

【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10日 (2012.5.10)

【公表番号】特表2011-515412(P2011-515412A)

【公表日】平成23年5月19日 (2011.5.19)

【年通号数】公開・登録公報2011-020

【出願番号】特願2011-500942(P2011-500942)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

C 0 7 D 471/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 1 6

A 6 1 P 31/18

C 0 7 D 498/08 C S P

A 6 1 K 31/5383

C 0 7 D 471/18

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 487/04

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 519/00 3 1 1

C 0 7 D 487/08

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月16日 (2012.3.16)

【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

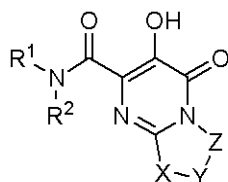
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I ;

【化 1】



I

〔式中、

R^1 は、(Ar¹) アルキル、アルキル、(シクロアルキル) アルキル、ジフェニルアルキル、フェノキシアルキル、(PhNH) アルキル、(メチルピロリジニル) アルキル、(イミダゾリル) アルキル、(バレロラクタミル) アルキル、(テトラヒドロフラニル) アルキル、((フルオロ)(メチル)ピリジニル) メチル、フェニルシクロプロピル、またはベンジルピロリジニルであり；

R^2 は、水素、アルキル、ヒドロキシまたはアルコキシであり；

R^3 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、シアノ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、 $N(R^8)(R^9)$ 、 $N(R^6)COR^7$ 、 $N(R^6)SO_2R^7$ 、 $N(R^6)CO_2R^7$ 、 $N(R^6)SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 CO_2R^6 、 $CON(R^8)(R^9)$ 、 SOR^7 、 SO_2R^7 、 $SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 $PO(OR^6)_2$ 、 R^{12} 、または Ar² であり；

R^4 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、または $N(R^6)(R^6)$ であり；

R^5 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、または $N(R^6)(R^6)$ であり；

R^6 は、水素、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであり；

R^7 は、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであり；

R^8 は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキルまたはジアルキルアミノアルキルであり；

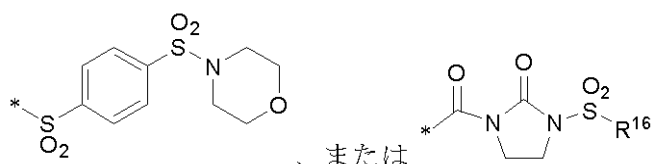
R^9 は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキルまたはジアルキルアミノアルキルであるか；あるいは

$N(R^8)(R^9)$ は一緒になって、アゼチジニル、ピロリジニル、(R^{10}) - ピペリジニル、N - (R^{11}) - ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、またはジオキソチアジニルであり；

R^{10} は、水素、アルキル、ヒドロキシ、またはヒドロキシアルキルであり；

R^{11} は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルコキシアルキル、フェニル、ピリジニル、(メチルイミダゾリル) メチル、 COR^6 、 CO_2R^6 、(ヒドロキシアルキル) CO、(アルコキシアルキル) CO、(テトラヒドロフラニル) CO、(メチルイソオキサゾリル) CO、(チエニル) CO、(フラニル) CO、(ピリジニル) CO、 $CON(R^8)(R^9)$ 、 SO_2R^7 、 $SO_2N(R^8)(R^9)$ 、(ジメチルイソオキサゾリル) SO_2 、((カルボエトキシ)チエニル) SO_2 、(メチルイミダゾリル) SO_2 、

【化 2】



であり；

R^{12} は、アゼチジノニル、ピロリジノニル、バレロラクタミル、カプロラクタミル、マレイミド、オキサゾリジノニル、イミダゾリジノニル、トリアゾロニル、 $N-(R^6)$ -ジオキソチアゾリジニルまたはジオキソチアジニルであって、アルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、およびアミノアルキルからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R^{13} は、水素、アルキル、アルキルカルボニル、アルコシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、またはアルキルスルホニルであり；

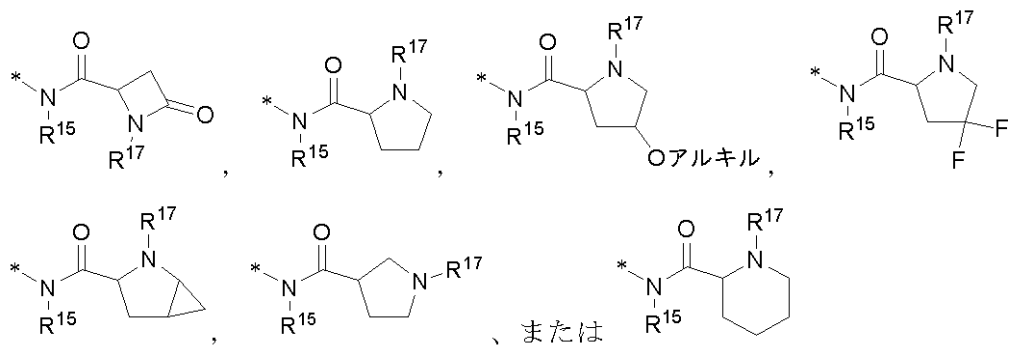
R^{14} は、 $N(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})$ (ベンジルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ (アルキルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ ((ヒドロキシアルキル)オキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ ((アルキルオキシ)アルキルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})CO(R^{16})$ 、 $N(R^{15})((CO(N(R^{15}))_2)アルキル)$ 、 $N(R^{15})((CO_2CO(N(R^{15}))_2)アルキル)$ 、 $N(R^{15})CO((N(R^{15}))_2)アルキル$ 、 $N(R^{15})CO((CON(R^{15}))(R^{15})アルキル)$ 、 $N(R^{15})COCO_2(R^{15})$ 、 $N(R^{15})CO((CO_2(R^{15})アルキル)$ 、 $N(R^{15})COCON(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})COCO((N(R^{15}))(R^{15}))アルキル$ 、 $N(R^{15})CO(N(R^{15}))_2$ 、 $N(R^{15})SO_2R^{16}$ 、 $N(R^{15})SO_2(N(R^{15}))_2$ 、または $N(R^{15})COAr^3$ であるか；

