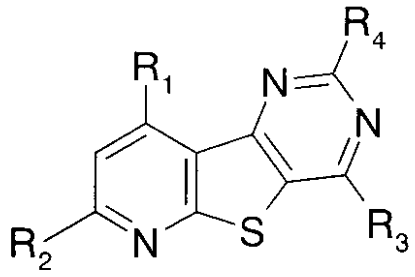
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年10月11日(2007.10.11)

【公表番号】特表2007-508323(P2007-508323A)
【公表日】平成19年4月5日(2007.4.5)
【年通号数】公開・登録公報2007-013
【出願番号】特願2006-534455(P2006-534455)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 495/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/551 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/53 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 39/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 495/04 １０５Ａ
Ｃ０７Ｄ 495/04 １０５Ｚ
Ｃ０７Ｄ 495/04 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/551
Ａ６１Ｋ 31/519
Ａ６１Ｋ 31/53
Ａ６１Ｋ 39/00 Ｚ
Ａ６１Ｐ 37/00
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 17/00
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 29/00 １０１
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 1/04
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 11/06
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１

【手続補正書】
【提出日】平成19年8月24日(2007.8.24)

【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式(I)
【化１】



(I)

の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
〔式中、
R_1は
(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、
(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、$-CO_2C_{1-5}$アルキル、フェニル、ベンジル、-OH及び-C(O)ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、
(c) $R_b(CH_2)_mO-$、
(d) C_{3-6}-シクロアルキル、
(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(f) R_bOCH_2-、
(g) $R_b(CH_2)_mNH-$、
(h) $R_b(CH_2)_p(CH=CH)_m-$、
(i) C_{1-6}アルキル、
(j) C_{1-8}アルコキシ、
(k) C_{1-8}アルキルチオ、
(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、
(m) $-CF_3$、
(n) -CHO、
(o) $-OCH_2CO_2H$、
(p) $-OSO_2CF_3$、
(q) $-N(R_c)(R_d)$、又は
(r) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2は
(a) C_{1-6}アルキル-$OC(O)C_{1-6}$アルコキシ、
(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、
(c) 必要により-$C(O)C_{1-6}$アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-、

(d) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルコキシ-、
(e) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキル-、
(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(g) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキルアミノ-、
(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(i) 複素環$(CH_2)_m$-（前記複素環は1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、
(j) 複素環$(CH_2)_mO$-（その複素環は必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、
(k) $R_b(CH_2)_mO$-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_mO$-（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキル$C(O)N(R_c)(R_d)$であり、
R_3は-$N(R_c)(R_d)$であり、
R_4は水素又は-NH_2であり、
R_aはC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、-NO_2、-OH、-CF_3、-$N(R_c)(R_d)$、-$NHC(O)NHC_{1-6}$アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bは必要によりハロゲン、ピリジル、C_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bはC_{3-6}シクロアルキル、ナフチル、ピリジル、キノリニル及びイソキノリニルであり、
R_c及びR_dは独立にH、C_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル、-SO_2C_{1-6}アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、また
R_c及びR_dが両方ともC_{1-6}アルキルである場合、それらはそれらが結合されている窒素と一緒に、4-7員環を必要により形成してもよく、
R_eは-OH、NHCHO、-$O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、-CO_2C_{1-6}アルキル、-CO_2H、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、$N(R_c)(R_d)$、-$CH_2N(R_c)(R_d)$、-$NHCH_2CO_2H$、-$NHCH_2CON(R_c)(R_d)$、-NHCOOベンジル、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_g)CH_2NH$-、-$NHC(O)N(R_c)(R_d)$、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fはC_{1-6}アルキル、-$(CH_2)_{1-4}NH_2$、ベンジル又はR_bから選ばれ、
R_gはC_{1-6}-アルキル基；フェニル、ナフチル、イミダゾリル、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、2,3-ジヒドロ-ベンゾ〔1,4〕ジオキシニル、1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラニル、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ〔1,4〕オキサジニル及び2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾリルから選ばれたアリール基又はヘテロアリール基であり、
R_gはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、ベンジル、C_{1-6}アルコキシ、フェノキシ、フェニルアミノ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、-NO_2、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル及び-$S(O)_nN(R$

$_{c}$)(R_d)から選ばれた１～３個のR_h基で必要により置換されていてもよく、又はR_hはフェニル、イミダゾリル、ピラゾリル、チエニル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、及びキノリニルから選ばれたアリール基もしくはヘテロアリール基であり、又はR_hはモルホリニルであり、

R_hはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、-CN、$-CO_2H$、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-N(R_c)(R_d)$及び$C(O)N(R_c)(R_d)$から選ばれた１～３個のR_i基で必要により置換されていてもよく、

ｍは０又は１であり、

ｎは０、１又は２であり、かつ

ｐは０、１、２又は３である〕

【請求項２】

R_1が

(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、

(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、$-CO_2C_{1-5}$アルキル、フェニル、ベンジル、-OH及び-C(O)ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、

