

【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24年5月24日(2012.5.24)

【公表番号】特表2010-521443(P2010-521443A)

【公表日】平成22年6月24日(2010.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-025

【出願番号】特願2009-553202(P2009-553202)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/76 (2006.01)
 A 6 1 K 31/445 (2006.01)
 C 0 7 D 413/10 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 C 0 7 D 405/10 (2006.01)
 A 6 1 K 31/453 (2006.01)
 C 0 7 D 409/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4535 (2006.01)
 C 0 7 D 405/06 (2006.01)
 C 0 7 D 417/10 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
 C 0 7 D 413/06 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 C 0 7 D 401/06 (2006.01)
 C 0 7 D 401/10 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/08 (2006.01)
 A 6 1 P 11/06 (2006.01)
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)
 A 6 1 P 17/00 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 17/06 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 19/06 (2006.01)
 A 6 1 P 21/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/76 C S P
 A 6 1 K 31/445
 C 0 7 D 413/10
 A 6 1 K 31/454
 C 0 7 D 405/10
 A 6 1 K 31/453

C 0 7 D 409/06
A 6 1 K 31/4535
C 0 7 D 405/06
C 0 7 D 417/10
A 6 1 K 31/4709
C 0 7 D 413/06
C 0 7 D 401/12
C 0 7 D 401/06
C 0 7 D 401/10
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/00 1 0 1
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月11日(2011.3.11)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

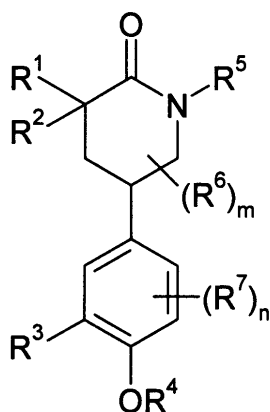
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)の化合物、または当該化合物の薬事的に許容される塩、溶媒化合物、プロドラッグ、もしくは多形体。



I

ここで、式中：

m は、0、1、2、3、4 または 5を表し；

n は、0、1、2または3を表し；

R^1 は、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル（ここで後の3つの基は、任意に、 X^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。）、 $-A^1-T^z-B^1$ 、 $-A^{1a}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-A^{1b}-OR^9$ 、 $-A^{1c}-C(O)R^9$ 、 $-A^{1d}-C(O)OR^9$ または $-A^{1e}-C(O)N(R^9)R^{10}$ を表し；

R^2 は、水素、 $-OR^4$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；または、

R^1 と R^2 とが一緒になって、 $=C(R^9)R^{10}$ を形成するものである；

R^3 は、水素、 $-OR^4$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル（ここで後の3つの基は、任意に、 X^2 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。）または $-A^2-B^2$ を表し；

それぞれの R^4 は独立して、水素、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル（ここで後の3つの基は、任意に、 X^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）および / または $-A^3-B^3$ を表し；

R^5 は水素、 $-A^4-B^4$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^4 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^6 は独立して、ハロゲン、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^{11}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)R^9$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tOR^{9x}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^9$ 、 $-R^{11}-OC(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-OS(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{w3})R^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tOR^9$ ； $-R^{11}-Si(R^{16})_3$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルケニル、 C_{1-12} アルキニル、 C_{3-15} シクロアルキルおよび / または複素環を表し、ここで後の5つの基は、任意に、 X^5 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；または、

任意の2つの R^6 基、あるいは R^2 基と任意の1つの R^6 基が、それらの2つの関連のある基の直接結合によって、あるいは C_{1-5} アルキレンによって架橋されることによって、形成される、更なる環を形成するように結合しているものであり；

それぞれの R^7 は独立して、ハロゲン、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^{11}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)R^9$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tOR^{9x}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^9$ 、 $-R^{11}-OC(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-OS(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{w3})R^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tOR^9$ ； $-R^{11}-Si(R^{16})_3$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルケニル、 C_{1-12} アルキニル、 C_{3-15} シクロアルキルおよび / または複素環を表し、ここで後の5つの基は、任意に、 X^5 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

T^z は、直接結合、 $-N(R^{w1})-$ 、または $-C(O)N(R^{w2})-$ を表し；

それぞれの R^{9x} は、独立して、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル (ここで後の3つの基は、任意に、 X^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-A^5-O-A^6$ および/または $-A^7-B^7$ を表し;

R^9 、 R^{10} 、 R^{w1} 、 R^{w2} および R^{w3} は、それぞれ独立して、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル (ここで後の3つの基は、任意に、 X^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-A^5-O-A^6$ および/または $-A^7-B^7$ を表し;

または、 R^9 および R^{10} は、これらがいずれも結合する炭素または窒素原子と一緒にとなって、シクロアルキルもしくは複素環基(これらのいずれも、任意に、 Z^{1a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。)、またはアリールもしくはヘテロアリール基(これらのいずれも、任意に、 Z^{1b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)を形成するように、一緒になって結合しているものであり;そして、

それぞれの R^{11} は、独立して、直接結合または R^8 を表し;

A^1 、 A^{1a} 、 A^{1b} 、 A^{1c} 、 A^{1d} 、 A^{1e} 、 A^4 および A^5 は、それぞれ独立して C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレン または C_{2-12} アルキニレンを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^7 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

A^2 、 A^3 および A^7 は、それぞれ独立して、直接結合、 C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレンまたは C_{2-12} アルキニレンを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^8 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

A^6 は、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここでこれらのいずれもが、任意に、 X^9 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

それぞれの R^8 は、独立して、 C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレンまたは C_{2-12} アルキニレンを表し、ここで、これらのいずれもが、任意に、 X^{10} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

B^1 は、ヘテロアリール(任意に、 Z^{2a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される)、または、複素環(任意に、 Z^{2b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される)を表し、ここで、 B^1 が多環式ヘテロアリール基を表す場合には、 B^1 が T^2 に結合する位置は、当該多環の複素環 または複素芳香環を介するものであり;

B^2 、 B^3 および B^7 は、それぞれ独立して、アリール(任意に、 Y^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 C_{3-15} シクロアルキルのようなシクロアルキル(シクロアルキル基は、任意に、 Z^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、複素環(任意に、 Z^{4a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)またはヘテロアリール(任意に、 Z^{4b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)を表し;

B^4 は、任意に、 Y^2 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される、アリールを表し;

