

【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2010-530004(P2010-530004A)

【公表日】平成22年9月2日(2010.9.2)

【年通号数】公開・登録公報2010-035

【出願番号】特願2010-512418(P2010-512418)

【国際特許分類】

C 0 7 J 31/00 (2006.01)

C 0 7 J 41/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 K 31/568 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 J 31/00

C 0 7 J 41/00

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/568

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月13日(2011.6.13)

【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

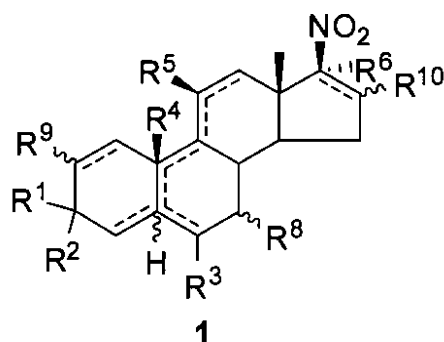
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式1の化合物、およびその立体異性体、ならびに医薬品として許容可能なその組成物：

【化 1】



〔式中、 R^1 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^2 は、OH、または OR^{14} であり、

式中、 R^{14} は、HCO-もしくは（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-（但し、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、および R^{10} = Hであり、 R^4 = CH₃であり、かつ、二重結合が存在しない場合には、 R^{14} はCH₃-CO-ではない）、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-X-CO-、 C_{2-18} アルケニル-X-CO-、 C_{2-18} アルキニル-X-CO-、 C_{6-10} アリール-X-CO-、またはヘテロ環-X-CO-であり；あるいは、 R^{14} は、トリメチルシリルまたはトリエチルシリルであり；あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{2-4} アルキニルであり；あるいは R^{14} は、HO-SO₂-またはその塩であり；

あるいは、 R^2 は、 $NR^{15}R^{16}$ であり、

式中、 R^{15} は、H、OH、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、ヘテロ環であり、

あるいは、 R^{15} は、 OR^{17} であり、式中、 R^{17} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環、 C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；かつ、

式中、 R^{16} は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり、あるいは、 R^{16} は、H-CO-または（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{3-6} シクロアルキル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；

上記式中、Xは、Oまたは NR^{100} であり、式中、 R^{100} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、

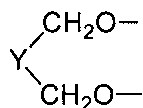
Xは、 NOR^{110} であり、式中、 R^{110} は、H、または C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-12} アリール、またはヘテロアリールであり、これらの基は場合により置換されていてもよく；あるいは、

Xは、(H, H)、(H, OH)、(H, $OSi(C_{1-6}$ アルキル)₃)、または(H, $OCOR^{111}$)であり、式中、 R^{111} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-12} アリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリール、

ヘテロアラルキル、ヘテロアラルケニル、またはヘテロアラルキニルであり、これらの基は場合により置換されていてもよく；あるいは、

Xは、下記式：

【化 2】



〔式中、Yは、 $-(\text{CH}_2)_m-$ であり、式中、mは、0～3の整数であり、あるいは、Yは、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{Z}-(\text{CH}_2)_p-$ であり、式中、nは、0～2の整数であり、pは、0～2の整数であり、Zは、（場合により置換されていてもよい）ヘテロ原子であるか、あるいはZは、1個または2個の C_{1-6} アルキル基で置換された炭素原子である〕であり；

R^3 は、H、ハロゲン、シアノ、アジドまたは（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^4 は、H、または（場合により置換されていてもよい）Meであり；

R^5 は、H、ハロゲン、アジド、シアノ、チオシアノ、 $=\text{O}$ 、OH、 OR^{16} （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりである）であり、または R^5 は、 NH_2 または $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^5 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、または C_{2-4} アルケニルであり；あるいは、 R^5 は、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{16}$ （式中 R^{16} は、先に定義したとおりであり、かつ、n = 0、1、または2である）であり；

R^6 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-8} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^8 は、H、ハロゲン、アジド、シアノ、チオシアノ、 $=\text{O}$ 、OH、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、 NH_2 または $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-18} アルキニル、 C_{2-18} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、 R^8 は、 COOR^{18} 〔式中、 R^{18} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環である〕であり；あるいは、 R^8 は、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{16}$ （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりであり、n = 0、1、または2である）であり；

R^9 は、H、シアノ、アジド、ハロゲン、チオシアノ、OH、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、上述したとおりである）であり、または R^9 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} -アルケニル、ヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；かつ、