(c) $R_b(CH_2)_mO-$、

(d) C_{3-6}-シクロアルキル、

(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、

(f) R_bOCH_2-、

(g) $R_b(CH_2)_mNH-$、

(h) $R_b(CH_2)_p(CH=CH)_m-$、

(i) C_{1-6}アルキル、

(j) C_{1-8}アルコキシ、

(k) C_{1-8}アルキルチオ、

(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、

(m) $-CF_3$、

(n) -CHO、

(o) $-OCH_2CO_2H$、

(p) $-OSO_2CF_3$、

(q) $-N(R_c)(R_d)$、又は

(r) $-C(O)NR_cR_d$であり、

R_2が

(a) C_{1-6}アルキル-$OC(O)C_{1-6}$アルコキシ、

(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、

(c) 必要により$-C(O)C_{1-6}$アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-、

(d) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルコキシ-、

(e) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキル-、

(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、

(g) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキルアミノ-、

(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルキルアミノ-、

(i) 複素環$(CH_2)_m-$（前記複素環は1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、

(j) 複素環CH_2O-（その複素環は必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピ

ペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、
(k) $R_b(CH_2)_mO$-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_mO$-（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキル$C(O)N(R_c)(R_d)$であり、
R_3が$-N(R_c)(R_d)$であり、
R_4が水素又は$-NH_2$であり、
R_aがC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、$-CO_2H$、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$-NO_2$、-OH、$-CF_3$、$-N(R_c)(R_d)$、$-NHC(O)NHC_{1-6}$アルキル、$-C(O)N(R_c)(R_d)$及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bが必要によりハロゲン、ピリジル、C_{1-6}アルキル、-CN、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bがC_{3-6}シクロアルキル、ナフチル、ピリジル、キノリニル及びイソキノリニルであり、
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項３】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項４】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項５】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項６】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項７】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項８】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項９】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１０】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１１】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１２】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１３】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１４】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１５】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１６】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、
R_4が水素であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_f)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１７】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{3-6}-シクロアルキル、
(c) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(d) C_{1-4}アルコキシ、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパ

R_c)(R_d)、N(R_c)(R_d)、-CH_2N(R_c)(R_d)、-NHCOOベンジル、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-C(O)C_{1-6}アルキルN(R_c)(R_d)、-NHC$O_2$$C_{1-6}$アルキル、HOCH($R_b$)$CH_2$NH-、-NHC(O)N($R_c$)($R_d$)、-S(O)$_n$$C_{1-6}$アルキル、($CH_3$)$_3$COC(O)-、フェニル、ピリジル、$H_2$NCH($R_f$)C(O)-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環がピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、

R_fがC_{1-6}アルキル、-(CH_2)$_{1-4}$$NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、

ｍが０又は１であり、

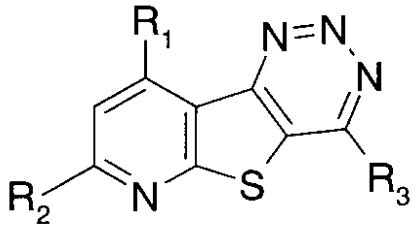
ｎが０、１又は２であり、かつ

ｐが０、１、２又は３である、請求項１記載の式Ｉの化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。

【請求項４】

式(II)

【化２】



(II)

の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。

〔式中、

R_1は

(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、

(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、-$CO_2$$C_{1-5}$アルキル、フェニル、ベンジル、-OH及び-C(O)ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、