R^{14} は、ヒドロキシ、アルコキシ、(ヒドロキシ)アルコキシ、(アルコキシ)アルコキシ、 $(R^{16}CO_2)アルコキシ$ 、または $(PhCO_2)アルコキシ$ であるか；

R^{14} は、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ (アルコキシアルキル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ (ヒドロキシアルキル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ ((テトラヒドロフラン)メチル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ ((N,N -ジメチルピラゾリル)メチル)、または $N(R^{15})CO((Ar^4)アルキル)$ であるか；

R^{14} は、

【化 3】



であるか；

あるいは R^{14} は、

*N(R15)C(=O)CN1CCCC1=O, *N(R15)C(=O)C1CCNC1=O, *N(R15)C(=O)c1cc2c(c1)ncn2C3=CC=CC=C3,
*N(R15)C(=O)C1CCNC(=O)N1, *N(R15)C(=O)C1=CC=CC=C1, *N(R15)C(=O)C1=C2C(=C(C=C1)N)C(=C(C=C2)C)C3=CC=CC=C3C3,
*N(R15)C(=O)C(=O)c1c[nH]c2cc(F)cnc12, *N(R15)C(=O)N(R15)アルキル, *N(R15)C(=O)N(R15)ピリジニル, *N(R15)C(=O)N(R15)SO2フェニル,
*N(R15)C(=O)N1CCN(S(=O)(=O)R16)C1=O, *N(R15)S(=O)(=O)c1cc2c(c1)nc(=O)n2C, *N(R15)C(=O)C12CC3CC1(C2)C(C3)C(=O)NCC, *N(R15)C(=O)C12CC3CC1(C2)C(C3)C(=O)NS(=O)(=O)C,
*N(R15)C(=O)C1C(C)N2C=CC=CC2N1, *N(R15)C(=O)C12CC1(C2)C(F)(F)F, *N(R15)C(=O)C12CC1(C2)COC, *N(R15)C(=O)C12CC1(C2)C3=CC=CC=C3N,
*N(R15)C(=S)N(R15), *N(R15)C(=S)N(R15)COPh, *N(R15)C(=S)N(R15)COC, または *N(R15)C(=NCN)N(R15)

R¹⁻⁵ は、水素、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであるか；

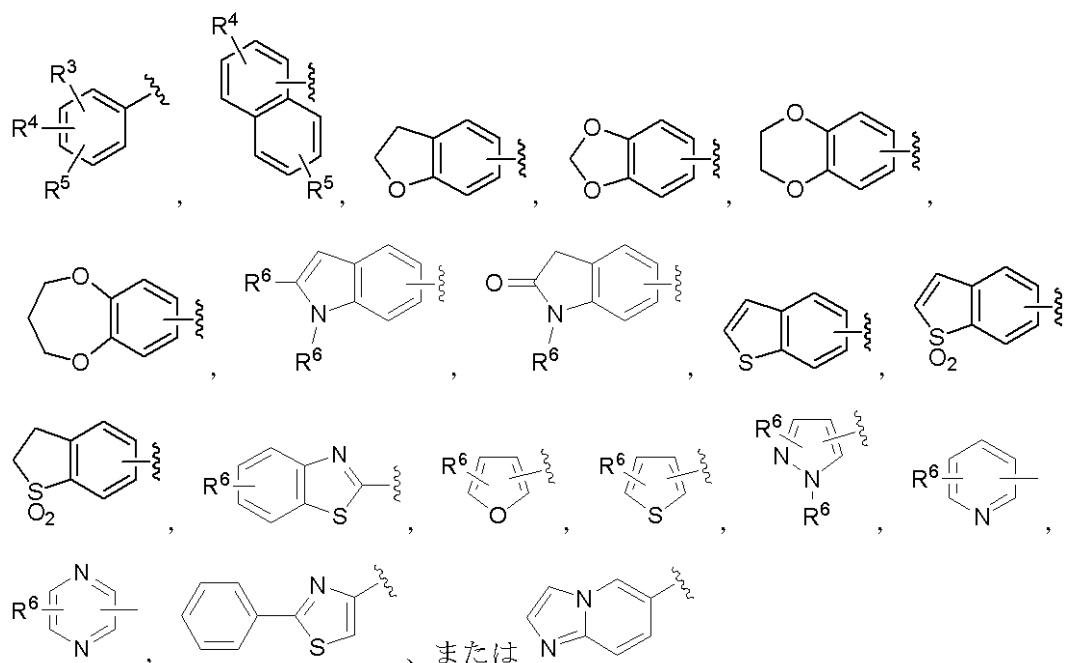
あるいは $N(R^{15})(R^{15})$ は一緒になって、アゼチジニル、ピロリジニル、 $(R^1)^0$ - ピペリジニル、 $N - (R^{11})$ - ピペラジニル、モルホリニル、またはチオモルホリニルであって、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキルオキシアルキル、アセトアミド、 CO_2R^6 、もしくは $CON(R^8)(R^9)$ から選択される 0 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R¹⁻⁶ は、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、テトラヒドロピラニル、または Ar³ であり；

