

【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28年5月12日(2016.5.12)

【公表番号】特表2015-510894(P2015-510894A)

【公表日】平成27年4月13日(2015.4.13)

【年通号数】公開・登録公報2015-024

【出願番号】特願2015-500618(P2015-500618)

【国際特許分類】

C 07 D 231/38 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
A 61 K 31/415 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
A 61 K 31/4184 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
A 61 K 31/4178 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
C 07 D 409/14 (2006.01)
A 61 K 31/4196 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
A 61 K 31/427 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 9/20 (2006.01)
A 61 K 9/48 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 7/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 37/08 (2006.01)
A 61 P 11/02 (2006.01)
A 61 P 17/04 (2006.01)
A 61 P 27/14 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 17/10 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)

C 0 7 D 231/56 (2006.01)
A 6 1 K 31/416 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 231/38 B
C 0 7 D 403/12 C S P
A 6 1 K 31/415
A 6 1 K 31/4155
A 6 1 K 31/4184
A 6 1 K 31/506
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/4439
C 0 7 D 405/12
A 6 1 K 31/4178
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/496
C 0 7 D 409/14
A 6 1 K 31/4196
C 0 7 D 417/12
A 6 1 K 31/427
C 0 7 D 409/12
A 6 1 K 31/454
C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 413/12
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/48
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 7/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 17/04
A 6 1 P 27/14
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 17/10
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 29/00 1 0 1
C 0 7 D 231/56 Z
A 6 1 K 31/416

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月11日(2016.3.11)

【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

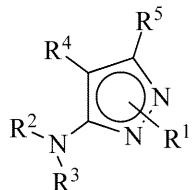
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IAの化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化1】



(IA)

(式中：

R¹は、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；

R²は、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；

R³は、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、又は-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；

R⁴は、シアノ、アミノカルボニル、-C(O)N=CR^{4a}R^{4b}、又は-C(O)NR^{4a}R^{4b}であり；

ここで：

R^{4a}は、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

R^{4b}は、独立に、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、又は-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；

R⁵は、-N(R^{5e})CR^{5a}R^{5c}R^{5d}であり；

ここで：

R^{5a}は、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；

R^{5c}及びR^{5d}は、各々独立に、水素、ハロ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

R^{5e}は、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、又は-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；かつ

各々のR^{1a}、R^{1b}、R^{1c}、及びR^{1d}は、独立に、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、もしくはヘテロシクリルであるか；又はR^{1a}及びR^{1c}は、それらが結合しているC及びN原子と一緒に、ヘテ

ロシクリルを形成するか；又はR^{1b}及びR^{1c}は、それらが結合しているN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成し；

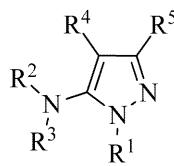
ここで、各々のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリルは、1以上の置換基Qで任意に置換されており、ここで、各々のQは、独立に、(a)オキソ、シアノ、ハロ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b)その各々が、1以上の置換基Q^aでさらに任意に置換されている、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル；並びに(c)-B(R^a)OR^d、-B(OR^a)OR^d、-C(O)OR^a、-C(O)NR^bR^c、-C(NR^a)NR^bR^c、-OR^a、-OC(O)R^a、-OC(O)OR^a、-OC(O)NR^bR^c、-OC(=NR^a)NR^bR^c、-OS(O)R^a、-OS(O)₂R^a、-OS(O)NR^bR^c、-OS(O)₂NR^bR^c、-NR^bR^c、-NR^aC(O)R^d、-NR^aC(O)OR^d、-NR^aC(O)NR^bR^c、-NR^aC(=NR^d)NR^bR^c、-NR^aS(O)R^d、-NR^aS(O)₂R^d、-NR^aS(O)NR^bR^c、-NR^aS(O)₂NR^bR^c、-P(O)R^aR^d、-P(O)(OR^a)R^d、-P(O)(OR^a)(OR^d)、-SR^a、-S(O)R^a、-S(O)₂R^a、-S(O)NR^bR^c、及び-S(O)₂NR^bR^cから選択され、ここで、各々のR^a、R^b、R^c、及びR^dは、独立に、(i)水素；(ii)1以上の置換基Q^aで各々任意に置換された、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、もしくはヘテロシクリル-C₁₋₆アルキルであるか；又は(iii)R^b及びR^cは、それらが結合しているN原子と一緒に、1以上の置換基Q^aで任意に置換されたヘテロシクリルを形成し；

ここで、各々のQ^aは、独立に、(a)オキソ、シアノ、ハロ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b)C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル；並びに(c)-B(R^e)OR^g、-B(OR^e)OR^g、-C(O)R^e、-C(O)OR^e、-C(O)NR^fR^g、-C(NR^e)NR^fR^g、-OR^e、-OC(O)R^e、-OC(O)OR^e、-OC(O)NR^fR^g、-OC(=NR^e)NR^fR^g、-OS(O)R^e、-OS(O)₂R^e、-OS(O)NR^fR^g、-OS(O)₂NR^fR^g、-NR^fR^g、-NR^eC(O)R^h、-NR^eC(O)OR^f、-NR^eC(O)NR^fR^g、-NR^eC(=NR^h)NR^fR^g、-NR^eS(O)R^h、-NR^eS(O)₂R^h、-NR^eS(O)NR^fR^g、-NR^eS(O)₂NR^fR^g、-P(O)R^eR^h、-P(O)(OR^e)R^h、-P(O)(OR^e)(OR^h)、-SR^e、-S(O)R^e、-S(O)₂R^e、-S(O)NR^fR^g、及び-S(O)₂NR^fR^gからなる群から選択され；ここで、各々のR^e、R^f、R^g、及びR^hは、独立に、(i)水素；(ii)C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、もしくはヘテロシクリル-C₁₋₆アルキルであるか；又は(iii)R^f及びR^gは、それらが結合しているN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成する)。

【請求項2】

式Iの構造を有する、請求項1記載の化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化2】

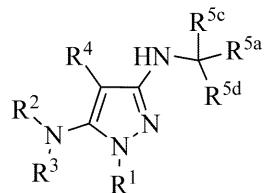


(I)

；又は、

式XIIIの構造を有する、請求項1記載の化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化3】



(XIII)

。

【請求項3】

R^2 が、その各々が、1つ、2つ、3つ、4つ、又は5つの置換基Qで任意に置換されている、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、又はヘテロアリールであるか；又は
 R^2 が、1以上の置換基Qで任意に置換された C_{3-10} シクロアルキルであるか；又は
 R^2 が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、又はシクロヘプチルであるか；又は
 R^2 が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、シクロプロピル又はシクロヘキシルであるか；又は
 R^2 が、1以上の置換基Qで任意に置換されたヘテロアリールであるか；又は
 R^2 が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、5又は6員ヘテロアリールであるか；又は
 R^2 が、1以上の置換基Qで任意に置換されたピリジニルである、請求項1又は2記載の化合物。

【請求項4】

R^2 が、その各々が1つ、2つ、3つ、4つ、又は5つの置換基Qで任意に置換されている、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、又はヘテロアリールであり、
ここで、各々の置換基Qが、独立に、シアノ、ニトロ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} アルコキシから選択され、ここで、該アルキル及びアルコキシは、1以上の置換基Q^aで各々任意に置換されているか；又は

各々の置換基Qが、独立に、シアノ、ニトロ、クロロ、メチル、ブチル、及びメトキシから選択される、請求項3記載の化合物。

【請求項5】

R^2 が、その各々が、1つ、2つ、3つ、4つ、又は5つの置換基Qで任意に置換されている、シクロプロピル、シクロヘキシル、フェニル、又はピリジニルであり、
ここで、任意に、各々の置換基Qが、独立に、シアノ、ニトロ、ハロ、 C_{1-6} アルキル、及び C_{1-6} アルコキシから選択され、ここで、該アルキル及びアルコキシは、1以上の置換基Q^aで各々任意に置換されているか；又は

ここで、任意に、各々の置換基Qが、独立に、シアノ、ニトロ、クロロ、メチル、ブチル、及びメトキシから選択され、

ここで、任意に、 R^2 が、シクロプロピル、シクロヘキシル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2,3,4,5-テトラクロロフェニル、4-シアノフェニル、4-ニトロフェニル、4-t-ブチルフェニル、3,5-ジメチルフェニル、4-メトキシフェニル、又はピリジン-3-イルである、請求項4記載の化合物。

【請求項6】

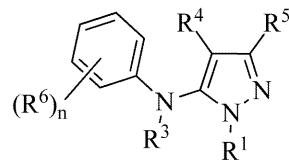
R^2 が、1以上の置換基Qで任意に置換された C_{6-14} アリールである、請求項3記載の化合物。

【請求項7】

式IVの構造を有する、請求項3記載の化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれら

の医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化4】



(IV)

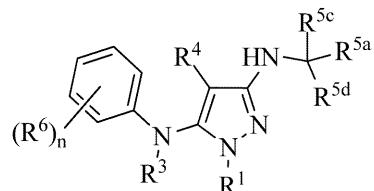
(式中：

各々のR⁶は、独立に、(a)シアノ、ハロ、もしくはニトロ；(b)その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、もしくはヘテロシクリル；又は(c)-B(R^{1a})OR^{1d}、-B(OR^{1a})OR^{1d}、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-OR^{1a}、-OC(O)R^{1a}、-OC(O)OR^{1a}、-OC(O)NR^{1b}R^{1c}、-OC(=NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-OS(O)R^{1a}、-OS(O)₂R^{1a}、-OS(O)NR^{1b}R^{1c}、-OS(O)₂NR^{1b}R^{1c}、-NR^{1b}R^{1c}、-NR^{1a}C(O)R^{1d}、-NR^{1a}C(O)OR^{1d}、-NR^aC(O)NR^{1b}R^{1c}、-NR^{1a}C(=NR^{1d})NR^{1b}R^{1c}、-NR^{1a}S(O)R^{1d}、-NR^{1a}S(O)₂R^{1d}、-NR^{1a}S(O)NR^{1b}R^{1c}、-NR^{1a}S(O)₂NR^{1b}R^{1c}、-SR^{1a}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、もしくは-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；かつ

nは、0、1、2、3、4、又は5の整数である)；
又は、

式XVの構造を有する、請求項3記載の化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化5】



(XV)

。

【請求項8】

R^{5c}が水素である、請求項1～7のいずれか一項記載の化合物。

【請求項9】

R^{5d}が水素である、請求項1～8のいずれか一項記載の化合物。

【請求項10】

R^{5a}が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであるか；又は

R^{5a}が、その各々が、1つ、2つ、3つ、4つ、又は5つの置換基Qで任意に置換されている、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり、ここで、各々の置換基Qは、独立に、(a)ハロ、シアノ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b)その各々が1以上の置換基Qでさらに任意に置換されている、C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル；並びに(c)-B(R^{1a})OR^{1d}、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-OR^{1a}、-NR^{1b}R^{1c}、及び-S(O)₂R^{1a}から選択され、

ここで、任意に、各々の置換基Qが、独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、ニトロ、ペンタフルオロスルファニル、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、フェニルチオメチル、フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、チエニル、トリア

ゾリル、ピリジニル、ベンゾイミダゾリル、メチルピペラジニル、テトラヒドロピロリル、モルホリニル、ヒドロキシル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、フルオロベンジルオキシ、クロロチアゾリルメトキシ、ピリミジニルオキシ、トリフルオロメチルピリミジニルオキシ、トリフルオロメチルピリジニルオキシ、ヒドロキシエトキシ、ヒドロキシカルボニルメトキシ、アミノ、ジメチルアミノ、ヒドロキシボリル、アセチル、ベンジルオキシカルボニル、メチルスルホニル、及びフェニルスルホニルから選択される、請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項11】

R^{5a} が、1以上の置換基Qで任意に置換された C_{6-14} アリールであるか；又は
 R^{5a} が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、フェニル又はナフチルであるか；又は

R^{5a} が、1以上の置換基Qで任意に置換されたヘテロアリールであるか；又は

R^{5a} が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、フラニル ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾ[d][1,2,3]チアジアゾリル、又は4H-ベンゾ[d][1,3]ジオキシニルであるか；又は