X^1 は、 G^1 、 C_{3-15} シクロアルキル(任意に、1ないしそれ以上の T^2 置換基によって置換されるものである)、複素環(任意に、1ないしそれ以上の T^2 置換基によって置換されるものである)、ヘテロアリール(任意に、1ないしそれ以上の T^3 置換基によって置換されるものである)、 $=O$ 、 $-Si(R^{16})_3$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-OC(O)-R^{14}$ 、 $-N(R^{14})_2$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{14}$ 、 $-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{16}$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ 、 $-S(O)_tOR^{16}$ 、 $-S(O)_pR^{16}$ 、 $-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tOR^{16}$ 、 $-OC(O)N(R^{14})_2$ および/または $-OS(O)_tR^{9x}$ を表し;

X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、それぞれ独立して、 G^1 、アリール(任意に、1ないしそれ以上の T^1 置換基によって置換されるものである。)、 C_{3-15} シクロアルキル(任意に、1ないしそれ以上の T^2 置換基によって置換されるものである。)、複素環(任意に、1ないしそれ以上の T^3 置換基によって置換されるものである。)、ヘテロアリー

ル(任意に、1ないしそれ以上の T^4 置換基によって置換されるものである)、 $=O$ 、 $-Si(R^1)^3$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-OC(O)-R^{14}$ 、 $-N(R^{14})_2$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{14}$ 、 $-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{16}$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ 、 $-S(O)_tOR^{16}$ 、 $-S(O)_pR^{16}$ 、 $-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tOR^{16}$ 、 $-OC(O)N(R^{14})_2$ および/または $-OS(O)_tR^{9x}$ を表し;

Y^1 および Y^2 は、それぞれ独立して、 $-A^x-B^y$ 、 G^1 、 G^2 、 $-R^{15}-OR^{17}-N(R^{14})_2$ および/または $-R^{15}-O-R^{17}-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ を表し;

Z^{1a} 、 Z^{1b} 、 Z^{2a} 、 Z^{2b} 、 Z^3 、 Z^{4a} および Z^{4b} は、それぞれ独立して、 G^1 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-A^x-B^y$ および/または G^2 を表し;

G^1 は、 C_{1-12} アルキル(任意に、1ないしそれ以上の T^5 置換基によって置換されるものである)、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで後の2つの基は、任意に、 T^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。)、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ または $=O$ を表し;

G^2 は、 $-A^x-B^x$ 、 $-R^{15}-OR^{14}$ 、 $-R^{15}-OC(O)-R^{14}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{15}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{15}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{15}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})C(O)OR^{16}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})C(O)R^{16}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ 、 $-R^{15}-S(O)_tOR^{16}$ 、 $-R^{15}-S(O)_pR^{16}$ および/または $-R^{15}-S(O)_tN(R^{14})_2$ を表し;

A^x は、直接結合、または、任意に1ないしそれ以上のハロゲンまたは $=O$ 置換基により置換された、 C_{1-12} アルキレンを表し;

B^x は、アリールまたはヘテロアリールを表し、そしてこれらの基は、任意に、それぞれ、 T^7 および T^8 から、選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

B^y は、シクロアルキルまたは複素環を表し、そしてこれらの基はいずれも、任意に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン置換基によって置換されるものである)、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ からなる群から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

T^1 、 T^4 、 T^5 、 T^6 、 T^7 および T^8 は、それぞれ独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 Q^{x1} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。)、 $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{2-6}$ アルケニル、 $-OC_{2-6}$ アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 Q^{x2} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-N(R^w)_2$ 、 $-NO_2$ および/または $-CN$ を表し; および/または、

T^5 と T^6 は、これに代って、または付加的に、 $=O$ を表し;

T^2 および T^3 、それぞれ独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、ハロゲンによって置換されるものである)、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ を表し;

Q^{x1} および Q^{x2} は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^w)_2$ および/または $=O$ を表し;

それぞれの R^w は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり; または、

2つの R^w 基は、同一の窒素原子に結合した場合、これらが必要として結合した当該窒素原子と一緒にあって、5員または6員環を形成するように結合するものであり、ここで、任意に、さらに別の異種原子を含み得る、および任意に、フルオロ、 $-CH_3$ および $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

t は、1または2を表し;

p は、0、1または2を表し;

それぞれの R^{14} は、独立して、水素、 $-A^{x1}-B^{x1}$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたは C_{2-6} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、 E^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

それぞれの R^{15} は、独立して、直接結合、 C_{1-12} アルキレンまたは C_{2-12} アルケニレンを表し、ここで、後の2つの基は、任意に、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^{16} は、独立して、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで、後の3つの基は、任意に、ハロゲンおよび/または $=O$ 基から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、または $-A^{y1}-B^{y1}$ を表し、；

R^{17} は、 C_{1-12} アルキレンまたは C_{2-12} アルケニレンを表し、そしてこれらの基はいずれも、任意に、ハロゲンおよび $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

A^{x1} および A^{y1} は、それぞれ独立して、直接結合または、任意に、ハロゲンおよび/または $=O$ 基から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換された、 C_{1-12} アルキレンを表し；

B^{x1} および B^{y1} は、それぞれ独立して、シクロアルキル、複素環(ここで、後の2つの基は、任意に、ハロゲンおよび $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、アリールまたはヘテロアリール(ここで、後の2つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものである)を表し；

E^1 は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $-OR^{18}$ 、 $-OC(O)-R^{18}$ 、 $-N(R^{18})_2$ 、 $-C(O)R^{18}$ 、 $-C(O)OR^{18}$ 、 $-C(O)N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})C(O)OR^{19}$ 、 $-N(R^{18})C(O)R^{19}$ 、 $-N(R^{18})S(O)_{t1}R^{19}$ 、 $-S(O)_{t1}OR^{19}$ 、 $-S(O)_{p1}R^{19}$ 、 $-S(O)_{t1}N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})S(O)_{t1}OR^{19x}$ 、 $-OC(O)N(R^{18})_2$ 、 $-OS(O)_{t1}R^{19x}$ および/または $-Si(R^{19x})_3$ を表し；

各 R^{18} および R^{19} は、それぞれ独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} アルケニルまたは C_{2-3} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものであり；

それぞれの R^{19x} は、独立して、 C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} アルケニルまたは C_{2-3} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものであり；

