

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年12月6日(2007.12.6)

【公表番号】特表2007-506785(P2007-506785A)

【公表日】平成19年3月22日(2007.3.22)

【年通号数】公開・登録公報2007-011

【出願番号】特願2006-528279(P2006-528279)

【国際特許分類】

C 07 D 213/73 (2006.01)
C 07 C 237/40 (2006.01)
C 07 F 7/18 (2006.01)
C 07 C 235/56 (2006.01)
C 07 C 237/30 (2006.01)
C 07 F 5/04 (2006.01)
C 07 C 255/60 (2006.01)
C 07 C 317/32 (2006.01)
C 07 C 311/46 (2006.01)
C 07 C 323/42 (2006.01)
C 07 C 233/80 (2006.01)
C 07 C 237/20 (2006.01)
C 07 C 233/25 (2006.01)
C 07 D 333/20 (2006.01)
A 61 K 31/381 (2006.01)
C 07 D 307/14 (2006.01)
A 61 K 31/341 (2006.01)
A 61 K 31/167 (2006.01)
C 07 D 333/52 (2006.01)
C 07 D 207/335 (2006.01)
A 61 K 31/40 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
A 61 K 31/403 (2006.01)
C 07 D 409/14 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/4184 (2006.01)
C 07 D 333/36 (2006.01)
A 61 K 31/24 (2006.01)
A 61 K 31/192 (2006.01)
A 61 K 31/245 (2006.01)
A 61 K 31/196 (2006.01)
C 07 D 333/34 (2006.01)
C 07 D 333/22 (2006.01)
A 61 K 31/4436 (2006.01)
C 07 D 277/20 (2006.01)
C 07 D 277/40 (2006.01)
A 61 K 31/426 (2006.01)
A 61 K 31/44 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
A 61 K 31/41 (2006.01)
A 61 K 31/4535 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/275 (2006.01)
C 0 7 D 233/84 (2006.01)
C 0 7 D 233/60 (2006.01)
C 0 7 D 207/325 (2006.01)
C 0 7 D 209/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/404 (2006.01)
C 0 7 D 277/28 (2006.01)
A 6 1 K 31/425 (2006.01)
C 0 7 D 263/56 (2006.01)
A 6 1 K 31/423 (2006.01)
A 6 1 K 31/498 (2006.01)
A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/4192 (2006.01)
C 0 7 D 333/68 (2006.01)
C 0 7 D 249/06 (2006.01)
C 0 7 D 257/04 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/437 (2006.01)
C 0 7 D 319/18 (2006.01)
A 6 1 K 31/357 (2006.01)
A 6 1 K 31/517 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 33/02 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 48/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/7088 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 K 31/695 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
A 6 1 K 31/69 (2006.01)
C 0 7 D 277/64 (2006.01)
A 6 1 K 31/428 (2006.01)
C 0 7 D 239/28 (2006.01)
A 6 1 K 31/505 (2006.01)
C 0 7 D 239/52 (2006.01)
A 6 1 K 31/18 (2006.01)
C 0 7 D 333/18 (2006.01)
C 0 7 D 413/04 (2006.01)
C 0 7 D 213/61 (2006.01)
C 0 7 D 333/38 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)
C 1 2 N 9/99 (2006.01)
C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/73 C S P
C 0 7 C 237/40 Z N A
C 0 7 F 7/18 R
C 0 7 C 235/56
C 0 7 F 7/18 N
C 0 7 C 237/30
C 0 7 F 5/04 C
C 0 7 C 255/60
C 0 7 C 317/32
C 0 7 C 311/46
C 0 7 C 323/42
C 0 7 C 233/80
C 0 7 C 237/20
C 0 7 C 233/25
C 0 7 D 333/20
A 6 1 K 31/381
C 0 7 D 307/14
A 6 1 K 31/341
A 6 1 K 31/167
C 0 7 D 333/52
C 0 7 D 207/335
A 6 1 K 31/40
C 0 7 D 409/12
A 6 1 K 31/403
C 0 7 D 409/14
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/4184
C 0 7 D 333/36
A 6 1 K 31/24
A 6 1 K 31/192
A 6 1 K 31/245
A 6 1 K 31/196
C 0 7 D 333/34
C 0 7 D 333/22
A 6 1 K 31/4436
C 0 7 D 277/40
A 6 1 K 31/426
A 6 1 K 31/44
A 6 1 K 31/497
A 6 1 K 31/41
A 6 1 K 31/4535
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/275
C 0 7 D 233/84
C 0 7 D 233/60 1 0 1
C 0 7 D 207/325

