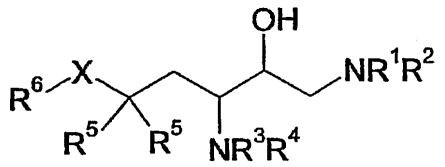
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年5月15日(2008.5.15)

【公表番号】特表2007-529473(P2007-529473A)
【公表日】平成19年10月25日(2007.10.25)
【年通号数】公開・登録公報2007-041
【出願番号】特願2007-503351(P2007-503351)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 209/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4045　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 295/08　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4453　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/06　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4545　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 209/12　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/4045
Ｃ０７Ｄ 295/08
Ａ６１Ｋ 31/4453
Ｃ０７Ｄ 401/06
Ａ６１Ｋ 31/4545
Ａ６１Ｐ 9/04
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 9/10　１０３
Ａ６１Ｐ 9/12
Ａ６１Ｐ 27/06
Ａ６１Ｐ 43/00　１１１

【手続補正書】
【提出日】平成20年3月14日(2008.3.14)
【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)

{式中、
Ｘは、メチレンまたはヒドロキシメチレンであり；
R^1は、ａ）水素であるか；または
ｂ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリール－C_0～C_4－アルキルもしくはヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキルであり、これらの基はC_1～C_8－アルキル、ハロゲン、シアノ、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリール、もしくはヘテロシクリル１～４個により置換されていてもよく；
R^2は、ａ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルキルスルホニル、C_3～C_8－シクロアルキルスルホニル、アリール－C_0～C_8－アルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_1～C_8－アルカノイル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_3～C_8－シクロアルカノイル、アリール－C_1～C_8－アルカノイル、ヘテロシクリル－C_1～C_8－アルカノイル、アリール－C_3～C_8－シクロアルカノイル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、場合によりＮ－モノ－もしくはＮ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキル化カルバモイル－C_0～C_8－アルキル、アリール－C_0～C_4－アルキル、またはヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキルであり、これらの基はC_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ、アミノ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_0～C_6－アルキルカルボニルアミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、場合によりＮ－モノ－もしくはＮ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキル化カルバモイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、C_1～C_6－アルキレンジオキシ、アリールまたはヘテロシクリル１～４個により置換されていてもよく；あるいは
ｂ）R^1およびそれらの結合する窒素原子と一緒になって、更なる窒素、酸素もしく硫黄原子、または－ＳＯ－もしくは－SO_2－基を含んでいてもよい飽和または部分不飽和の４～８員ヘテロシクリル環をなしており、更なる窒素原子は、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリル基によって場合により置換されていてもよく、その場合、このヘテロシクリル環は、合計で最大１６員の二環系または三環系の一部であってもよく、第２の環は、窒素、酸素もしく硫黄原子、または－ＳＯ－もしくは－SO_2－基を含んでいてもよく、その第２の環の窒素原子は、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリル基によって場合により置換されていてもよく、列挙した環系の全ては、C_1～C_8－アルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシカルボニルアミノ、C_1～C_8－アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_8－アルキルアミノ、Ｎ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキルアミノ、アリール－C_0～C_4－アルキル、アリールオキシ－C_0～C_4－アルキル、アリール－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、アリールオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、ヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキル、ヘテロシクリルオキシ－C_0～C_4－アルキル、ヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、またはヘテロシクリルオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ１～４個により置換されていてもよく；

R^3は、水素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_8－アルコキシカルボニルまたはC_1～C_8－アルカノイルであり；

R^4は、水素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_8－アルコキシカルボニルまたはC_1～C_8－アルカノイルであり；

R^5は、それぞれ独立して、水素もしくはC_1～C_8－アルキルであるか、またはそれらの結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_8－シクロアルキリデン基をなしており；