$t1$ は、1または2を表し；

$p1$ は、0、1または2を表し、

以下の条件：

(B) R^4 がメチルを表し、 R^2 、 R^3 および R^5 が全て水素を表し、 n が0を表し、 m が1を表し、そして R^6 置換基が、メチル置換の a ないし $-N(R^5)$ -部分である場合、 R^1 は非置換メチルを表さない；

(C) R^2 が水素を表し、 m および n がいずれも0を表し、 R^4 がメチルを表す場合であって、 R^3 が $-OR^4$ を表し、 R^4 がシクロペンチルまたはメチルを表しかつ R^5 が水素、ベンジルまたは $-C(O)OR^{10}$ を表し、 R^{10} が $tert$ -ブチルを表す場合には、 R^1 は水素を表さない；

(D) R^2 が水素を表し、 m および n がいずれも0を表し、 R^3 が水素を表し、 R^5 がメチルを表す場合であって、 R^4 が X^3 によって置換されたメチルを表し、 X^3 が $-C(O)N(R^{14})_2$ を表し、そのいずれの R^{14} もイソプロピルを表すものとなる場合には、 R^1 は水素を表さない；

【請求項2】

R^1 が水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで、後の3つの基は、任意に、ハロゲンおよび $-OH$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基により置換されるものである)、 $-A^1-T^z-B^1$ 、 $-A^{1a}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-A^{1b}-OR^9$ 、 $-A^{1c}-C(O)R^9$ 、 $-A^{1d}-C(O)OR^9$ または $-A^{1e}-C(O)N(R^9)R^{10}$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 および R^2 が両方とも水素を表すものではない、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

m および n が、独立して、0、1、または2を表すものである請求項1から3のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項5】

R^2 が水素、 C_{1-12} アルキルまたは C_{1-12} アルケニル(ここで、後の2つの基は、任意に、水素またはハロゲンから選択されてなる1ないしそれ以上の置換基により置換されるものである)、請求項1から4のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項6】

R^3 が $-A^2-B^2$ 、水素または $-OR^4$ を表すものである請求項1から5のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項7】

それぞれの R^4 が独立して、水素、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 C_{1-12} アルキル、(任意に、 X^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、または $-A^3-B^3$ を表すものである請求項1から6のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項8】

A^2 および A^3 が、それぞれ独立して、 C_{1-3} アルキレンまたは直接結合を表すものである請求項1から7のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項9】

B^3 が、 C_{3-15} シクロアルキル(任意に、 Z^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)または5員~10員の複素環基(任意に、 Z^{4a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)を表すものである請求項1から8のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項10】

R^5 が $-A^4-B^4$ 、水素または $-C(O)R^9$ を表すものである請求項1から9のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項11】

R^6 および R^7 が、独立して、ハロゲン、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^{11}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^9)R^{10}$ および/または、任意に X^5 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換された、 C_{1-12} アルキル、を表すものである請求項1から10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項12】

それぞれの R^8 が、独立して、任意に X^{10} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換された、 C_{1-12} アルキレンを表すものである請求項1から11のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項13】

それぞれの R^9 および R^{10} が、独立して、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルケニル(ここで後の2つの基は、任意に、 X^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。)、 $-A^5-O-A^6$ および/または $-A^7-B^7$ を表す;または、

R^9 および R^{10} は結合し、これらが必然的に付加された窒素原子と一緒にあって、5員または6員の複素環基(任意に、ハロゲン、 $-CH_3$ および $=O$ 選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)形成しているものである請求項1から12のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項14】

A^1 、 A^{1a} 、 A^{1b} 、 A^{1c} 、 A^{1d} 、 A^{1e} 、 A^4 および A^5 が、それぞれ独立して C_{1-6} アルキレンを表すものである請求項1から13のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項15】

A^6 が C_{1-6} アルキルを表すものである請求項1から14のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項16】

A^2 、 A^3 および A^7 が、それぞれ独立して直接結合または C_{1-6} アルキレンを表すものである請求項1から15のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項17】

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 、 X^9 、 X^{10} 、 Y^1 および Y^2 が、それぞれ独立して G^1 を表すものである請求項1から16のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項18】

Z^{1a} 、 Z^{1b} 、 Z^{2a} 、 Z^{2b} 、 Z^3 、 Z^{4a} および Z^{4b} が、それぞれ独立して G^2 または G^1 を表すものである請求項1から17のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項19】

G^1 が、ハロゲンまたは C_{1-6} アルキル(任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものである)を表すものである請求項1から18のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項20】

G^2 が $-R^{15}-O-R^{14}$ を表すものである請求項1から19のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項21】

R^{15} が直接結合を表すものである請求項1から20のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項22】

R^{14} が、任意に $C(O)N(R^{18})_2$ およびハロゲンから選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される C_{1-6} アルキルを表すものである請求項1から21のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項23】

R^{18} が水素を表すものである請求項1から22のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項24】

R^{w1} および R^{w2} が、独立して、水素または任意に1ないしそれ以上のハロゲンによって置換される C_{1-3} アルキルを表すものである請求項1から23のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項25】

B^1 が単環式ヘテロアリアル基を表す場合、これは、任意に置換されてなるものである、イミダゾリル、トリアゾリル、ピリジル、チエニルおよびフラニルを表すものである請求項1から24のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項26】

B^1 が多環式ヘテロアリアル基を表す場合、これは、任意に置換されてなるものである、1,3-ジヒドロインドール-2-オン-イル、2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシニル、ベンゾ[1,4]オキサジニル、ピロピリジニル、イミダゾピリジニル、チアゾピリジニル、ベンゾキサゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾトリアゾリルおよびオキサゾピリジニルを表すものである請求項1から25のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項27】

請求項1において定義される式(1)の化合物であり、ここで、しかしながら、

m は、0、1、2、3、4または5を表し；

n は、0、1、2または3を表し；

R^1 は、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 X^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-A^1-T^z-B^1$ 、 $-A^{1a}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-A^{1b}-OR^9$ 、 $-A^{1c}-C(O)R^9$ 、 $-A^{1d}-C(O)OR^9$ または $-A^{1e}-C(O)N(R^9)R^{10}$ を表し；

R^2 は、水素、 $-OR^4$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；または、

R^1 と R^2 とが一緒になって、 $=C(R^9)R^{10}$ を形成するものであり；

R^3 は、水素、 $-OR^4$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 X^2 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)または $-A^2-B^2$ を表し；