R^{1 7} は、水素、アルキル、アルキルCO、シクロアルキルCO、アルキルオキシCO、CON(R^{1 5})(R^{1 5})、COCON(R^{1 5})(R^{1 5})、COAr³、アルキルSO₂、シクロアルキルSO₂、フラニルSO₂、トリアゾリルSO₂、またはN-メチルピロリルSO₂であり；

 $A r^{-1}$ は、

【化 5】



であり；

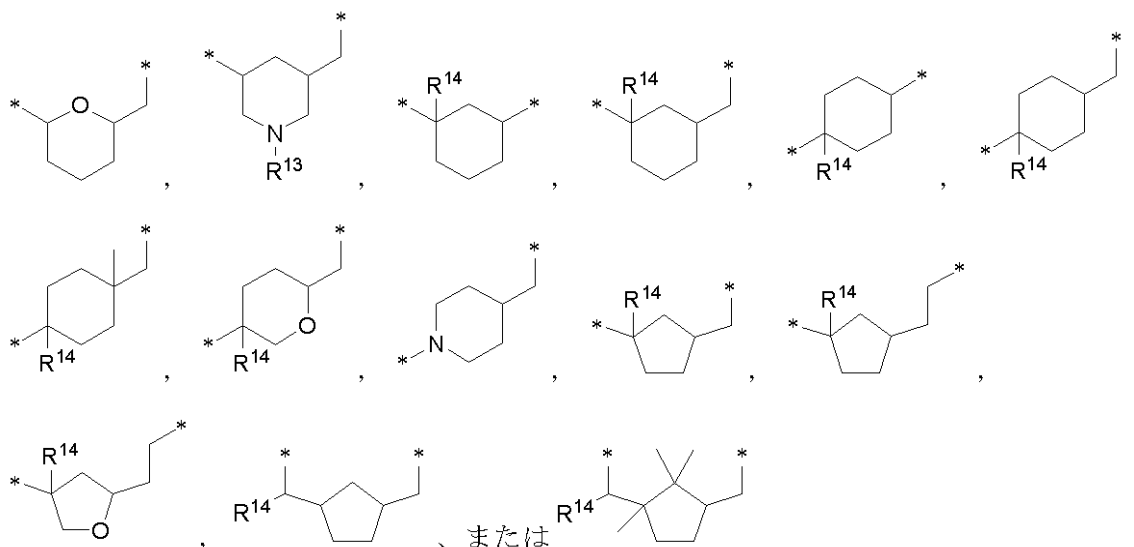
Ar^2 は、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリジニル、またはヒドロキシピリジニルであって、オキソ、ハロ、シアノ、ベンジル、アルキル、アルコキシ、 $N(R^8)(R^9)$ 、 CO_2R^6 、および $CON(R^8)(R^9)$ からなる群から選択される 0～3 個の置換基で置換されており；

Ar^3 は、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、またはフェニルであって、オキソ、ハロ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、ベンジル、アルキル、ハロアルキル、 $N(R^8)(R^9)$ 、および $N(R^{15})CO(R^{16})$ からなる群から選択される 0～3 個の置換基で置換されており；

Ar^4 は、ピラゾリルまたはトリアゾリルであって、 CO_2R^6 もしくは $CON(R^8)(R^9)$ から選択される 0～1 個の置換基で置換されており；

X - Y - Z は、

【化 6】



である]

の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2】

R^1 が、 (Ar^1) アルキルであり；

R^2 が、水素、アルキル、ヒドロキシまたはアルコキシであり；

R^3 が、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、 $N(R^8)(R^9)$ 、 $N(R^6)COR^7$ 、 $N(R^6)SO_2R^7$ 、 $N(R^6)CO_2R^7$ 、 $N(R^6)SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 CO_2R^6 、 $CON(R^8)(R^9)$ 、 SOR^7 、 SO_2R^7 、 $SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 $PO(OR^6)_2$ 、 R^{12} 、または Ar^2 であり；

R^4 が、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、または $N(R^6)(R^6)$ であり；

R^5 が、水素、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、または $N(R^6)(R^6)$ であり；

R^6 が、水素、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであり；

R^7 が、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであり；

R^8 が、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキルまたはジアルキルアミノアルキルであり；

R^9 が、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキルまたはジアルキルアミノアルキルであるか；あるいは

$N(R^8)(R^9)$ が一緒になって、アゼチジニル、ピロリジニル、 (R^{10}) -ピペリジニル、 $N-(R^{11})$ -ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、またはジオキソチアジニルであり；

R^{10} が、水素、アルキル、ヒドロキシ、またはヒドロキシアルキルであり；

R^{11} が、水素、アルキル、シクロアルキル、 COR^6 、または CO_2R^6 であり；

R^{12} が、アゼチジノニル、ピロリジノニル、パレロラクタミル、カプロラクタミル、マレイミド、オキサゾリジノニル、イミダゾリジノニル、トリアゾロニル、 $N-(R^6)$ -ジオキソチアゾリジニルまたはジオキソチアジニルであって、アルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、およびアミノアルキルからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R^{13} が、水素、アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、またはアルキルスルホニルであり；

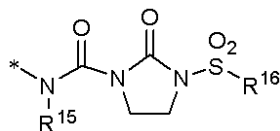
R^{14} が、 $N(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})($ ベンジルオキシカルボニル $)$ 、 $N(R^{15})($ アルキルオキシカルボニル $)$ 、 $N(R^{15})CO(R^{16})$ 、 $N(R^{15})C$