C 0 7 D 209/08
A 6 1 K 31/404
C 0 7 D 277/28
A 6 1 K 31/425
C 0 7 D 263/56
A 6 1 K 31/423
A 6 1 K 31/498
A 6 1 K 31/4155
A 6 1 K 31/4025
A 6 1 K 31/4178
C 0 7 D 417/14
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/4192
C 0 7 D 333/68
C 0 7 D 249/06
C 0 7 D 257/04 E
C 0 7 D 471/04 1 0 7 E
A 6 1 K 31/437
C 0 7 D 319/18
A 6 1 K 31/357
A 6 1 K 31/517
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 43/00 1 0 5
A 6 1 P 33/02
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 35/00
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 48/00
A 6 1 K 31/7088
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 31/695
C 0 7 D 413/12
A 6 1 K 31/4245
A 6 1 K 31/69
C 0 7 D 277/64
A 6 1 K 31/428
C 0 7 D 239/28
A 6 1 K 31/505
C 0 7 D 239/52
A 6 1 K 31/18
C 0 7 D 333/18
C 0 7 D 413/04
C 0 7 D 213/61
C 0 7 D 333/38
A 6 1 K 31/538
C 1 2 N 9/99
C 1 2 N 15/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成19年10月16日(2007.10.16)

【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

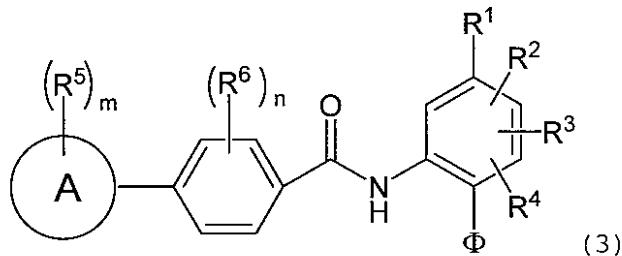
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式の化合物、或いは薬剤として許容されるその塩、又は in vivo 加水分解可能なエステル若しくはアミド

【化1】



(式中、

は、 - NH₂ 又は - OH であり、

環 A は、ヘテロシクリルであり、前記ヘテロシクリルが - NH - 部分を含有する場合、その窒素は K から選択される基で置換されていてもよく、

R⁵ は、炭素上の置換基であり、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C₁ ~ 6 - アルキル、C₂ ~ 6 - アルケニル、C₂ ~ 6 - アルキニル、C₁ ~ 6 - アルコキシ、C₁ ~ 6 - アルカノイル、C₁ ~ 6 - アルカノイルオキシ、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)アミノ、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂アミノ、C₁ ~ 6 - アルカノイルアミノ、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)カルバモイル、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂カルバモイル、C₁ ~ 6 - アルキルS(O)_a(aは0 ~ 2である)、C₁ ~ 6 - アルコキシカルボニル、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)スルファモイル、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂スルファモイル、アリール、アリールオキシ、アリールC₁ ~ 6 - アルキル、複素環基、(複素環基)C₁ ~ 6 - アルキル又は基(B - E -)から選択され、基(B - E -)を含むR⁵は、炭素上で1個又は複数のWで置換されていてもよく、前記複素環基が - NH - 部分を含有する場合、その窒素はJで置換されていてもよく、

Wは、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C₁ ~ 6 - アルキル、C₂ ~ 6 - アルケニル、C₂ ~ 6 - アルキニル、C₁ ~ 6 - アルコキシ、C₁ ~ 6 - アルカノイル、C₁ ~ 6 - アルカノイルオキシ、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)アミノ、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂アミノ、C₁ ~ 6 - アルカノイルアミノ、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)カルバモイル、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂カルバモイル、C₁ ~ 6 - アルキルS(O)_a(aは0 ~ 2である)、C₁ ~ 6 - アルコキシカルボニル、N - (C₁ ~ 6 - アルキル)スルファモイル、N, N - (C₁ ~ 6 - アルキル)₂スルファモイル又は基(B' - E' -)であり、基(B' - E' -)を含むWは、炭素上で1個又は複数のYで置換されていてもよく、

