

【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31年4月11日 (2019.4.11)

【公表番号】特表2018-510908(P2018-510908A)

【公表日】平成30年4月19日 (2018.4.19)

【年通号数】公開・登録公報2018-015

【出願番号】特願2018-500857(P2018-500857)

【国際特許分類】

C 0 7 D 309/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 41/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 309/10 C S P

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 407/12

C 0 7 D 409/12

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4155

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 41/00

A 6 1 P 11/00

C 1 2 N 15/00 Z N A A

【手続補正書】

【提出日】平成31年2月26日 (2019.2.26)

【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

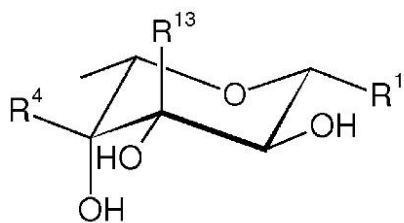
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 1】



(I)

[式中、

R⁴は、

(a) 水素 ;

(b) ハロゲン、 - CN、 - NH₂、 - NR¹¹R¹²、 - NH - CO - R¹¹、 - NH - SO₂ - R¹¹、 - OR¹¹、 - SR¹¹、 - SO₂R¹¹、 - COOR¹¹、 - NO₂、 - トリアゾール - R¹¹および - CH₂ - R¹¹からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい C₁ ~ C₆アルキル基

(ここで、R¹²は、C₁ ~ C₄アルキル基であり ;

ここで、R¹¹は、

- 水素、

- C₁ ~ C₄アルキル基、

- C₁ ~ C₄アルキル基、ハロゲン、C₁ ~ C₄ハロアルキル基、 - OH、C₁ ~ C₄アルコキシ基、 - NH₂、 - NHR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NR¹³R¹⁴ (ここで、R¹³およびR¹⁴は各々お互いに独立してC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NO₂、 - CN、 - COOH、 - COOR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である) および - SO₃Hからなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- C₁ ~ C₄アルキル基、ハロゲン、C₁ ~ C₄ハロアルキル基、 - OH、C₁ ~ C₄アルコキシ基、 - NH₂、 - NHR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NR¹³R¹⁴ (ここで、R¹³およびR¹⁴は各々お互いに独立してC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NO₂、 - CN、 - COOH、 - COOR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である) および - SO₃Hからなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基からなる群から選択される) ;

(c) ハロゲン、 - CN、 - NH₂、 - NR¹¹R¹²、 - NH - CO - R¹¹、 - NH - SO₂ - R¹¹、 - OR¹¹、 - SR¹¹、 - SO₂R¹¹、 - COOR¹¹、 - NO₂、 - トリアゾール - R¹¹および - CH₂ - R¹¹からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい C₃ ~ C₇シクロアルキル基

(ここで、R¹²は、C₁ ~ C₄アルキル基であり ;

ここで、R¹¹は、

- 水素、

- C₁ ~ C₄アルキル基、

- C₁ ~ C₄アルキル基、ハロゲン、C₁ ~ C₄ハロアルキル基、 - OH、C₁ ~ C₄アルコキシ基、 - NH₂、 - NHR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NR¹³R¹⁴ (ここで、R¹³およびR¹⁴は各々お互いに独立してC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NO₂、 - CN、 - COOH、 - COOR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である) および - SO₃Hからなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- C₁ ~ C₄アルキル基、ハロゲン、C₁ ~ C₄ハロアルキル基、 - OH、C₁ ~ C₄アルコキシ基、 - NH₂、 - NHR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NR¹³R¹⁴ (ここで、R¹³およびR¹⁴は各々お互いに独立してC₁ ~ C₄アルキル基である)、 - NO₂、 - CN、 - COOH、 - COOR¹³ (ここで、R¹³はC₁ ~ C₄アルキル基

である)および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される1、2または3個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基からなる群から選択される);

(d) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(e) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、アリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アラルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(f) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);および

(g) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)

からなる群から選択され;

R^1 は、

- 水素、

- $-(CH_2)_n - NR^2 - X - R^3$ (ここで、 n は、1、2または3である);

- $-(CH_2)_n - NH_2$ (ここで、 n は、2または3である);および

- $-(CH_2)_n - O - R^5$ (ここで、 R^5 は、水素原子であり、 n は、2または3である)

あるか、または R^5 は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり、 n は、1、2または3である)からなる群から選択され、ここで、

R^2 は、水素または $C_1 \sim C_3$ アルキル基であり;

X は、 SO_2 または CO であり;

R^3 は、

(i) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、アリール部分が、ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アラルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(i i) アルケニル部分が 2 ~ 6 個の炭素原子を有し、アリール部分が、ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されている、アラルケニル基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(i i i) ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよいアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(i v) ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基 (ここで、該ヘテロアリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(v) アルキル部分が 1 ~ 6 個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基 ; および