R^{5a} が、1以上の置換基Qで任意に置換されたヘテロシクリルであるか；又は

R^{5a} が、その各々が1以上の置換基Qで任意に置換されている、テトラヒドロピロリル、ペリジニル、又はピペラジニルであるか；又は

R^{5a} が、(i)フェニル又はナフト-1-イル；(ii)4-クロロフェニル、4-シアノフェニル、4-ニトロフェニル、4-ペンタフルオロスルファニルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-チエン-2-イルフェニル、4-(4H-1,2,4-トリアゾール-4-イル)フェニル、4-ピリジン-2-イルフェニル、4-(ベンゾイミダゾール-1-イル)フェニル、4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、3-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル、4-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル、4-(4-フルオロベンジルオキシ)フェニル、3-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニル、2-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニル、4-(4-トリフルオロメチルピリミジン-2-イルオキシ)フェニル、4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル、4-(ピリミジン-2-イルオキシ)フェニル、4-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)フェニル、2-(ヒドロキシカルボニルメトキシ)フェニル、もしくは4-メチルスルホニルフェニル；(iii)2-フルオロ-6-クロロフェニル、4-フルオロ-3-シアノフェニル、4-フルオロ-2-メチルフェニル、4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル、5-フルオロ-2-メトキシフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、5-フルオロ-2-メトキシフェニル、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル、2,4-ジクロロフェニル、2-クロロ-6-ヒドロキシフェニル、4-クロロ-2-ヒドロキシフェニル、5-クロロ-2-ヒドロキシフェニル、5-ブロモ-2-ヒドロキシフェニル、2-ニトロ-5-ヒドロキシフェニル、3-ニトロ-4-ヒドロキシフェニル、4-ニトロ-3-ヒドロキシフェニル、5-ニトロ-2-ヒドロキシフェニル、3-ニトロ-4-メトキシフェニル、5-トリフルオロメチル-2-メトキシフェニル、2-ヒドロキシ-4-メチルフェニル、2,4-ジヒドロキシフェニル、2,5-ジヒドロキシフェニル、2-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル、2-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル、2-ヒドロキシ-6-メトキシフェニル、4-ヒドロキシ-3-メトキシフェニル、3-ヒドロキシ-4-ジフルオロメトキシフェニル、3-メトキシ-4-(2-クロロチアゾール-5-イルメトキシ)フェニル、もしくは5-(ヒドロキシボリル)-2-メトキシフェニル；(iv)3,5-ジフルオロ-4-ヒドロキシフェニル、2,4-ジクロロ-6-ヒドロキシフェニル、2,3-ジメチル-4-メトキシフェニル、4-ヒドロキシ-3,5-ジメチルフェニル、4-ヒドロキシ-2,6-ジメチルフェニル、4-ヒドロキシ-3,5-ジメチルフェニル、2,4,6-トリヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル、もしくは4-ヒドロキシ-5-メトキシ-3-ジメチルアミノフェニル；(v)5-(4-クロロフェニル)フラン-2-イル、5-(ヒドロキシメチル)フラン-2-イル、ピロール-2-イル、ピロール-3-イル、1-フェニルスルホニルピロール-2-イル、チエン-2-イル、2-(ピリジン-2-イル)チエン-5-イル、3-(4-フルオロフェニル)ピラゾール-4-イル、3-クロロ-5-トリフルオロ

メチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-フェニルチオメチル-5-クロロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-クロロピラゾール-4-イル、3-(4-フルオロフェニル)ピラゾール-4-イル、イミダゾール-4-イル、2-エチル-5-メチルイミダゾール-4-イル、2-フェニル-5-クロロイミダゾール-4-イル、5-メチルイソオキサゾール-5-イル、2-クロロ-チアゾール-5-イル、2-アミノチアゾール-5-イル、4-メチルチアゾール-5-イル、2-テトラヒドロピロール-1-イルピリジン-3-イル、3-テトラヒドロピロール-1-イルピリジン-5-イル、2-(モルホリン-4-イル)ピリジン-5-イル、2-クロロピリジン-3-イル、2-クロロピリジン-5-イル、2-クロロピリジン-6-イル、3-フルオロピリジン-2-イル、2-メトキシピリジン-5-イル、ピラジン-2-イル、3,5-ジクロロピラジン-2-イル、ベンゾ[d][1,2,3]チアジアゾール-5-イル、2-メチルインドール-3-イル、1-メチル-2-クロロインドール-3-イル、4,5,6,7-テトラフルオロインドール-3-イル、6-フルオロ-4H-ベンゾ[d][1,3]ジオキシン-8-イル、もしくはベンゾイミダゾール-2-イル；又は(vi)1-(ベンジルオキシカルボニル)テトラヒドロピロール-2-イル、ピペリジン-4-イル、1-メチルスルホニルピペリジン-4-イル、もしくは4-アセチルピペラジン-1-イルである、請求項10記載の化合物。

【請求項12】

R^{5a} が、その各々が、1つ、2つ、3つ、4つ、又は5つの置換基Qで任意に置換されている、フェニル、ナフチル、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピリジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾ[d][1,2,3]チアジアゾリル、4H-ベンゾ[d][1,3]ジオキシニル、テトラヒドロピロリル、ピペリジニル、又はピペラジニルであり、

ここで、任意に、各々の置換基Qが、独立に、(a)ハロ、シアノ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b)その各々が1以上の置換基Qでさらに任意に置換されている、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-14} アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル；並びに(c)-B(R^{1a})OR^{1d}、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-OR^{1a}、-NR^{1b}R^{1c}、及び-S(O)₂R^{1a}から選択されるか、又は

ここで、任意に、各々の置換基Qが、独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、ニトロ、ペンタフルオロスルファニル、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、フェニルチオメチル、フェニル、フルオロフェニル、クロロフェニル、チエニル、トリアゾリル、ピリジニル、ベンゾイミダゾリル、メチルピペラジニル、テトラヒドロピロリル、モルホリニル、ヒドロキシル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、フルオロベンジルオキシ、クロロチアゾリルメトキシ、ピリミジニルオキシ、トリフルオロメチルピリミジニルオキシ、トリフルオロメチルピリジニルオキシ、ヒドロキシエトキシ、ヒドロキシカルボニルメトキシ、アミノ、ジメチルアミノ、ヒドロキシボリル、アセチル、ベンジルオキシカルボニル、メチルスルホニル、及びフェニルスルホニルから選択される、請求項10記載の化合物。

【請求項13】

R^3 が、任意に、水素であり、

R^1 が、任意に、水素であり、

R^4 がCN、アミノカルボニル又は-C(O)N=CR^{4a}R^{4b}であり、

任意にR^{4b}が水素であり、

R^{4a} が、1以上の置換基Qで任意に置換された C_{6-14} アリールであるか、又は

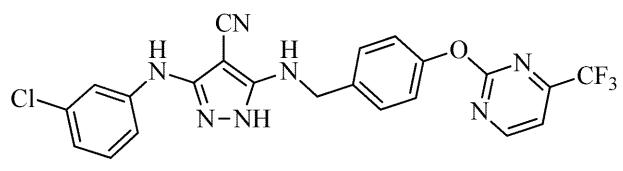
任意にR^{4a}が、1以上の置換基Qで任意に置換されたフェニルであるか、又は

任意にR^{4a}がメトキシフェニルである、請求項1～12のいずれか一項記載の化合物。

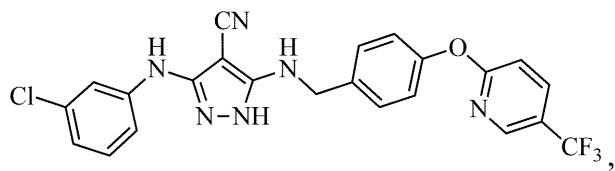
【請求項14】

下記からなる群から選択される、請求項1記載の化合物、並びにその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、及び同位体変種；並びにそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、及び水和物：

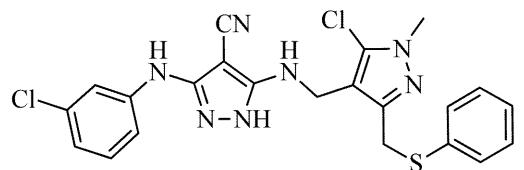
【化 6】



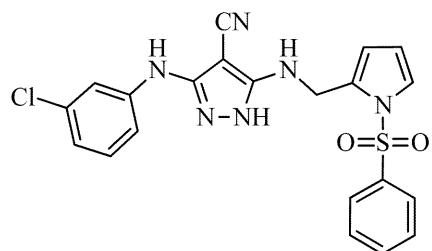
C1



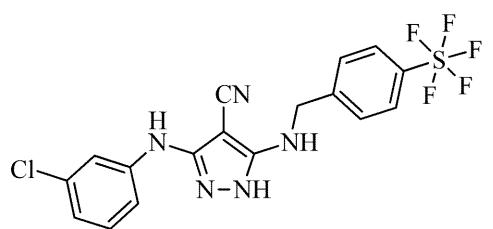
C2



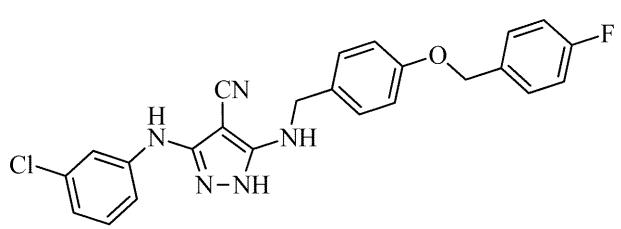
C3



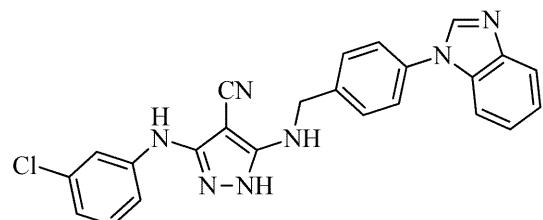
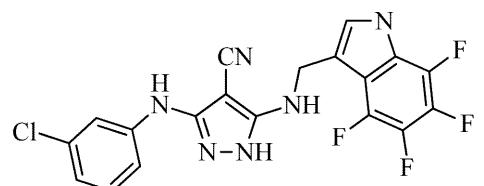
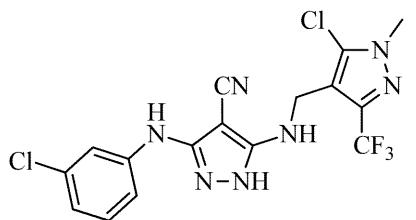
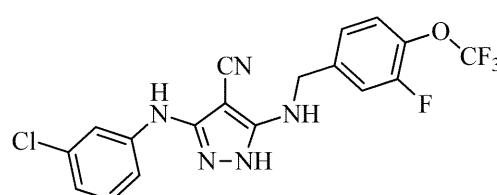
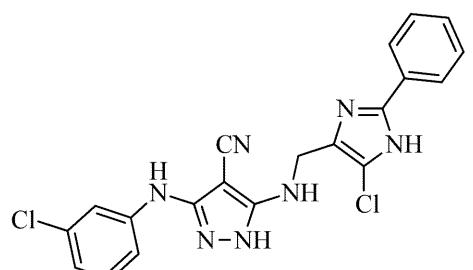
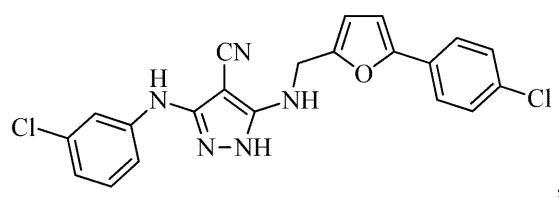
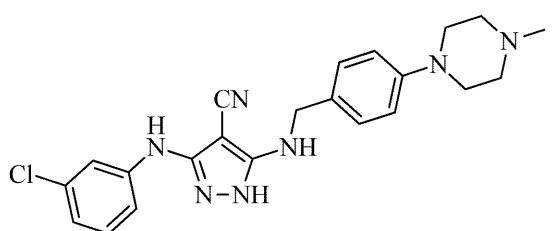
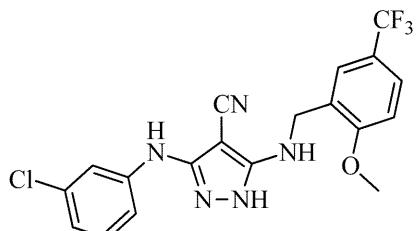
C4

