

【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23年5月12日(2011.5.12)

【公表番号】特表2010-522713(P2010-522713A)

【公表日】平成22年7月8日(2010.7.8)

【年通号数】公開・登録公報2010-027

【出願番号】特願2010-500259(P2010-500259)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/4365 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 409/14 C S P

C 0 7 D 495/04 1 0 8

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

C 0 7 D 513/04 3 6 1

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 487/04 1 4 4

C 0 7 D 487/04 1 5 3

C 0 7 D 487/04 1 5 4

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/4365

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月24日(2011.3.24)

【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

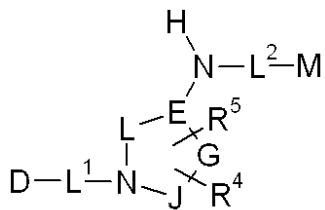
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【化1】

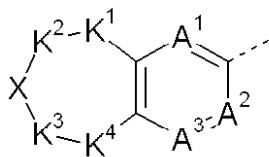


(I)

(式中、

Dが、式(IIa)、(IIb)又は(IIc)の置換二環系を表し、

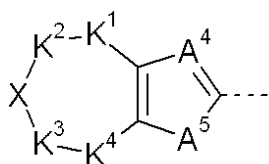
【化2】



(IIa)

又は、

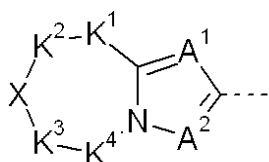
【化3】



(IIb)

又は、

【化4】



(IIc)

K¹及びK⁴が、

それぞれ独立して結合、-CH₂基、-CHR^{7a}基、-CR^{7b}R^{7c}基、若しくは、-C(O)基を表し、ここで、

R^{7a}/R^{7b}/R^{7c}が、

それぞれ独立してフッ素原子、ヒドロキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₅-アルキルアミノ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ基、C₃₋₅-シクロアルキレンイミノ基、C₁₋₅-アルキルカルボニルアミノ基、1-3個のフッ素原子によって置換されてもよいC₁₋₅-アルキル基、ヒドロキシ-C₁₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルオキシ-C₁₋₅-アルキル基、アミノ-C₁₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルアミノ-C₁₋₅-アルキル基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ-C₁₋₅-アルキル基、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノ-C₁₋₅-アルキル基、カルボキシ-C₀₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル-C₀₋₅-アルキル基、アミノカルボニル-C₀₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルアミノカルボニル-C₀₋₅-アルキル基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノカルボニル-C₀₋₅-アルキル基、若しくは、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノカルボニル-C₀₋₅-アルキル基を表し、

(ここで、-C(R^{7b}R^{7c})-が-CF₂基である場合を除いて、2個の基R^{7b}/R^{7c}が同時にヘテロ原子によって環状炭素原子に結合してはならない)、又は、

R^{7a}が、

フッ素、塩素、臭素、メチル、メトキシ、アミノ若しくはニトロによって置換された、フェニル基、若しくは、単環ヘテロアリアル基を表し、又は、

2個の基R^{7b}/R^{7c}が環状炭素原子と一緒に、

3-、4-、5-、6-又は7-員環の飽和炭素環基、シクロペンテン環、シクロヘキセン環、オキセタン環、アゼチジン環、チエタン環、テトラヒドロフラン環、ピロリジン環、テトラヒドロチオフェン環、テトラヒドロピラン環、ピペリジン環、ペンタメチレンスルフィド環、ヘキサメチレンイミン環、1,3-ジオキサラン環、1,4-ジオキサラン環、ヘキサヒドロピリダジン環、ピペラジン環、チオモルホリン環、モルホリン環、2-イミダゾリジノン環、2-オキサゾリジノン環、テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン環、若しくは、[1,3]オキサジナン-2-オン環を形成してもよく、

ここで、それらのメチレン基が、1-2個のC₁₋₃-アルキル基若しくはCF₃-基によって置換されてよく、及び/又は、

それらのメチレン基が、ヘテロ原子に結合していない場合、該基が1-2個のフッ素原子によって置換されてもよく、及び/又は、

ここで、-CH₂基が、N原子によって置き換わるもののほかに、-CO基によって置き換わってもよく、及び/又は、

それらのイミノ基がそれぞれ、C₁₋₃-アルキル基若しくはC₁₋₃-アルキルカルボニル基によって置換されてもよく、及び/又は、

ここで、硫黄原子が酸化されて、スルホキシド基若しくはスルホン基を形成してもよく、

K²及びK³が、

それぞれ独立して-CH₂基、-CHR^{8a}基、-CR^{8b}R^{8c}基、若しくは、-C(O)基を表し、ここで、

R^{8a}/R^{8b}/R^{8c}が、

それぞれ独立して、1-3個のフッ素原子によって置換されてもよいC₁₋₅-アルキル基、ヒドロキシ-C₁₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルオキシ-C₁₋₅-アルキル基、アミノ-C₁₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルアミノ-C₁₋₅-アルキル基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ-C₁₋₅-アルキル基、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノ-C₁₋₅-アルキル基、カルボキシ-C₀₋₅-アルキル基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル-C₀₋₅-アルキル基、アミノカルボニル-C₀₋₅-アルキル