それぞれの R^4 は独立して、水素、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 X^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。)および/または $-A^3-B^3$ を表し；

R^5 は水素、 $-A^4-B^4$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-C(O)OR^{10}$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^4 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^6 は独立して、ハロゲン、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^{11}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)R^9$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tOR^{9x}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^9$ 、 $-R^{11}-OC(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-OS(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{w3})R^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tOR^9$ ； $-R^{11}-Si(R^{16})_3$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルケニル、 C_{1-12} アルキニル、 C_{3-15} シクロアルキルおよび/または複素環を表し、ここで後の5つの基は、任意に、 X^5 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；または、

任意の2つの R^6 基、あるいは R^2 基と任意の1つの R^6 基が、それらの2つの関連のある基の直接結合によって、あるいは C_{1-5} アルキレンによって架橋されることによって、形成される、更なる環を形成するように結合しているものであり；

それぞれの R^7 は独立して、ハロゲン、 $-R^{11}-OR^9$ 、 $-R^{11}-CN$ 、 $-R^{11}-NO_2$ 、 $-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^{11}-N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)R^9$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})C(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-N(R^{w3})S(O)_tOR^{9x}$ 、 $-R^{11}-OC(O)R^9$ 、 $-R^{11}-OC(O)N(R^9)R^{10}$ 、 $-R^{11}-OS(O)_tR^{9x}$ 、 $-R^{11}-S(O)_pR^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tN(R^{w3})R^9$ 、 $-R^{11}-S(O)_tOR^9$ ； $-R^{11}-Si(R^{16})_3$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{1-12} アルケニル、 C_{1-12} アルキニル、 C_{3-15} シクロアルキルおよび/または複素環を表し、ここで後の5つの基は、任意に、 X^5 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

T^2 は、直接結合、 $-N(R^{w1})-$ 、または $-C(O)N(R^{w2})-$ を表し；

それぞれの R^{9x} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル（ここで後の3つの基は、任意に、 X^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）、 $-A^5-O-A^6$ および/または $-A^7-B^7$ を表し；

R^9 、 R^{10} 、 R^{w1} 、 R^{w2} および R^{w3} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル（ここで後の3つの基は、任意に、 X^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。）、 $-A^5-O-A^6$ および/または $-A^7-B^7$ を表し；

または、 R^9 および R^{10} は、これらがいずれも結合する炭素または窒素原子と一緒にとなって、シクロアルキルもしくは複素環基（これらのいずれも、任意に、 Z^{1a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）、またはアリアルもしくはヘテロアリアル基（これらのいずれも、任意に、 Z^{1b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）を形成するように、一緒になって結合しているものであり；そして、

それぞれの R^{11} は、独立して、直接結合または R^8 を表し；

A^1 、 A^{1a} 、 A^{1b} 、 A^{1c} 、 A^{1d} 、 A^{1e} 、 A^4 および A^5 は、それぞれ独立して C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレン または C_{2-12} アルキニレンを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^7 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

A^2 、 A^3 および A^7 は、それぞれ独立して、直接結合、 C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレンまたは C_{2-12} アルキニレンを表し、ここで後の3つの基は、任意に、 X^8 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

A^6 は、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニルまたは C_{2-12} アルキニルを表し、ここでこれらのいずれもが、任意に、 X^9 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^8 は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、 C_{1-12} アルキレン、 C_{2-12} アルケニレン または C_{2-12} アルキニレンを表し、これらのいずれもが、任意に、 X^{10} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

B^1 は、ヘテロアリアル（任意に、 Z^{2a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によ

って置換される)、または、複素環 (任意に、 Z^{2b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される)を表し;

B^2 、 B^3 および B^7 は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、アリール(任意に、 Y^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 C_{3-15} シクロアルキルのようなシクロアルキル(シクロアルキル基は、任意に、 Z^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、複素環 (任意に、 Z^{4a} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)またはヘテロアリール(任意に、 Z^{4b} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)を表し;

B^4 は、任意に、 Y^2 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換される、アリールを表し;

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、 G^1 、アリール(任意に、1ないしそれ以上の T^1 置換基によって置換されるものである)、 C_{3-15} シクロアルキル (任意に、1ないしそれ以上の T^2 置換基によって置換されるものである)、複素環(任意に、1ないしそれ以上の T^3 置換基によって置換されるものである)、ヘテロアリール (任意に、1ないしそれ以上の T^3 置換基によって置換されるものである)、 $=O$ 、 $-Si(R^{16})_3$ 、 $-OR^{14}$ 、 $-OC(O)-R^{14}$ 、 $-N(R^{14})_2$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{14}$ 、 $-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{16}$ 、 $-N(R^{14})C(O)R^{16}$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ 、 $-S(O)_tOR^{16}$ 、 $-S(O)_pR^{16}$ 、 $-S(O)_tN(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})S(O)_tOR^{16}$ 、 $-OC(O)N(R^{14})_2$ および/または $-OS(O)_tR^{9x}$ を表し;

Y^1 および Y^2 は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、 $-A^x-B^y$ 、 G^1 、 G^2 、 $-R^{15}-OR^{17}-N(R^{14})_2$ および/または $-R^{15}-O-R^{17}-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ を表し;

Z^{1a} 、 Z^{1b} 、 Z^{2a} 、 Z^{2b} 、 Z^3 、 Z^{4a} および Z^{4b} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、 G^1 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-A^x-B^y$ および/または G^2 を表し;

G^1 は、 C_{1-12} アルキル(任意に、1ないしそれ以上の T^5 置換基によって置換されるものである)、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル(ここで後の2つの基は、任意に、 T^6 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ または $=O$ を表し;

G^2 は、 $-A^x-B^x$ 、 $-R^{15}-OR^{14}$ 、 $-R^{15}-OC(O)-R^{14}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{15}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{15}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{15}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})C(O)OR^{16}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})C(O)R^{16}$ 、 $-R^{15}-N(R^{14})S(O)_tR^{16}$ 、 $-R^{15}-S(O)_tOR^{16}$ 、 $-R^{15}-S(O)_pR^{16}$ および/または $-R^{15}-S(O)_tN(R^{14})_2$ を表し;