(c) R_b(CH_2)$_m$O-、

(d) C_{3-6}-シクロアルキル、

(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、

(f) R_bOCH_2-、

(g) R_b(CH_2)$_m$NH-、

(h) R_b(CH_2)$_p$(CH=CH)$_m$-、

(i) C_{1-6}アルキル、

(j) C_{1-8}アルコキシ、

(k) C_{1-8}アルキルチオ、

(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、

(m) -CF_3、

(n) -CHO、

(o) -O$CH_2$$CO_2$H、

(p) -O$SO_2$$CF_3$、

(q) -N(R_c)(R_d)、又は

(r) -C(O)N$R_c$$R_d$であり、

R_2は

(a) C_{1-6}アルキル-OC(O)C_{1-6}アルコキシ、

(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、
(c) 必要により-C(O)C_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-、
(d) (R_c)(R_d)NC_{1-6}アルコキシ-、
(e) (R_c)(R_d)NC_{1-6}アルキル-、
(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(g) (R_c)(R_d)NC_{1-6}アルキルアミノ-、
(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(i) 複素環$(CH_2)_m$-（前記複素環は1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、
(j) 複素環$(CH_2)_m$O-（その複素環は必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、
(k) $R_b(CH_2)_m$O-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_m$O-（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキルC(O)N(R_c)(R_d)であり、
R_3は-N(R_c)(R_d)であり、
R_aはC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-S(O)$_n C_{1-6}$アルキル、-NO_2、-OH、-CF_3、-N(R_c)(R_d)、-NHC(O)NHC_{1-6}アルキル、-C(O)N(R_c)(R_d)及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bは必要によりハロゲン、1-ナフチル、C_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2C_{1-6}アルキル、-C(O)N(R_c)(R_d)、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bはC_{3-6}シクロアルキルであり、
R_c及びR_dは独立にH、C_{1-6}アルキル、-C(O)C_{1-6}アルキル、-SO_2C_{1-6}アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3$COC(O)-から選ばれ、また
R_c及びR_dが両方ともC_{1-6}アルキルである場合、それらはそれらが結合されている窒素と一緒に、4-7員環を必要により形成してもよく、
R_eは-OH、NHCHO、-O(CH_2)フェニル、アミノ、-CN、オキソ、-CO_2C_{1-6}アルキル、-CO_2H、-C(O)N(R_c)(R_d)、N(R_c)(R_d)、-CH_2N(R_c)(R_d)、-NHCH_2CO_2H、-NHCH_2CON(R_c)(R_d)、-NHCOOベンジル、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-C(O)C_{1-6}アルキルN(R_c)(R_d)、-NHCO_2C_{1-6}アルキル、HOCH(R_g)CH_2NH-、-NHC(O)N(R_c)(R_d)、-S(O)$_n C_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3$COC(O)-、フェニル、ピリジル、H_2NCH(R_f)C(O)-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fはC_{1-6}アルキル、-$(CH_2)_{1-4}NH_2$、ベンジル又はR_bから選ばれ、
R_gはC_{1-6}アルキル基；フェニル、ナフチル、イミダゾリル、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、2,3-ジヒドロ-ベンゾ〔1,4〕ジオキシニル、1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラニル、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ〔1,4〕オキサジニル及び2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾリルから選ばれたアリール基又はヘテロアリール基であり、
R_gはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、ベンジル、C_{1-6}アルコキシ、フェノキシ、フェニルアミノ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-N(R_c)(R

$_d$)、C_{1-6}アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-NO_2$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル及び$-S(O)_nN(R_c)(R_d)$から選ばれた１～３個のR_h基で必要により置換されていてもよく、又はR_hはフェニル、イミダゾリル、ピラゾリル、チエニル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、及びキノリニルから選ばれたアリール基もしくはヘテロアリール基であり、又はR_hはモルホリニルであり、

R_hはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、$-CN$、$-CO_2H$、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-N(R_c)(R_d)$及び$C(O)N(R_c)(R_d)$から選ばれた１～３個のR_i基で必要により置換されていてもよく、

ｍは０又は１であり、

ｎは０、１又は２であり、かつ

ｐは０、１、２又は３である〕

【請求項５】

R_1が

(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、

(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、$-CO_2C_{1-5}$アルキル、フェニル、ベンジル、$-OH$及び$-C(O)$ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、

(c) $R_b(CH_2)_mO-$、

(d) C_{3-6}-シクロアルキル、

(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、

(f) R_bOCH_2-、

(g) $R_b(CH_2)_mNH-$、

(h) $R_b(CH_2)_p(CH=CH)_m-$、

(i) C_{1-6}アルキル、

(j) C_{1-8}アルコキシ、

(k) C_{1-8}アルキルチオ、

(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、

(m) $-CF_3$、

(n) $-CHO$、

(o) $-OCH_2CO_2H$、

(p) $-OSO_2CF_3$、

(q) $-N(R_c)(R_d)$、又は

(r) $-C(O)NR_cR_d$であり、

R_2が

(a) C_{1-6}アルキル$-OC(O)C_{1-6}$アルコキシ、

(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、

(c) 必要により$-C(O)C_{1-6}$アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-、

(d) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルコキシ-、

(e) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキル-、

(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、

(g) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキルアミノ-、

(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}-アルキルアミノ-、

(i) 複素環$(CH_2)_m-$（前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、

(j) 複素環CH_2O-（その複素環が必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、
(k) $R_b(CH_2)_mO$-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_mO$-（そのヘテロアリールがフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールがフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキル$C(O)N(R_c)(R_d)$であり、
R_3が-$N(R_c)(R_d)$であり、
R_aがC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、-NO_2、-OH、-CF_3、-$N(R_c)(R_d)$、-$NHC(O)NHC_{1-6}$アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bが必要によりハロゲン、1-ナフチル、C_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bがC_{3-6}シクロアルキルであり、
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル、-SO_2C_{1-6}アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、-NH_2、NHCHO、-$O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、-CO_2C_{1-6}アルキル、-CO_2H、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、-$N(R_c)(R_d)$、-$CH_2N(R_c)(R_d)$、-CH_2OH、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_b)CH_2NH$-、-$NHC(O)N(R_c)(R_d)$、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環がピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、-$(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項４記載の式(II)の化合物又はその医薬上許される誘導体。
【請求項６】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{1-4}アルコキシ、
(c) C_{3-6}-シクロアルキル、
(d) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) -CF_3、又は
(g) -$C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が-NH_2であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル、-SO_2C_{1-6}アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、-NH_2、NHCHO、-$O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、-CO_2C_{1-6}アルキル、-CO_2H、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、-$N(R_c)(R_d)$、-$CH_2N(R_c)(R_d)$、-CH_2OH、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$NHCO_2C_{1-6}$アルキル、HO

$CH(R_b)CH_2NH$-、-$NHC(O)N(R_c)(R_d)$、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環がピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、