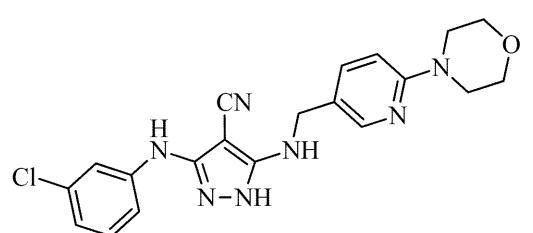
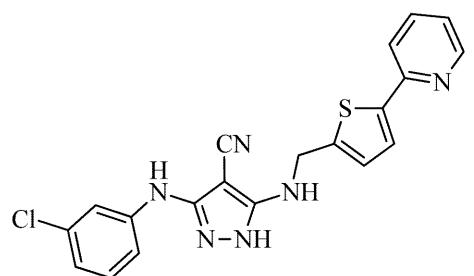
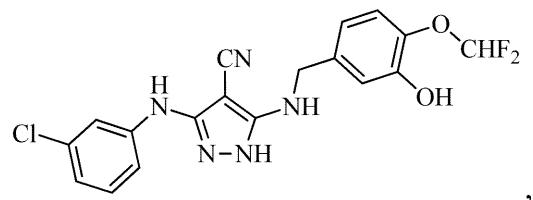
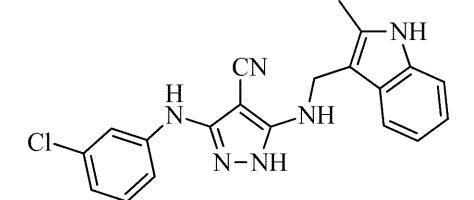
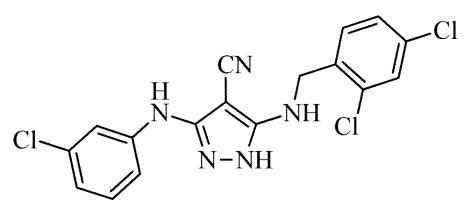
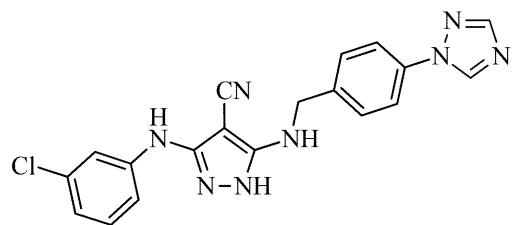
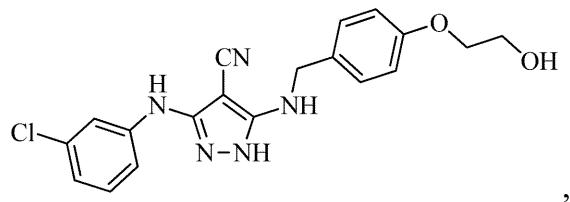
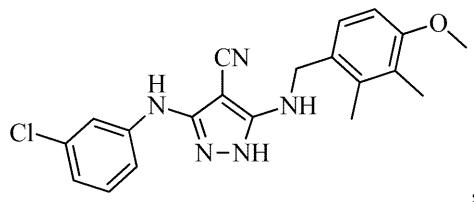


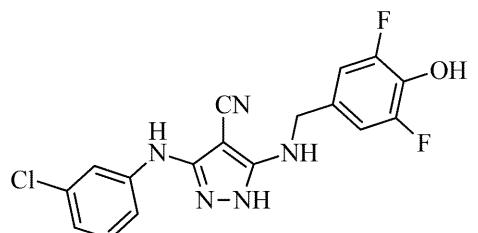
C5



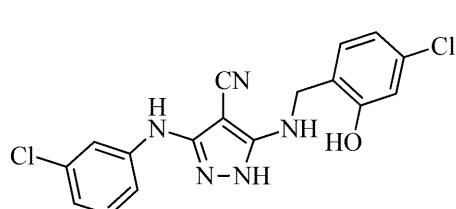
C6

**C7****C8****C9****C10****C11****C12****C13****C14**

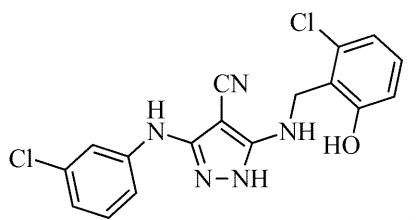
**C15****C16****C17****C18****C19****C20****C21****C22**



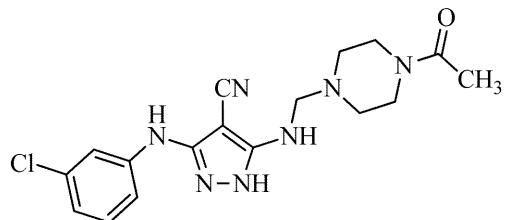
C23



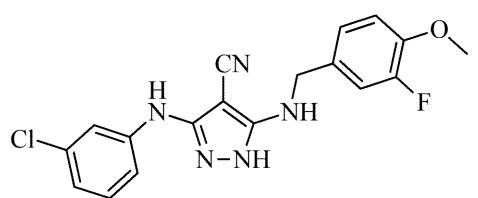
C24



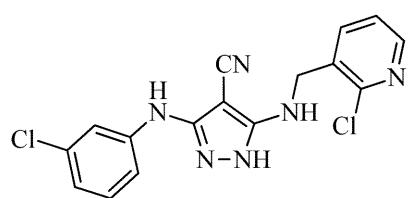
C25



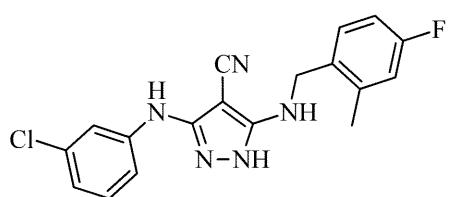
C26



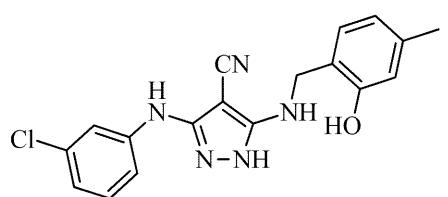
C27



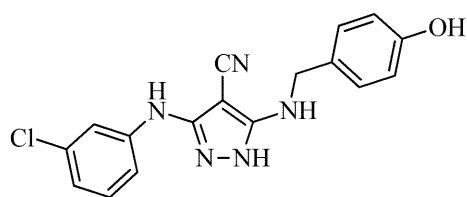
C28



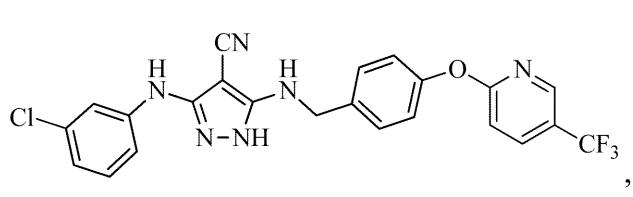
C29



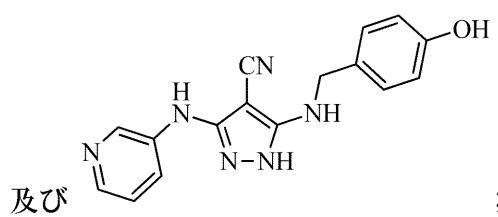
C30



C31



C32



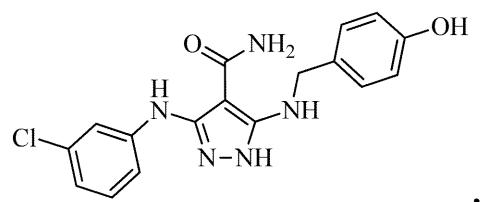
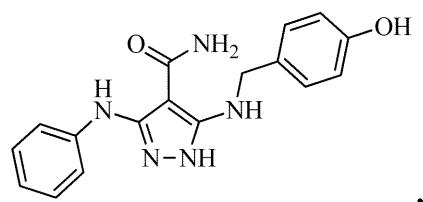
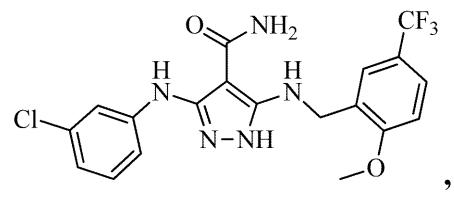
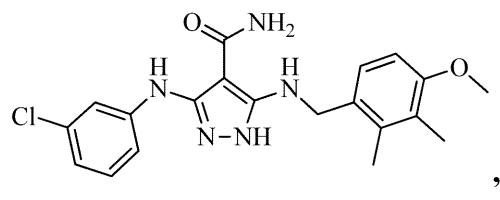
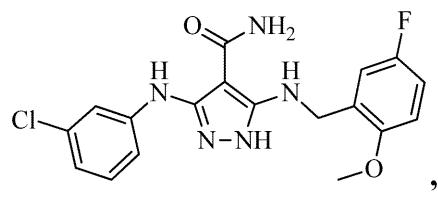
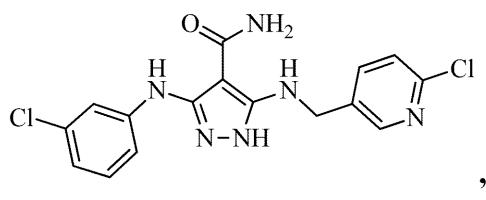
及び

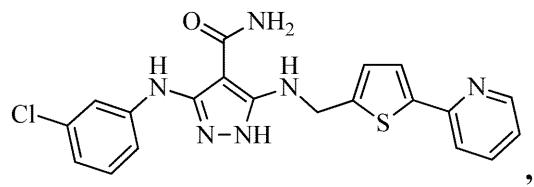
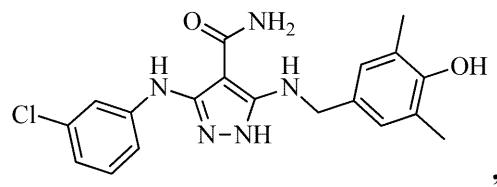
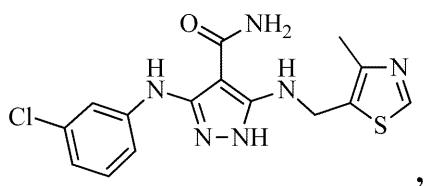
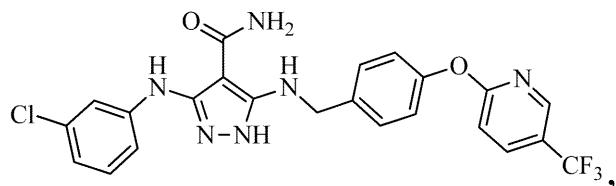
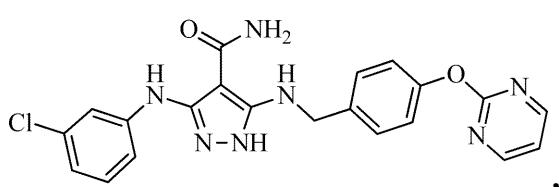
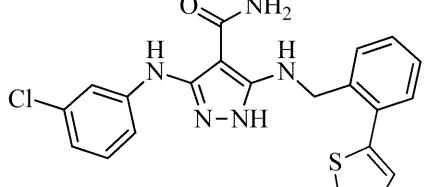
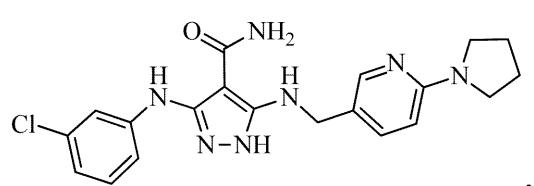
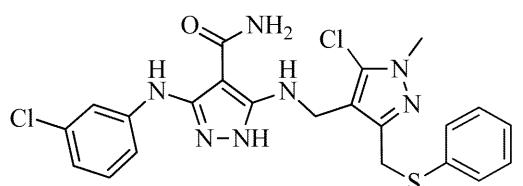
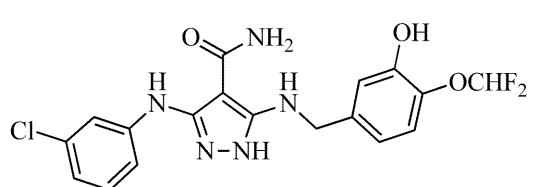
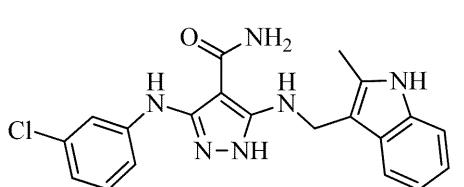
C33