（Ａ）R^6は、ヘテロシクリル基［これは、
C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ、C_3～C_8－シクロアルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、アミノ－C_1～C_6－アルキル、アミノ－C_2～C_7－アルコキシ、ポリハロ－C_1～C_6－アルキル、ポリハロ－C_2～C_7－アルコキシ、ニトロ、アミノ、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルカノイルオキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、オキシド、オキソ、シアノ、カルバモイル、カルボキシ、C_1～C_6－アルキレンジオキシ、フェニル、フェノキシ、フェニルチオ、フェニル－C_1～C_6－アルキルもしくはフェニル－C_1～C_6－アルコキシ（これらのそれぞれは、ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、ヒドロキシル、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル、ヒドロキシ－C_1～C_6－アルキルもしくはトリフルオロメチルによって場合により置換されている）；
ピリジルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_2～C_7－アルケニルオキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、メトキシベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、メチレンジオキシベンジルオキシ、ジオキソラニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_3～C_8－シクロアルキル－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル－C_1～C_6－アルコキシ、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ、カルバモイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、ピリジルカルバモイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、ベンゾイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_3～C_8－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_2～C_6－アルコキシ、シアノ－C_1～C_6－アルキル、シアノ－C_1～C_6－アルコキシ、
２－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルキル、２－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_2～C_7－ア

ルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルキル、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、アシル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、６－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、
（Ｎ－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－アシル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、１－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルイミダゾール－２－イル、１－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－５－イル、５－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－１－イル、２－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル－４－オキソイミダゾール－１－イル、カルバモイル－C_1～C_6－アルキル、カルバモイル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルバモイル、ジ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルキルスルホニル、C_1～C_6－アルキルアミジニル、アセトアミジニル－C_1～C_6－アルキル、Ｏ－メチルオキシミル－C_1～C_6－アルキル、Ｏ，Ｎ－ジメチルヒドロキシルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル－C_1～C_6－アルカノイル、アリール－C_1～C_6－アルカノイルもしくはヘテロシクリル－C_1～C_6－アルカノイル；または
ピリジル、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルアミノ、ピリジル－C_1～C_6－アルキル、ピリジル－C_1～C_6－アルコキシ、ピリミジニル、ピリミジニルオキシ、ピリミジニルチオ、ピリミジニルアミノ、ピリミジニル－C_1～C_6－アルキル、ピリミジニル－C_1～C_6－アルコキシ、チエニル、チエニル－C_1～C_6－アルキル、チエニル－C_1～C_6－アルコキシ、フリル、フリル－C_1～C_6－アルキルもしくはフリル－C_1～C_6－アルコキシ（これらのそれぞれは、ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシもしくはジヒドロキシ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルによって場合により置換されている）；
ピペリジノアルキル、ピペリジノアルコキシ、ピペリジノアルコキシアルキル、モルホリノアルキル、モルホリノアルコキシ、モルホリノアルコキシアルキル、ピペラジノアルキル、ピペラジノアルコキシ、ピペラジノアルコキシアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－１－イルアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－１－イルアルコキシ、［１，２，４］－トリアゾール－４－イルアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－４－イルアルコキシ、［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルキル、［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、３－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルキル、３－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、５－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－３－イルアルキル、５－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－３－イルアルコキシ、テトラゾール－１－イルアルキル、テトラゾール－１－イルアルコキシ、テトラゾール－２－イルアルキル、テトラゾール－２－イルアルコキシ、テトラゾール－５－イルアルキル、テトラゾール－５－