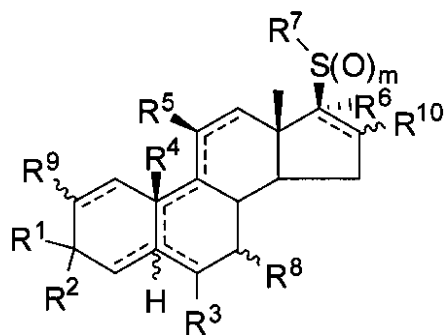
R^{10} は、H、ケト、ハロゲン、シアノ、チオシアノ、アジド、または $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、上述したとおりである）であり；あるいは、 R^{10} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、 R^{10} は、 OR^{16} であり、式中、 R^{16} は、上述したとおりであるか、または R^{16} は、トリメチルシリルまたはトリエチルシリルであり；あるいは、 R^{10} は、 $=\text{CH}_2$ または $=\text{CHR}^{19}$ 〔式中、 R^{19} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{6-10} アリールである〕であり；あるいは、 R^{10} は、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{16}$ （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりであり、かつ、n = 0、1、または2である）で

ある]。

【請求項2】

構造式2の化合物：

【化3】



2

[式中、mは0、1、または2であり、

R^1 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^2 は、OH、または OR^{14} であり、

式中、 R^{14} は、HCO-もしくは（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-（但し、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、および $R^{10} = H$ であり、 $R^4 = CH_3$ であり、かつ、二重結合が存在しない場合には、 R^{14} は CH_3 -CO-ではない）、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-X-CO-、 C_{2-18} アルケニル-X-CO-、 C_{2-18} アルキニル-X-CO-、アリール-X-CO-、またはヘテロ環-X-CO-（式中、Xは、OまたはNHである）であり；あるいは、 R^{14} は、トリメチルシリルまたはトリエチルシリルであり；

あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{2-4} アルキニルであり；あるいは R^{14} は、 $HO-SO_2$ -またはその塩であり；

あるいは、 R^2 は、 $NR^{15}R^{16}$ であり、

式中、 R^{15} は、H、OH、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、ヘテロ環であり、

あるいは、 R^{15} は、 OR^{17} であり、式中、 R^{17} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環、 C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；かつ、

式中、 R^{16} は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり、あるいは、 R^{16} は、H-CO-または（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{3-6} シクロアルキル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；あるいは、 R^{16} は、 C_{1-18} アルキル-X-CO-、 C_{2-18} アルケニル-X-CO-、 C_{2-18} アルキニル-X-CO-、アリール-X-CO-、またはヘテロ環-X-CO-（式中、Xは、OまたはNHである）であり；

R^3 は、H、ハロゲン、シアノ、アジドまたは（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^4 は、H、または（場合により置換されていてもよい）Meであり；

R^5 は、H、ハロゲン、アジド、シアノ、チオシアノ、 $=O$ 、 OH 、 OR^{16} （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりである）であり、または R^5 は、 NH_2 または $NR^{15}R^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^5 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、または C_{2-4} アルケニルであり；あるいは、 R^5 は、 $S(O)_n R^{16}$ （式中 R^{16} は、先に定義したとおりであり、かつ、 $n = 0, 1$ 、または2である）であり；

R^6 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-8} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^7 は、H、シアノ、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-8} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^8 は、H、ハロゲン、アジド、シアノ、チオシアノ、 $=O$ 、 OH 、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、 NH_2 または $NR^{15}R^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-18} アルキニル、 C_{2-18} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、 R^8 は、 $COOR^{18}$ 〔式中、 R^{18} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環である〕であり；あるいは、 R^8 は、 $S(O)_n R^{16}$ （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりであり、 $n = 0, 1$ 、または2である）であり；

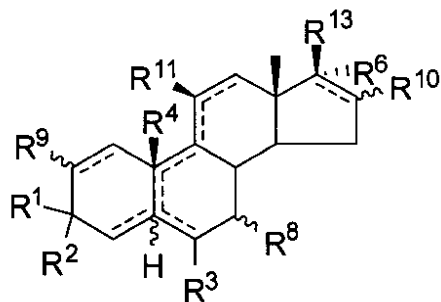
R^9 は、H、シアノ、アジド、ハロゲン、チオシアノ、 OH 、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、上述したとおりである）であり、あるいは、 R^9 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、ヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；かつ、