A^x は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、直接結合、または、任意に1ないしそれ以上のハロゲンまたは $=O$ 置換基により置換された、 C_{1-12} アルキレンを表し;

B^x は、アリールまたはヘテロアリールを表し、そしてこれらの基は、任意に、それぞれ、 T^7 および T^8 から、選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

B^y は、シクロアルキルまたは複素環を表し、そしてこれらの基はいずれも、任意に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン置換基によって置換されるものである)、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ からなる群から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり;

T^1 、 T^4 、 T^5 、 T^6 、 T^7 および T^8 は、それぞれ独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 Q^{x1} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-OH$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{2-6}$ アルケニル、 $-OC_{2-6}$ アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、 Q^{x2} から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである)、 $-N(R^w)_2$ 、 $-NO_2$ および/または $-CN$ を表し; および/または、

T^5 と T^6 は、これに代って、または付加的に、 $=O$ を表し;

T^2 および T^3 、それぞれ独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル(ここで後の3つの基は、任意に、ハロゲンによって置換されるものである)。

)、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ を表し；

Q^{x1} および Q^{x2} は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^w)_2$ および/または $=O$ を表し；

それぞれの R^w は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および/または $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；または、

2つの R^w 基は、同一の窒素原子に結合した場合、これらが必要として結合した当該窒素原子と一緒にとなつて、5員または6員環を形成するように結合し得るものであり、ここで、任意に、さらに別の異種原子を含み得る、および任意に、フルオロ、 $-CH_3$ および $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

t は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、1または2を表し；

p は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、0、1または2を表し；

それぞれの R^{14} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、水素、 $-A^{x1}-B^{x1}$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたは C_{2-6} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、 E^1 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^{15} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、直接結合、 C_{1-12} アルキレンまたは C_{2-12} アルケニレンを表し、ここで、後の2つの基は、任意に、ハロゲン、 $-OCH_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ および $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

それぞれの R^{16} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル（ここで、後の3つの基は、任意に、ハロゲンおよび/または $=O$ 基から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）、または $-A^{y1}-B^{y1}$ を表し、；

R^{17} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、 C_{1-12} アルキレンまたは C_{2-12} アルケニレンを表し、そしてこれらの基はいずれも、任意に、ハロゲンおよび $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものであり；

A^{x1} および A^{y1} は、それぞれ独立して、直接結合または、任意に、1ないしそれ以上のハロゲンおよび/または $=O$ 基によって置換された、 C_{1-12} アルキレンを表し；

B^{x1} および B^{y1} は、それぞれ独立して、シクロアルキル、複素環（ここで、後の2つの基は、任意に、ハロゲンおよび $=O$ から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである）、アリアルまたはヘテロアリアル（ここで、後の2つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものである）を表し；

E^1 は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $=O$ 、 $-OR^{18}$ 、 $-OC(O)-R^{18}$ 、 $-N(R^{18})_2$ 、 $-C(O)R^{18}$ 、 $-C(O)OR^{18}$ 、 $-C(O)N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})C(O)OR^{19}$ 、 $-N(R^{18})C(O)R^{19}$ 、 $-N(R^{18})S(O)_{t1}R^{19}$ 、 $-S(O)_{t1}OR^{19}$ 、 $-S(O)_{p1}R^{19}$ 、 $-S(O)_{t1}N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})C(O)N(R^{18})_2$ 、 $-N(R^{18})S(O)_{t1}OR^{19x}$ 、 $-OC(O)N(R^{18})_2$ 、 $-OS(O)_{t1}R^{19x}$ および/または $-Si(R^{19x})_3$ を表し；

R^{18} および R^{19} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、それぞれ独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} アルケニルまたは C_{2-3} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものであり；

それぞれの R^{19x} は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、独立して、 C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} アルケニルまたは C_{2-3} アルキニルを表し、ここで、後の3つの基は、任意に、1ないしそれ以上のハロゲン原子によって置換されるものであり；

$t1$ は、ここにおいて用いられるいずれの場合にも、1または2を表し；

$p1$ は、0、1または2を表し、

次の条件：

(A) R^1 が X^1 によって置換されたメチルである場合、 R^2 は水素を表し、 m および n はいずれも0を表し、 R^4 はメチルを表す：

(1) R^3 が $-OR^4$ を表し、ここにおいて R^4 がシクロペンチルを表す場合：

(i) R^5 が水素を表し、そして X^1 が非置換フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、3-メトキシフェニル、3-エトキシフェニル、3-プロポキシフェニル、3-ブトキシフェニル、4-ブトキシフェニル、3-ペンチルオキシフェニル、3-ヘキシルオキシフェニル、3-ヘプチルオキシフェニル、3-フェノキシフェニル、4-フルオロフェニル、3-ベンジルオキシフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、3-メトキシ-4-ヒドロキシフェニル、3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニル、3-(4-クロロ-フェノキシ)フェニル、4-フェノキシフェニル、2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル、またはベンゾジオキソール-5-イル (特に、該化合物が(3R,5R) 配向にある場合)を表さない;

(ii) R^5 が $-C(O)OR^{10}$ を表し、ここにおいて R^{10} がtert-ブチルを表し、そして X^1 が3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニルを表さない;

(iii) R^5 がイソブチルまたは $-C(O)R^9$ を表し、ここにおいて R^9 がメチルまたは非置換フェニルを表し、そして X^1 が3-メチルフェニルを表さない;

(II) R^3 が $-OR^4$ を表し、ここにおいて R^4 がメチルを表す場合:

(i) R^5 が水素またはベンジルを表し、そして X^1 が3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニルまたは3-メトキシ-4-ヒドロキシフェニルを表さない;

(ii) R^5 が $-C(O)OR^{10}$ を表し、ここにおいて、 R^{10} がtert-ブチルを表し、そして X^1 が3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニルを表さない;

(III) R^3 が $-OR^4$ を表し、ここにおいて R^4 がイソプロピルを表す場合:

(i) R^5 が水素を表し、そして X^1 が非置換フェニル、4-トリフルオロメチルフェニルまたは3-ベンジルオキシフェニルを表さない;

(IV) R^3 が $-OR^4$ を表し、ここにおいて、 R^4 がエチルを表す場合:

(i) R^5 は水素を表し、そして、 X^1 は、非置換フェニル、4-フルオロフェニルまたは3-ベンジルオキシフェニルを表さない;