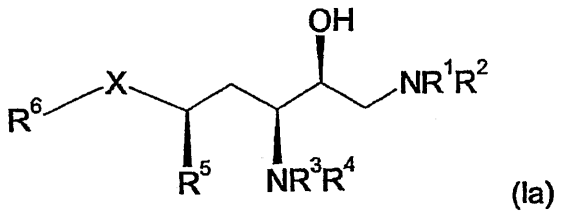
イルアルコキシ、５－メチルテトラゾール－１－イルアルキル、５－メチルテトラゾール－１－イルアルコキシ、チアゾール－４－イルアルキル、チアゾール－４－イルアルコキシ、オキサゾール－４－イルアルキル、オキサゾール－４－イルアルコキシ、２－オキソピロリジニルアルキル、２－オキソピロリジニルアルコキシ、イミダゾリルアルキル、イミダゾリルアルコキシ、２－メチルイミダゾリルアルキル、２－メチルイミダゾリルアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルキル、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシアルキル、ジオキソラニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ジチアニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、３－アセトアミドメチルピロリジニル、３－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２，６－ジメチルモルホリニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ－［１，３］オキサジニル、２－オキソテトラヒドロピリミジニルおよび－Ｏ－CH_2CH（ＯＨ）CH_2NR_x基（式中、NR_xは、モノ－もしくはジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、ピペリジノ、モルホリノ、ピペラジノ、またはＮ－メチルピペラジノ基である）
から選択される基１～４個により置換されている］であるか、あるいは、
（Ｂ）R^6は、C_1～C_6－アルキレンジオキシにより置換されたフェニル、フリル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、インドリル、キノリニル、ピラジニル、トリアゾリル、イミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ピラニル、テトラヒドロピラニル、アゼチジニル、モルホリニル、テトラヒドロキノリル、テトラヒドロイソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、イソキノリル、ベンゾ［ｂ］チエニル、イソベンゾフラニル、ベンゾイミダゾリル、２－オキソベンゾイミダゾイル、オキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、トリアジニル、ジヒドロベンゾフラニル、２－オキソジヒドロベンゾ［ｄ］［１，３］オキサジニル、４－オキソジヒドロイミダゾリル、５－オキソ－４Ｈ－［１，２，４］トリアジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ［１，４］チアジニル、テトラヒドロキノキサリニル、１，１，３－トリオキソジヒドロ－２Ｈ－１λ^6－ベンゾ［１，４］チアジニル、１－オキソピリジル、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、２－オキソテトラヒドロベンゾ［ｅ］［１，４］ジアゼピニル、２－オキソジヒドロベンゾ［ｅ］［１，４］ジアゼピニル、１Ｈ－ピロリジニル、フタラジニル、１－オキソ－３Ｈ－イソベンゾフラニル、４－オキソ－３Ｈ－チエノ［２，３－ｄ］ピリミジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、［１，５］ナフチリジル、ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］チアジニル、１，１－ジオキソジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］チアジニル、２－オキソ－１Ｈ－ピリド［２，３－ｂ］［１，４］オキサジニル、ジヒドロ－１Ｈ－ピリド［２，３－ｂ］［１，４］オキサジニル、１Ｈ－ピロロ［２，３－ｂ］ピリジル、ベンゾ［１，３］ジオキソリル、ベンゾオキサゾリル、２－オキソベンゾオキサゾリル、２－オキソ－１，３－ジヒドロインドリル、２，３－ジヒドロインドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ジオキソラニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ジチアニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２，６－ジメチルモルホリニル、テトラヒドロピラニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピペリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ［１，３］オキサジニル、２－オキソアゼパニル、または２－オキソテトラヒドロピリミジニルである
}
で示される化合物、またはそのプロドラッグ（これは、インビボでの適用の際、化学的ま

たは生理学的過程により式（Ｉ）の化合物を放出する）、もしくは原子１個以上がそれらの安定した非放射性同位体に置き換わったもの、もしくはその塩。

【請求項２】

式（１ａ）：

【化２】



（式中、置換基は、それぞれ、請求項１に定義したとおりである）に相当することを特徴とする、請求項１記載の化合物。

【請求項３】

R^2が、C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルキルスルホニル、C_3～C_8－シクロアルキルスルホニル、アリール－C_0～C_8－アルキルスルホニル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_1～C_8－アルカノイル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_3～C_8－シクロアルカノイル、アリール－C_1～C_8－アルカノイル、ヘテロシクリル－C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルカノイル、またはアリール－C_0～C_4－アルキルであり、これらの基がC_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ、C_0～C_6－アルキルカルボニルアミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキシド、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、または場合によりＮ－モノ－もしくはＮ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキル化カルバモイル１～４個により置換されていてもよい、請求項１または２記載の化合物。