ル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル- C_{0-5} -アルキル基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノカルボニル- C_{0-5} -アルキル基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル- C_{0-5} -アルキル基を表し、

又は、2個の基 R^{8b} / R^{8c} が環状炭素原子と一緒に、

3-、4-、5-、6-若しくは7-員環の飽和炭素環基、シクロペンテン環、シクロヘキセン環、オキサタン環、アゼチジン環、チエタン環、テトラヒドロフラン環、ピロリジン環、テトラヒドロチオフェン環、テトラヒドロピラン環、ペリリジン環、ペンタメチレンスルフィド環、ヘキサメチレンイミン環、ヘキサヒドロピリダジン環、テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン環、若しくは、[1,3]オキサジナン-2-オン環を形成してもよく、

ここで、それらのメチレン基が、1-2個の C_{1-3} -アルキル基若しくは CF_3 -基によって置換されてもよく、及び/又は、

それらのメチレン基が、ヘテロ原子に結合していない場合、該基が1-2個のフッ素原子によって置換されてもよく、及び/又は、

ここで、 $-CH_2$ 基が、N原子によって置き換わるもののほかに、 $-CO$ 基によって置き換わってもよく、及び/又は、

それらのイミノ基がそれぞれ、 C_{1-3} -アルキル基若しくは C_{1-3} -アルキルカルボニル基によって置換されてもよく、及び/又は、

ここで、硫黄原子が酸化されて、スルホキシド基若しくはスルホン基を形成してもよく、

(但し、式(1)において R^{8b} 若しくは R^{8c} で導入されたヘテロ原子が、ただ1個の炭素原子を介してXと結合してはならない)そして、

全てにおいて、式(11a)、(11b)若しくは(11c)において、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{7c} 、 R^{8a} 、 R^{8b} 及び R^{8c} から選択される最大4つの基が存在してもよく、そして、

Xが、

酸素原子、硫黄原子、 CF_2 基、スルフェン基、スルホン基、若しくは、 NR^1 基を表し、ここで、

R^1 が、

水素原子、ヒドロキシ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノ基、ジ- $(C_{1-3}$ -アルキル)-アミノ基、 C_{1-5} -アルキル基、 C_{2-5} -アルケニル- CH_2 基、 C_{2-5} -アルキニル- CH_2 基、 C_{3-6} -シクロアルキル基、 C_{4-6} -シクロアルケニル基、オキサタン-3-イル基、テトラヒドロフラン-3-イル基、ベンジル基、 C_{1-5} -アルキル-カルボニル基、トリフルオロメチルカルボニル基、 C_{3-6} -シクロアルキル-カルボニル基、 C_{1-5} -アルキル-スルホニル基、 C_{3-6} -シクロアルキル-スルホニル基、アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル基を表し、

ここで、先に記載した基に存在するメチレン基及びメチル基が、更に、 C_{1-3} アルキル基、カルボキシ基、 C_{1-5} -アルコキシカルボニル基、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、 C_{1-5} -ジアルキルアミノ基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノ基によって置換されてもよく(但し、メチレン基若しくはメチル基が、O、N及びSの中から選択されるヘテロ原子に直接結合していない場合)、及び/又は

1から3個の水素原子が、フッ素原子によって置き換わってもよく(但し、メチレン基若しくはメチル基が、O、N及びSの中から選択されるヘテロ原子に直接結合していない場合)、

A^1 が、

N若しくはCR¹⁰を表し、
 A²が、
 N若しくはCR¹¹を表し、
 A³が、
 N若しくはCR¹²を表し、
 A⁴が、
 N若しくはCR¹²を表し、
 A⁵が、
 NH、硫黄、若しくは酸素を表し、