R_fがC_{1-6}アルキル、-$(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、

ｍが０又は１であり、

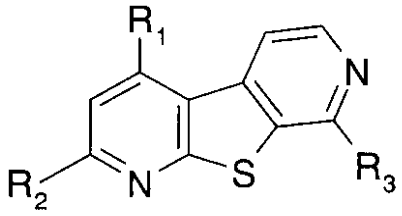
ｎが０、１又は２であり、かつ

ｐが０、１、２又は３である、請求項４記載の式(II)の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。

【請求項７】

式(III)

【化３】



(III)

の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。

〔式中、

R_1は

(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、

(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、-CO_2C_{1-5}アルキル、フェニル、ベンジル、-OH及び-C(O)ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、

(c) $R_b(CH_2)_mO$-、

(d) C_{3-6}-シクロアルキル、

(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、

(f) R_bOCH_2-、

(g) $R_b(CH_2)_mNH$-、

(h) $R_b(CH_2)_p(CH=CH)_m$-、

(i) C_{1-6}アルキル、

(j) C_{1-8}アルコキシ、

(k) C_{1-8}アルキルチオ、

(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、

(m) -CF_3、

(n) -CHO、

(o) -OCH_2CO_2H、

(p) -OSO_2CF_3、

(q) -$N(R_c)(R_d)$、又は

(r) -$C(O)NR_cR_d$であり、

R_2は

(a) C_{1-6}アルキル-$OC(O)C_{1-6}$アルコキシ、

(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、

(c) 必要により-$C(O)C_{1-6}$アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-

、
(d) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルコキシ-、
(e) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキル-、
(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(g) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキルアミノ-、
(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルキルアミノ-、
(i) 複素環$(CH_2)_m$-（前記複素環は1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、
(j) 複素環CH_2O-（その複素環は必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、
(k) $R_b(CH_2)_mO$-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_mO$-（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキル$C(O)N(R_c)(R_d)$であり、
R_3は-$N(R_c)(R_d)$であり、
R_aはC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、-NO_2、-OH、-CF_3、-$N(R_c)(R_d)$、-$NHC(O)NHC_{1-6}$アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bは必要によりハロゲン、1-ナフチル、C_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bはC_{3-6}シクロアルキルであり、
R_c及びR_dは独立にH、C_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル、-SO_2C_{1-6}アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、また
R_c及びR_dが両方ともC_{1-6}アルキルである場合、それらはそれらが結合されている窒素と一緒に、4-7員環を必要により形成してもよく、
R_eは-OH、NHCHO、-$O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、-CO_2C_{1-6}アルキル、-CO_2H、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、$N(R_c)(R_d)$、-$CH_2N(R_c)(R_d)$、-$NHCH_2CO_2H$、-$NHCH_2CON(R_c)(R_d)$、-NHCOOベンジル、C_{1-6}アルキル、-CO_2ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-$C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_g)CH_2NH$-、-$NHC(O)N(R_c)(R_d)$、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環はピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fはC_{1-6}アルキル、-$(CH_2)_{1-4}NH_2$、ベンジル又はR_bから選ばれ、
R_gはC_{1-6}-アルキル基；フェニル、ナフチル、イミダゾリル、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾチアゾリル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、2,3-ジヒドロ-ベンゾ〔1,4〕ジオキシニル、1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラニル、2,3-ジヒドロ-ベンゾフラニル、3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ〔1,4〕オキサジニル及び2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾリルから選ばれたアリール基又はヘテロアリール基であり、
R_gはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、ベンジル、C_{1-6}アルコキシ、フェノキシ、フェニルアミノ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、-CN、-CO_2H、-CO_2C_{1-6}アルキル、-$N(R_c)(R_d)$、C_{1-6}アルキル$N(R_c)(R_d)$、-$C(O)N(R_c)(R_d)$、-NO_2、-$S(O)_nC_{1-6}$アルキル及び-$S(O)_nN(R_c)(R_d)$から選ばれた１～３個のR_h基で必要により置換されていてもよく、又はR_hはフェニ

ル、イミダゾリル、ピラゾリル、チエニル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ベンゾ〔1,3〕ジオキソリル、及びキノリニルから選ばれたアリール基もしくはヘテロアリール基であり、又はR_hはモルホリニルであり、

R_hはハロゲン、ヒドロキシル、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、-CN、$-CO_2H$、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-N(R_c)(R_d)$及び$C(O)N(R_c)(R_d)$から選ばれた１～３個のR_i基で必要により置換されていてもよく、

ｍは０又は１であり、

ｎは０、１又は２であり、かつ

ｐは０、１、２又は３である〕

【請求項８】

R_1が

(a) 必要により１個～２個のR_aで置換されていてもよい、フェニル又はフラニル、チエニル、ピリジル、ピロリル、イミダゾリル及びベンゾフラニルから選ばれたヘテロアリール、

(b) 必要によりC_{1-6}アルキル、$-CO_2C_{1-5}$アルキル、フェニル、ベンジル、-OH及び-C(O)ヘテロアリール（そのヘテロアリールはフラニル、チエニル、ピリジル及びピロリルから選ばれる）から選ばれた１個～２個の基で置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、1-ピロリジニル及び4-モルホリニルから選ばれた複素環、