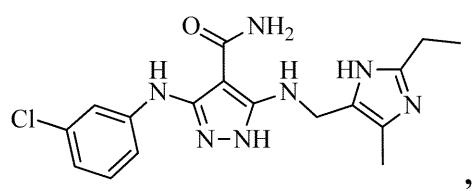
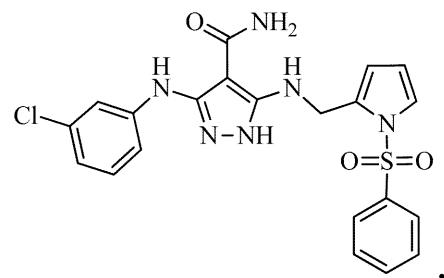
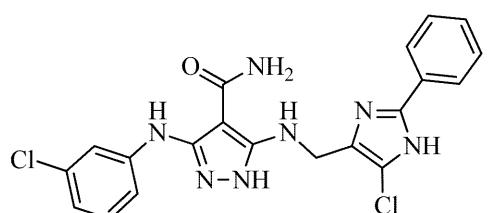
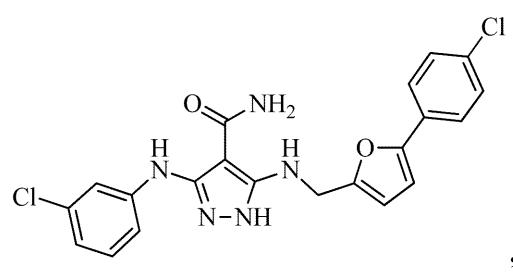
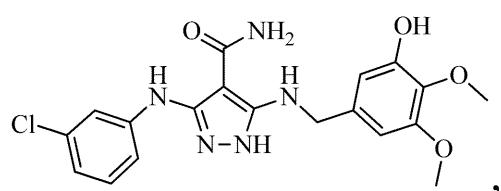
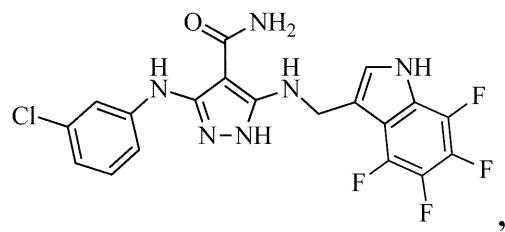
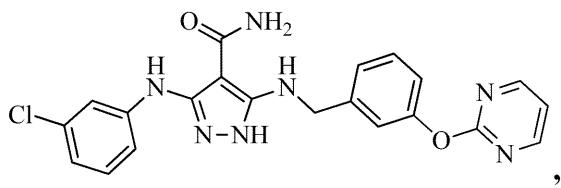
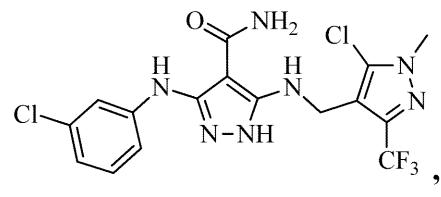
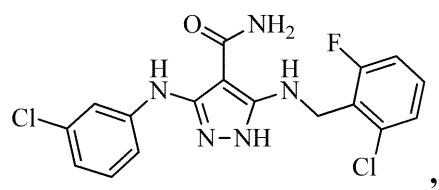
又は

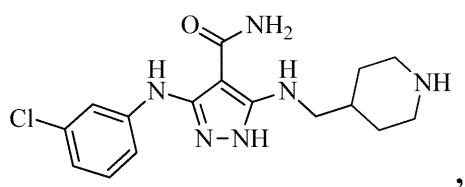
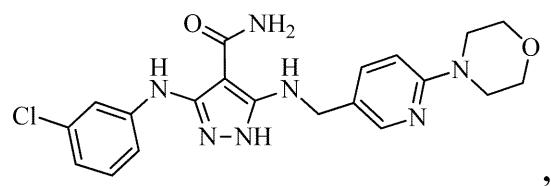
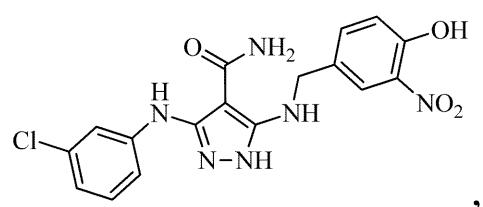
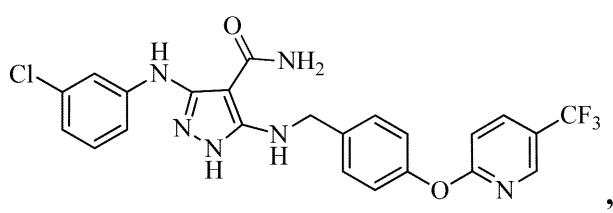
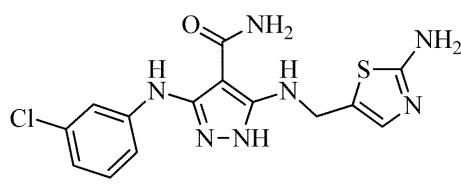
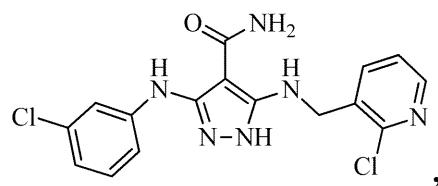
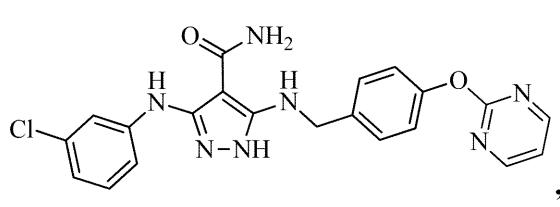
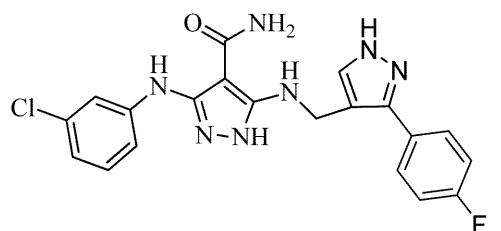
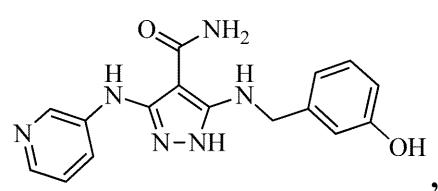
下記からなる群から選択される、請求項1記載の化合物、並びにその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、及び同位体変種；並びにそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、及び水和物：

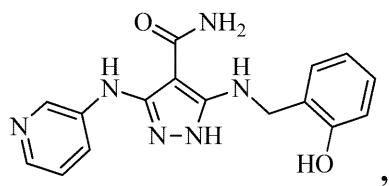
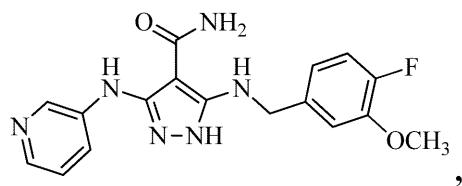
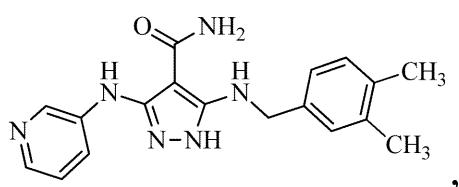
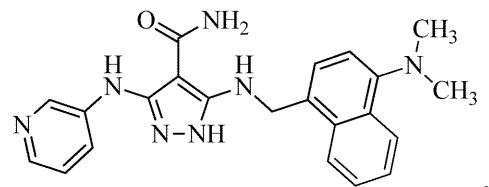
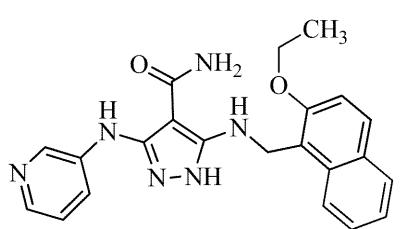
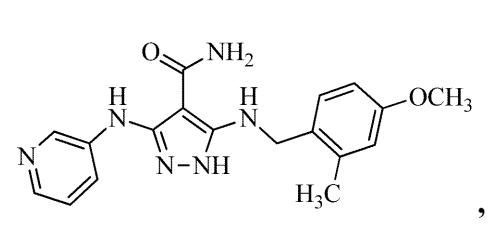
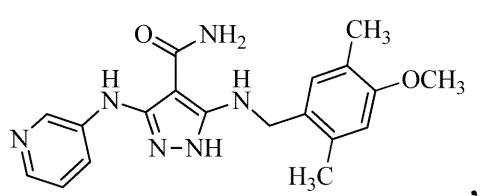
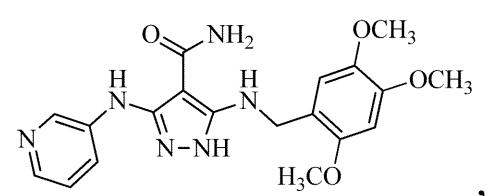
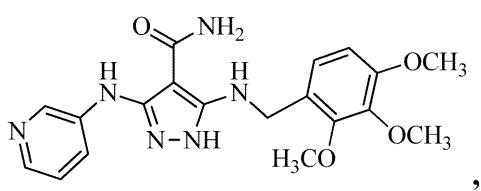
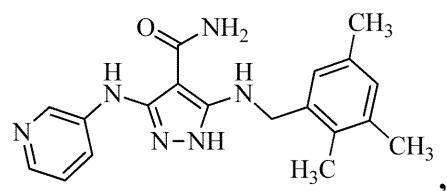
【化 7】

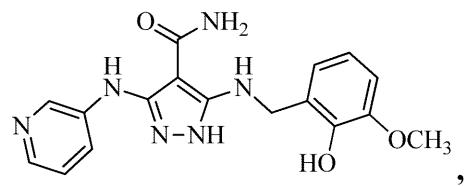
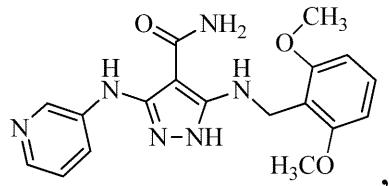
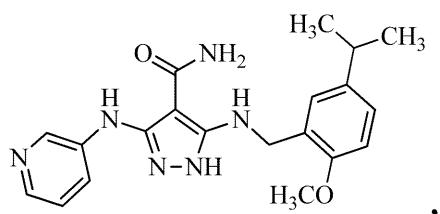
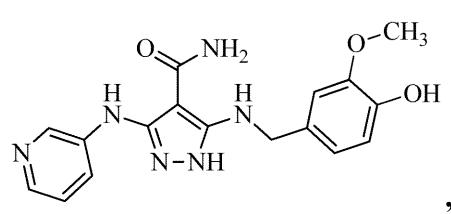
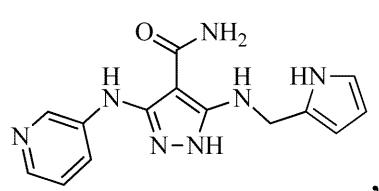
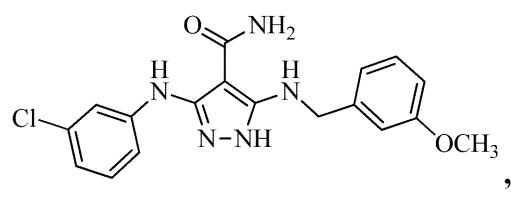
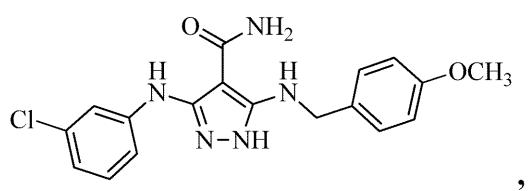
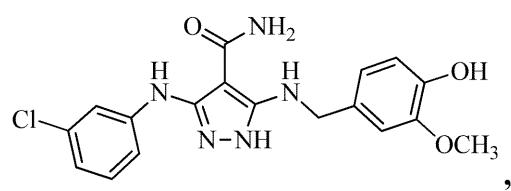
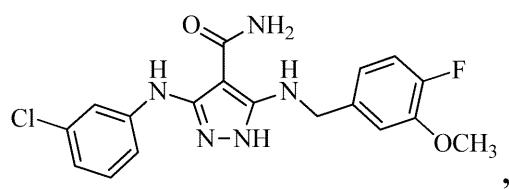
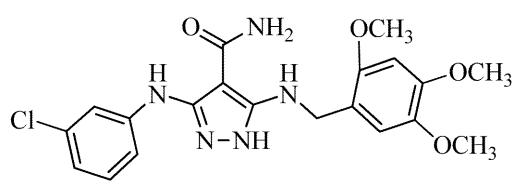
**D1****D2****D3****D4****D5****D6**