(v i) アルケニル部分が 2 ~ 6 個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、ハロゲン原子、 $-NH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基および $-COOR^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラルケニル基
からなる群から選択され ;

R^{13} は、

(a) 水素 ;

(b) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、 $-トリアゾール-R^{11}$ および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり ;

ここで、 R^{11} は、

- 水素、

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基
からなる群から選択される) ;

(c) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2$
 $-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、 $-$ トリアゾール-
 R^{11} および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換され
 てもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり；

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
 アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
 である)および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される1、2または3個
 の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
 アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
 である)および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される1、2または3個
 の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基

からなる群から選択される)；

(d) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
 アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
 である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換され
 ていてもよいアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチ
 レンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)；

(e) アルキル部分が1～6個の炭素原子を有し、アリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基
 、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、
 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13}
 および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-$
 $COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$
 からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アラ
 ルキル基 (ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基または
 エチレンジオキシ基を形成してもよい)；

(f) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
 アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
 である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換され
 ていてもよいヘテロアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合し
 てメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)；および

(g) アルキル部分が1～6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アル
 キル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-N$
 H_2 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで
 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-C$
 N 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-S$
 O_3H からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテ
 ロアラ
 ルキル基 (ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオ

キシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)

からなる群から選択される；

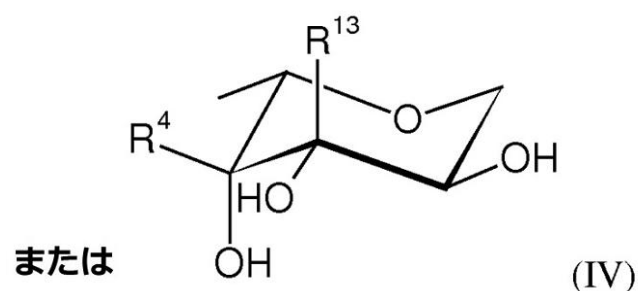
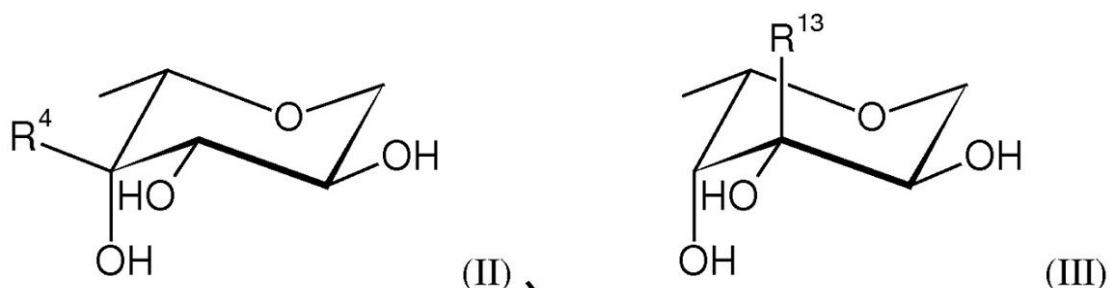
ただし、 R^1 、 R^4 または R^{13} のうち少なくとも1つは水素ではない]

で示される化合物、またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項2】

化合物が、一般式(I I)、一般式(I I I)または一般式(I V)：

【化2】

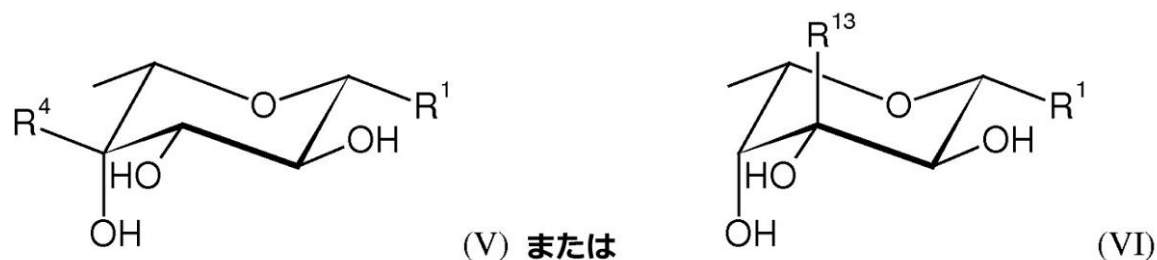


で示される構造を有する、請求項1記載の化合物、またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項3】

一般式(V)または一般式(V I)：

【化3】



[式中、

R^4 は、

(b) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、-トリアゾール- R^{11} および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり；

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、-

$\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基からなる群から選択される) ;