【請求項４】

R^1が、ａ）水素であるか；または

ｂ）C_1～C_8－アルキルもしくはC_3～C_8－シクロアルキルであり；

R^2が、ａ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルカノイル、ヘテロシクリル－C_1～C_8－アルカノイル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_1～C_8－アルカノイル、もしくはアリール－C_1～C_8－アルカノイルであり、これらの基がC_1～C_8－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシル、C_1～C_6－アルカノイルアミノ、C_1～C_8－アルコキシ、オキシド、オキソ、トリフルオロメチルもしくはアリール１～４個により置換されていてもよく；または

ｂ）R^1およびそれらの結合する窒素原子と一緒になって、更なる窒素もしくは酸素原子を含んでいてもよい飽和もしくは部分不飽和の４～８員ヘテロシクリル環をなしており、その場合、更なる窒素原子が、C_1～C_8－アルキルもしくはC_1～C_8－アルカノイルによって場合により置換されていてもよく、その場合、このヘテロシクリル環が、合計で最大１６員の二環系もしくは三環系の一部であってもよく、第２の環が、窒素もしくは酸素原子を含んでいてもよく、その第２の環の窒素原子が、C_1～C_8－アルキルもしくはC_1～C_8－アルカノイルによって場合により置換されていてもよく、列挙した環系の全てが、C_1～C_8－アルキル、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルカノイルアミノもしくはアリールオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ１～４個により置換されていてもよい、請求項１または２記載の化合物。

【請求項５】

Ｘが、メチレンであり；

R^1が、ａ）水素であるか；または

ｂ）C_1～C_8－アルキルもしくはC_3～C_8－シクロアルキルであり；

R^2が、ａ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルカノイ

ル、ヘテロシクリル－C_1～C_8－アルカノイル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_1～C_8－アルカノイル、もしくはアリール－C_1～C_8－アルカノイルであり、これらの基がC_1～C_8－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシル、C_1～C_6－アルカノイルアミノ、C_1～C_8－アルコキシ、オキシド、オキソ、トリフルオロメチルもしくはアリール１～４個により置換されていてもよく；または

ｂ）R^1およびそれらの結合する窒素原子と一緒になって、更なる窒素もしくは酸素原子を含んでいてもよい飽和もしくは部分不飽和の４～８員ヘテロシクリル環をなしており、その場合、更なる窒素原子が、C_1～C_8－アルキルもしくはC_1～C_8－アルカノイルによって場合により置換されていてもよく、その場合、このヘテロシクリル環が、合計で最大１６員の二環系もしくは三環系の一部であってもよく、第２の環が、窒素もしくは酸素原子を含んでいてもよく、その第２の環の窒素原子が、C_1～C_8－アルキルもしくはC_1～C_8－アルカノイルによって場合により置換されていてもよく、列挙した環系の全てが、C_1～C_8－アルキル、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルカノイルアミノもしくはアリールオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ１～４個により置換されていてもよく；

R^3が、水素であり；

R^4が、水素であり；

R^5が、それぞれ独立して、水素またはC_1～C_8－アルキルであり；

R^6が、請求項１に定義したとおりである、請求項１または２記載の化合物。

【請求項６】

R^6基が、フリル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、インドリル、キノリニル、ベンゾイミダゾリル、ジ－C_1～C_6－アルコキシピリミジニル、２－および５－ベンゾ［ｂ］チエニル、６－および７－イソキノリル、６－および７－テトラヒドロキノリル、６－および７－テトラヒドロイソキノリル、６－キノキサリニル、６－および７－キナゾリニル、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、２－オキソベンゾオキサゾリル、２－オキソ－１，３－ジヒドロインドリル、２，３－ジヒドロインドリル、インダゾリルまたはベンゾフラニル；ならびに