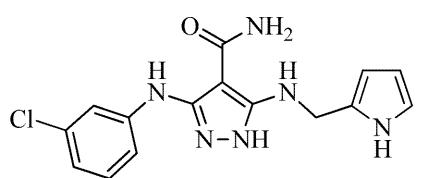
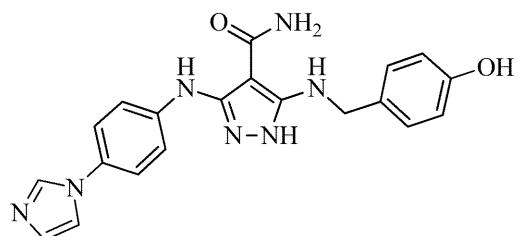
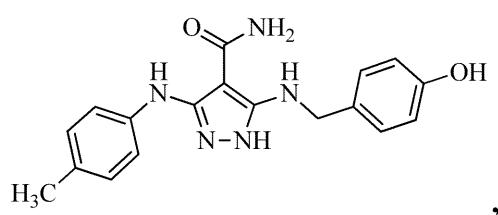
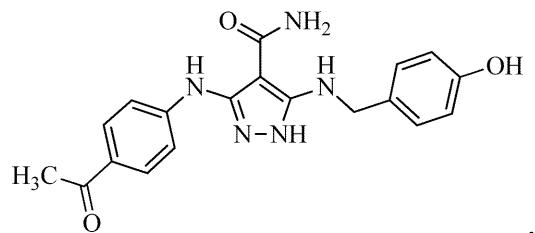
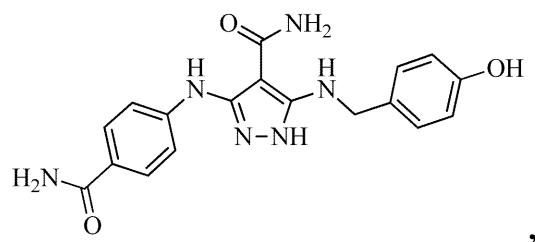
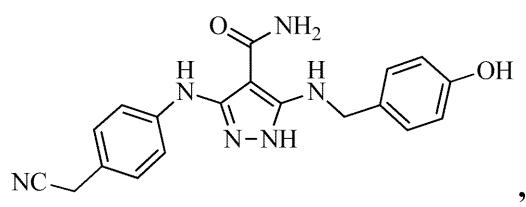
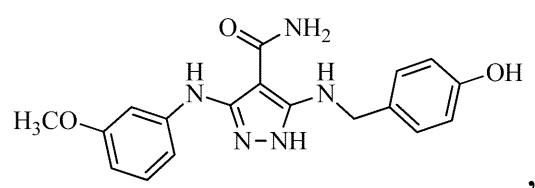
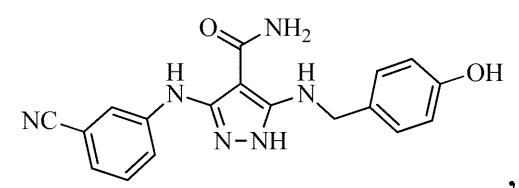
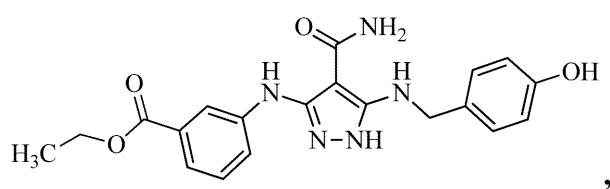
**D7****D8****D9****D10****D11****D12****D13****D14****D15****D16**

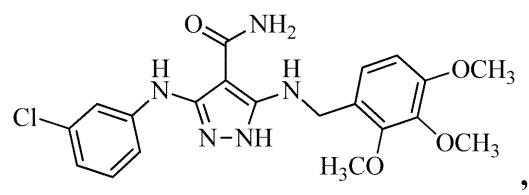
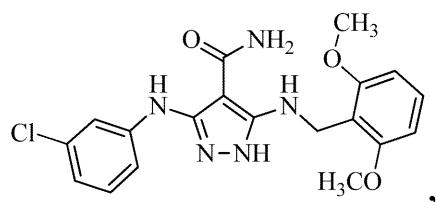
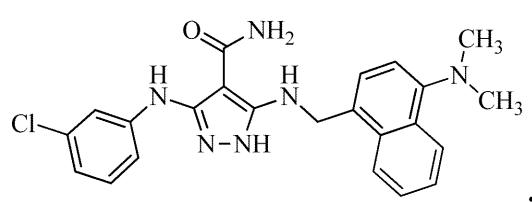
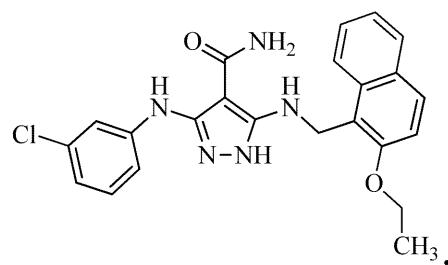
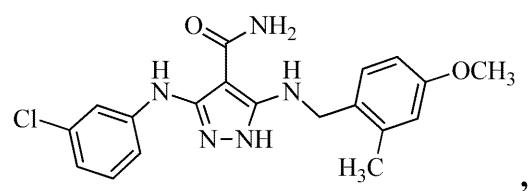
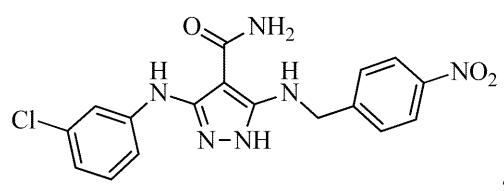
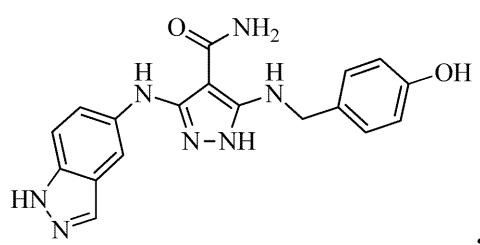
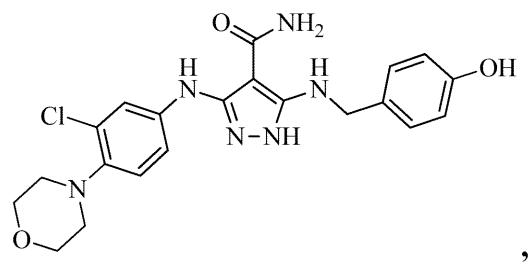
**D17****D18****D19****D20****D21****D22****D23****D24**

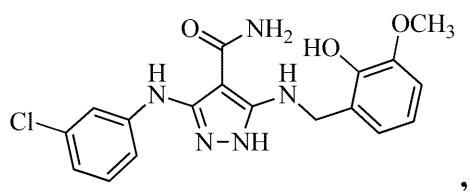
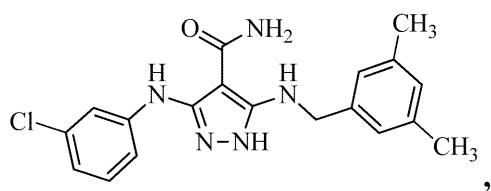
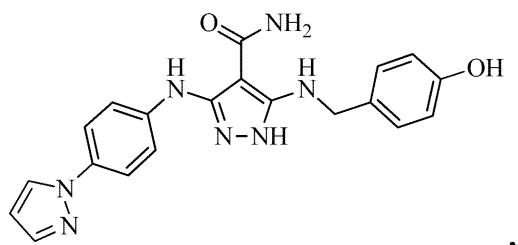
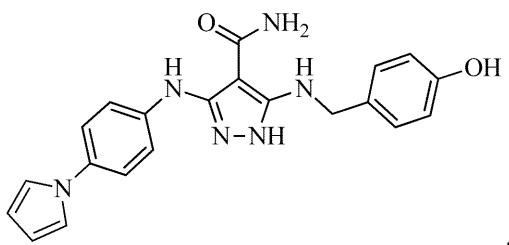
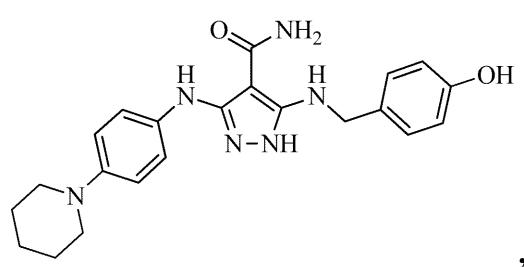
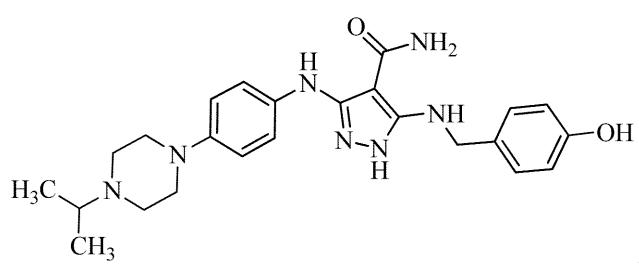
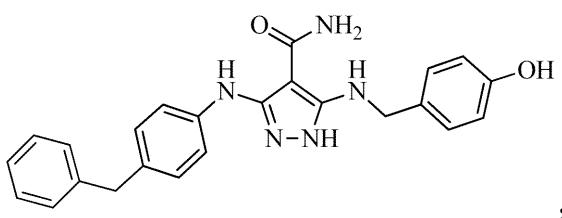
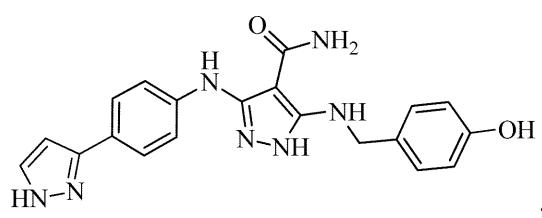
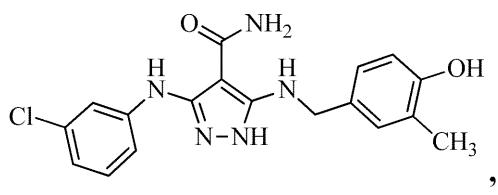
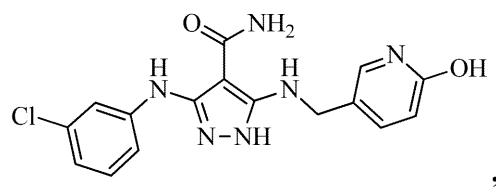
D25**D27****D29****D31****D33****D26****D28****D30****D32****D34****D38**

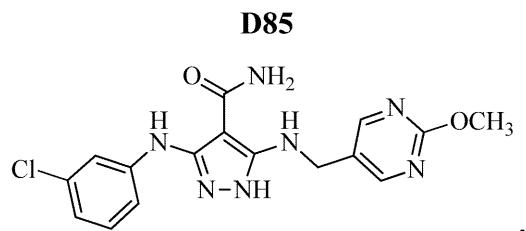
**D39****D40****D41****D42****D43****D44****D45****D46****D47****D48**

**D49****D50****D51****D52****D53****D54****D55****D56****D57****D58**

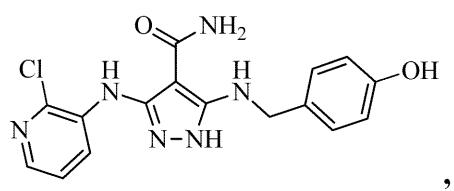
**D59****D60****D61****D62****D63****D64****D65****D66**

D67**D69****D68****D70****D71****D72****D73****D74**

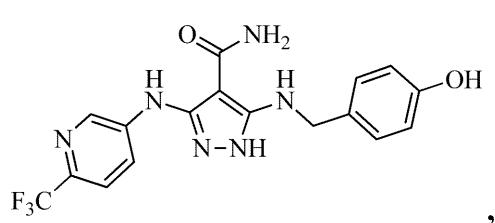
D75**D76****D77****D78****D79****D80****D81****D82****D83****D84**