(c) $R_b(CH_2)_mO-$、

(d) C_{3-6}-シクロアルキル、

(e) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、

(f) R_bOCH_2-、

(g) $R_b(CH_2)_mNH-$、

(h) $R_b(CH_2)_p(CH=CH)_m-$、

(i) C_{1-6}アルキル、

(j) C_{1-8}アルコキシ、

(k) C_{1-8}アルキルチオ、

(l) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}アルコキシ、

(m) $-CF_3$、

(n) -CHO、

(o) $-OCH_2CO_2H$、

(p) $-OSO_2CF_3$、

(q) $-N(R_c)(R_d)$、又は

(r) $-C(O)NR_cR_d$であり、

R_2が

(a) C_{1-6}アルキル-$OC(O)C_{1-6}$アルコキシ、

(b) ヒドロキシC_{1-6}アルキル-、

(c) 必要により$-C(O)C_{1-6}$アルキルで置換されていてもよい、ヒドロキシC_{1-6}アルコキシ-、

(d) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルコキシ-、

(e) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキル-、

(f) ヒドロキシC_{1-6}アルキルアミノ-、

(g) $(R_c)(R_d)NC_{1-6}$アルキルアミノ-、

(h) C_{1-6}アルコキシC_{1-6}-アルキルアミノ-、

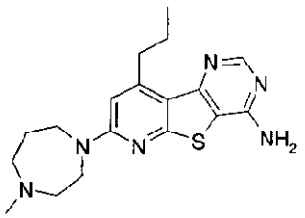
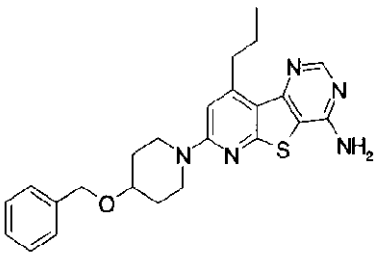
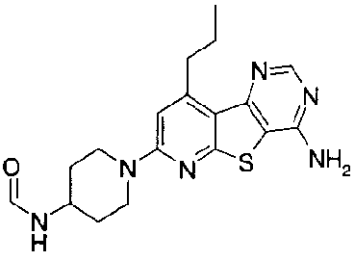
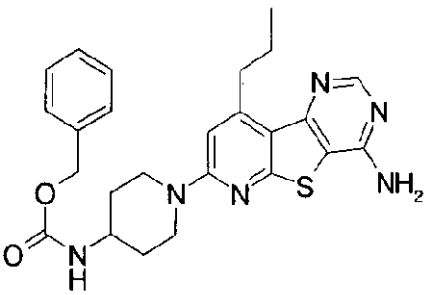
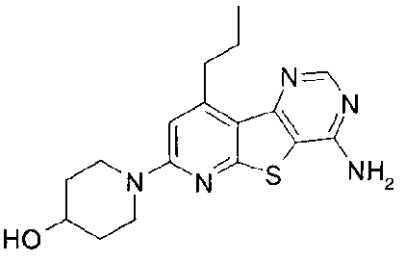
(i) 複素環$(CH_2)_m-$（前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよい）、

(j) 複素環CH_2O-（その複素環が必要によりC_{1-6}アルキルで置換されていてもよい、1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル及び1-ピロリジニルから選ばれる）、