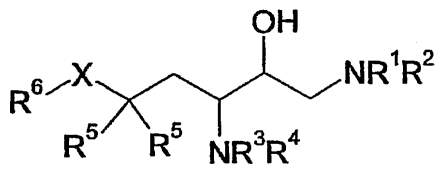
６－および７－キノリル、６－および７－イソキノリル、６－および７－テトラヒドロキノリル、オキソテトラヒドロキノリル、６－および７－テトラヒドロイソキノリル、６－キノキサリニル、６－および７－キナゾリニル、インドリル、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ［１，４］オキサジニル、２－オキソベンゾオキサゾリル、２－オキソ－２，３－ジヒドロベンゾオキサゾリル、２－オキソ－１，３－ジヒドロインドリル、２，３－ジヒドロインドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、２，３－ジヒドロベンゾチアジニル、イミダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ピリジニル、ピロロ［２，３－ｂ］ピリジニル、ピロロ［３，２－ｃ］ピリジニル、ピロロ［２，３－ｃ］ピリジニル、ピロロ［３，２－ｂ］ピリジニル、［１，２，３］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジニル、［１，２，４］トリアゾロ［４，３－ａ］ピリジニル、イミダゾ［１，２－ａ］ピリミジニル、またはイミダゾ［１，５－ａ］ピリジニル

（これらのそれぞれは、

C_1～C_6－アルキル、シアノ、オキソ、オキシド、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、ハロゲン、カルバモイル、カルボキシ、C_1～C_6－アルコキシ、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、２，３－ジヒドロキシプロポキシ、２，３－ジヒドロキシプロポキシ－C_1～C_6－アルコキシ、２，３－ジメトキシプロポキシ、メトキシベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、フェネチルオキシ、メチレンジオキシベンジルオキシ、ジオキソラニル－C_1～C_6－アルコキシ、シクロプロピル－C_1～C_6－アルコキシ、ピリジルカルバモイルオ

キシ－C_1～C_6－アルコキシ、３－モルホリノ－２－ヒドロキシプロポキシ、ベンジルオキシ－C_1～C_6－アルコキシ、ピコリルオキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルコキシ、C_3～C_6－シクロアルキルカルボノルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_1～C_6－アルコキシ、シアノ－C_1～C_6－アルキル、シアノ－C_1～C_6－アルコキシ、２－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルキル、
２－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルキル、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、アシル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、
C_1～C_6－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、６－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（Ｎ－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（Ｎ－アシル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、（Ｎ－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、１－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルイミダゾール－２－イル、１－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－５－イル、５－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－１－イル、２－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル－４－オキソイミダゾール－１－

イル、カルバモイル－C_1～C_6－アルキル、カルバモイル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルバモイル、ジ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルキルスルホニル、ピペリジノアルキル、ピペリジノアルコキシ、ピペリジノアルコキシアルキル、モルホリノアルキル、モルホリノアルコキシ、モルホリノアルコキシアルキル、ピペラジノアルキル、
ピペラジノアルコキシ、ピペラジノアルコキシアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－１－イルアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－１－イルアルコキシ、［１，２，４］－トリアゾール－４－イルアルキル、［１，２，４］－トリアゾール－４－イルアルコキシ、［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルキル、［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、３－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルキル、３－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、５－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－３－イルアルキル、５－メチル－［１，２，４］－オキサジアゾール－３－イルアルコキシ、テトラゾール－１－イルアルキル、テトラゾール－１－イルアルコキシ、テトラゾール－２－イルアルキル、テトラゾール－２－イルアルコキシ、テトラゾール－５－イルアルキル、テトラゾール－５－イルアルコキシ、５－メチルテトラゾール－１－イルアルキル、５－メチルテトラゾール－１－イルアルコキシ、チアゾール－４－イルアルキル、チアゾール－４－イルアルコキシ、オキサゾール－４－イルアルキル、オキサゾール－４－イルアルコキシ、２－オキソピロリジニルアルキル、２－オキソピロリジニルアルコキシ、イミダゾリルアルキル、イミダゾリルアルコキシ、２－メチルイミダゾリルアルキル、２－メチルイミダゾリルアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルキル、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシアルキル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、３－アセトアミドメチルピロリジニル、３－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２，６－ジメチルモルホリニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ－［１，３］オキサジニルおよび２－オキソテトラヒドロピリミジニル
から選択される基１～４個により置換されている）
からなる群から選択される、請求項１～５の１項記載の化合物。
【請求項７】
式（Ｉ）：
【化１４】



(I)