Y及びZは、独立に、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリ

フルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキル、 $C_{2\sim 6}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ -アルキニル、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルオキシ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)アミノ、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂アミノ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルアミノ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂カルバモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキルS(O)_a(_aは0~2である)、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)スルファモイル又は $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂スルファモイルから選択され、

G、J及びKは、独立に、 $C_{1\sim 8}$ -アルキル、 $C_{1\sim 8}$ -アルケニル、 $C_{1\sim 8}$ -アルカノイル、 $C_{1\sim 8}$ -アルキルスルホニル、 $C_{1\sim 8}$ -アルコキシカルボニル、カルバモイル、 $N-(C_{1\sim 8}$ -アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1\sim 8}$ -アルキル)カルバモイル、ベンジルオキシカルボニル、ベンゾイル、フェニルスルホニル、アリール、アリール $C_{1\sim 6}$ -アルキル又は(複素環基) $C_{1\sim 6}$ -アルキルから選択され、G、J及びKは、炭素上で1個又は複数のQで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素は水素又は $C_{1\sim 6}$ アルキルで置換されていてもよく、

Qは、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキル、 $C_{2\sim 6}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ -アルキニル、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルオキシ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)アミノ、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂アミノ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルアミノ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂カルバモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキルS(O)_a(_aは0~2である)、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシカルボニル、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシカルボニルアミノ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)スルファモイル、アリール、アリールオキシ、アリール $C_{1\sim 6}$ -アルキル、アリール $C_{1\sim 6}$ -アルコキシ、複素環基、(複素環基) $C_{1\sim 6}$ -アルキル、(複素環基) $C_{1\sim 6}$ -アルコキシ又は基(B"-E"-)であり、基(B"-E"-)を含むQは、炭素上で1個又は複数のZで置換されていてもよく、

B、B'及びB"は、独立に、 $C_{1\sim 6}$ -アルキル、 $C_{2\sim 6}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ -アルキニル、 $C_{3\sim 8}$ -シクロアルキル、 $C_{3\sim 8}$ -シクロアルキル $C_{1\sim 6}$ -アルキル、アリール、アリール $C_{1\sim 6}$ -アルキル、複素環基、(複素環基) $C_{1\sim 6}$ -アルキル、フェニル又はフェニル $C_{1\sim 6}$ -アルキルから選択され、B、B'及びB"は、炭素上で1個又は複数のDで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素はGから選択される基で置換されていてもよく、

E、E'及びE"は、独立に、-N(R^a)-、-O-、-C(O)O-、-OC(O)-、-C(O)-、-N(R^a)C(O)-、-N(R^a)C(O)N(R^b)-、-N(R^a)C(O)O-、-OC(O)N(R^a)-、-C(O)N(R^a)-、S(O)_r、-SO₂N(R^a)-、-N(R^a)SO₂-から選択され、R^a及びR^bは、独立に、水素又は1個若しくは複数のFで置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ -アルキルから選択され、rは0~2であり、

D及びFは、独立に、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキル、 $C_{2\sim 6}$ -アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ -アルキニル、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルオキシ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)アミノ、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂アミノ、 $C_{1\sim 6}$ -アルカノイルアミノ、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂カルバモイル、 $C_{1\sim 6}$ -アルキルS(O)_a(_aは0~2である)、 $C_{1\sim 6}$ -アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)スルファモイル又は $N,N-(C_{1\sim 6}$ -アルキル)₂スルファモイルから選択され、

mは、0、1、2、3又は4であり、R⁵のその値は同じでも異なっていてもよく、R⁶はハロであり、

n は、0、1 又は 2 であり、 R^6 のその値は同じか異なり、

R^2 、 R^3 及び R^4 は、独立に、水素、ハロゲン、-NH₂、ニトロ、ヒドロキシ、アリール、ヘテロシクリル、C₃ ~ C₈-シクロアルキル、ヘテロアリール、C₁ ~ C₇-アルキル、ハロアルキル、C₁ ~ C₇-アルケニル、C₁ ~ C₇-アルキニル、C₁ ~ C₇-アシル、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールオキシ、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールスルファニル、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールスルフィニル、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールスルホニル、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールアミノスルホニル、C₁ ~ C₇-アルキル-アリールアミン、C₁ ~ C₇-アルキニル-C(=O)-アミン、C₁ ~ C₇-アルケニル-C(=O)-アミン、C₁ ~ C₇-アルキニル-R⁹、C₁ ~ C₇-アルケニル-R⁹ からなる群から選択され、R⁹ は、水素、ヒドロキシ、アミノ、C₁ ~ C₇-アルキル又はC₁ ~ C₇-アルコキシであり、