O (アルキル (N (R¹⁵)₂))、N (R¹⁵) CO CO₂ (R¹⁵)、N (R¹⁵) CO CON (R¹⁵) (R¹⁵)、N (R¹⁵) CO (N (R¹⁵)₂)、N (R¹⁵) SO₂ R¹⁶、N (R¹⁵) SO₂ (N (R¹⁵)₂)、または N (R¹⁵) CO Ar³ であるか；

R¹⁴ が、ヒドロキシ、アルコキシ、(ヒドロキシ)アルコキシ、(アルコキシ)アルコキシ、(R¹⁶ CO₂)アルコキシ、または (Ph CO₂)アルコキシであるか；

あるいは R¹⁴ が、

【化 7】



であり；

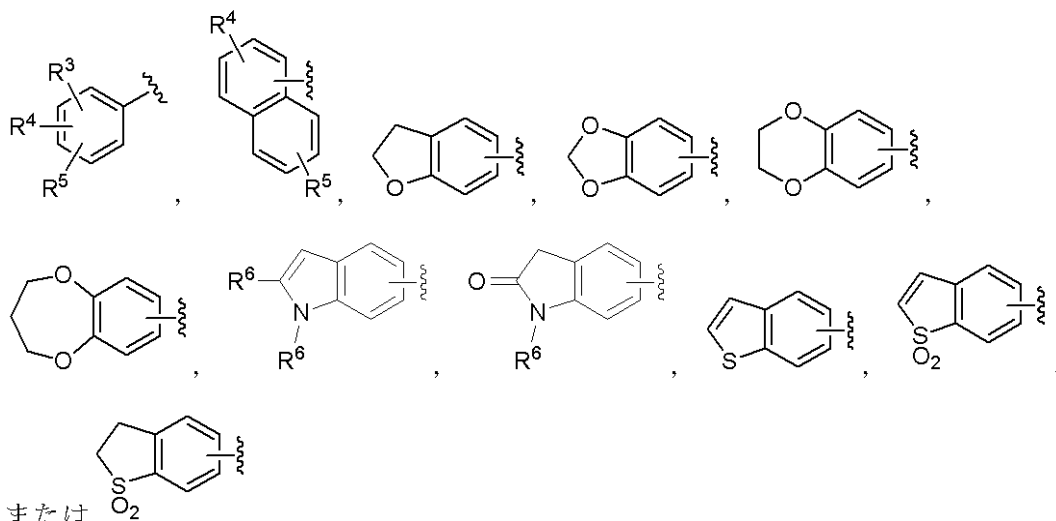
R¹⁵ が、水素、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであるか；

あるいは N (R¹⁵) (R¹⁵) が一緒になって、アゼチジニル、ピロリジニル、(R¹⁰) - ピペリジニル、N - (R¹¹) - ピペラジニル、モルホリニル、またはチオモルホリニルであり；

R¹⁶ が、アルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであり；

Ar¹ が、

【化 8】



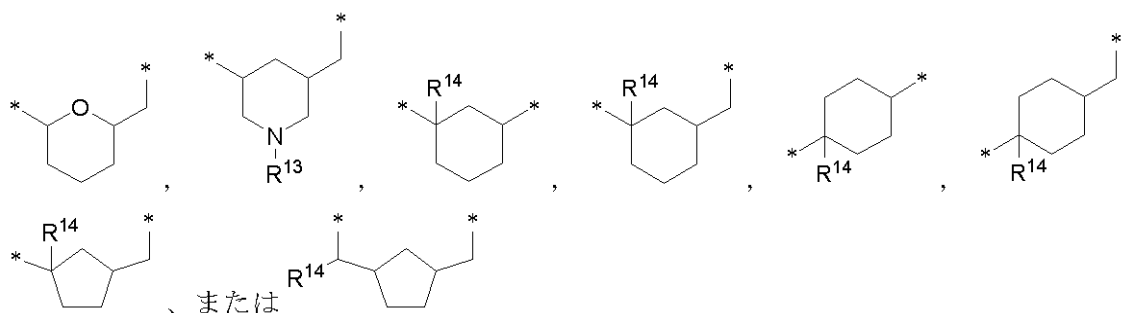
であり；

Ar² が、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリジニル、またはヒドロキシピリジニルであって、オキソ、ハロ、シアノ、ベンジル、アルキル、アルコキシ、N (R⁸) (R⁹)、CO₂ R⁶、および CON (R⁸) (R⁹) からなる群から選択される 0 ~ 3 個の置換基で置換されており；

Ar³ が、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、またはピリジニルであって、オキソ、ハロ、アルコキシ、シアノ、ベンジル、およびアルキルからなる群から選択される 0 ~ 3 個の置換基で置換されており；

X - Y - Z が、

【化 9】

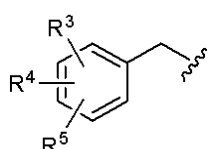


である、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 3】

R^1 が、

【化 10】

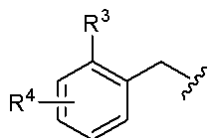


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 が、

【化 11】



であり、

R^3 が、水素またはハロ以外である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^3 が、 $\text{CON}(\text{R}^8)(\text{R}^9)$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^8)(\text{R}^9)$ 、アゼチジノニル、ピロリジノニル、パレロラクタミル、カプロラクタミル、オキサゾリジノニル、イミダゾリジノニル、ジオキソチアジニル、 $\text{N}-(\text{R}^6)$ -ジオキソチアゾリジニル、またはトリアゾリルであり、トリアゾリルは 0 ~ 2 個のアルキルもしくはオキソ置換基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^3 が、ハロ、 $\text{CON}(\text{R}^8)(\text{R}^9)$ 、オキサゾリジノニル、またはトリアゾリルであり、トリアゾリルは 0 ~ 2 個のアルキルもしくはオキソ置換基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