｛式中、
Ｘは、メチレンまたはヒドロキシメチレンであり；
R^1は、ａ）水素であるか；または
ｂ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリール－C_0～C_4－アルキルもしくはヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキルであり、これらの基はC_1～C_8－アルキル、ハロゲン、シアノ、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリール、もしくはヘテロシクリル１～４個により置換されていてもよく；

R^2は、ａ）C_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_1～C_8－アルキルスルホニル、C_3～C_8－シクロアルキルスルホニル、アリール－C_0～C_8－アルキルスルホニル、ヘテロシクリルスルホニル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_1～C_8－アルカノイル、C_3～C_{12}－シクロアルキル－C_3～C_8－シクロアルカノイル、アリール－C_1～C_8－アルカノイル、ヘテロシクリル－C_1～C_8－アルカノイル、アリール－C_3～C_8－シクロアルカノイル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、場合によりＮ－モノ－もしくはＮ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキル化カルバモイル－C_0～C_8－アルキル、アリール－C_0～C_4－アルキル、またはヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキルであり、これらの基はC_1～C_8－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ、アミノ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_0～C_6－アルキルカルボニルアミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、場合によりＮ－モノ－もしくはＮ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキル化カルバモイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、C_1～C_6－アルキレンジオキシ、アリールまたはヘテロシクリル１～４個により置換されていてもよく；あるいは

ｂ）R^1およびそれらの結合する窒素原子と一緒になって、更なる窒素、酸素もしく硫黄原子、または－ＳＯ－もしくは－SO_2－基を含んでいてもよい飽和または部分不飽和の４～８員ヘテロシクリル環をなしており、更なる窒素原子は、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリル基によって場合により置換されていてもよく、その場合、このヘテロシクリル環は、合計で最大１６員の二環系または三環系の一部であってもよく、第２の環は、窒素、酸素もしく硫黄原子、または－ＳＯ－もしくは－SO_2－基を含んでいてもよく、その第２の環の窒素原子は、C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルカノイル、C_1～C_8－アルコキシカルボニル、アリールまたはヘテロシクリル基によって場合により置換されていてもよく、列挙した環系の全ては、C_1～C_8－アルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、オキシド、オキソ、トリフルオロメチル、C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルキル、C_1～C_8－アルコキシ－C_1～C_8－アルコキシ、C_1～C_8－アルコキシカルボニルアミノ、C_1～C_8－アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_8－アルキルアミノ、Ｎ，Ｎ－ジ－C_1～C_8－アルキルアミノ、アリール－C_0～C_4－アルキル、アリールオキシ－C_0～C_4－アルキル、アリール－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、アリールオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、ヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキル、ヘテロシクリルオキシ－C_0～C_4－アルキル、ヘテロシクリル－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ、またはヘテロシクリルオキシ－C_0～C_4－アルキル－C_1～C_8－アルコキシ１～４個により置換されていてもよく；

R^3は、水素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_8－アルコキシカルボニルまたはC_1～C_8－アルカノイルであり；

R^4は、水素、C_1～C_4－アルキル、C_1～C_8－アルコキシカルボニルまたはC_1～C_8－アルカノイルであり；

R^5は、それぞれ独立して、水素もしくはC_1～C_8－アルキルであるか、またはそれらの結合する炭素原子と一緒になって、C_3～C_8－シクロアルキリデン基をなしており；

R^6は、非置換多環式不飽和炭化水素基、または多環式不飽和炭化水素基［これは、C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ、C_3～C_8－シクロアルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、アミノ－C_1～C_6－アルキル、アミノ－C_2～C_7－アルコキシ、ポリハロ－C_1～C_6－アルキル、ポリハロ－C_2～C_7－アルコキシ、ニトロ、アミノ、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルカノイルオキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、オキシド、オキソ、シアノ、カルバモイル、カルボキシ、C_1～C_6－アルキレンジオキシ、フェニル、フェノキシ、フェニルチオ、フェニル－C_1～C_6－アルキルもしくはフェニル－C_1～C_6－アルコキシ（これらのそれぞれは、ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ

、ヒドロキシル、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル、ヒドロキシ－C_1～C_6－アルキルもしくはトリフルオロメチルによって場合により置換されている）；
ピリジルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_2～C_7－アルケニルオキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、メトキシベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、メチレンジオキシベンジルオキシ、ジオキソラニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_3～C_8－シクロアルキル－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキル－C_1～C_6－アルコキシ、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ、カルバモイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、ピリジルカルバモイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、ベンゾイルオキシ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_3～C_8－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_8－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ヒドロキシ－C_2～C_7－アルコキシ－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルカルボニルオキシ－C_2～C_6－アルコキシ、シアノ－C_1～C_6－アルキル、シアノ－C_1～C_6－アルコキシ、
2－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルキル、2－オキソオキサゾリジニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_1～C_6－アルキル、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルキルスルホニルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ－C_2～C_7－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルキル、
C_1～C_6－アルキルスルホニル－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルキル、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ、カルボキシ－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、アシル－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシカルボニルアミノ、（N－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（N－ヒドロキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（N－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（N－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、6－アルコキシアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（N－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルキル、（N－C_1～C_6－アルコキシ）－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_1～C_6－アルコキシ、（N－アシル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルアミノ

、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、（N－C_1～C_6－アルキル）－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルカルボニルアミノ、1－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルイミダゾール－2－イル、1－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－5－イル、5－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルテトラゾール－1－イル、2－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル－4－オキソイミダゾール－1－イル、カルバモイル－C_1～C_6－アルキル、カルバモイル－C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルカルバモイル、ジ－C_1～C_6－アルキルカルバモイル、C_1～C_6－アルキルスルホニル、C_1～C_6－アルキルアミジニル、アセトアミジニル－C_1～C_6－アルキル、O－メチルオキシミル－C_1～C_6－アルキル、O，N－ジメチルヒドロキシルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル－C_1～C_6－アルカノイル、アリール－C_1～C_6－アルカノイルもしくはヘテロシクリル－C_1～C_6－アルカノイル；または

ピリジル、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルアミノ、ピリジル－C_1～C_6－アルキル、ピリジル－C_1～C_6－アルコキシ、ピリミジニル、ピリミジニルオキシ、ピリミジニルチオ、ピリミジニルアミノ、ピリミジニル－C_1～C_6－アルキル、ピリミジニル－C_1～C_6－アルコキシ、チエニル、チエニル－C_1～C_6－アルキル、チエニル－C_1～C_6－アルコキシ、フリル、フリル－C_1～C_6－アルキルもしくはフリル－C_1～C_6－アルコキシ（これらのそれぞれは、ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシもしくはジヒドロキシ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルによって場合により置換されている）；

ピペリジノアルキル、ピペリジノアルコキシ、ピペリジノアルコキシアルキル、モルホリノアルキル、モルホリノアルコキシ、モルホリノアルコキシアルキル、ピペラジノアルキル、ピペラジノアルコキシ、ピペラジノアルコキシアルキル、［1，2，4］－トリアゾール－1－イルアルキル、［1，2，4］－トリアゾール－1－イルアルコキシ、［1，2，4］－トリアゾール－4－イルアルキル、［1，2，4］－トリアゾール－4－イルアルコキシ、［1，2，4］－オキサジアゾール－5－イルアルキル、［1，2，4］－オキサジアゾール－5－イルアルコキシ、3－メチル－［1，2，4］－オキサジアゾール－5－イルアルキル、3－メチル－［1，2，4］－オキサジアゾール－5－イルアルコキシ、5－メチル－［1，2，4］－オキサジアゾール－3－イルアルキル、5－メチル－［1，2，4］－オキサジアゾール－3－イルアルコキシ、テトラゾール－1－イルアルキル、テトラゾール－1－イルアルコキシ、テトラゾール－2－イルアルキル、テトラゾール－2－イルアルコキシ、テトラゾール－5－イルアルキル、テトラゾール－5－イルアルコキシ、5－メチルテトラゾール－1－イルアルキル、5－メチルテトラゾール－1－イルアルコキシ、チアゾール－4－イルアルキル、チアゾール－4－イルアルコキシ、オキサゾール－4－イルアルキル、オキサゾール－4－イルアルコキシ、2－オキソピロリジニルアルキル、2－オキソピロリジニルアルコキシ、イミダゾリルアルキル、イミダゾリルアルコキシ、2－メチルイミダゾリルアルキル、2－メチルイミダゾリルアルコキシ、N－メチルピペラジノアルキル、N－メチルピペラジノアルコキシ、N－メチルピペラジノアルコキシアルキル、ジオキソラニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ジチアニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリル、4－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、2－ヒドロキシメチルピロリジニル、3－ヒドロキシピロリジニル、3，4－ジヒドロキシピロリジニル、3－アセトアミドメチルピロリジニル、3－C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキルピロリジニル、4－ヒドロキシピペリジニル、4－オキソピペリジニル、3，5－ジメチルモルホリニル、4，4－ジオキソチオモルホリニル、4－オキソチオモルホリニル、2，6－ジメチルモルホリニル、2－オキソイミダゾリジニル、2－オキソオキサゾリジニル、2－オキソピロリジニル、2－オキソ－［1，3］オキサジニル、2－オキソテトラヒドロピリミジニルおよび－O－CH_2CH（OH）CH_2NR_x基（式中、NR_xは、モノ－もしくはジ－C_1～C_6－アルキ