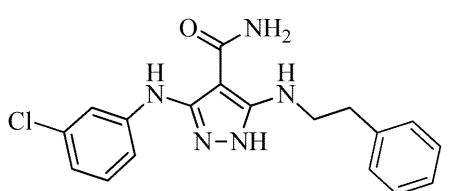
D87



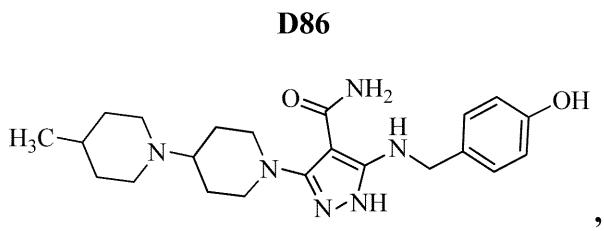
D89



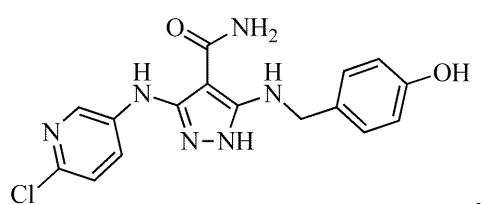
D91



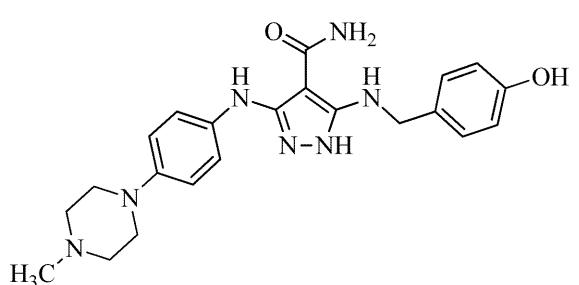
D93



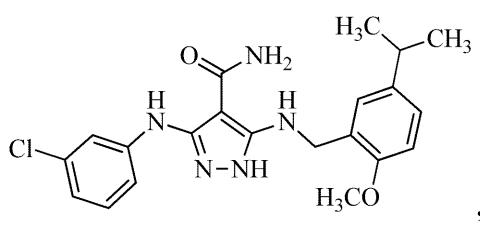
D88



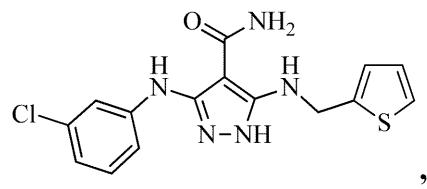
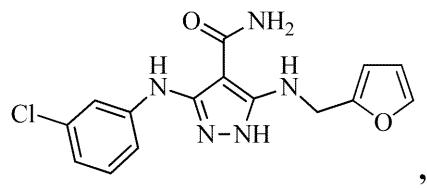
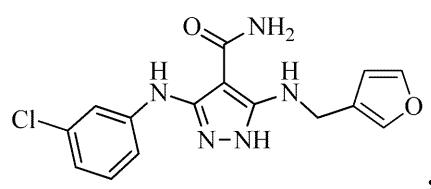
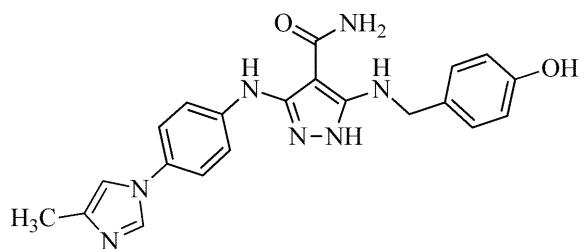
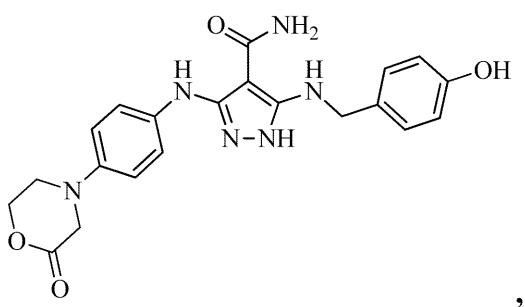
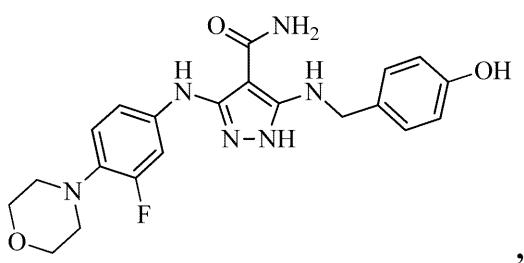
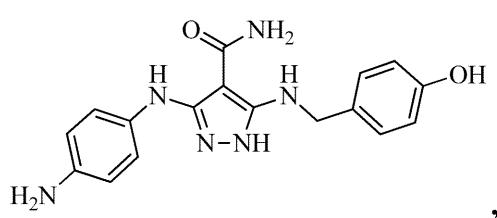
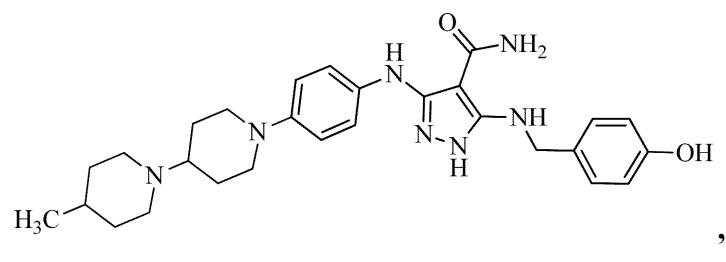
D90

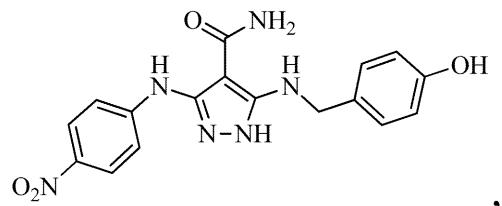
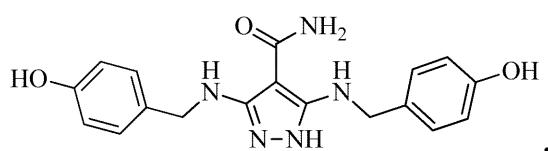
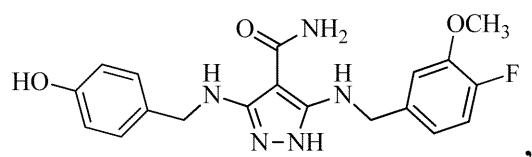
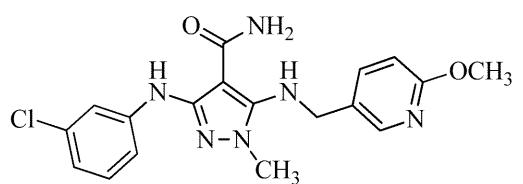
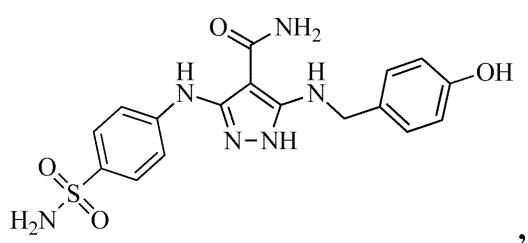
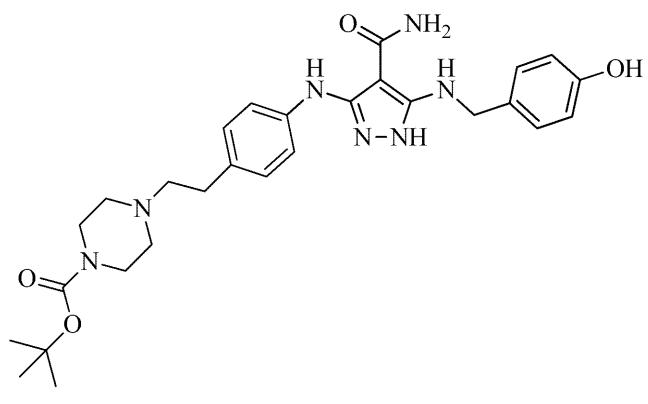


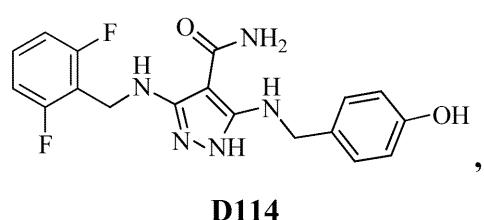
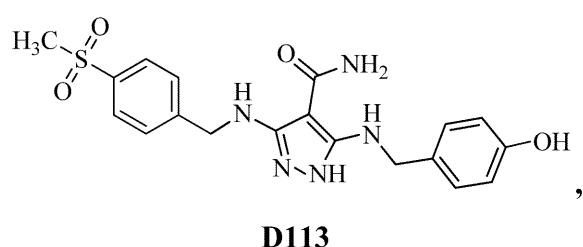
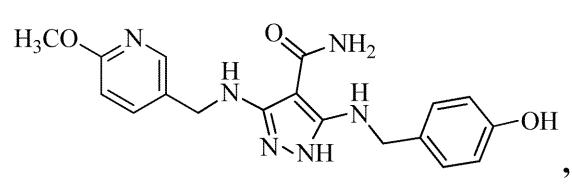
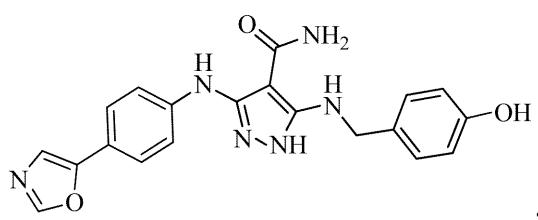
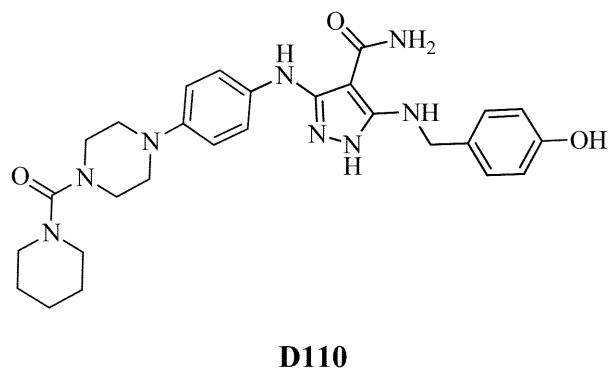
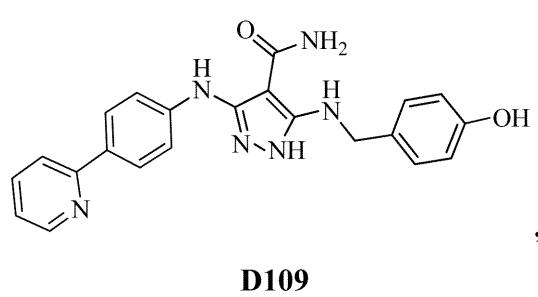
D03

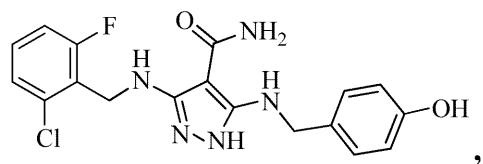
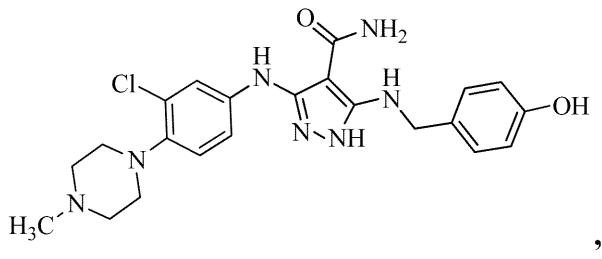
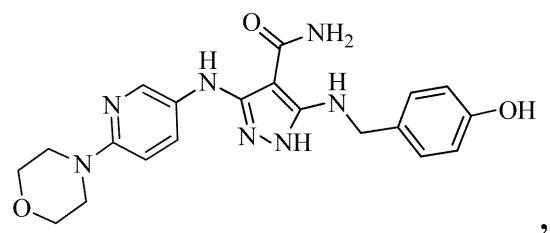
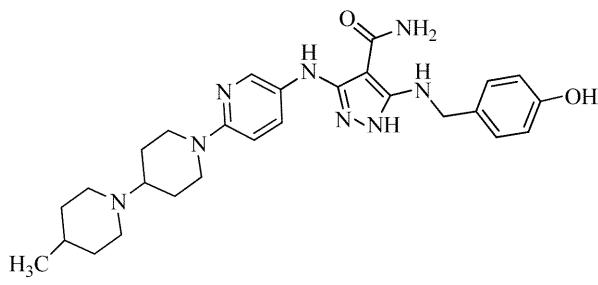
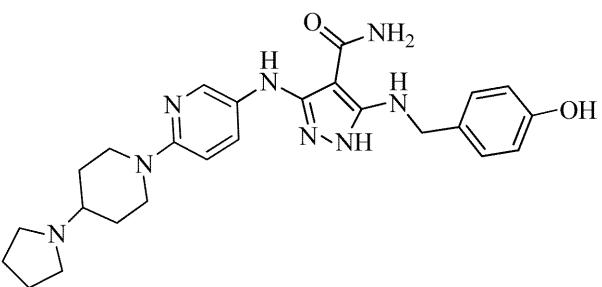