(B) R^4 がメチルを表し、 R^2 、 R^3 および R^5 が全て水素を表し、 n が0を表し、 m が1を表し、そして R^6 置換基が、メチル置換のaないし $-N(R^5)$ -部分である場合、 R^1 は非置換メチルを表さない;

(C) R^2 が水素を表し、 m および n がいずれも0を表し、 R^4 がメチルを表す場合であって、 R^3 が $-OR^4$ を表し、ここにおいて R^4 がシクロペンチルまたはメチルを表しかつ R^5 が水素、ベンジルまたは $-C(O)OR^{10}$ で表され、 R^{10} がtert-ブチルを表す場合には、 R^1 は水素を表さない;

(D) R^2 が水素を表し、 m および n がいずれも0を表し、 R^3 が水素を表し、 R^5 がメチルを表す場合であって、 R^4 が X^3 によって置換されたメチルを表し、ここにおいて X^3 が $-C(O)N(R^{14})_2$ を表し、そのいずれの R^{14} もイソプロピルを表すものとなる場合には、 R^1 は水素を表さない;

を満たす、

化合物、または当該化合物の薬事的に許容される塩、溶媒化合物、プロドラッグ、もしくは多形体。

【請求項 28】

R^2 が水素を表す場合、 R^1 は任意に置換されたベンジルを表すものではない、請求項 27に記載の式Iの化合物。

【請求項 29】

医薬品としての使用のための、請求項 1 ~ 28のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件(C)および(D)をなくした、式Iの化合物、またはその薬事的に許容される塩。

【請求項 30】

請求項 1 ~ 28のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件(C)および(D)をなくした、式Iの化合物、またはその薬事的に許容される塩を、薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤と組み合わせて、含む医薬処方物。

【請求項 3 1】

i) 炎症性不全症; ii) 哺乳種における細胞内サイクリックアデノシン-5'-モノホスフェートのレベルを変調することが望まれるおよび/または必要とされる不全症であり、この不全症は炎症性不全症であり得る; iii) 第二細胞メッセンジャー類に関連する酵素類を阻止することによって変調された病理学的症状に関連する不全症; iv) 哺乳種における移植拒絶; v) 制御できない細胞増殖; および/または、vi) 中枢神経系に関連する不全症、の治療においての使用のための、請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式 I の化合物、またはその薬事的に許容される塩。

【請求項 3 2】

請求項 3 1 に記載の i) ないし vi) のいずれかによって定義される不全症の治療のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式 I の化合物、またはその薬事的に許容される塩の使用。

【請求項 3 3】

不全症が、炎症、増殖性不全症、または中枢神経系の疾患ないし病理学的症状である請求項 3 1 に記載の化合物、または請求項 3 2 に記載の使用。

【請求項 3 4】

不全症が、強直性脊椎炎、関節炎、喘息、慢性閉塞性肺疾患、慢性気管支炎、呼吸窮迫症候群、鼻炎、アレルギー性鼻炎、クローン病、腎臓炎、湿疹、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、結膜炎、潰瘍性大腸炎、リュウマチ様関節炎、骨関節炎、好酸球性胃腸炎、血管疾患、そして、真性糖尿病 繊維筋痛症候群、痛風、脳の炎症、気腫、炎症性腸疾患、過敏性腸症候群、虚血再灌流障害若年性エリテマトーデス肺サルコイドーシス、川崎病、骨関節炎、骨盤炎症性疾患、乾癬性関節炎(乾癬)、リュウマチ様関節炎、乾癬、組織/臓器移植、強皮症、脊椎関節症、全身性紅斑性狼瘡、肺サルコイドーシス、潰瘍性大腸炎、癌、白血病、固形腫瘍、認識機能、アルツハイマー病、学習および記憶障害、脳血管障害、鬱病、精神分裂病、パーキンソン病および/または多発性硬化症である、請求項 3 3 に記載の化合物または使用。

【請求項 3 5】

請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式 I の化合物、またはその薬事的に許容される塩の、治療学的に有効な量を、請求項 3 1 に記載の i) ないし vi) のいずれかによって定義される不全症の症状に苦しむあるいこの不全症に感受性の患者に、投与することでなる、請求項 3 1 に記載の i) ないし vi) のいずれかによって定義される不全症の治療方法。

【請求項 3 6】

(A) 請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式 I の化合物、またはその薬事的に許容される塩; および
(B) 請求項 3 1 に記載の i)、ii)、iii)、iv)、v) またはvi) のいずれかによって定義される不全症の治療に有効な他の治療剤を有してなり、それぞれの化合物(A)および(B)が、薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤と組み合わせて処方されるものである、
複合製品。

【請求項 3 7】

請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式 I の化合物またはその薬事的に許容される塩、請求項 3 1 に記載の i)、ii)、iii)、iv)、v) またはvi) のいずれかによって定義される不全症の治療に有効な当該他の治療剤、ならびに薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤を含有してなる請求項 3 6 に記載の複合製品。

【請求項 3 8】

(a) 請求項 1 ~ 2 8 のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記

条件群をなくした、式Iの化合物またはその薬事的に許容される塩を、薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤との組合せにおいて含む医薬処方物、および (b) 請求項31に記載の(i)、(ii)、(iii)、(iv)、(v) または(vi)のいずれかによって定義される不全症の治療に有効な当該他の治療剤を、薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤との組合せにおいて含む医薬処方物、からなるキットであって、これらの部分(a)および(b)はそれぞれ他方との組み合わせでの投与に適した形態で与えられてなるものである、キット

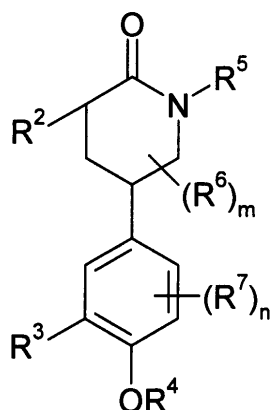
を含有してなる請求項36に記載の複合製品。

【請求項39】

請求項1～28のいずれかひとつにおいて定義される式Iの化合物の製造方法であって

(i) R^1 が $-A^1-T^z-B^1$ を表す、式Iの化合物群に関して：

式IIの化合物



II

[但し、式中、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は請求項1において定義されている通りである。] またはその保護された誘導体と、式IIIの化合物