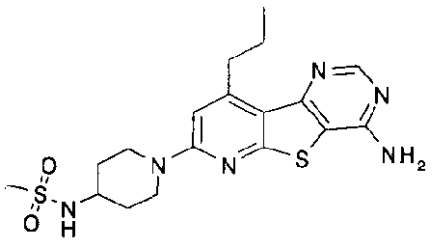
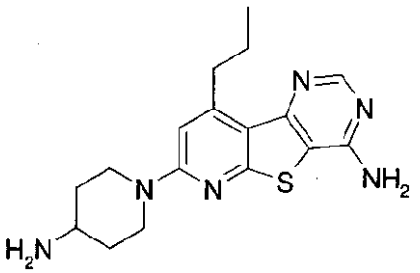
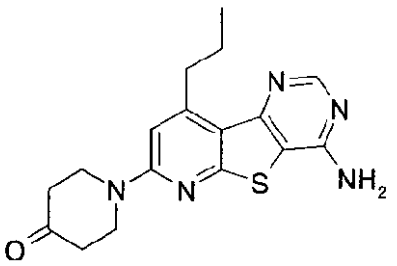
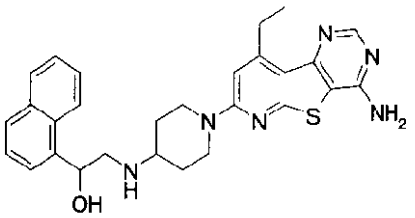
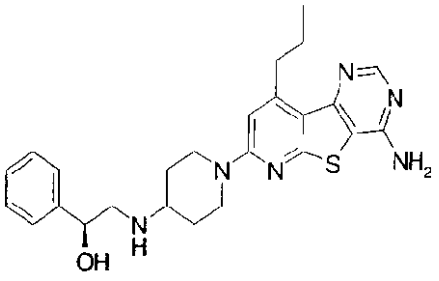
(k) $R_b(CH_2)_mO$-、
(l) ヘテロアリール$(CH_2)_mO$-（そのヘテロアリールがフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(m) ヘテロアリールC_{1-6}アルキルアミノ（そのヘテロアリールがフラニル、チエニル、イミダゾリル、ピリジル、インドリル及びピロリルから選ばれる）、
(n) -SC_{1-6}アルキル、又は
(o) -SC_{1-6}アルキル$C(O)N(R_c)(R_d)$であり、
R_3が$-N(R_c)(R_d)$であり、
R_aがC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、ハロゲン、-CN、$-CO_2H$、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$-NO_2$、-OH、$-CF_3$、$-N(R_c)(R_d)$、$-NHC(O)NHC_{1-6}$アルキル、$-C(O)N(R_c)(R_d)$及びフェニル（必要によりハロゲン、C_{1-6}アルキル、-CN又はC_{1-6}アルコキシで置換されていてもよい）から選ばれ、
R_bが必要によりハロゲン、1-ナフチル、C_{1-6}アルキル、-CN、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、NO_2及びC_{1-6}アルコキシから選ばれた１個又は２個の基で置換されていてもよいフェニル基であり、又はR_bがC_{3-6}シクロアルキルであり、
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、$-NH_2$、NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、$-CH_2OH$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_b)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環がピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項７記載の式(III)の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項９】
R_1が
(a) C_{1-6}アルキル、
(b) C_{1-4}アルコキシ、
(c) C_{3-6}-シクロアルキル、
(d) C_{3-6}-シクロアルキルC_{1-3}アルキル、
(e) C_{1-4}アルキルチオ、
(f) $-CF_3$、又は
(g) $-C(O)NR_cR_d$であり、
R_2が
複素環であり、前記複素環が1-ピペリジニル、1-ピペラジニル、4-モルホリニル、1-アゼパニル、1-ピロリジニル、ジアゼパン-1-イル、1,4-ジアザシクロヘプタン-1-イル、及び2,5-ジアザビシクロ〔2.2.1〕ヘプタン-2-イルから選ばれ、必要により１個又は２個のR_eで置換されていてもよく、
R_3が$-NH_2$であり、かつ
R_c及びR_dが独立にH、C_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル、$-SO_2C_{1-6}$アルキル、フェニル、ベンジル、ピペリジニル、フェニルエチル及び$(CH_3)_3COC(O)$-から選ばれ、
R_eが-OH、$-NH_2$、-NHCHO、$-O(CH_2)$フェニル、アミノ、-CN、オキソ、$-CO_2C_{1-6}$アルキル、$-CO_2H$、$-C(O)N(R_c)(R_d)$、$-N(R_c)(R_d)$、$-CH_2N(R_c)(R_d)$、$-CH_2OH$、C_{1-6}アルキル、$-CO_2$ベンジル、ヒドロキシC_{1-6}アルキル、$-C(O)C_{1-6}$アルキル$N(R_c)(R_d)$、$-NHCO_2C_{1-6}$アルキル、$HOCH(R_b)CH_2NH$-、$-NHC(O)N(R_c)(R_d)$、$-S(O)_nC_{1-6}$アルキル、$(CH_3)_3COC(O)$-、フェニル、ピリジル、$H_2NCH(R_f)C(O)$-及び-C(O)複素環から選ばれ、前記複素環がピペリジニル、ピ

ペラジニル、モルホリニル及びピロリジニルから選ばれ、
R_fがC_{1-6}アルキル、$-(CH_2)_{1-4}NH_2$、フェニル又はベンジルから選ばれ、
ｍが０又は１であり、
ｎが０、１又は２であり、かつ
ｐが０、１、２又は３である、請求項８記載の式(III)の化合物又はその医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。
【請求項１０】

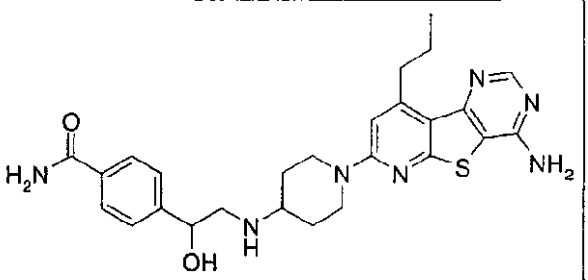
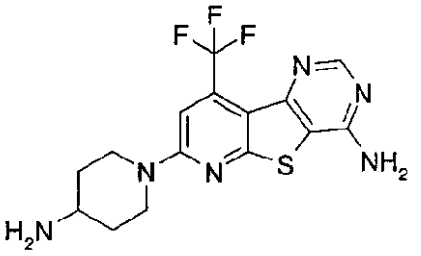
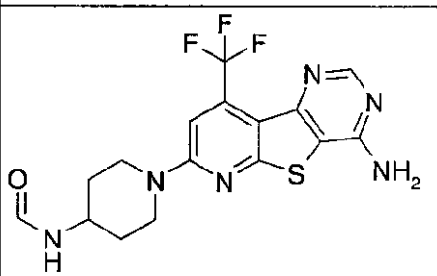
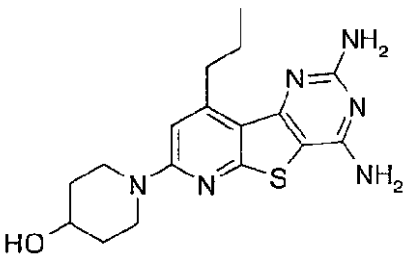
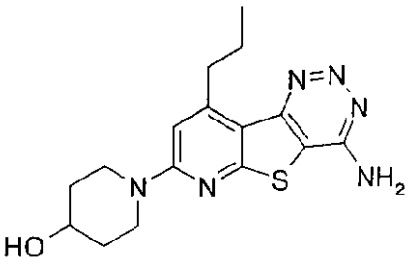
【化４】