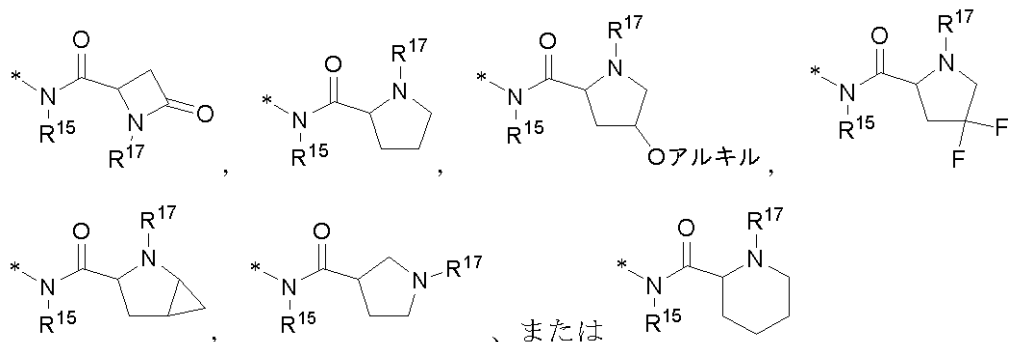
Ar^3 が、オキサジアゾリル、ピラゾリル、またはイソオキサゾリルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^{14} が、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{R}^{15})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{ベンジルオキシカルボニル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{アルキルオキシカルボニル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{(ヒドロキシアルキル)オキシカルボニル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{(アルキルオキシ)アルキルオキシカルボニル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{CO}(\text{R}^{16})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{(CO}(\text{N}(\text{R}^{15})_2\text{)アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})(\text{(CO}_2\text{CO}(\text{N}(\text{R}^{15})_2\text{)アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{CO}((\text{N}(\text{R}^{15})_2\text{)アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{CO}((\text{CON}(\text{R}^{15})(\text{R}^{15})\text{アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{COCO}_2(\text{R}^{15})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{CO}((\text{CO}_2(\text{R}^{15})\text{アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{COCON}(\text{R}^{15})(\text{R}^{15})$ 、 $\text{N}(\text{R}^{15})\text{COCO}((\text{N}(\text{R}^{15})$

R^{15})) アルキル)、 $N(R^{15})CO(N(R^{15})_2)$ 、 $N(R^{15})SO_2R^{16}$ 、 $N(R^{15})SO_2(N(R^{15})_2)$ 、 または $N(R^{15})COAr^3$ であるか；
 R^{14} が、 ヒドロキシ、 アルコキシ、 (ヒドロキシ) アルコキシ、 (アルコキシ) アルコキシ、 ($R^{16}CO_2$) アルコキシ、 または ($PhCO_2$) アルコキシであるか；
 R^{14} が、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ (アルコシアルキル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ (ヒドロシアルキル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ ((テトラヒドロフラニル)メチル)、 $N(R^{15})COCON(R^{15})$ ((N, N - ジメチルピラゾリル)メチル)、 または $N(R^{15})CO((Ar^4)アルキル)$ であるか；
 あるいは R^{14} が、

【化 12】



である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^1 が、 (Ar^1) アルキル、 アルキル、 (シクロアルキル) アルキル、 ジフェニルアルキル、 フェノシアルキル、 ($PhNH$) アルキル、 (メチルピロリジニル) アルキル、 (イミダゾリル) アルキル、 (パレロラクタミル) アルキル、 (テトラヒドロフラニル) アルキル、 ((フルオロ) (メチル) ピリジニル) メチル、 フェニルシクロプロピル、 またはベンジルピロリジニルであり；

R^2 が、 水素であり；

R^3 が、 水素、 ハロ、 ヒドロキシ、 アルコキシ、 シアノ、 アルキル、 シクロアルキル、 ハロアルキル、 ヒドロシアルキル、 アルコシアルキル、 アルコキシ、 ハロアルコキシ、 $N(R^8)(R^9)$ 、 $N(R^6)COR^7$ 、 $N(R^6)SO_2R^7$ 、 $N(R^6)CO_2R^7$ 、 $N(R^6)SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 CO_2R^6 、 $CON(R^8)(R^9)$ 、 SO_2R^7 、 $SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 または Ar^2 であり；

R^4 が、 水素、 ハロ、 またはアルキルであり；

R^5 が、 水素、 ハロ、 またはアルキルであり；

R^6 が、 水素、 アルキル、 ハロアルキル、 またはシクロアルキルであり；

R^7 が、 アルキル、 ハロアルキル、 またはシクロアルキルであり；

R^8 が、 水素またはアルキルであり；

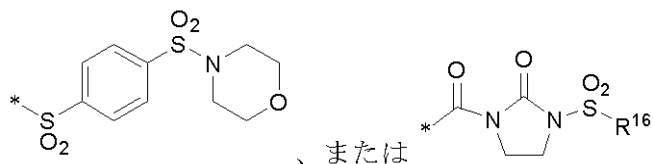
R^9 が、 水素またはアルキルであるか； あるいは

$N(R^8)(R^9)$ が一緒になって、 アゼチジニル、 ピロリジニル、 (R^{10}) - ピペリジニル、 N - (R^{11}) - ピペラジニル、 モルホリニル、 チオモルホリニル、 またはジオキソチアジニルであり；