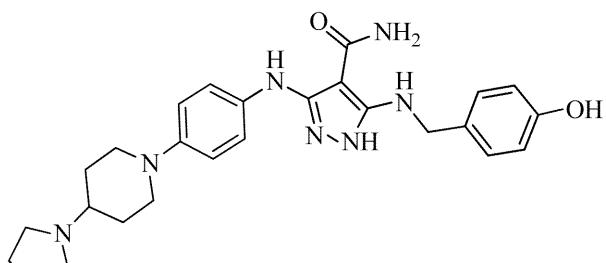
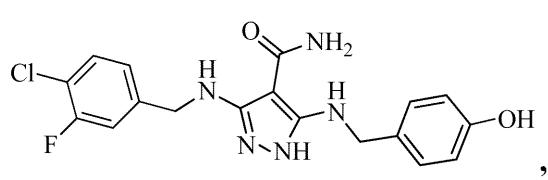
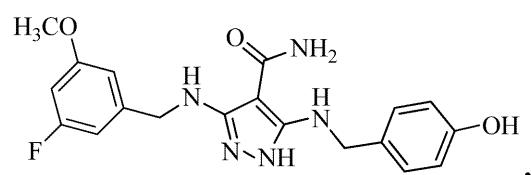
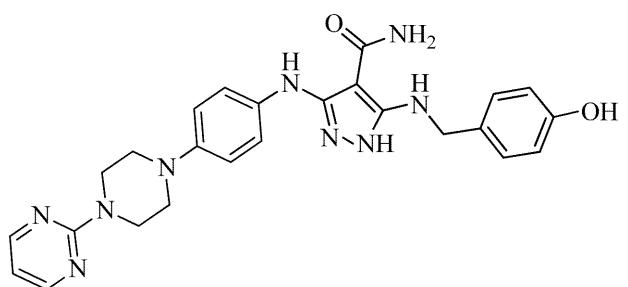
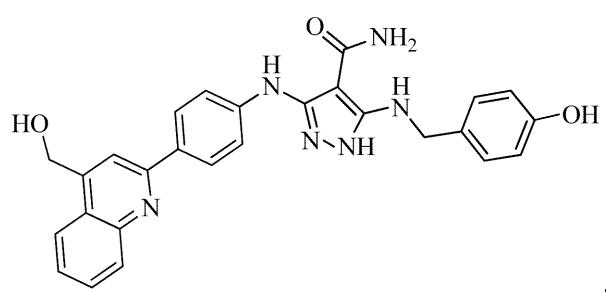
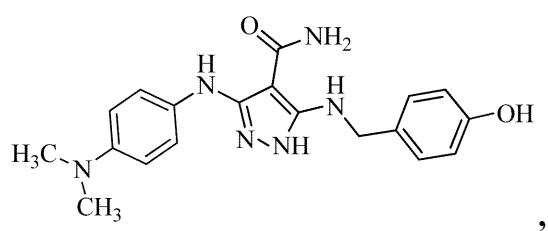
D94

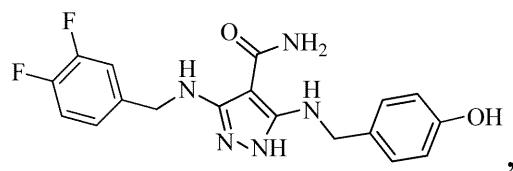
**D95****D96****D97****D98****D99****D100****D101****D102**

**D103****D104****D105****D106****D107****D108**

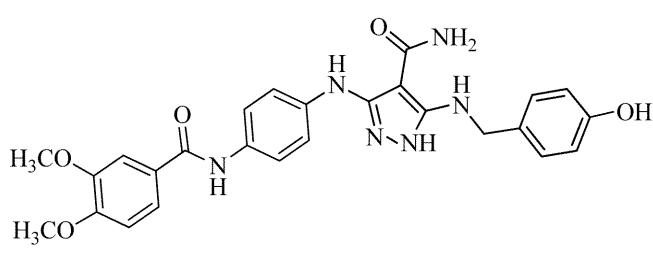


**D115****D116****D118****D119****D120**

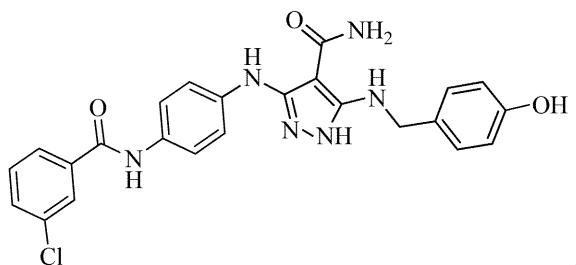
**D121****D122****D123****D124****D125****D126**



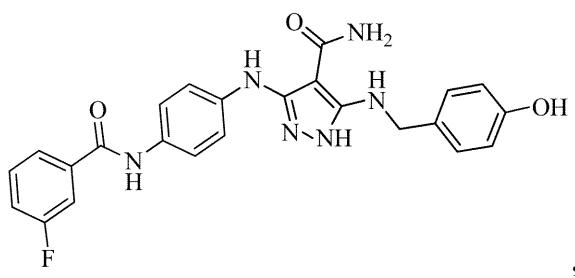
D127



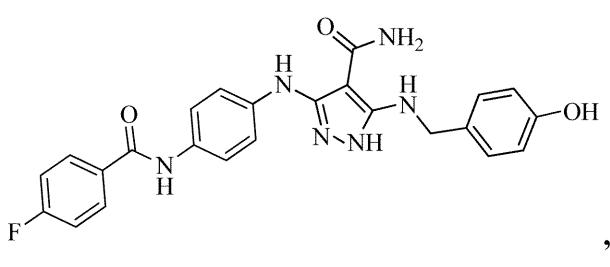
D129



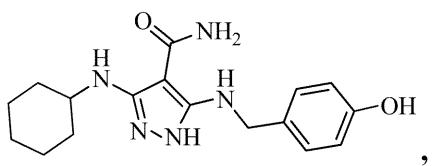
D130



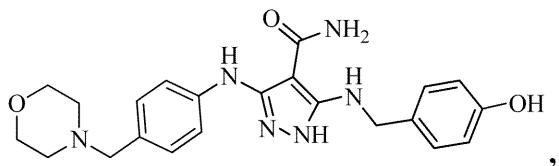
D131



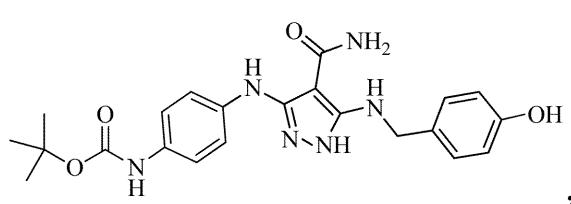
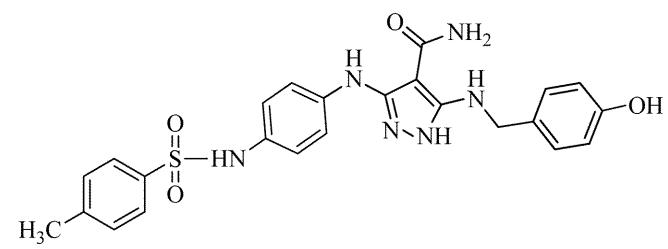
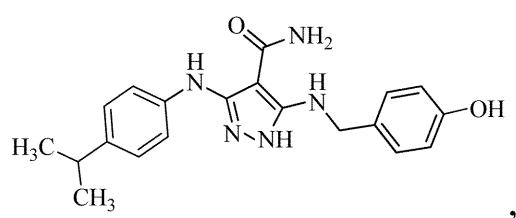
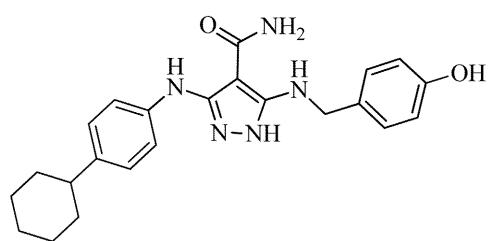
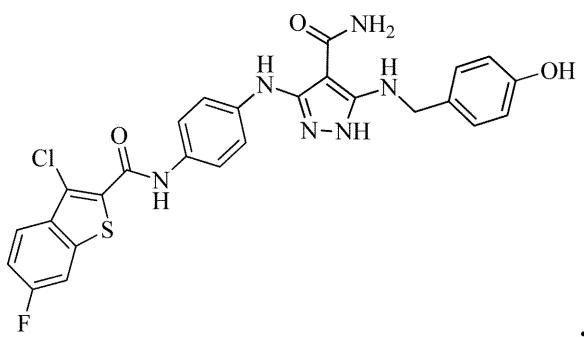
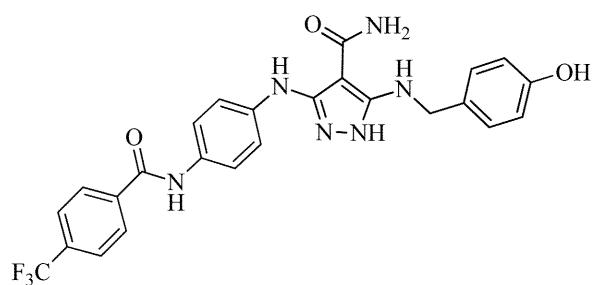
D132

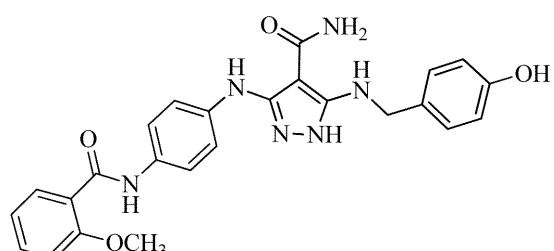
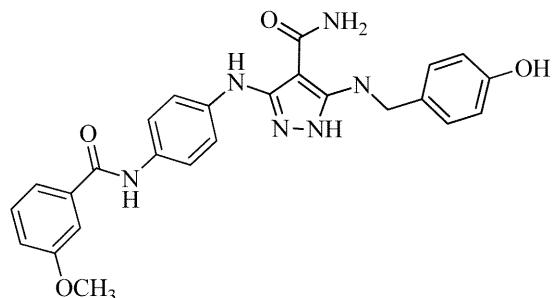
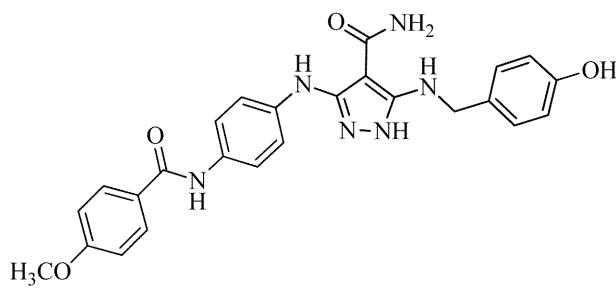
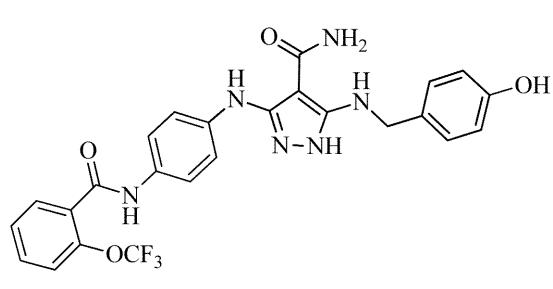
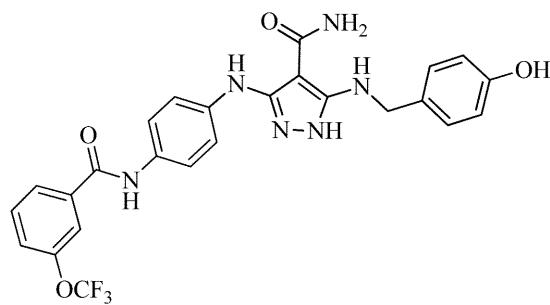
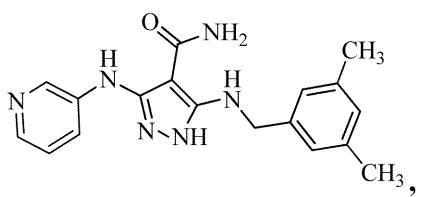
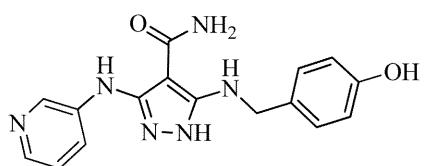