(c) ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{R}^{11}$ 、 $-\text{NH}-\text{SO}_2-\text{R}^{11}$ 、 $-\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{SR}^{11}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{11}$ 、 $-\text{COOR}^{11}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{トリアゾール}-\text{R}^{11}$ および $-\text{CH}_2-\text{R}^{11}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基であり ;

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、
- $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基からなる群から選択される) ;

(d) $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよいアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(e) アルキル部分が 1 ~ 6 個の炭素原子を有し、アリール部分が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である) および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい、アラルキル基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(f) $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である

)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);および

(g) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキル基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{COOR}^{13}$ (ここで、 R^{13} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)および $-\text{SO}_3\text{H}$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)

からなる群から選択され;

R^1 は、水素、 $-(\text{CH}_2)_n - \text{NR}^2 - \text{X} - \text{R}^3$ 、 $-(\text{CH}_2)_n - \text{NH}_2$ および $-(\text{CH}_2)_n - \text{OR}^5$ (ここで、 R^5 は、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択され、

n は、1、2または3であり;

R^2 は、水素または $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル基であり;

X は、 SO_2 または CO であり;

R^3 は、

(i) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、アリール部分が、ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(ii) アルケニル部分が2~6個の炭素原子を有し、アリール部分が、ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アルケニル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(iii) ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(iv) ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基(ここで、該ヘテロアリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(v) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアルキル基;および

(vi) アルケニル部分が2~6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、ハロゲン原子、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ基および $-\text{COOR}^5$ (ここで、 R^5 は水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である)か

らなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラリケニル基

からなる群から選択され；

R^{13} は、

(b) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、 $-トリアゾール-R^{11}$ および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり；

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基

からなる群から選択される)；

(c) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、 $-トリアゾール-R^{11}$ および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される 1 個以上の置換基によって置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり；

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基

からなる群から選択される)；

(d) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基

である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(e) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、アリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、アラルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);

(f) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい);および

(g) アルキル部分が1~6個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基(ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい)

からなる群から選択される]

で示される構造を有する化合物、またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項4】

R^4 が、

(b) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、-トリアゾール- R^{11} および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ アルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり;

ここで、 R^{11} は、

- 水素、

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される1、2または3個の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される1、2または3個

の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基
からなる群から選択される) ;

(c) ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-NH-CO-R^{11}$ 、 $-NH-SO_2$
 $-R^{11}$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-COOR^{11}$ 、 $-NO_2$ 、 $-トリアゾール$
 $-R^{11}$ および $-CH_2-R^{11}$ からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって
置換されていてもよい $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基

(ここで、 R^{12} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキル基であり ;

ここで、 R^{11} は、

- 水素、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、
- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個
の置換基によって置換されていてもよいアリール基、および

- $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
である) および $-SO_3H$ からなる群からお互いに独立して選択される 1、2 または 3 個
の置換基によって置換されていてもよいヘテロアリール基
からなる群から選択される) ;

(d) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
である) および $-SO_3H$ からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって
置換されていてもよいアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合
してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(e) アルキル部分が 1 ~ 6 個の炭素原子を有し、アリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル
基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-NH_2$ 、
 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13}
および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-$
 $COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-SO_3H$
からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよい、ア
ラルキル基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ
基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ;

(f) $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$
アルコキシ基、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-$
 $NR^{13}R^{14}$ (ここで、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である
)、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基
である) および $-SO_3H$ からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって
置換されていてもよいヘテロアリール基 (ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基
は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい) ; および

(g) アルキル部分が 1 ~ 6 個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、 $C_1 \sim C_4$ アル
キル基、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル基、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基、 $-N$
 H_2 、 $-NHR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NR^{13}R^{14}$ (ここで
、 R^{13} および R^{14} は各々お互いに独立して $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、 $-NO_2$ 、 $-C$
 N 、 $-COOH$ 、 $-COOR^{13}$ (ここで、 R^{13} は $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) および $-S$

O₃H からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基（ここで、該アリール基の隣接する 2 つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい）からなる群から選択される、請求項 1～3 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 5】

R⁴ のアリール部分またはアリール基がフェニル基またはナフチル基であるか；または R⁴ のヘテロアリール部分またはヘテロアリール基が、

(i) 5 員単環式芳香環（ここで、環原子のうち 1、2、3 または 4 個は同一または異なるヘテロ原子であり、該ヘテロ原子は O、N または S から選択される）；

(ii) 6 員単環式芳香環（ここで、環原子のうち 1、2、3、4 または 5 個は同一または異なるヘテロ原子であり、該ヘテロ原子は O、N または S から選択される）；および

(iii) 8～12 個の構成員を有する二環式芳香環系（ここで、環原子のうち 1、2、3、4、5 または 6 個は同一または異なるヘテロ原子であり、該ヘテロ原子は O、N または S から選択される）