化合物 No.	名称	構造
1.	7-(4-メチル-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イルアミン	
2.	7-(4-ベンジルオキシ-ピペリジン-1-イル)-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イルアミン	
3.	N-[1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル]-ホルムアミド	
4.	1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル]-カルバミン酸ベンジルエステル	
5.	1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-オール	

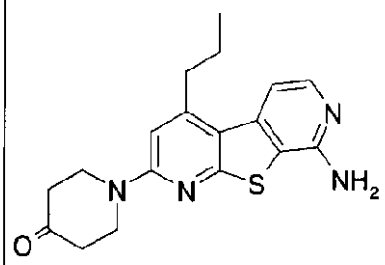
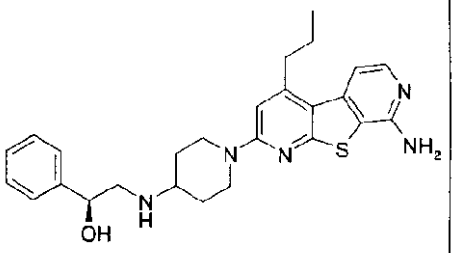
【化５】

化合物 No.	名称	構造
6.	N-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル〕-メタンスルホンアミド	
7.	7-(4-アミノ-ピペリジン-1-イル)-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-4-イルアミン	
8.	1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-オン	
9.	2-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-ナフタレン-1-イル-エタノール	
10.	(S)-2-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-フェニル-エタノール	

【化６】

化合物 No.	名称	構造
11.	4-[2-[1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ]-1-ヒドロキシ-エチル]-ベンズアミド	
12.	7-(4-アミノ-ピペリジン-1-イル)-9-トリフルオロメチル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イルアミン	
13.	N-[1-(4-アミノ-9-トリフルオロメチル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル]-ホルムアミド	
14.	1-(2,4-ジアミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d]ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-オール	
15.	1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド[3',2':4,5]チエノ[3,2-d][1,2,3]トリアジン-7-イル)-ピペリジン-4-オール	

【化７】

化合物 No.	名称	構造
16.	1-(8-アミノ-4-プロピル-9-チア-1,7-ジアザ-フルオレン-2-イル)-ピペリジン-4-オン	
17.	(S)-2-〔1-(8-アミノ-4-プロピル-9-チア-1,7-ジアザ-フルオレン-2-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-フェニル-エタノール	

及びこれらの医薬上許される誘導体から選ばれた化合物。

【請求項１１】

N-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル〕-メタンスルホンアミド、

7-(4-アミノ-ピペリジン-1-イル)-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-4-イルアミン、

1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-オン、

2-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-ナフタレン-1-イル-エタノール、

(S)-2-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-フェニル-エタノール、

4-{2-〔1-(4-アミノ-9-プロピル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イルアミノ〕-1-ヒドロキシ-エチル}-ベンズアミド、

7-(4-アミノ-ピペリジン-1-イル)-9-トリフルオロメチル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-4-イルアミン、