R^1 は、単環、二環又は三環式アリール又はヘテロアリールであり、そのそれぞれは置換されていてもよい)。

又は薬剤として許容されるその塩或いはインビボで加水分解可能なそのエステル又はアミド。

【請求項 2】

任意の R⁵ 置換基を含む A は、キノリン-8-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-2-イルギ酸塩、6-(メトキシ)-1,2-ピラジン-3-イル、フラン-3-イル、2-メチルピリジン-4-イル、2-フルオロピリジン-4-イル、チアゾール-2-イル、2-アミノピリミジン-6-イル、ピリミン-6-イル、2-クロロピリミジン-6-イル、2-[3-(1-H-イミダゾール-1-イル)プロピルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[3-(4-メチルピペラジノ)プロピルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[3-(ジエチルアミノ)ブチルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[((3-ピリジル)メチルアミノ)ピリミジン-4-イル、2-[2-(ピペリジノ)エチルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[3-(メトキシ)プロピルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[3-(モルホリノ)プロポキシ]ピリド-4-イル、2-メチル-5-ピリジル、2-[3-(ピペリジノ)プロピルアミノ]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イル、チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イル、2-[3-(ピペリジノ)プロピルアミノ]ピリミジン-5-イル、2-[3-(4-メチルピペラジノ)プロピルアミノ]ピリミジン-5-イル、2-[3-(モルホリノ)プロピルアミノ]ピリミジン-5-イル、2-[2-(ピロリジノ)エチルアミノ]ピリミジン-5-イル、2-[3-(モルホリノ)プロピルアミノ]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イル、2-[2-(ピペリジノ)エチルアミノ]チエノ[3,2-d]ピリミジン-4-イル、5-[(シクロヘキシルカルバモイルオキシ)メチル]チアゾール-2-イル、2-[2-(メチルチオ)ピリミド-4-イル]チエン-5-イル、チエノ[3,2-b]ピリジン-7-イル、チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-イル、2-[3-(モルホリノ)プロピルアミノ]ピリド-4-イル、9-メチル-9-H-プリン-6-イル、2-(ピペラジノ)ピラジン-6-イル、2,4-ジ(エチルアミノ)-1,3,5-トリアジン-6-イル、2-(4-メチルピペラジノ)ピリミジン-4-イル、2-[3-(N,N-メチルフェニルアミノ)プロピルアミノ]ピリミジン-4-イル、2-[2-(N,N-ジブチルアミノ)エチルアミノ]ピリミジン-4-イル又は5-[(フェニルカルバモイルオキシ)メチル]チアゾール-2-イルであり、

n は 0 である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A はピリジン-3-イルであり、

m は 0 であり、

n は 1 であり、

R^6 は、ピリド-3-イル置換基に対してオルトに位置するフルオロである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

A は 4 - ピペリジニルであり、4 - ピペリジニル基上の N が、3 - (t - プトキシカルボニルアミノ) プロピル、ベンジル、2 - オキソピロリジン - 3 - イルメチル、2 - (o - メトキシフェノキシ) エチル、2 - フェノキシエチル、2 - (p - アセチルアミノフェノキシ) エチル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 1 - イルカルボニルメチル、2 - (p - クロロフェノキシ) エチル、2 - ピリジルメチル、p - シアノフェニルメチル、m - シアノフェニルメチル、m - メトキシフェニルメチル、2 - (t - プトキシカルボニルアミノ) エチル、3 - (2 - (メトキシ) エトキシ) プロピル、2 , 3 - ジヒドロキシプロピル、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル、3 - (ベンジルオキシ) プロピル、3 - (1 - H - ピロール - 1 - イル) プロピル又は 2 - (アセチルオキシ) エチルの 1 つで置換され、

m 及び n は、両方 0 である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

A は 3 - ピペリジニルであり、3 - ピペリジニル基上の N が、メトキシカルボニルメチル、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 1 - イルカルボニルメチル、2 - (p - ニトロフェノキシ) エチル、2 - メチルブチル、ベンジル、4 - (ベンジルオキシ) ブチル、p - (ジエチルアミノ) ベンゾイルメチル、2 - (p - ヒドロキシフェノキシ) エチル、1 , 2 , 5 - チアジアゾール - 3 - イルメチル、2 - ヒドロキシ - 2 - ナフチルエチル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、2 - (p - アセチルアミノフェノキシ) エチル、2 - エトキシエチル又はテトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イルメチルの 1 つで置換され、