ここで、R¹⁰、R¹¹及びR¹²が、それぞれ独立して、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C₁₋₅-アルキル基、CF₃基、C₂₋₅-アルケニル基、C₂₋₅-アルキニル基、フェニル基、シアノ基、カルボキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル基、ヒドロキシ基、C₁₋₃-アルキルオキシ基、CF₃O基、CHF₂O基、CH₂FO基、アミノ基、C₁₋₅-アルキルアミノ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ基、若しくは、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノ基を表し、そして、

-L-E-G-J-が、
 R⁴及びR⁵によって置換されてもよい-C-C-C-C基を表し、そして、

L¹が、
 -C(O)基を表し、そして、

R⁴が、
 水素原子、又は、直鎖若しくは分岐のC₁₋₆-アルキル基、C₂₋₆-アルケニル基、若しくは、C₂₋₆-アルキニル基を表し、

ここで、直鎖若しくは分岐のC₁₋₆-アルキル基、C₂₋₆-アルケニル基、若しくは、C₂₋₆-アルキニル基のメチレン部分及び/又はメチル部分の水素原子が、フッ素原子によって全て若しくは部分的に置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、直鎖若しくは分岐のC₁₋₆-アルキル基、C₂₋₆-アルケニル基、又は、C₂₋₆-アルキニル基のメチレン部分及び/又はメチル部分の水素原子が、C₃₋₅-シクロアルキル基、ニトリル基、ヒドロキシ基、若しくは、C₁₋₅-アルキルオキシ基から選択される1から2個の置換基によって、それぞれ独立して置換されてもよく、ここで、C₁₋₅-アルキルオキシ基の水素原子が、フッ素原子、アリルオキシ基、プロパルギルオキシ基、ベンジルオキシ基、C₁₋₅-アルキルカルボニルオキシ基、C₁₋₅-アルキルアミノカルボニルオキシ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノカルボニルオキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニルオキシ基、カルボキシ-C₁₋₅-アルキルオキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル-C₁₋₅-アルキルオキシ基、メルカプト基、C₁₋₅-アルキルスルファニル基、C₁₋₅-アルキルスルフィニル基、C₁₋₅-アルキルスルホニル基、カルボキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、C₁₋₅-アルキルアミノカルボニル基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノカルボニル基、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノカルボニル基、アミノスルホニル基、C₁₋₅-アルキルアミノスルホニル基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノスルホニル基、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノスルホニル基、アミノ基、C₁₋₅-アルキルアミノ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ基、C₁₋₅-アルキルカルボニルアミノ基、C₁₋₃-アルキルオキシ-C₁₋₂-アルキルカルボニルアミノ基、C₁₋₃-アルキルオキシカルボニルアミノ基、C₁₋₃-アルキルアミノカルボニルアミノ基、C₁₋₅-アルキルスルホニルアミノ基、N-(C₁₋₅-アルキルスルホニル)-C₁₋₅-アルキルアミノ基、C₃₋₆-シクロアルキルカルボニルアミノ基、モルホリニル基、チオモルホリニル基、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、テトラヒドロフラニル基、テトラヒドロピラニル基のいずれかによって全て若しくは部分的に置き換わってもよく、更に、環における、上記炭素環式及びヘテロ環式の基が、それぞれ1-4個のC₁₋₃-アルキル基若しくはC₁₋₃-アルキルカルボニル基によって、又は、いずれの場合も、1-2個のオキシ基

によって置換されてもよく、及び/又は、

ここで、直鎖若しくは分岐 C_{2-6} -アルケニル基の sp^2 -混成の炭素原子の水素原子が、フッ素原子によって全て若しくは部分的に置き換わってもよく、又は、

ニトリル基、カルボキシ基、アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル基、 C_{3-6} -シクロアルキルアミノカルボニル基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル基を表し、ここで、メチレン基が、酸素原子、硫黄原子、若しくは、 C_{0-3} -アルキル置換窒素原子によって置き換わってもよく、又は、

フェニル基、単環若しくは二環のヘテロアリール基、フェニル- C_{1-5} -アルキル基、若しくは、単環若しくは二環のヘテロアリール- C_{1-5} -アルキル基を表し、

これらは、フェニル基若しくはヘテロアリール基において、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 C_{1-5} -アルキル基、トリフルオロメチル基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノ基、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、モノ-、ジ-若しくはトリフルオロメトキシ基、カルボキシ基、及び、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基の中から選択される同一若しくは異なる置換基によって一置換から三置換されてもよく、