R^{10} が、 水素、 アルキル、 ヒドロキシ、 またはヒドロシアルキルであり；

R^{11} が、 水素、 アルキル、 シクロアルキル、 ヒドロシアルキル、 アルコシアルキル、 ヒドロシアルコシアルキル、 フェニル、 ピリジニル、 (メチルイミダゾリル) メチル、 COR^6 、 CO_2R^6 、 (ヒドロシアルキル) CO 、 (アルコシアルキル) CO 、 (テトラヒドロフラニル) CO 、 (メチルイソオキサゾリル) CO 、 (チエニル) CO 、 (フラニル) CO 、 (ピリジニル) CO 、 $CON(R^8)(R^9)$ 、 SO_2R^7 、 $SO_2N(R^8)(R^9)$ 、 (ジメチルイソオキサゾリル) SO_2 、 ((カルボエトキシ) チエニル) SO_2 、 (メチルイミダゾリル) SO_2 、

【化 1 3】



であり；

R^{13} が、水素、アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、またはアルキルスルホニルであり；

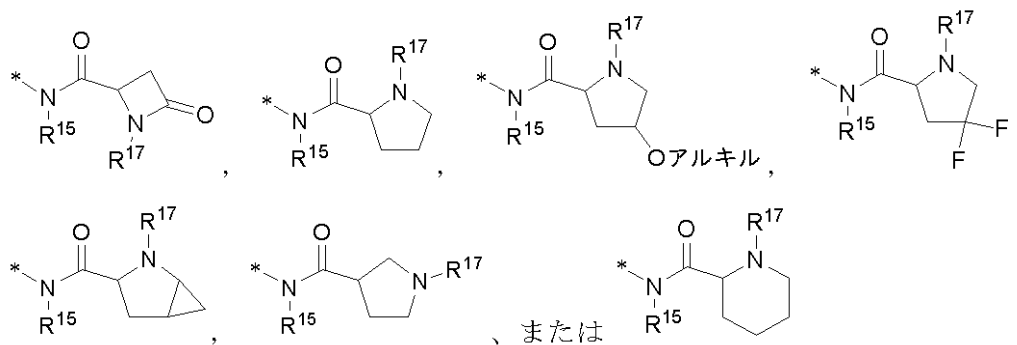
R^{14} が、 $N(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})$ (ベンジルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ (アルキルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ ((ヒドロキシアルキル)オキシカルボニル)、 $N(R^{15})$ ((アルキルオキシ)アルキルオキシカルボニル)、 $N(R^{15})CO(R^{16})$ 、 $N(R^{15})((CO(N(R^{15}))_2)$ アルキル)、 $N(R^{15})((CO_2CO(N(R^{15}))_2)$ アルキル)、 $N(R^{15})CO((N(R^{15}))_2)$ アルキル)、 $N(R^{15})CO((CON(R^{15}))(R^{15})$ アルキル)、 $N(R^{15})COCO_2(R^{15})$ 、 $N(R^{15})CO((CO_2(R^{15})$ アルキル)、 $N(R^{15})COCO(N(R^{15}))(R^{15})$ 、 $N(R^{15})COCO((N(R^{15}))(R^{15}))$ アルキル)、 $N(R^{15})CO(N(R^{15}))_2$ 、 $N(R^{15})SO_2R^{16}$ 、 $N(R^{15})SO_2(N(R^{15}))_2$ 、または $N(R^{15})COAr^3$ であるか；

R^{14} が、ヒドロキシ、アルコキシ、(ヒドロキシ)アルコキシ、(アルコキシ)アルコキシ、 $(R^{16}CO_2)$ アルコキシ、または $(PhCO_2)$ アルコキシであるか；

R^{14} が、 $N(R^{15})COCO(N(R^{15}))$ (アルコキシアルキル)、 $N(R^{15})COCO(N(R^{15}))$ (ヒドロキシアルキル)、 $N(R^{15})COCO(N(R^{15}))$ ((テトラヒドロフラン)メチル)、 $N(R^{15})COCO(N(R^{15}))$ ((N,N -ジメチルピラゾリル)メチル)、または $N(R^{15})CO((Ar^4)$ アルキル)であるか；

R^{14} が、

【化 1 4】



であるか；

あるいは R^{14} が、

*N(R15)C(=O)CN1CCCC1=O, *N(R15)C(=O)C1CCNC1=O, *N(R15)C(=O)c1cc2c(c1)ncn2C3=CC=CC=C3,
*N(R15)C(=O)C1CCNC(=O)N1, *N(R15)C(=O)C1=CC=CC=C1, *N(R15)C(=O)C1=C2C(=C(C=C1)N)C(=C(C=C2)OC)C3=CC=CC=C3Cl,
*N(R15)C(=O)C(=O)c1c[nH]c2cc(F)cnn2c1, *N(R15)C(=O)N(R15)アルキル, *N(R15)C(=O)N(R15)ピリジニル, *N(R15)C(=O)N(R15)SO2フェニル,
*N(R15)C(=O)N1CCN(S(=O)(=O)R16)C1=O, *N(R15)S(=O)(=O)c1cc2c(c1)nc(=O)n2C, *N(R15)C(=O)C12CC3C(C1)CC=C3C2C(=O)NC(C)C, *N(R15)C(=O)C12CC3C(C1)CC=C3C2C(=O)NS(=O)(=O)C,
*N(R15)C(=O)C1C(C)N2C=CC=N2N1, *N(R15)C(=O)C12CC3C(C1)C(C2)C(F)(F)F3, *N(R15)C(=O)C12CC3C(C1)CC=C3C2C(=O)COC, *N(R15)C(=O)C12CC3C(C1)CC=C3C2C(=O)c1ccncc1,
*N(R15)C(=S)N(R15)R15, *N(R15)C(=S)N(R15)COPh, *N(R15)C(=S)N(R15)COC, または *N(R15)C(=NCN)N(R15)R15