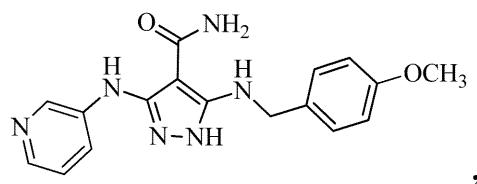
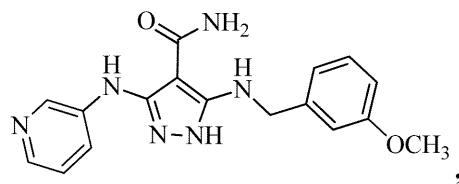
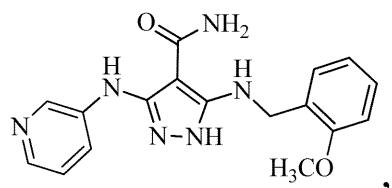
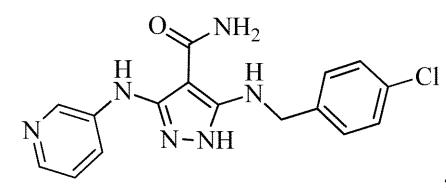
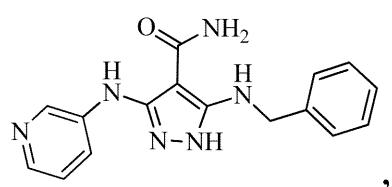
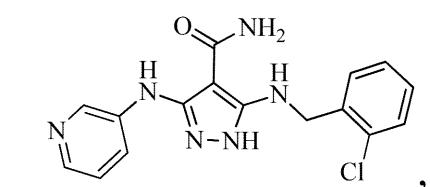
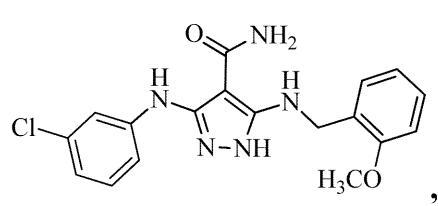
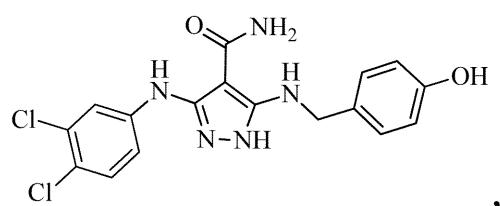
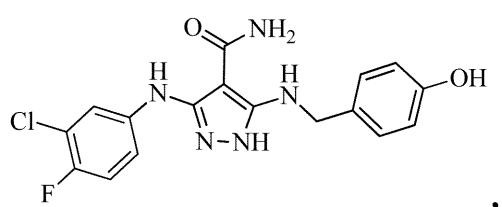
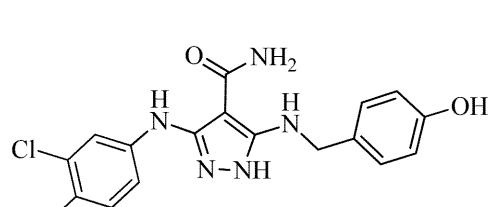
D133

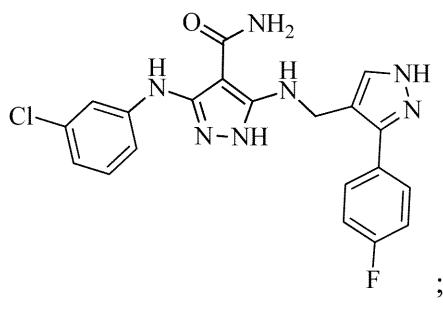
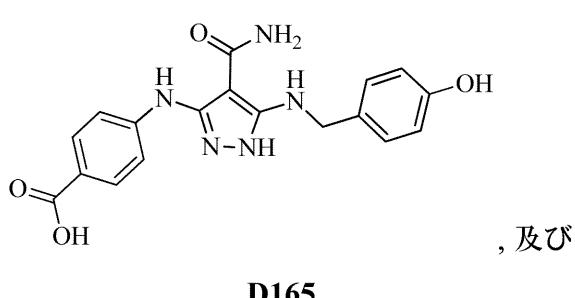
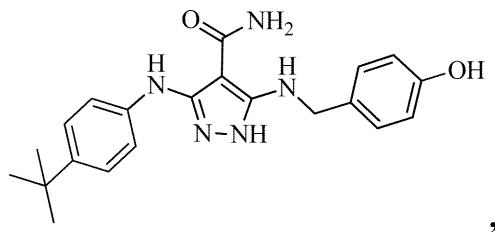
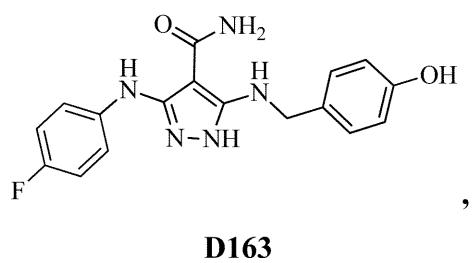
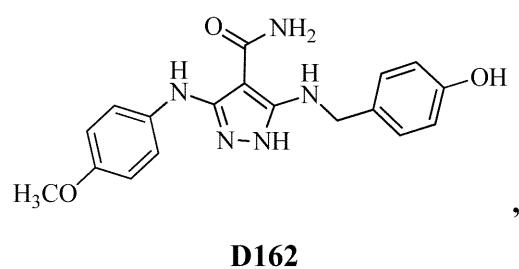
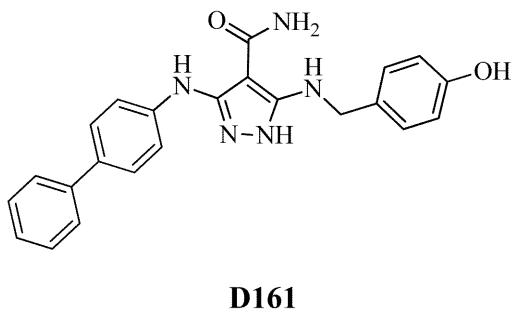


D134

**D135****D136****D137****D138****D141****D142**

**D143****D144****D145****D146****D147****D148****D150**

**D151****D152****D153****D154****D155****D156****D157****D158****D159****D160**



。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項記載の化合物、及び1以上の医薬として許容し得る賦形剤を含む医薬組成物であって、

任意に、該組成物が、単一用量投与用に製剤化されているか；又は

該組成物が、経口、非経口、又は静脈内剤形として製剤化されており、任意に、該経口剤形が錠剤又はカプセル剤である、前記組成物。

【請求項 1 6】

第二の治療剤をさらに含む、請求項 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

対象におけるRCキナーゼ媒介性の障害、疾患もしくは疾病、又は
 対象における好酸球関連の障害、疾患もしくは疾病、又は
 対象における好塩基球関連の障害、疾患もしくは疾病、又は
 対象における肥満細胞関連の障害、疾患もしくは疾病の1以上の症状の治療、予防、又は改善のための方法に使用するための請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項記載の化合物、又は請求項 1 5 記載の医薬組成物であって、ここで、該方法が該対象に投与することを含む、前記化合物又は医薬組成物。

【請求項 1 8】

対象における炎症性疾患の1以上の症状の治療、予防、又は改善のための方法に使用するための請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項記載の化合物、又は請求項 1 5 記載の医薬組成物であって、

任意に、該障害、疾患又は疾病が、喘息、アレルギー性喘息、運動誘発性喘息、アレル

ギー性鼻炎、通年性アレルギー性鼻炎、季節性アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、接触過敏症、接触性皮膚炎、結膜炎、アレルギー性結膜炎、好酸球性気管支炎、食物アレルギー、好酸球性胃腸炎、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、クローン病、肥満細胞症、高IgE症候群、全身性エリテマトーデス、乾癬、座瘡、多発性硬化症、同種異系移植拒絶反応、再灌流傷害、慢性閉塞性肺疾患、チャーグ-ストラウス症候群、副鼻腔炎、好塩基球性白血病、慢性蕁麻疹、好塩基球性白血球増加症、湿疹、関節炎、関節リウマチ、乾癬性関節炎、変形性関節症、及び心血管障害からなる群から選択されるか、又は

任意に、該障害、疾患又は疾病が、喘息、運動誘発性喘息、アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、慢性閉塞性肺疾患、又はアレルギー性結膜炎である、前記化合物又は医薬組成物。

【請求項19】

前記化合物又は医薬組成物が、第二の治療剤と組み合わせて投与される、請求項17又は18記載の使用のための化合物。

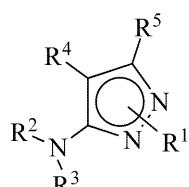
【請求項20】

RCキナーゼ活性を調節する方法に使用するための請求項1~14のいずれか一項記載の化合物、又は請求項15記載の医薬組成物であって、ここで、該方法が、RCキナーゼを、該化合物又は医薬組成物と接触させることを含む、前記化合物又は医薬組成物。

【請求項21】

式IAの化合物、又はその立体異性体、エナンチオマー、エナンチオマーの混合物、ジアステレオマーの混合物、もしくは同位体変種；又はそれらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、もしくは水和物：

【化8】



(IA)

(式中：

R¹は、水素、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；

R²は、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、又は-C(O)R^{1a}であり；

R³は、水素、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、又は-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；

R⁴は、シアノ、アミノカルボニル、-C(O)N=CR^{4a}R^{4b}、又は-C(O)NR^{4a}R^{4b}であり；

ここで：

R^{4a}は、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

R^{4b}は、独立に、水素、C_{1~6}アルキル、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R^{1a}、-C(O)OR^{1a}、-C(O)NR^{1b}R^{1c}、-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}、-S(O)R^{1a}、-S(O)₂R^{1a}、-S(O)NR^{1b}R^{1c}、又は-S(O)₂NR^{1b}R^{1c}であり；

R⁵は、-N(R^{5e})CR^{5a}R^{5c}R^{5d}であり；

ここで：

R^{5a}は、C_{3~10}シクロアルキル、C_{6~14}アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル

であり；

R^{5c} 及び R^{5d} は、各々独立に、水素、ハロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

R^{5e} は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $-C(O)R^{1a}$ 、 $-C(O)OR^{1a}$ 、 $-C(O)NR^{1b}R^{1c}$ 、 $-C(NR^{1a})NR^{1b}R^{1c}$ 、 $-S(O)R^{1a}$ 、 $-S(O)_2R^{1a}$ 、 $-S(O)NR^{1b}R^{1c}$ 、又は $-S(O)_2NR^{1b}R^{1c}$ であり；かつ

各々の R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^{1c} 、及び R^{1d} は、独立に、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、ヘテロアリール、もしくはヘテロシクリルであるか；又は R^{1a} 及び R^{1c} は、それらが結合しているC及びN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成するか；又は R^{1b} 及び R^{1c} は、それらが結合しているN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成し；

ここで、各々のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクリルは、1以上の置換基Qで任意に置換されており、ここで、各々のQは、独立に、(a)オキソ、シアノ、ハロ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b)その各々が、1以上の置換基Q^aでさらに任意に置換されている、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル- C_{1-6} アルキル；並びに(c)- $B(R^a)OR^d$ 、 $-B(OR^a)OR^d$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-C(O)NR^bR^c$ 、 $-C(NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)NR^bR^c$ 、 $-OC(=NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OS(O)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-NR^aC(O)R^d$ 、 $-NR^aC(O)OR^d$ 、 $-NR^aC(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^aC(=NR^d)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)R^d$ 、 $-NR^aS(O)_2R^d$ 、 $-NR^aS(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-P(O)R^aR^d$ 、 $-P(O)(OR^a)R^d$ 、 $-P(O)(OR^a)(OR^d)$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-S(O)NR^bR^c$ 、及び $-S(O)_2NR^bR^c$ から選択され、ここで、各々の R^a 、 R^b 、 R^c 、及び R^d は、独立に、(i)水素；(ii)1以上の置換基Q^aで各々任意に置換された、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、もしくはヘテロシクリル- C_{1-6} アルキルであるか；又は(iii) R^b 及び R^c は、それらが結合しているN原子と一緒に、1以上の置換基Q^aで任意に置換されたヘテロシクリルを形成し；

ここで、各々のQ^aは、独立に、(a)オキソ、シアノ、ハロ、ニトロ、及びペンタフルオロスルファニル；(b) C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル- C_{1-6} アルキル；並びに(c)- $B(R^e)OR^g$ 、 $-B(OR^e)OR^g$ 、 $-C(O)R^e$ 、 $-C(O)OR^e$ 、 $-C(O)NR^fR^g$ 、 $-C(NR^e)NR^fR^g$ 、 $-OR^e$ 、 $-OC(O)R^e$ 、 $-OC(O)OR^e$ 、 $-OC(O)NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-OS(O)R^e$ 、 $-OS(O)_2R^e$ 、 $-OS(O)NR^fR^g$ 、 $-OS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-NR^fR^g$ 、 $-NR^eC(O)R^h$ 、 $-NR^eC(O)OR^f$ 、 $-NR^eC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^eC(=NR^h)NR^fR^g$ 、 $-NR^eS(O)R^h$ 、 $-NR^eS(O)_2R^h$ 、 $-NR^eS(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^eS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-P(O)R^eR^h$ 、 $-P(O)(OR^e)R^h$ 、 $-P(O)(OR^e)(OR^h)$ 、 $-SR^e$ 、 $-S(O)R^e$ 、 $-S(O)_2R^e$ 、 $-SF_5$ 、 $-S(O)NR^fR^g$ 、及び $-S(O)_2NR^fR^g$ からなる群から選択され；ここで、各々の R^e 、 R^f 、 R^g 、及び R^h は、独立に、(i)水素；(ii) C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、もしくはヘテロシクリル- C_{1-6} アルキルであるか；又は(iii) R^f 及び R^g は、それらが結合しているN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成する)。