R^{10} は、H、ケト、ハロゲン、シアノ、チオシアノ、アジド、または $NR^{15}R^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、上述したとおりである）であり；あるいは、 R^{10} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、 R^{10} は、 OR^{16} であり、式中、 R^{16} は、上述したとおりであるか、または R^{16} は、トリメチルシリルまたはトリエチルシリルであり；あるいは、 R^{10} は、 $=CH_2$ または $=CHR^{19}$ 〔式中、 R^{19} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{6-10} アリールである〕であり；あるいは、 R^{10} は、 $S(O)_n R^{16}$ （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりであり、かつ、 $n = 0, 1$ 、または2である）である〕。

【請求項 3】

構造式3の化合物、およびその立体異性体、ならびに医薬品として許容可能なその組成物：

【化 4】



3

〔式中、 R^1 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環、2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^2 は、OH、または OR^{14} であり、式中、 R^{14} は、 $HCO-$ もしくは（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-（但し、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、および $R^{10} = H$ であり、 $R^4 = CH_3$ であり、かつ、二重結合が存在しない場合には、 R^{14} は CH_3-CO- ではない）、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-X-CO-、 C_{2-18} アルケニル-X-CO-、 C_{2-18} アルキニル-X-CO-、 C_{6-10} アリール-X-CO-、またはヘテロ環-X-CO-であり；あるいは、 R^{14} は、トリメチルシリルまたはトリエチルシリルであり；あるいは、 R^{14} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{2-4} アルキニルであり；あるいは R^{14} は、 $HO-SO_2-$ またはその塩であり；

あるいは、 R^2 は、 $NR^{15}R^{16}$ であり、

式中、 R^{15} は、H、OH、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、ヘテロ環であり、

あるいは、 R^{15} は、 OR^{17} であり、式中、 R^{17} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環、 C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；かつ、

式中、 R^{16} は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり、あるいは、 R^{16} は、 $H-CO-$ または（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル-CO-、 C_{2-18} アルケニル-CO-、 C_{2-18} アルキニル-CO-、 C_{3-6} シクロアルキル-CO-、 C_{6-10} アリール-CO-、またはヘテロ環-CO-であり；

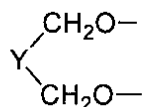
式中、X は、Oまたは NR^{100} であり、式中、 R^{100} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、

X は、 NOR^{110} であり、式中、 R^{110} は、H、または C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-12} アリール、またはヘテロアリールであり、これらの基は場合により置換されていてもよく；あるいは、

X は、(H, H)、(H, OH)、(H, $OSi(C_{1-6}$ アルキル) $_3$)、または(H, $OCOR^{111}$)であり、式中、 R^{111} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-12} アリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロアラルケニル、またはヘテロアラルキニルであり、これらの基は場合により置換されていてもよく；あるいは、

X は、下記式で表され：

【化 5】



〔式中、Yは、 $-(\text{CH}_2)_m-$ であり、式中、mは、0～3の整数であり、あるいは、Yは、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{Z}-(\text{CH}_2)_p-$ であり、式中、nは、0～2の整数であり、pは、0～2の整数であり、Zは、（場合により置換されていてもよい）ヘテロ原子であるか、あるいはZは、1個または2個の C_{1-6} アルキル基で置換された炭素原子である〕；

R^3 は、H、ハロゲン、シアノ、アジドまたは（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

R^4 は、H、または（場合により置換されていてもよい）Meであり；

R^6 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-8} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；

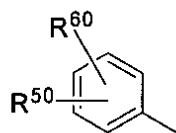
R^8 は、H、ハロゲン、アジド、シアノ、チオシアノ、 $=\text{O}$ 、OH、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、 NH_2 または $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ （式中、 R^{15} および R^{16} は、先に定義したとおりである）であり；あるいは、 R^8 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-18} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-18} アルキニル、 C_{2-18} アルケニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環であり；あるいは、 R^8 は、 COOR^{18} 〔式中、 R^{18} は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環である〕であり；あるいは、 R^8 は、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{16}$ （式中、 R^{16} は、先に定義したとおりであり、 $n = 0, 1$ 、または2である）であり；

R^9 は、H、シアノ、アジド、ハロゲン、チオシアノ、OH、または OR^{16} （式中、 R^{16} は、上述したとおりである）であり、または R^9 は、（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} -アルケニル、ヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；かつ、

R^{11} は、 C_{1-18} アルキル、 C_{2-18} アルケニル、 C_{2-18} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{6-12} アリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロアラルケニル、またはヘテロアラルキニルであり、これらは任意に置換されていてもよく；