R¹⁻⁵ が、水素、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルキル、またはシクロアルキルであるか；

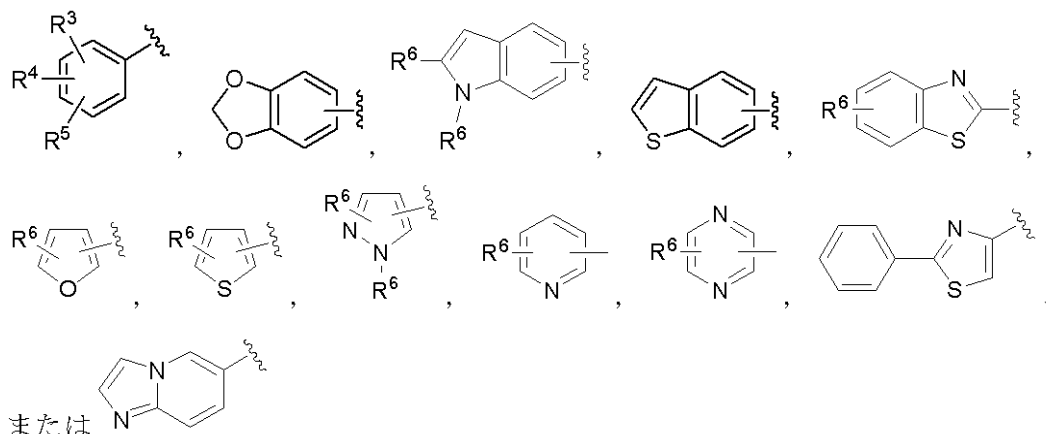
あるいは $N(R^{15})(R^{15})$ が一緒になって、アゼチジニル、ピロリジニル、 $(R^1)^0$ - ピペリジニル、 $N - (R^{11})$ - ピペラジニル、モルホリニル、またはチオモルホリニルであって、ハロ、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキルオキシアルキル、アセトアミド、 CO_2R^6 、もしくは $CON(R^8)(R^9)$ から選択される 0 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R¹⁻⁶ が、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、テトラヒドロピラニル、または Ar³ であり；

R¹⁻⁷ が、水素、アルキル、アルキルCO、シクロアルキルCO、アルキルオキシCO、CON(R¹⁻⁵)(R¹⁻⁵)、COCON(R¹⁻⁵)(R¹⁻⁵)、COAr³、アルキルSO₂、シクロアルキルSO₂、フラニルSO₂、トリアゾリルSO₂、またはN-メチルピロリルSO₂であり；

A r¹ が、

【化 16】



であり；

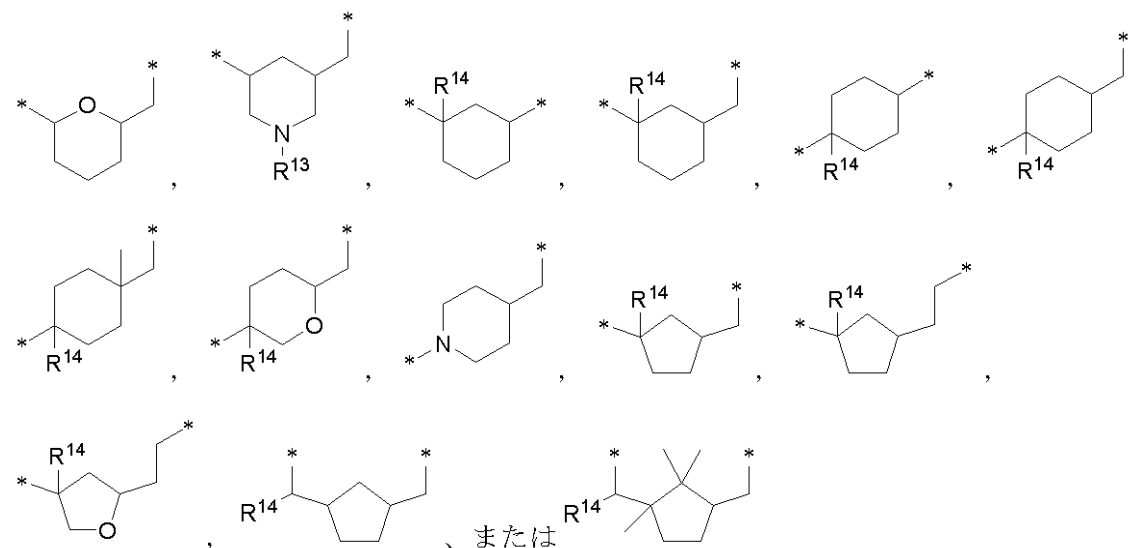
Ar^2 が、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリジニル、またはヒドロキシピリジニルであって、オキソ、ハロ、シアノ、ベンジル、アルキル、アルコキシ、 $N(R^8)(R^9)$ 、 CO_2R^6 、および $CON(R^8)(R^9)$ からなる群から選択される 0～3 個の置換基で置換されており；