又は、 R^4 がGに結合する場合、それが、フッ素原子、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、 C_{2-5} -アルケニル-オキシ基、 C_{2-5} -アルキニル-オキシ基、 C_{3-6} -シクロアルキルオキシ基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニルオキシ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)アミノカルボニルオキシ基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニルオキシ基、フェニル- C_{0-3} -アルキルオキシ基、ヘテロアリール- C_{0-3} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノ基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノ基、 C_{1-3} -アシルアミノ基、 $(C_{1-3}$ -アシル) C_{1-3} -アルキルアミノ基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニルアミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニルアミノ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)アミノカルボニルアミノ基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニルアミノ基を表してもよく、

ここで、上記アルキル基若しくはシクロアルキル基に存在する、メチル基若しくはメチレン基が、それぞれ独立して、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ジメチルアミノカルボニル、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル、カルボキシ、メチル、ヒドロキシ、メトキシ及びアミノの中から選択される置換基によって置換されてもよく、そして、

上記フェニル基若しくはヘテロアリール基が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 C_{1-5} -アルキル基、トリフルオロメチル基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノ基、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、モノ-、ジ-若しくはトリフルオロメトキシ基、カルボキシ基、及び、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基の中から選択される同一若しくは異なる置換基によって一置換から三置換されてもよく、

但し、酸素及び窒素の中から選択される2個のヘテロ原子が、ただ1個の置換されてもよい- CH_2 基によって、互いに隔てられる場合、及び/又は

2個の原子が-O-O結合、若しくは、-S-O結合を形成している場合が除かれ、そして、

R^5 が、

水素原子、 C_{1-5} アルキル基、 C_{2-5} アルケニル基、 C_{2-5} アルキニル基、若しくは、フェニル- C_{0-5} アルキル基を表し、ここで、アルキル基がヒドロキシ基、メトキシ基、ヒドロキシカルボニル基、若しくは、 C_{1-5} アルコキシカルボニル基によって置換されてもよく、

又は、 R^5 がGに結合する場合、それが、ヒドロキシ基、若しくは、メトキシ基を表して

もよく、又は、

R^4 及び R^5 が、

それらが同じ1個の炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、 $-C=O$ 基若しくは $-CF_2$ 基を形成してもよく、又は、

R^4 及び R^5 が、

それらが同じ1個の炭素原子、若しくは、2個の隣接する炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、3-7-員環の炭素環基、若しくは、単不飽和の5-7員環の炭素環基を形成してもよく、

ここで、この環状基の炭素鎖の一つが、酸素原子、硫黄原子、 $-NH$ 基、 $-N(C_{1-5}$ -アルキル)基、 $-N(C_{1-4}$ -アルキルカルボニル)基、カルボニル基、スルフィニル基、若しくは、スルホニル基によって置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、これらの C_{4-7} -炭素環基の2個の直接隣接する炭素鎖部分が、一緒に $-C(O)NH$ 基、 $-C(O)N(C_{1-5}$ -アルキル)基、 $-S(O)_2NH$ 基、若しくは、 $-S(O)_2N(C_{1-5}$ -アルキル)基によって置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、これらの C_{5-7} -炭素環基の4個の直接隣接する炭素鎖部分が、一緒に $-O-CH_2-CH_2-O$ 基によって置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、これら3-7員環の環状基の1から3個の炭素原子がそれぞれ、1個若しくは2個のフッ素原子、1個若しくは2個の C_{1-5} -アルキル基、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、 C_{1-5} -アルキルカルボニルオキシ基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノ基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノ基、 C_{1-5} -アルキルカルボニルアミノ基、 C_{3-6} -シクロアルキルカルボニルアミノ基、ニトリル基、カルボキシ- C_{1-5} -アルキル基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル- C_{1-5} -アルキル基、カルボキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル基、ジ- $(C_{1-5}$ -アルキル)-アミノカルボニル基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル基によって互いに独立して置換されてもよく、

但し、一緒に R^4 及び R^5 から形成された環状基であって、環状基の2個の窒素原子、又は、1個の窒素原子及び1個の酸素原子が、ただ1個の置換されてもよい $-CH_2$ 基によって、互いに隔てられる環状基、及び/又は、環の2個の原子が $-O-O$ 結合、若しくは、 $-S-O-$ 結合を形成する環状基が除かれ、そして、

L^2 が、

$-C(O)$ 基を表し、そして、

M が、

R^2 及び R^3 によって置換されてもよいフェニル環、ピリジル環、チエニル環、若しくは、フリル環を表し、ここで、

R^2 が、

フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メチル基、エチル基、ビニル基、メトキシ基、エチニル基、シアノ基、若しくは、 $-C(O)NH_2$ 基を表し、そして、