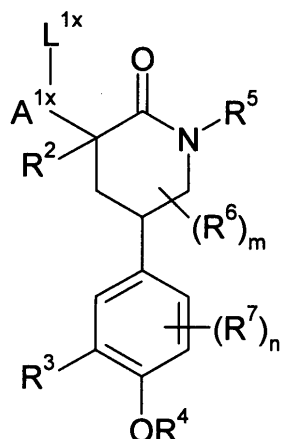
$L^1-A^1-T^z-B^1$

III

[但し、式中、 L^1 は、適当な脱離基を表し、 T^z 、 A^1 および B^1 は請求項1において定義されている通りである。] とを、反応させる；

(ii) R^1 が $-A^1-T^z-B^1$ を表し、そして T^z が $-N(R^{w1})-$ を表す、または、 R^1 が $-A^{1a}-N(R^9)R^{10}$ または $-A^{1b}-OR^9$ を表す式Iの化合物群に関して：

式IVの化合物



IV

[式中、 L^{1x} は、適当な脱離基を表し、 A^{1x} は A^1 、 A^{1a} または A^{1b} (適切に、すなわち、 R^1 がそれぞれ $-A^1-N(R^{w1})-B^1$ 、 $-A^{1a}-N(R^9)R^{10}$ または $-A^{1b}-OR^9$ である式Iの化合物の調製のために)を表し、そして R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は、は請求項1において定義さ

れている通りである。]と、式Vの化合物、

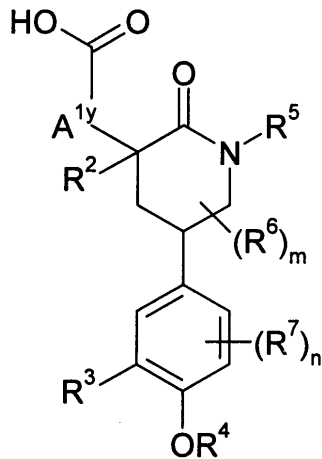
H-Z^a

V

[式中、Z^aは-N(R^{w1})-B¹、-N(R⁹)R¹⁰または-OR⁹(R¹がそれぞれ-A¹-N(R^{w1})-B¹、-A^{1a}-N(R⁹)R¹⁰または-A^{1b}-OR⁹である式Iの化合物の調製の関して)を表し、またR^{w1}、B¹、R⁹はR¹⁰は請求項1において定義されている通りである。]とを反応させる；

(iii) R¹が-A¹-T^z-B¹を表し、そしてT^zが-C(O)-N(R^{w2})-を表す、またはR¹が-A^{1e}-C(O)N(R⁹)R¹⁰を表す化合物Iに関して：

式VIの化合物



VI

[但し、式中、A^{1y}はA¹またはA^{1e}(適切に、すなわち、R¹がそれぞれ-A¹-C(O)-N(R^{w2})-B¹または-A^{1e}-C(O)N(R⁹)R¹⁰である式Iの化合物の調製のために)を表し、またR²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁹、R¹⁰、R^{w2}、B¹、A¹、A^{1e}、mおよびnは請求項1において定義されている通りである。]またはその保護された誘導体と、化合物VII

H-Z^b

VII

[式中、Z^bは-N(R^{w2})-B¹または-N(R⁹)R¹⁰(R¹がそれぞれ-A¹-C(O)-N(R^{w2})-B¹または-A^{1e}-C(O)N(R⁹)R¹⁰である式Iの化合物の調製の関して)を表し、またR^{w2}、B¹、R⁹およびR¹⁰は請求項1においてされている通りである。]とを、反応させる；

(iv) R¹がC₁₋₁₂ アルキル、C₂₋₁₂ アルケニル、C₂₋₁₂ アルキニル(これら後の3つの基は任意に上記したように置換されるものである)、-A^{1a}-N(R⁹)R¹⁰、-A^{1b}-OR⁹、-A^{1c}-C(O)R⁹、-A^{1d}-C(O)OR⁹または-A^{1e}-C(O)N(R⁹)R¹⁰を表し、そしてR⁹およびR¹⁰が水素でない式Iの化合物に関して：

先に定義した式IIの化合物を、式VIIAの化合物

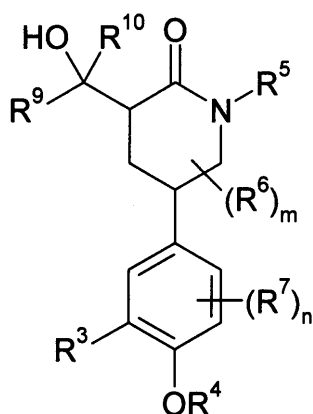
L^{1b}-Z^c

VIIA

[式中、L^{1b}は、適当な脱離基を表し、Z^cは、C₁₋₁₂ アルキル、C₂₋₁₂ アルケニル、C₂₋₁₂ アルキニル(これら後の3つの基は任意に上記したように置換されるものである)、-A^{1a}-N(R⁹)R¹⁰、-A^{1b}-OR⁹、-A^{1c}-C(O)R⁹、-A^{1d}-C(O)OR⁹または-A^{1e}-C(O)N(R⁹)R¹⁰を表すが、R⁹およびR¹⁰は水素以外の基を表す。]と、反応させる；

(v) R¹とR²が一緒になって=C(R⁹)R¹⁰を形成する化合物Iに関して：

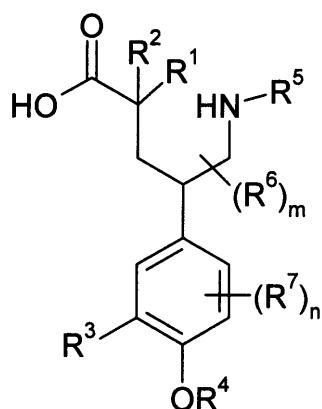
式VIIBの化合物



VII B

[式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^9 、 R^{10} 、 m および n は請求項 1 においてされている通りである。] を脱水させる；

(vi) 式VIICの化合物

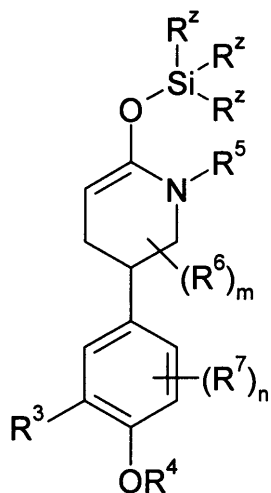


VIIC

[式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は請求項 1 においてされている通りである。] を分子内環化させる；