m 及び n は、両方 0 である、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

A は、ピリジル、キノリル、インドリル、ピリミジニル、モルホリニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピラダジニル、ピラジニル、チアゾリル、チエニル、チエノピリミジニル、チエノピリジニル、ブリニル、トリアジニル、オキサゾリル、ピラゾリル、フラニル、ピリジン - 4 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、キノリン - 8 - イル、ピリミジン - 6 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピリミジン - 4 - イル、モルホリン - 4 - イル、ピペリジン - 4 - イル、ピペリジン - 3 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペラジン - 4 - イル、ピリダジン - 5 - イル、ピラジン - 6 - イル、チアゾール - 2 - イル、チエン - 2 - イル、チエノ [3 , 2 b] ピリミジニル、チエノ [3 , 2 b] ピリミジニル、チエノ [3 , 2 b] ピリジニル、プリン - 6 - イル又はトリアジン - 6 - イルからなる群から選択され、前記環構造のいずれかの上の - NH - 部分は、K から、或いはピラジン - 2 - イル又はフラン - 3 - イルからなる群から選択される基で置換されていてもよく、

R⁵ は、炭素上の置換基であり、ハロ、アミノ、C_{1 ~ 6} - アルキル、C_{1 ~ 6} - アルコキシ、N - (C_{1 ~ 6} - アルキル) アミノ、アリール、アリールオキシ、アリール C_{1 ~ 6} - アルキル、複素環基、(複素環基) C_{1 ~ 6} - アルキル又は基 (B - E -) から選択され、基 (B - E -) を含む R⁵ は、炭素上で 1 個又は複数の W で置換されていてもよく、前記複素環基が - NH - 部分を含有する場合、その窒素は J で置換されていてもよく、

W は、ヒドロキシ、メルカプト、C_{1 ~ 6} - アルキル、C_{1 ~ 6} - アルコキシ、N , N - (C_{1 ~ 6} - アルキル)₂ アミノ又は基 (B ' - E ' -) であり、基 (B ' - E ' -) を含む W は、炭素上で 1 個又は複数の Y で置換されていてもよく、

Y 及び Z は、独立に、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、C_{1 ~ 6} - アルコキシ、N , N - (C_{1 ~ 6} - アルキル)₂ アミノ又は C_{1 ~ 6} - アルカノイルアミノから選択され、

G、J及びKは、独立に、C_{1～8}-アルキル、C_{2～8}-アルケニル、C_{1～8}-アルカノイル、アリール、アリールC_{1～6}-アルキル又は(複素環基)C_{1～6}-アルキルから選択され、G、J及びKは、炭素上で1個又は複数のQで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素は水素又はC_{1～6}アルキルで置換されていてもよく、

Qは、シアノ、ヒドロキシ、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルカノイルオキシ、C_{1～6}-アルコキシカルボニル、C_{1～6}-アルコキシカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ又は基(B"-E"-)であり、基(B"-E"-)を含むQは、炭素上で1個又は複数のZで置換されていてもよく、

B、B'及びB"は、独立に、C_{1～6}-アルキル、C_{2～6}-アルケニル、C_{2～6}-アルキニル、C_{3～8}-シクロアルキル、C_{3～8}-シクロアルキルC_{1～6}-アルキル、アリール、アリールC_{1～6}-アルキル、複素環基、(複素環基)C_{1～6}-アルキル、フェニル又はフェニルC_{1～6}-アルキルから選択され、B、B'及びB"は、炭素上で1個又は複数のDで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素はGから選択される基で置換されていてもよく、

E、E'及びE"は、独立に、-N(R^a)-、-O-、-C(O)O-、-OC(O)-、-C(O)-、-N(R^a)C(O)-、-N(R^a)C(O)N(R^b)-、-N(R^a)C(O)O-、-OC(O)N(R^a)-、-C(O)N(R^a)-、-S(O)_r-、-SO₂N(R^a)-、-N(R^a)SO₂-から選択され、R^a及びR^bは、独立に、水素又は1個若しくは複数のFで置換されていてもよいC_{1～6}-アルキルから選択され、rは0～2であり、