R^3 が、

水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ヒドロキシ基、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基、フッ素原子によって置換されてもよい C_{1-3} -アルキル基、シアノ基、アミノ基、若しくは、 $NH_2C(O)$ 基を表し、

ここで、特に明記しない限り、上記定義における用語"ヘテロアリール基"が、単環の5-若しくは6-員環ヘテロアリール基を意味し、ここで、

6-員環ヘテロアリール基が、1、2若しくは3個の窒素原子を含み、そして、

5-員環ヘテロアリール基が、

C_{1-3} -アルキル基によって置換されてもよいイミノ基、又は、酸素原子、若しくは、硫黄原子を含み、又は、

C_{1-3} -アルキル基によって置換されてもよいイミノ基、又は、酸素原子、若しくは、硫黄原子、及び、更に1個又は2個の窒素原子を含み、又は、

C_{1-3} -アルキル基によって置換されてもよいイミノ基、及び、3個の窒素原子を含み、

そして更に、フッ素原子、塩素原子、若しくは、臭素原子、 C_{1-3} -アルキル基、ヒドロキシ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノ基、ジ-(C_{1-3} -アルキル)-アミノ基、若しくは、 C_{3-6} -シクロアルキレンイミノ基によって置換されてもよいフェニル環が、上記単環ヘテロアリール基と2個の隣接する炭素原子によって縮合されてもよく、

そして、結合がヘテロ環基の窒素原子若しくは炭素原子、又は、縮合フェニル環によって生じ、

そして、ここで、特に明記しない限り、上記定義における用語"ハロゲン原子"は、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の中から選択される原子を意味し、

そして、ここで、特に明記しない限り、先に記載した定義に存在する2個より多い炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アルキニル基及びアルキルオキシ基が、直鎖若しくは分岐であってもよく、そして、先に記載したジアルキル化された基、例えばジアルキルアミノ基におけるアルキル基が、同一若しくは異なってもよく、

そして、上記の定義に含まれるメチル基若しくはエチル基の水素原子が、特に明記しない限り、フッ素原子によって全て若しくは部分的に置き換わってもよい。))

【請求項2】

D、E、G、J、L、 L^1 、 L^2 、及び、Mが、請求項1に定義したとおりで、

R^4 が、

水素原子、若しくは、直鎖若しくは分岐の C_{1-6} -アルキル基を表し、

ここで、直鎖若しくは分岐の C_{1-6} -アルキル基のメチレン部分及び/又はメチル部分の水素原子が、フッ素原子によって全て若しくは部分的に置き換わってもよく、及び/又は

ここで、直鎖若しくは分岐の C_{1-6} -アルキル基のメチレン部分及び/又はメチル部分の水素原子が、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニルオキシ基、ジ-(C_{1-5} -アルキル)-アミノカルボニルオキシ基、カルボキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基、アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル基、ジ-(C_{1-5} -アルキル)-アミノカルボニル基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ-(C_{1-5} -アルキル)-アミノ基、 C_{1-5} -アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルオキシ- C_{1-2} -アルキルカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルオキシカルボニルアミノ基、 C_{1-3} -アルキルアミノカルボニルアミノ基、 C_{1-5} -アルキルスルホニルアミノ基、N-(C_{1-5} -アルキルスルホニル)- C_{1-5} -アルキルアミノ基、及び、 C_{3-6} -シクロアルキルカルボニルアミノ基から選択される置換基によってそれぞれ独立して置換されてもよく、又は、

ニトリル基、カルボキシ基、アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニル基、 C_{3-6} -シクロアルキルアミノカルボニル基、ジ-(C_{1-5} -アルキル)-アミノカルボニル基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニル

基を表し、ここで、メチレン基が、酸素原子、硫黄原子、若しくは、 C_{0-3} -アルキル置換窒素原子によって置き換わってもよく、そして、

又は、 R^4 がGに結合する場合、それが、フッ素原子、ヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、 C_{2-5} -アルケニル-オキシ基、 C_{2-5} -アルキニル-オキシ基、 C_{3-6} -シクロアルキルオキシ基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニルオキシ基、ジ(C_{1-5} -アルキル)アミノカルボニルオキシ基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニルオキシ基、フェニル- C_{0-2} -アルキルオキシ基、アミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノ基、ジ-(C_{1-5} -アルキル)-アミノ基、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノ基、 C_{1-3} -アシルアミノ基、(C_{1-3} -アシル) C_{1-3} -アルキルアミノ基、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニルアミノ基、 C_{1-5} -アルキルアミノカルボニルアミノ基、ジ(C_{1-5} -アルキル)アミノカルボニルアミノ基、若しくは、 C_{4-7} -シクロアルキレンイミノカルボニルアミノ基を表してもよく、