(vii) R^1 が水素を表し、 R^2 が $-OR^4$ を表し、そしてその R^4 が水素を表す式Iの化合物群は、 R^2 が水素を表す関連する式Iの化合物群を、塩基と反応させ、その後、酸素あるいは適当なその等価物を用いて、消滅する；

(viii) R^1 が水素を表し、 R^2 が $-OR^4$ を表し、そしてその R^4 が水素を表す式Iの化合物群は、式VIIDの化合物

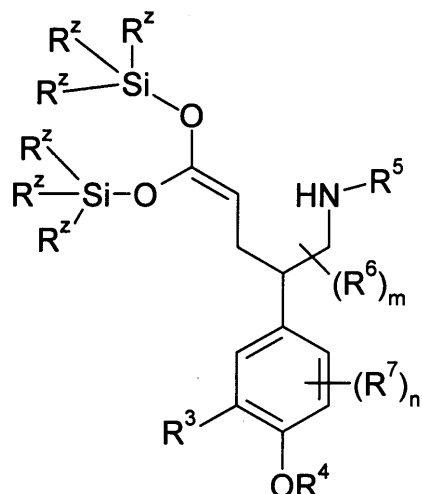


VIID

[式中、それぞれの R^2 は、独立して、 C_{1-6} アルキルを表し、また、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は請求項 1 において定義したものと同一である。] またはその保護された誘導

体類を、二重結合のエポキシ化反応条件下に、反応させる；

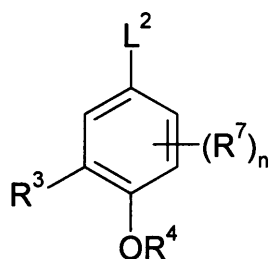
(ix) R^1 が水素を表し、 R^2 が $-OR^4$ を表し、そしてその R^4 が水素を表す式Iの化合物群は、式VII Eの化合物



VII E

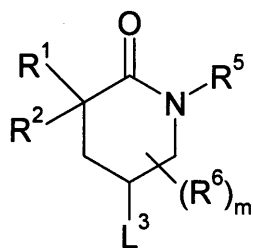
[式中、 R^2 は先に定義されたものであり、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は請求項1に定義されている通りである。] またはその保護された誘導体類を、適当な酸化剤の存在下で反応させる；

(x) 式Iの化合物群は、式VIIIの化合物



VIII

[式中、 L^2 は、適当な脱離基を表し、 R^3 、 R^4 、 R^7 および n は請求項1において定義されている通りである。] を、式IXの化合物

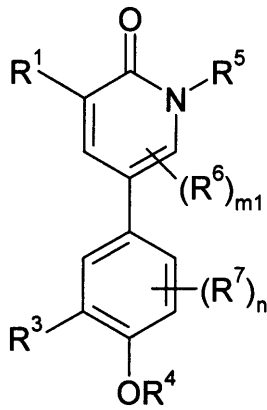


IX

[式中、 L^3 は、適当な脱離基を表し、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 L^3 および m は請求項1において定義されている通りである。] あるいはその互変異性体またはその誘導体類と、反応させる；

(xi) R^2 が水素を表し、そして最大2つの R^6 置換基(第4および/または第6位)を有する式Iの化合物群に関して；

式IXAの化合物、

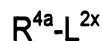


IXA

[式中、 m_1 は0、1または2を表し、また R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および n は請求項1において定義されている通りである。]、あるいはその互変異性体またはその誘導体類を、還元する；

(xii) R^3 が $-OR^4$ を表し、そしてその R^4 が水素以外である式Iの化合物に関して、あるいは、 R^4 が水素以外である式Iの化合物に関して、

R^3 が $-OH$ である、または、 R^4 が水素を表す関連する式Iの化合物を、式IXBの化合物

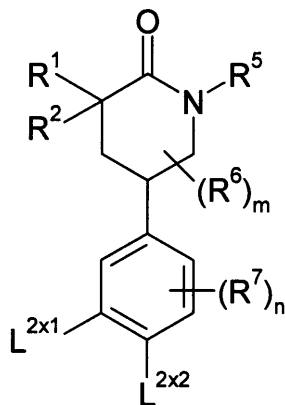


IXB

[式中、 R^{4a} は、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル (ここで後の3つの基は、任意に、 X^3 から選択されてなる1ないしそれ以上の置換基によって置換されるものである。) または $-A^3-B^3$ を表し、 L^{2x} は、適当な脱離基を表し、そして、 R^8 、 R^9 、 X^3 、 A^3 および B^3 は請求項1において定義されている通りである。]と、反応させる；

(xiii) R^3 が $-OR^4$ を表し、その R^4 が水素以外のものである式Iの化合物に関して、あるいは、 R^4 が水素以外である式Iの化合物に関して；

式IXCの化合物



IXC

[式中、 L^{2x1} は L^{2x} または R^3 を表し、 L^{2x2} は L^{2x} は $-OR^4$ を表し、少なくとも R^{2x1} および R^{2x2} のいずれかが L^{2x} を表す場合には、その L^{2x} は先に定義したものと同一であり、好ましくは臭素のような適当な脱離基を表す。また、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 m および n は請求項1において定義されている通りである。]を、式IXDの化合物



IXD

[式中、 R^4 は請求項1において定義されている通りである。]と、反応させる；
ことなる、式Iの化合物の製造方法。

【請求項40】

請求項30において定義される医薬処方物の製造方法であって、請求項1～28のいづ

れかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件(C)および(D)をなくした、式Iの化合物、またはその薬事的に許容される塩を、薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤と組み合わせることからなる医薬処方物の製造方法。

【請求項41】

請求項36～38のいずれかひとつにおいて定義される複合製品の製造方法であって、請求項1～28のいずれかひとつにおいて定義された通りの、しかしながら前記条件群をなくした、式Iの化合物、またはその薬事的に許容される塩を、請求項31におけるi)、ii)、iii)、iv)、v) またはvi)によって定義された不全症の治療に有用である当該他の治療薬、および少なくとも1つの薬事的に許容されるアジュバント、希釈剤、担体または賦形剤と、組み合わせることからなるもの複合製品の製造方法。