D及びFは、独立に、ハロ、C_{1～6}-アルコキシ又はN,N-(C_{1～6}-アルキル)₂アミノから選択され、

mは、0、2、3又は4であり、R⁵の値は同じでも異なっていてもよく、

R⁶はハロであり、

nは、0、1又は2であり、R⁶の値は同じでも異なっていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

Aは、ヘテロシクリルであり、

R⁵は、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C_{1～6}-アルキル、C_{2～6}-アルケニル、C_{2～6}-アルキニル、C_{1～6}-アルコキシ、C_{1～6}-アルカノイル、C_{1～6}-アルカノイルオキシ、N-(C_{1～6}-アルキル)アミノ、N,N-(C_{1～6}-アルキル)₂アミノ、C_{1～6}-アルカノイルアミノ、N-(C_{1～6}-アルキル)カルバモイル、N,N-(C_{1～6}-アルキル)₂カルバモイル、C_{1～6}-アルキルS(O)_a(aは0～2である)、C_{1～6}-アルコキシカルボニル、N-(C_{1～6}-アルキル)スルファモイル、N,N-(C_{1～6}-アルキル)₂スルファモイル又は基(B-E-)であり、Bは、C_{1～6}-アルキル、C_{2～6}-アルケニル、C_{2～6}-アルキニル、C_{3～8}-シクロアルキル、C_{3～8}-シクロアルキルC_{1～6}-アルキル、フェニル、ヘテロシクリル、フェニルC_{1～6}-アルキル又はヘテロシクリルC_{1～6}-アルキルから選択され、Bは、炭素上で1個又は複数のDで置換されていてもよく、前記ヘテロシクリルが-NH-部分を含有する場合、その窒素はGから選択される基で置換されていてもよく、

Eは、-N(R^a)-、-O-、-C(O)O-、-OC(O)-、-C(O)-、-N(R^a)C(O)-、-C(O)N(R^a)-、-S(O)_r-、-SO₂N(R^a)-、-N(R^a)SO₂-であり、R^aは、水素又は1個若しくは複数のDで置換されていてもよいC_{1～6}-アルキルであり、rは0～2であり、

Dは、独立に、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C_{1～6}-アルキル、C_{2～6}-アルケニル、C_{2～6}-アルキニル、C_{1～6}-アルコキシ、

$C_{1\sim 6}$ - アルカノイル、 $C_{1\sim 6}$ - アルカノイルオキシ、N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)アミノ、N, N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)₂アミノ、 $C_{1\sim 6}$ - アルカノイルアミノ、N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)カルバモイル、N, N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)₂カルバモイル、 $C_{1\sim 6}$ - アルキルS(O)_a (a は0~2である)、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシカルボニル、N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)スルファモイル及びN, N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)₂スルファモイルから選択され、

Gは、 $C_{1\sim 4}$ - アルキル、 $C_{1\sim 4}$ - アルカノイル、 $C_{1\sim 4}$ - アルキルスルホニル、 $C_{1\sim 4}$ - アルコキシカルボニル、カルバモイル、N - ($C_{1\sim 4}$ - アルキル)カルバモイル、N, N - ($C_{1\sim 4}$ - アルキル)カルバモイル、ベンジル、ベンジルオキシカルボニル、ベンゾイル及びフェニルスルホニルから選択され、

mは、0、1、2、3又は4であり、R⁵の値は同じか異なり、

R⁶はハロであり、

nは、0、1又は2であり、R⁶の値は同じでも異なっていてもよい、

請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

Aは、ピリジル、キノリル、インドリル、ピリミジニル、モルホリニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピラダジニル、ピラジニル、チアゾリル、チエニル、チエノピリミジニル、チエノピリジニル、ブリニル、トリアジニル、オキサゾリル、ピラゾリル又はフラニルであり、環Aが-NH-部分を含有する場合、その窒素はKから選択される基で置換されていてもよく、

R⁵は、炭素上の置換基であり、ハロ、アミノ、 $C_{1\sim 6}$ - アルキル、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシ、N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)アミノ、アリール、アリールオキシ、アリールC_{1~6} - アルキル、複素環基、(複素環基) $C_{1\sim 6}$ - アルキル又は基(B-E-)から選択され、基(B-E-)を含むR⁵は、炭素上で1個又は複数のWで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素はJで置換されていてもよく、