ここで、上記アルキル基若しくはシクロアルキル基に存在する、メチル基若しくはメチレン基が、それぞれ独立して、ジメチルアミノカルボニル、 C_{1-5} -アルキルオキシカルボニル、カルボキシ、メチル、ヒドロキシ、メトキシ、及び、アミノの中から選択される置換基によって置換されてもよく、

但し、酸素及び窒素の中から選択される2個のヘテロ原子が、ただ1個の置換されてもよい- CH_2 基によって、互いに隔てられる場合、及び/又は2個の原子が-O-O結合、若しくは、-S-O結合を形成している場合が除かれ、そして、

R^5 が、

水素原子、 C_{1-5} アルキル基、アリル基、プロパルギル基、若しくは、ベンジル基を表し、

又は、 R^5 がGに結合する場合、それが、ヒドロキシ基、若しくは、メトキシ基を表してもよく、又は、

R^4 及び R^5 が、

それらが同じ1個の炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、-C=O基若しくは-CF₂基を形成してもよく、又は、

R^4 及び R^5 が、

それらが同じ1個の炭素原子、若しくは、2個の隣接する炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、3-7-員環の炭素環基を形成してもよく、

ここで、この環状基の炭素鎖の一つが、酸素原子、硫黄原子、-NH基、-N(C_{1-5} -アルキル)基、-N(C_{1-4} -アルキルカルボニル)基、カルボニル基、スルフィニル基、若しくは、スルホニル基によって置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、これらの C_{4-7} -炭素環基の2個の直接隣接する炭素鎖部分が、一緒に-C(O)NH基、-C(O)N(C_{1-5} -アルキル)基、-S(O)₂NH基、若しくは、-S(O)₂N(C_{1-5} -アルキル)基によって置き換わってもよく、及び/又は、

ここで、これらの C_{5-7} -炭素環基の4個の直接隣接する炭素鎖部分が、一緒に-O-CH₂-CH₂-O基によって置き換わってもよく、

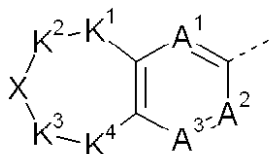
但し、一緒に R^4 及び R^5 から形成された環状基であって、環状基の2個の窒素原子、又は、1個の窒素原子及び1個の酸素原子が、ただ1個の置換されてもよい- CH_2 基によって、互いに隔てられる置換基、及び/又は、環の2個の原子が-O-O結合、若しくは、-S-O-結合を

形成する置換基が除かれた、請求項1に記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項3】

E、G、J、L、L¹、L²、M、R⁴、及び、R⁵が、請求項1又は2に定義したとおりで、Dが、式(IIa)又は(IIb)の置換二環系を表し、

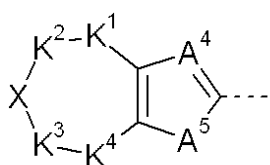
【化5】



(IIa)

又は、

【化6】



(IIb)

K¹及びK⁴が、

それぞれ独立して結合、-CH₂基、-CHR^{7a}基、-CR^{7b}R^{7c}基、若しくは、-C(O)基を表し、ここで、

R^{7a}/R^{7b}/R^{7c}が、

それぞれ独立してフッ素原子、ヒドロキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシ基、若しくは、C₁₋₅-アルキル基を表し、

(ここで、-C(R^{7b}R^{7c})-が-CF₂基である場合を除いて、2個の基R^{7b}/R^{7c}が同時にヘテロ原子によって環状炭素原子に結合してはならない)、又は、

2個の基R^{7b}/R^{7c}が環状炭素原子と一緒に、
3-員環の炭素環基を形成してもよく、

但し、K¹及びK⁴が同時に結合を表す場合が除かれ、

K²及びK³が、

それぞれ独立して-CH₂基、-CHR^{8a}基、-CR^{8b}R^{8c}基、若しくは、-C(O)基を表し、ここで、

R^{8a}/R^{8b}/R^{8c}が、

それぞれ独立して、C₁₋₅-アルキル基を表し、

及び/又は

2個の基R^{8b}/R^{8c}が環状炭素原子と一緒に、

3-員環の飽和炭素環基を形成してもよく、

全てにおいて、式(IIa)若しくは(IIb)において、R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}、R^{8a}、R^{8b}及びR^{8c}から選択される4つを超えない基が存在してもよく、そして、