あるいは、 R^{11} は、下記式で表され；

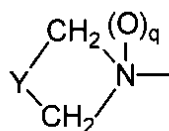
【化 6】



式中、 R^{50} および R^{60} は、それぞれ独立に、H、ハロゲン； $(\text{R}^{70}\text{R}^{80}\text{N}(\text{O})_r)-$ であり、式中、rは、0または1であり、

R^{70} および R^{80} は、それぞれ独立に、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、または C_{2-6} アルキニル（これらは任意に置換されていてもよい）；下記構造式II：

【化 7】

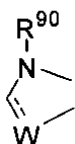


II

〔式中、 q は、0または1であり、 Y は、 $-(CH_2)_m-$ （式中、 m は、0～5の整数である）であり、あるいは、 Y は、 $-(CH_2)_n-Z-(CH_2)_p-$ （式中、 n は、0～2の整数であり、 p は、0～2の整数であり、 Z は、場合により置換されていてもよいヘテロ原子であり、かつ、 CH_2 基は、場合により置換されていてもよい）； N -イミダゾリル； N -ピロリル-； $HO-$ ； CF_3SO_2O- ； C_{1-6} アルキル- $O-$ ； C_{1-6} パーフルオロアルキル- $O-$ ； C_{1-6} アルキル- $S-$ ； C_{1-6} アルキル- $CH(OH)-$ ； $NC-$ ； $HCC-$ ； C_6H_5CC- ；2'-フリル；3'-フリル；2'-チオフエニル；3'-チオフエニル；2'-ピリジル；3'-ピリジル；4'-ピリジル；2'-チアゾリル；2'- N -メチルイミダゾリル；5'-ピリミジニル； C_6H_5- ； $H_2C=CH-$ ； C_{1-6} アルキル； $MeC(=CH_2)-$ ； C_{1-6} アルキル- CO ； HCO ； C_{1-6} アルキル； $C=NOR^{120}$ または $HC=NOR^{120}$ （式中、 R^{120} は、 H 、または C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{6-12} アリール、またはヘテロアリールであり、これらは任意に置換されていてもよい）〕であり；

あるいは、 R^{50} および R^{60} は、組み合わせられて以下の環：

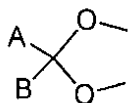
【化 8】



（式中、 W は、 CH_2 、 CH 、 NH 、 N 、 O 、または S であり、かつ、 R^{90} は、 H または C_{1-6} アルキルである）を形成してよく；

あるいは、 R^{50} および R^{60} は、組み合わせられて以下の環：

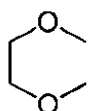
【化 9】



（式中、 A および B は、それぞれ独立に、 H 、 F 、または $C_{1-6}alkyl$ であり、あるいは A および B は、組み合わせられて $=O$ を形成する）を形成してよく；

あるいは、 R^{50} および R^{60} は、組み合わせられて以下の環：

【化 10】



（式中、 CH_2 基は、それぞれ独立に、任意に置換されていてもよい）を形成してよく；かつ、

R^{13} は、水素、チオ- C_{1-4} -アルキル、チオ- C_{2-4} -アルケニル、ニトロ、シアノ、 C_{1-4} アルコキシ、置換 C_{1-4} アルコキシ、 C_{2-4} アルケニルオキシ、アミノカルボニル、モノ- C_{1-4} -アルキルアミノカルボニル、ジ- C_{1-4} -アルキルアミノカルボニル、スルフィニル、スルホニル、チオ、スルホンアミド、 C_{2-4} -アルキニルオキシ、場合により置換されていてもよい C_{6-10} アリールオキシ、場合により置換されていてもよい C_{6-10} アリール- C_{1-4} -アルキルオキシ、場合により置換されていてもよい、アセチル基の1,3-ジオキソラン-4-オン、

場合により置換されていてもよい、アセチル基の1,3-ジオキサン-4-オン、場合により置換されていてもよい、アセチル基の1,3-オキサチオラン-5-オン、場合により置換されていてもよい、アセチル基の1,3-オキサチオアン-5-オン、 $-O-C(=O)-NR'R''$ 、 $-C(=O)-CH_2-J-G$ 、

$-C(=O)-CH_2-O-T$ 、 $-C(=O)-CH_2-O-E$ 、 $-C(=O)-CH_2-Q-G$ 、 $-C(=O)-CH_2-J'-Q-G$ 、または $-C(=O)-CH_2-J'-Q-L$ のうちの1つであり；

上記式中、 R' および R'' は、独立に、水素、または場合により置換されていてもよい C_{1-4} アルキルを表し、あるいは互いに一緒になってこれらが結合している窒素と共に3～6員ヘテロ環を形成し；

