハロアキルおよびハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、ならびにアルキル、ハロアキルおよび

ハロから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロアリール、(xviii)スルホニル-C_6～C_8アリール、(xix)ヒドロキシ、=O、ヘテロシクロ、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは以下のもの：C_1～C_6アルコキシ、およびC_6～C_8アリール、から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員～7員ヘテロシクロ、(xx)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール：1個以上のアルコキシで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、4員～7員ヘテロシクロ、およびアルコキシ、ならびに(xxi)C_6～C_8アリール、

(g)C_6～C_8アリール、

(h)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている-(O)-5員または6員ヘテロシクロ：(i)ヒドロキシ、(ii)=O、(iii)C_1～C_6アルキル、(iv)-SO_2R_x、(v)-C(O)-C_6～C_8アリール、(vi)-COR_p、および(vii)-C(O)OR_x、

(i)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている-(O)-5員または6員ヘテロアリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)-CO_2R_x、(xiii)-COR_x、(xiv)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-C(O)NH_2、(xv)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリール、およびC_1～C_6アルキル(このアルキルは、1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、

(j)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている-C(O)-3員～7員ヘテロシクロ：(i)C_6～C_8アリール、(ii)5員または6員ヘテロアリール、および(iii)1個以上のヒドロキシで場合により置換されているC_1～C_6アルキル、

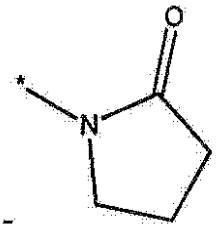
(k)-C(O)-5員または6員ヘテロアリール、

(l)-C(O)-C_6～C_8アリール、

(m)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されているアミノ：(i)-SO_2R_x、(ii)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、COR_xおよびハロアルコキシから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている6員～8員アリール、(iii)アルキル、ハロ、ハロアルキル、シアノ、アルコキシ、ハロアルコキシ、およびハロで場合により置換されているC_6～C_8アリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(iv)ヒドロキシ、アルキルおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_5～C_6ヘテロシクロ、(v)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_7アルキル：(i)アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロアリール、(ii)アルキル、ハロおよびハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、(iii)アルコキシ、ならびに(iv)ハロ、

(n)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員または6員ヘテロアリール：(i)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロおよび5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_1～C_6アルキル、(ii)アルコキシ、(iii)ハロ、(iv)アルキルチオ、(v)ハロアルキル、(vi)シアノ、(vii)1個以上のアルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリー

ルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されているアミノ、(viii)ヘテロシクロ、(ix)ニトロ、(x)ヒドロキシ、(xi)-COOH、(xii)-CO_2R_x、(xiii)-COR_x、(xiv)1個以上のC_1～C_6アルキル(このアルキルは、ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、および5員または6員ヘテロアリールから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている)で場合により置換されている-$C(O)NH_2$、(xv)ハロ、C_1～C_6アルコキシ、ヒドロキシ、5員または6員ヘテロシクロ、5員または6員ヘテロアリールおよびC_1～C_6アルキル(このアルキルは1個以上のC_1～C_6アルコキシで場合により置換されている)から独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているアミド、
(o)以下のものから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されている5員または6員ヘテロシクロ：(i)ヒドロキシ、(ii)=O、(iii)C_1～C_6アルキル、(iv)-SO_2R_x、(v)-C(O)-C_6～C_8アリール、(vi)-COR_p、および(vii)-C(O)OR_x、
(p)-OR_{kk}(R_{kk}は、(i)ハロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシおよびC_1～C_6ハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で場合により置換されているC_6～C_8アリール、(ii)C_1～C_6アルキル(このアルキルはC_6～C_8アリールで場合により置換されている)で場合により置換されている5員～6員ヘテロシクロ、または(iii)ハロ、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6アルコキシおよびC_1～C_6ハロアルキルから独立に選択される1個以上の置換基で置換されている5員～6員ヘテロアリール、(iv)-SO_2R_x、または(v)-Si$(R_x)_3$である)、
(q)-OC(O)NHR_x(R_xは-C_6～C_8アリールで場合により置換されている)、
(r)-OC(O)N$(R_x)_2$、または
【化１１】



(s) -

であり、そして
R_3はニトロである]、
または薬学的に許容されるその塩。
【請求項４】
以下の化合物範囲から選択される化合物：1330～1483、1485～1490、1498～1505、1508、1509、1515、1516、1524～1539,1543～1555、1557～1573、1575、1580、1585～1589、1594～1609、1611～1616,1624～1631、1634、1635、1641、1642、1650～1666、1668～1686、1691～1694、1696～1701、1703～1719、1721～1729、1731～1733、1735、1737、1739、1741～1748、1753～1758、1760、1764、1767～1770、1772～1777、1779～1782、1786、1788、1790、1792、1794、1796～1798、1800、1802、1804、1805、1806、1808、1810、1811、1814、1815、1817、1819、1821～1829、1831、1833～1855、1857～1861、1863～1871、1873～1884、1886～1890、1892、1894、1896、1898、1900、1902、1904、1906、1908、1910、1912、1914、1916～1918、1920、1922～1924、1926、1928、1930、1932、1934、1936～1938、1940、1942、1944、1946～1954、1956、1958～1966、1970～1993、1995～1999、2001、2003～2014、2018～2021、2025～2033、2035～2039、2041、2043、2045、2047、2049、2051～2055、2057、2059、2061、2063～2067、2069、2071、2073～2075、2077、2079、2081～2083、2085、2087、2089、2091～2104、2106～2126、2128、2150、2186、2194、2249～2251、2271～2277、2293～2297、2312、および2600～3348。
【請求項５】
請求項１、２または３のいずれか１項に記載の化合物および1種以上の薬学的に許容される賦形剤を含む組成物。
【請求項６】

C型肝炎ウイルス感染を、その必要のある被験体において治療する方法であって、該被験体に、有効量の1種以上の請求項１、２または３のいずれか１項に記載の化合物、または有効量の1種以上の請求項１、２または３のいずれか１項に記載の化合物を含む医薬組成物を投与することを含む方法。

【請求項７】

内部リボソーム進入部位を含むウイルスによる感染を、その必要のある被験体において治療する方法であって、該被験体に、有効量の1種以上の請求項１、２または３のいずれか１項に記載の化合物、または有効量の1種以上の請求項１、２または３のいずれか１項に記載の化合物を含む医薬組成物を投与することを含む方法。