Xが、

酸素原子、硫黄原子、CF₂基、若しくは、NR¹基を表し、ここで、

R¹が、

水素原子、ヒドロキシ基、C₁₋₃-アルキルオキシ基、アミノ基、C₁₋₃-アルキルアミノ基、ジ-(C₁₋₃-アルキル)-アミノ基、C₁₋₅-アルキル基、C₂₋₅-アルケニル-CH₂基、C₂₋₅-アルキニル-CH₂基、若しくは、C₃₋₆-シクロアルキル基を表し、

A¹が、

N若しくはCR¹⁰を表し、

A²が、

N若しくはCR¹¹を表し、

A³が、

N若しくはCR¹²を表し、

A⁴が、

N若しくはCR¹²を表し、

A⁵が、

NH、硫黄、若しくは酸素を表し、

ここで、R¹⁰、R¹¹及びR¹²が、それぞれ独立して、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、C₁₋₅-アルキル基、CF₃基、シアノ基、カルボキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル基、ヒドロキシ基、C₁₋₃-アルキルオキシ基、CF₃O基、CHF₂O基、CH₂FO基、アミノ基、C₁₋₅-アルキルアミノ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノ基、若しくは、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノ基を表す、請求項1又は2に記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項4】

Xが、

NR¹基を表し、

R¹が、

水素原子、C₁₋₅-アルキル基、アリル基、若しくは、シクロプロピル基を表し、

A¹が、

CR¹⁰を表し、

A²が、

CR¹¹を表し、

A³が、

CR¹²を表し、

A⁴が、

N若しくはCR¹²を表し、

A⁵が、

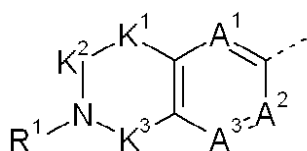
硫黄を表し、

更に、R¹⁰、R¹¹及びR¹²が、それぞれ独立して、水素原子、フッ素原子、塩素原子、メチル基、CF₃基、ヒドロキシ基、メトキシ基、CF₃O基、CHF₂O基、若しくは、CH₂FO基を表す、請求項1から3のいずれか1つに記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項5】

Dが、以下の式の置換二環系を表し、

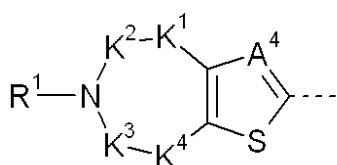
【化7】



(IIe)

又は

【化 8】



(II f)

K¹が、

-CH₂基、-CHR^{7a}基、若しくは、-CR^{7b}R^{7c}基を表し、

K²及びK³が、

それぞれ独立して-CH₂基、-CHR^{8a}基、若しくは、-CR^{8b}R^{8c}基を表し、ここで、

R^{8a}/R^{8b}/R^{8c}が、

それぞれ独立して、C₁₋₅-アルキル基を表し、

K⁴が、

結合、-CH₂基、-CHR^{7a}基、若しくは、-CR^{7b}R^{7c}基を表し、ここで、

R^{7a}が、

C₁₋₅-アルキル基を表し、そして、

R^{7b}/R^{7c}が、

それぞれ独立してヒドロキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシ基、若しくは、C₁₋₅-アルキル基を表し、

(ここで、2個の基R^{7b}/R^{7c}が、同時に酸素原子によって環状炭素原子に結合してはならない)、そして、

全てにおいて、式(II e)、若しくは、(II f)において、R^{7a}、R^{7b}、R^{7c}、R^{8a}、R^{8b}及びR^{8c}から選択される4つを超えない基が存在してもよく、そして、

R¹が、

水素原子、C₁₋₃-アルキル基、アリル基、若しくは、シクロプロピル基を表し、

A¹が、

CR¹⁰を表し、

A²が、

CR¹¹を表し、

A³が、

CR¹²を表し、

A⁴が、

N若しくはCR¹²を表し、

ここで、R¹⁰、R¹¹及びR¹²が、それぞれ独立して、水素原子、フッ素原子、塩素原子、メチル基、CF₃基、ヒドロキシ基、メトキシ基、CF₃O基、CHF₂O基、若しくは、CH₂FO基を表し、そして、

-L-E-G-J-が、

R⁴及びR⁵によって置換されてもよい-C-C-C-C基を表し、そして、

R⁴が、

水素原子、若しくは、直鎖若しくは分岐のC₁₋₃-アルキル基を表し、

ここで、直鎖若しくは分岐のC₁₋₆-アルキル基のメチレン部分及び/又はメチル部分の水素原子が、ヒドロキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシ基、C₁₋₅-アルキルアミノカルボニルオ