からなる群から選択される、請求項 1～4 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 6】

R⁴ が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、2-イソペンチル、ヘキシル、フェニル、ベンジル、シクロヘキシル、-CH₂-CN、-CH₂-CH₂-NH₂、-CH₂-CH₂-N(CH₃)₂、-CH₂-CH₂-NH-CO-CH₃、-CH₂-CH₂-NH-SO₂-CH₃ および -CH₂-CH₂-O-CH₃ からなる群から選択される、請求項 1～5 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 7】

R¹³ が、ハロゲン、-CN、-NH₂、-NR¹¹R¹²、-NH-CO-R¹¹、-NH-SO₂-R¹¹、-OR¹¹、-SR¹¹、-SO₂R¹¹、-COOR¹¹ および -NO₂ からなる群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されていてもよい C₁～C₆ アルキル基であり；

ここで、R¹¹ が水素および C₁～C₄ アルキル基からなる群から選択され、

ここで、R¹² が C₁～C₄ アルキル基であり；

好ましくは、R¹³ が、メチル、エチル、-CF₃、-CH₂-NH₂、-CH₂-NH-CO-iPr および -CH₂-NH-SO₂-iPr からなる群から選択される、請求項 1～6 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 8】

n が 1 であり、および / または R² が水素原子である、請求項 1 または 3～7 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 9】

R³ のアリール部分、ヘテロアリール部分、アリール基またはヘテロアリール基が、ハロゲン原子、-NH₂、-NO₂ およびメトキシ基からなる群から選択される 1 個以上の置換基を有してもよい、またはアリール部分またはアリール基の隣接する 2 個の置換基が結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよい、請求項 1 または 3～8 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 10】

R³ のアリール部分またはアリール基がフェニル基またはナフチル基である、請求項 1 または 3～9 いずれか 1 項記載の化合物 またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項 11】

XがSO₂であり、好ましくはR³が、ハロゲン原子、-NH₂、-NO₂、-CN、-OH、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基および-COOR⁵（ここで、R⁵は水素原子またはC₁~C₄アルキル基である）からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてよいアリールまたはヘテロアリール基であり、また、アリール基またはヘテロアリール基の隣接する2個の置換基が結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよく；該アリール基が好ましくはフェニル、ナフチルまたはアントラセニルであり；また、該ヘテロアリール基が、好ましくは、少なくとも1個の炭素原子が、好ましくはO、NおよびSから選択される、1、2、3もしくは4（5員環の場合）または1、2、3、4もしくは5個（6員環の場合）の同一または異なるヘテロ原子に置き換えられている、5または6員単環式芳香環である、請求項1または3~10いずれか1項記載の化合物またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項12】

XがC=Oであり、好ましくはR³が、

- アルケニル部分が2個の炭素原子を有し、アリール部分が、ハロゲン原子、-NH₂、-NO₂、-CN、-OH、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基および-COOR⁵（ここで、R⁵は水素原子またはC₁~C₄アルキル基である）からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてよい、アラルケニル基（ここで、該アリール基の隣接する2つの置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよく、該アリール基は好ましくはフェニル、ナフチルまたはアントラセニルである）または

- アルケニル部分が2個の炭素原子を有し、ヘテロアリール部分が、ハロゲン原子、-NH₂、-NO₂、-CN、-OH、C₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基および-COOR⁵（ここで、R⁵は水素原子またはC₁~C₄アルキル基である）からなる群から選択される1個以上の置換基によって置換されていてよい、ヘテロアラルケニル基（ここで、ヘテロアリール部分の隣接する2個の置換基は結合してメチレンジオキシ基またはエチレンジオキシ基を形成してもよく、ここで、該ヘテロアリール基は、好ましくは、少なくとも1個の炭素原子が、好ましくはO、NおよびSから選択される、1、2、3もしくは4個（5員環の場合）または1、2、3、4もしくは5個（6員環の場合）の同一または異なるヘテロ原子に置き換えられている、5または6員単環式芳香環である）

である、請求項1または3~10いずれか1項記載の化合物またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグ。

【請求項13】

請求項1~12いずれか1項記載の化合物またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグを含み、薬学的に許容される担体、希釈剤、賦形剤および抗菌治療剤からなる群から選択される1種類以上の成分を含んでもよい、医薬組成物。

【請求項14】

請求項1~12いずれか1項記載の化合物またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグを含む医薬。

【請求項15】

1種類以上の抗菌治療剤と組み合わせて使用してもよい、

患者における緑膿菌感染の予防または治療において使用するための、または

嚢胞性線維症に罹患している患者における緑膿菌関連気道感染の予防または治療において使用するための、

請求項1~12いずれか1項記載の化合物またはその塩またはその溶媒和物またはそのプロドラッグを含む医薬。