J は、 S 、 SO 、または SO_2 のうちの1つであり；

J' は、 O 、 S 、 SO 、または SO_2 のうちの1つであり；

Q は、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、または C_{2-4} アルキニルのうちの1つであり；

G は、 C -に結合したヘテロ- C_{5-10} -アリール、場合により置換されていてもよい C_{6-10} アリール、窒素含有ヘテロ- C_{5-10} -アリール基の四級アンモニウム塩、またはアミノ置換 C_{6-10} アリール基の四級アンモニウム塩のうちの1つであり；

T は、 C -に結合したヘテロ- C_{5-10} -アリール、または窒素含有ヘテロ- C_{5-10} -アリール基の四級アンモニウム塩であり；

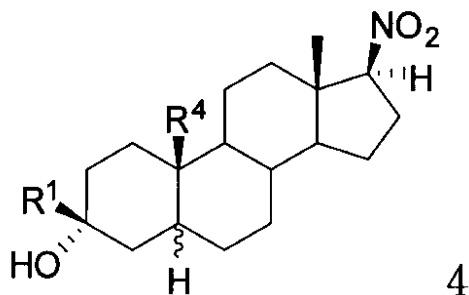
E は、場合により置換されていてもよい C_{6-10} アリール、またはアミノ置換 C_{6-10} アリール基の四級アンモニウム塩であり；

L は、アミノ、アミド、シアノ、チオシアノ、アジド、ニトロ、ヒドロキシ、ハロ、カルボキシル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 C_{1-4} アルカノイルオキシ、水素、スルフェート、チオスルフェート、スルホネート、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{1-4} アルキルスルフィニル、 C_{1-4} アルキルスルホニル、またはメルカプトのうちの1つである]。

【請求項4】

構造式4の化合物、およびその立体異性体、ならびに医薬品として許容可能なその組成物；

【化11】



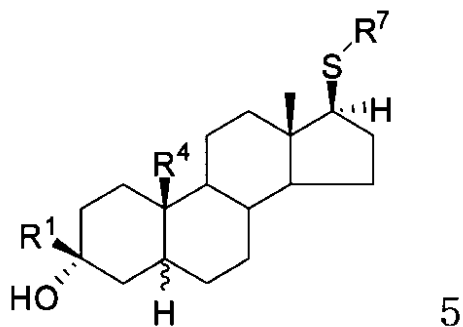
[式中、 R^1 は、 H 、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；

R^4 は、 H または Me である]。

【請求項5】

構造5の化合物、およびその立体異性体、ならびに医薬品として許容可能なその組成物；

【化 1 2】



〔式中、 R^1 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環、2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；

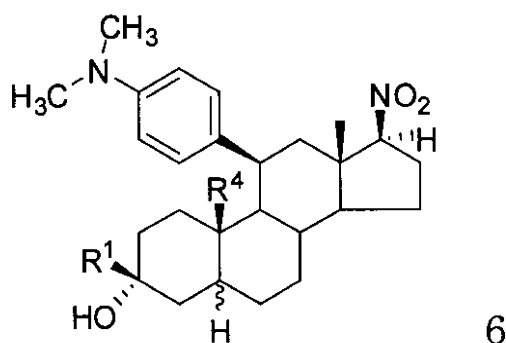
R^4 は、HまたはMeであり；かつ、

R^7 は、H、シアノ、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-8} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{6-10} アリール、またはヘテロ環である〕。

【請求項 6】

構造6の化合物、およびその立体異性体、ならびに医薬品として許容可能なその組成物：

【化 1 3】



〔式中、 R^1 は、H、または（場合により置換されていてもよい） C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{6-10} アリール、2-アリール置換エチニル、アリール置換 C_{1-4} アルキル、アリール置換 C_{2-4} -アルケニル、アリール置換 C_{3-6} シクロアルキル、ヘテロ環；2-ヘテロ環-置換エチニル、ヘテロ環-置換 C_{1-4} アルキル、ヘテロ環-置換 C_{2-4} アルケニル、またはヘテロ環-置換 C_{3-6} シクロアルキルであり；かつ、

R^4 は、HまたはMeである〕。

【請求項 7】

生物学的活性化合物の合成中間体としての、請求項 1 ～ 6 いずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 8】

ヒトまたは動物における、痙攣、てんかん、鬱病、薬物およびアルコール依存症、不安、記憶障害、ならびに神経系損傷の治療のための医薬の調製のための、請求項 1 ～ 6 いずれか一項に記載の化合物の使用。