Wは、ヒドロキシ、メルカプト、 $C_{1\sim 6}$ - アルキル、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシ、N, N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)₂アミノ又は基(B'-E'-)であり、基(B'-E'-)を含むWは、炭素上で1個又は複数のYで置換されていてもよく、

Y及びZは、独立に、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシ、N, N - ($C_{1\sim 6}$ - アルキル)₂アミノ又は $C_{1\sim 6}$ - アルカノイルアミノから選択され、

G、J及びKは、独立に、 $C_{1\sim 8}$ - アルキル、 $C_{1\sim 8}$ - アルケニル、 $C_{1\sim 8}$ - アルカノイル、アリール、アリールC_{1~6} - アルキル又は(複素環基) $C_{1\sim 6}$ - アルキルから選択され、G、J及びKは、炭素上で1個又は複数のQで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素は水素又は $C_{1\sim 6}$ アルキルで置換されていてもよく、

Qは、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ - アルカノイルオキシ、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシカルボニル、 $C_{1\sim 6}$ - アルコキシカルボニルアミノ、アリール、アリールオキシ又は基(B''-E''-)であり、基(B''-E''-)を含むQは、炭素上で1個又は複数のZで置換されていてもよく、

B、B'及びB''は、独立に、 $C_{1\sim 6}$ - アルキル、 $C_{2\sim 6}$ - アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ - アルキニル、 $C_{3\sim 8}$ - シクロアルキル、 $C_{3\sim 8}$ - シクロアルキルC_{1~6} - アルキル、アリール、アリールC_{1~6} - アルキル、複素環基、(複素環基) $C_{1\sim 6}$ - アルキル、フェニル又はフェニルC_{1~6} - アルキルから選択され、B、B'及びB''は、炭素上で1個又は複数のDで置換されていてもよく、前記複素環基が-NH-部分を含有する場合、その窒素はGから選択される基で置換されていてもよく、

E、E'及びE''は、独立に、-N(R^a) -、-O-、-C(O)O-、-OC(O) -、-C(O)C(O) -、-N(R^a)C(O)N(R^a) -、-N(R^a)C(O)O-、-OC(O)N(R^a) -、-C(O)N(R^a) -、-S(

$O)_{r-} - SO_2 N(R^a) - - N(R^a) SO_2 -$ から選択され、 R^a 及び R^b は、独立に、水素又は 1 個若しくは複数の F で置換されていてもよい C_{1-6} -アルキルから選択され、r は 0 ~ 2 であり、

D 及び F は、独立に、ハロ、 C_{1-6} -アルコキシ又は $N, N-(C_{1-6}-\text{アルキル})_2$ アミノから選択され、

m は、0、1、2、3 又は 4 であり、 R^5 の値は同じか異なり、

R^6 は、フルオロ又はクロロであり、

n は、0、1 又は 2 であり、 R^6 の値は同じでも異なっていてもよい、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

A は、ピリジン-4-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-2-イル、キノリン-8-イル、ピリミジン-6-イル、ピリミジン-5-イル、ピリミジン-4-イル、モルホリン-4-イル、ピペリジン-4-イル、ピペリジン-3-イル、ピペリジン-2-イル、ピペラジン-4-イル、ピリダジン-5-イル、ピラジン-6-イル、チアゾール-2-イル、チエン-2-イル、チエノ[3,2d]ピリミジニル、チエノ[3,2b]ピリミジニル、チエノ[3,2b]ピリジニル、プリン-6-イル又はトリアジン-6-イルであり、環 A が -NH- 部分を含有する場合、その窒素は K から選択される基で置換されていてもよく、

R^5 は、炭素上の置換基であり、フルオロ、クロロ、アミノ、メチル、エチル、プロピル、メトキシ、N-メチルアミノ、N-エチルアミノ、N-プロピルアミノ、N-ブチルアミノ、フェニル、ナフチルエチル、ピペラジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、ピペリジン-4-イル、2-(チオメチル)-ピリミジン-4-イル、テトラヒドロフラン-2-イルメチル、テトラヒドロピラン-2-イルメチル、1,2,5-チアジアゾール-3-イルエチル、ピペリジン-1-イルメチル、ピリジン-2-イルメチル又は基(B-B-)から選択され、基(B-B-)を含む R^5 は、炭素上で 1 個又は複数の W で置換されていてもよく、前記複素環基が -NH- 部分を含有する場合、その窒素は J で置換されていてもよく、