N-〔1-(4-アミノ-9-トリフルオロメチル-ピリド〔3',2':4,5〕チエノ〔3,2-d〕ピリミジン-7-イル)-ピペリジン-4-イル〕-ホルムアミド

から選ばれた請求項１０記載の化合物又はこれらの医薬上許される塩、エステル、異性体もしくは互変異性体。

【請求項１２】

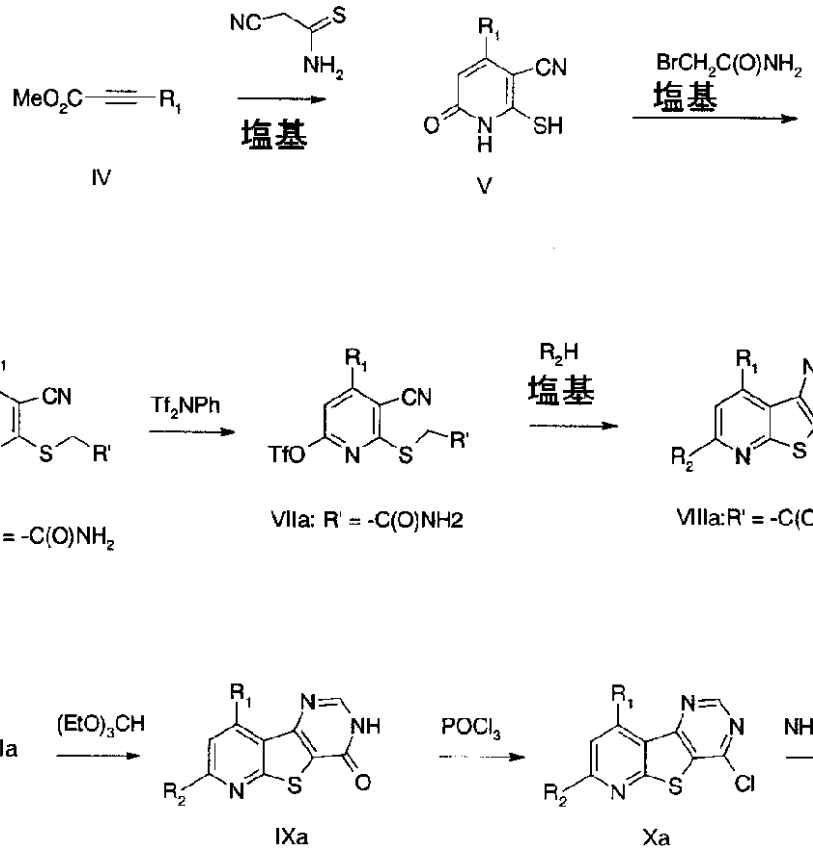
医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物及び一種以上の医薬上許される担体及び／又はアジュバントを含むことを特徴とする医薬組成物。

【請求項１３】

医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物を含有する免疫疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項１４】
医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物を含有する炎症性疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項１５】
医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物を含有するアレルギー性疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項１６】
医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物を含有する、慢性炎症、接触皮膚炎、乾癬、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、１型糖尿病、炎症性腸疾患、ギラン・バレー症候群、クローン病、潰瘍性大腸炎、移植片対宿主疾患、エリテマトーデス、喘息、慢性閉塞性肺病(COPD)、成人呼吸困難症候群(ARDS)、気管支炎、結膜炎、皮膚炎及びアレルギー性鼻炎から選ばれた疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項１７】
医薬有効量の請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物を含有する、癌を治療するための医薬組成物。
【請求項１８】
ワクチンの製造のための請求項１から１１のいずれか１項に記載の化合物の使用。
【請求項１９】
医薬有効量の請求項１０記載の化合物及び一種以上の医薬上許される担体及び／又はアジュバントを含むことを特徴とする医薬組成物。
【請求項２０】
医薬有効量の請求項１０に記載の化合物を含有する、免疫疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項２１】
医薬有効量の請求項１０に記載の化合物を含有する、炎症性疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項２２】
医薬有効量の請求項１０に記載の化合物を含有する、アレルギー性疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項２３】
医薬有効量の請求項１０に記載の化合物を含有する、慢性炎症、接触皮膚炎、乾癬、慢性関節リウマチ、多発性硬化症、１型糖尿病、炎症性腸疾患、ギラン・バレー症候群、クローン病、潰瘍性大腸炎、移植片対宿主疾患、エリテマトーデス、喘息、慢性閉塞性肺病(COPD)、成人呼吸困難症候群(ARDS)、気管支炎、結膜炎、皮膚炎及びアレルギー性鼻炎から選ばれた疾患を治療するための医薬組成物。
【請求項２４】
医薬有効量の請求項１０に記載の化合物を含有する、癌を治療するための医薬組成物。
【請求項２５】
ワクチンの製造のための請求項１０記載の化合物の使用。
【請求項２６】
下記の式(I)

【化８】



（式中、R_1、R_2、R_3、及びR_4は請求項１に定義されたとおりである）の化合物の製造方法であって、前記方法が

R_1を有するアルキノエートエステル、例えば、先に示されたメチルエステルIVを好適な塩基、例えば、モルホリンの存在下で2-シアノチオアセトアミドと反応させてメルカプトピリジンＶを得、

中間体Ｖを好適な塩基、例えば、炭酸カリウムの存在下で2-ブロモアセトアミドと反応させてメルカプトアセトアミドVIaを生成し、

中間体VIaを好適な塩基、例えば、トリエチルアミンの存在下でトリフルオロメチルスルホニル化試薬、例えば、N-フェニルトリフルオロメタンスルホンイミドと反応させてトリフルオロメタンスルホン酸エステルVIIaを生成し、

中間体VIIaを好適な塩基の存在下で求核性R_2Hと反応させて中間体VIIIaを得、

中間体VIIIaを好適な溶媒、例えば、EtOH中で触媒量の酸、例えば、氷酢酸の存在下でトリエチルオルトホルメートとともに加熱してピリドチエノピリミジノンIXaを得、

中間体IXaを好適な塩素化試薬、例えば、オキシ塩化リンと反応させてクロロ中間体Xaを得、

中間体Xaを、好ましくはシールした容器中で加熱しながら所望のアミン-NH(R_c)(R_d)と反応させて式Ｉ（R_3=-NH(R_c)(R_d)、R_4=H）の化合物を得ることを特徴とする式(I)の化合物の製造方法。