ルアミノ、ピペリジノ、モルホリノ、ピペラジノ、またはＮ－メチルピペラジノ基である）
から選択される基１～４個により置換されている］
である｝で示される化合物、またはそのプロドラッグ（これは、インビボでの適用の際、化学的または生理学的過程により式（Ｉ）の化合物を放出する）、もしくは原子１個以上がそれらの安定した非放射性同位体に置き換わったもの、もしくはその塩。
【請求項８】
ヒトまたは動物の体を治療的に処置する方法において使用される、請求項１～６のいずれか１項記載の化合物。
【請求項９】
活性医薬成分としての請求項１～６のいずれか１項記載の化合物を、遊離形態でまたは薬学的に使用され得る塩として含む医薬製剤。
【請求項１０】
高血圧、心不全、緑内障、心筋梗塞、腎不全または再狭窄の治療または予防のための医薬を製造するための、請求項１～７のいずれか１項記載の化合物の使用。
【請求項１１】
心臓血管作用を有する薬剤、例えばα－およびβ－ブロッカー（例えば、フェントラミン、フェノキシベンザミン、プラゾシン、テラゾシン、トラジン、アテノロール、メトプロロール、ナドロール、プロプラノロール、チモロール、カルテオロールなど）、血管弛緩剤（例えば、ヒドララジン、ミノキシジル、ジアゾキシド、ニトロプルシド、フロセキナンなど）、カルシウム拮抗剤（例えば、アムリノン、ベンシクラン、ジルチアゼム、フェンジリン、フルナリジン、ニカルジピン、ニモジピン、パーヘキシレン、ベラパミル、ガロパミル、ニフェジピンなど）、ＡＣＥ阻害剤（例えば、シラザプリル、カプトプリル、エナラプリル、リシノプリルなど）、カリウム活性化剤（例えばピナシジル）、抗セロトニン作動薬（例えばケタンセリン）、トロンボキサン合成酵素阻害剤、中性エンドペプチダーゼ阻害剤（ＮＥＰ阻害剤）、アンギオテンシンII拮抗剤；利尿薬（例えば、ヒドロクロロチアジド、クロロチアジド、アセタゾラミド、アミロリド、ブメタニド、ベンズチアジド、エタクリン酸、フロセミド、インダクリノン、メトラゾン、スピロノラクトン、トリアムテレン、クロルタリドンなど）、交感神経遮断薬（例えば、メチルドパ、クロニジン、グアナベンズ、レセルピン）、ならびにヒトおよび動物における、糖尿病または腎臓疾患（例えば急性または慢性腎不全）に関連する、高血圧、心不全または血管疾患の処置に適した他の薬剤を１種以上用いて製造を実施することを特徴とする、請求項１０記載の使用。