W は、ヒドロキシ、メチル、エチル、エトキシ、 $N, N-(ジエチル)アミノ、N, N-(ジブチル)アミノ$ 又は基(B'-E'-)であり、基(B'-E'-)を含む W は、炭素上で 1 個又は複数の Y で置換されていてもよく、

Y 及び Z は、独立に、フルオロ、クロロ、ブロモ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、 $N, N-(ジメチル)アミノ$ 又はメチルカルボニルアミノから選択され、

G、J 及び K は、独立に、メチル、エチル、プロピル、ペンチル、2-メチルブチル、ブチル、アセチル、ベンジル、3-(ピロール-1-イル)プロピル又はピロリジン-2-オン-(5S)-メチルから選択され、G、J 及び K は、炭素上で 1 個又は複数の Q で置換されていてもよく、前記複素環基が -NH- 部分を含有する場合、その窒素は水素又はメチルで置換されていてもよく、

Q は、シアノ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、メチルカルボニルオキシ、メトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニルアミノ、フェニル又は基(B''-E''-)であり、基(B''-E''-)を含む Q は、炭素上で 1 個又は複数の Z で置換されていてもよく、

B、B' 及び B'' は、独立に、メチル、エチル、プロピル、シクロヘキシリ、フェニル、ベンジル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、3-モルホリノプロピル、2-モルホリノエチル、2-ピロリジン-1-イルエチル、3-モルホリノプロピル、3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル、2-ピペリジン-1-イルエチル、3-ピペリジン-1-イルプロピル、ピリジン-3-イルメチル又はイミダゾール-1-イルプロピルから選択され、B、B' 及び B'' は、炭素上で 1 個又は複数の D で置換されていてもよく、前記複素環基が -NH- 部分を含有する場合、その窒素は G から選択される基で置換されていてもよく、

E、E' 及び E'' は、独立に、-N(R^a) - -O-、-C(O)-、-NHCO(O)-、-N(R^a)C(O)O- から選択され、R^a は、水素又は 1 個若しくは複数の F

で置換されていてもよいメチルであり、

D 及び F は、独立に、フルオロ、メトキシ又はエトキシから選択され、

m は、0、1又は2であり、R⁵ の値は同じか異なり、

R⁶ はフルオロであり、

n は、0又は1である、

請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

R¹ は、フェニル、ナフチル、アントラセニル又はフルオレニルから選択される、請求項1、7、8又は9に記載の化合物。

【請求項11】

R¹ は、アクリジニル、アゾシニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンズオキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズトリアゾリル、ベンズテトラゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズイミダゾリニル、カルバゾリル、4aH-カルバゾリル、カルボリニル、クロマニル、クロメニル、シンノリニル、フラニル、フラザニル、イミダゾリル、1H-インダゾリル、インドレニル、インドリニル、インドリジニル、インドリル、3H-インドリル、イソベンゾフラニル、イソクロマニル、イソインダゾリル、イソインドリニル、イソインドリル、イソキノリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、メチレンジオキシフェニル、ナフチリジニル、オキサジアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、オキサゾリジニル、オキサゾリル、ピリミジニル、フェナンスリジニル、フェナンスロリニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサチイニル、フェノキサジニル、フタラジニル、ピペロニル、ブテリジニル、ブリニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリドオキサゾール、ピリドイミダゾール、ピリドチアゾール、ピリジニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、キナゾリニル、キノリニル、4H-キノリジニル、キノキサリニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、テトラゾリル、6H-1,2,5-チアジアジニル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、チアントレニル、チアゾリル、チエニル、チエノチアゾリル、チエノオキサゾリル、チエノイミダゾリル、チオフェニル、トリアジニル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,5-トリアゾリル、1,3,4-トリアゾリル又はキサンテニルから選択される、請求項1、7、8又は9に記載の化合物。

【請求項12】

R¹ は、チアゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル又はピリジニルから選択される、請求項1、7、8又は9に記載の化合物。

【請求項13】

R¹ は、フラニル又はチエニルから選択される、請求項1、7、8又は9に記載の化合物。

【請求項14】

R²、R³ 及び R⁴ は、全てHである、請求項10、11、12又は13に記載の化合物。