キシ基、ジ-(C₁₋₅-アルキル)-アミノカルボニルオキシ基、カルボキシ基、C₁₋₅-アルキルオキシカルボニル基、C₁₋₃-アルキルオキシ-C₁₋₂-アルキルカルボニルアミノ基、C₁₋₃-アルキルオキシカルボニルアミノ基、C₁₋₃-アルキルアミノカルボニルアミノ基、C₁₋₅-アルキルカルボニルアミノ基、C₁₋₅-アルキルスルホニルアミノ基から選択される置換基によって互いに独立して置換されてもよく、又は、

R⁴がGに結合する場合、それが、フッ素原子、ヒドロキシ基、メトキシ基、C₃₋₅-アルケニル-オキシ基、C₂₋₅-アルキル-オキシ基、C₃₋₆-シクロアルキルオキシ基、ベンジルオキシ基、C₁₋₅-アルキルアミノカルボニルオキシ基、ジ(C₁₋₅-アルキル)アミノカルボニルオキシ基、若しくは、C₄₋₇-シクロアルキレンイミノカルボニルオキシ基を表してもよく、
但し、酸素及び窒素の中から選択される2個のヘテロ原子が、ただ1個の置換されてもよい-CH₂基によって、互いに隔てられる場合が除かれ、そして、

R⁵が、

水素原子、C₁₋₅-アルキル基、アリル基、ベンジル基、若しくは、フェニル基を表し、
又は、R⁵がGに結合する場合、それが、ヒドロキシ基、若しくは、メトキシ基を表してもよく、又は、

R⁴及びR⁵が、

それらが同じ1個の炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、-C=O基若しくは-CF₂基を形成してもよく、又は、

R⁴及びR⁵が、

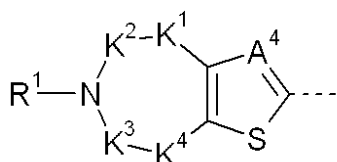
それらが同じ1個の炭素原子、若しくは、2個の隣接する炭素原子に結合している場合、その炭素原子と一緒に、3-6-員環の炭素環基を形成してもよく、

ここで、これらのC₅₋₆-炭素環基の4個の直接隣接する炭素鎖部分が、一緒に-O-CH₂-CH₂-O基によって置き換わってもよい、請求項1から4のいずれか1つに記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項6】

Dが、以下の式の置換二環系を表し、

【化9】



(II f)

K¹が、

-CH₂基、-CHR^{7a}基、若しくは、-CR^{7b}R^{7c}基を表し、そして、

K²及びK³が、

それぞれ独立して-CH₂基、-CHR^{8a}基、若しくは、-CR^{8b}R^{8c}基を表し、ここで、

R^{8a}/R^{8b}/R^{8c}が、

それぞれ独立して、C₁₋₅-アルキル基を表し、そして

K⁴が、

結合、-CH₂基、-CHR^{7a}基、若しくは、-CR^{7b}R^{7c}基を表し、ここで、

R^{7a} が、
 C_{1-5} -アルキル基を表し、そして、
 R^{7b}/R^{7c} が、

それぞれ独立してヒドロキシ基、 C_{1-5} -アルキルオキシ基、若しくは、 C_{1-5} -アルキル基を表し、

(ここで、2個の基 R^{7b}/R^{7c} が、同時に酸素原子によって環状炭素原子に結合してはならない)、そして、

全てにおいて、式(11f)において、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{7c} 、 R^{8a} 、 R^{8b} 及び R^{8c} から選択される4つを超えない基が存在してもよく、そして、

R^1 が、
 水素原子、 C_{1-3} -アルキル基、若しくは、シクロプロピル基を表し、ここで、

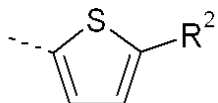
A^1 が、
 CR^{10} を表し、
 A^2 が、
 CR^{11} を表し、
 A^3 が、
 CR^{12} を表し、
 A^4 が、
 N若しくは CR^{12} を表し、

ここで、 R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} が、それぞれ独立して、水素原子、フッ素原子、塩素原子、メチル基、 CF_3 基、ヒドロキシ基、メトキシ基、 CF_3O 基、 CHF_2O 基、若しくは CH_2FO 基を表す、請求項1から5のいずれか1つに記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項7】

Mが、以下の式のチオフエン-2-イル環を表し、

【化10】



ここで、

R^2 が、塩素原子、臭素原子、若しくは、エチニル基を表す、請求項1から6のいずれか1つに記載の一般式(1)の化合物、それらの互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、混合物、又は、塩。

【請求項8】

請求項1から7のいずれか1つに記載の化合物の生理学的に許容される塩。