Ar^3 が、テトラゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾピリジニル、キノリニル、イソキノリニル、またはフェニルであって、オキソ、ハロ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、ベンジル、アルキル、ハロアルキル、 $N(R^8)(R^9)$ 、および $N(R^{15})CO(R^{16})$ からなる群から選択される 0～3 個の置換基で置換されており；

Ar^4 が、ピラゾリルまたはトリアゾリルであって、 CO_2R^6 もしくは $CON(R^8)(R^9)$ から選択される 0～1 個の置換基で置換されており；

$X-Y-Z$ が、

【化 17】



である、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 10】

R^1 が (Ar^1) アルキルであり、 R^2 が水素である、請求項 9 に記載の化合物。

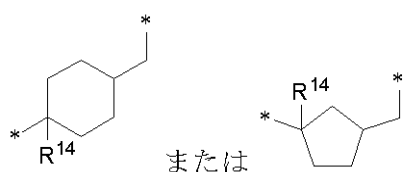
【請求項 11】

R^{14} が、 $N(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})(\text{ベンジルオキシカルボニル})$ 、 $N(R^{15})(\text{アルキルオキシカルボニル})$ 、 $N(R^{15})(\text{(ヒドロキシアルキル)オキシカルボニル})$ 、 $N(R^{15})(\text{(アルキルオキシ)アルキルオキシカルボニル})$ 、 $N(R^{15})CO(R^{16})$ 、 $N(R^{15})(CO(N(R^{15})_2)\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})(CO_2CO(N(R^{15})_2)\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})CO((N(R^{15})_2)\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})CO(CON(R^{15})(R^{15})\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})COCO_2(R^{15})$ 、 $N(R^{15})CO(CO_2(R^{15})\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})COCON(R^{15})(R^{15})$ 、 $N(R^{15})COCO((N(R^{15})(R^{15}))\text{アルキル})$ 、 $N(R^{15})CO(N(R^{15})_2)$ 、 $N(R^{15})SO_2R^{16}$ 、 $N(R^{15})SO_2(N(R^{15})_2)$ 、または $N(R^{15})COAr^3$ である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

X - Y - Z が、

【化 18】



である、請求項 11 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 13】

エタンジアミド、N - [2 - [[(4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N', N' - トリメチル - ;

エタンジアミド、N - [2 - [[(3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N', N' - トリメチル - ;

エタンジアミド、N - [2 - [[(4 - フルオロフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N', N' - トリメチル - ;

エタンジアミド、N' - [2 - [[(4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N - ジメチル - ;

エタンジアミド、N' - [2 - [[(3 - シクロプロピル - 4 - フルオロフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N - ジメチル - ;

エタンジアミド、N' - [2 - [[(4 - フルオロフェニル) メチル] アミノ] カルボニル] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - 7, 10 - エタノピリミド [1, 2 - a] アゼピン - 10 (4H) - イル] - N, N - ジメチル - ;

8, 11 - メタノ - 4H - ピリミド [1, 2 - a] アゾシン - 2 - カルボキサミド、N - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 11 - [[2 - (3R) - 3 - フルオロ - 1 - ピロリジニル] - 1, 2 - ジオキソエチル] アミノ] - 6, 7, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロ - 3 - ヒドロキシ - 4 - オキソ - , (8R, 11S) - ;

エタンジアミド、N - (2 - フルオロエチル) - N' - [2 - [[(4 - フルオロフ

エニル)メチル]アミノ]カルボニル]-7, 8, 9, 10-テトラヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-11(6H)-イル]-N-メチル-;

エタンジアミド, N'-[(8R, 11S)-2-[[[(4-フルオロ-3-メチルフェニル)メチル]アミノ]カルボニル]-7, 8, 9, 10-テトラヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-11(6H)-イル]-N, N-ジメチル-;

エタンジアミド, N'-[2-[[[(4-フルオロフェニル)メチル]アミノ]カルボニル]-7, 8, 9, 10-テトラヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-11(6H)-イル]-N, N-ジメチル-;

エタンジアミド, N'-[2-[[[(4-フルオロ-3-メチルフェニル)メチル]アミノ]カルボニル]-7, 8, 9, 10-テトラヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-11(6H)-イル]-N, N-ジメチル-;

8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-2-カルボキサミド, N-[(4-フルオロフェニル)メチル]-11-[[2-[(3R)-3-フルオロ-1-ピロリジニル]-1, 2-ジオキソエチル]アミノ]-6, 7, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-;

8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-2-カルボキサミド, N-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)メチル]-11-[[2-[(3R)-3-フルオロ-1-ピロリジニル]-1, 2-ジオキソエチル]アミノ]-6, 7, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-;および

エタンジアミド, N'-[2-[[[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)メチル]アミノ]カルボニル]-7, 8, 9, 10-テトラヒドロ-3-ヒドロキシ-4-オキソ-8, 11-メタノ-4H-ピリミド[1, 2-a]アゾシン-11(6H)-イル]-N, N-ジメチル-;

からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項14】

治療上有効な量の請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩、および薬学的に許容される担体を含む、HIV感染の治療に有用な医薬組成物。

【請求項15】

治療上有効な量の請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩、ならびにヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、HIVプロテアーゼ阻害剤、HIV融合阻害剤、HIV結合阻害剤、CCR5阻害剤、CXCR4阻害剤、HIV出芽もしくは成熟阻害剤、およびHIVインテグラーゼ阻害剤からなる群から選択される、AIDSまたはHIV感染の治療のために使用される少なくとも1種の他の薬剤を組み合わせる含む、HIV感染を治療するための剤であって、該少なくとも1種の他の薬剤を請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容されるその塩と同時だが別々に投与することができる、該剤。