

【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10月4日(2007.10.4)

【公表番号】特表2006-528637(P2006-528637A)

【公表日】平成18年12月21日(2006.12.21)

【年通号数】公開・登録公報2006-050

【出願番号】特願2006-521272(P2006-521272)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 5/50	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04	1 5 0
C 07 D 487/04	C S P
C 07 D 495/04	1 0 8
A 61 K 31/55	
A 61 P 3/06	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/10	
A 61 P 5/50	
A 61 P 1/16	
A 61 P 43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年7月20日(2007.7.20)

【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

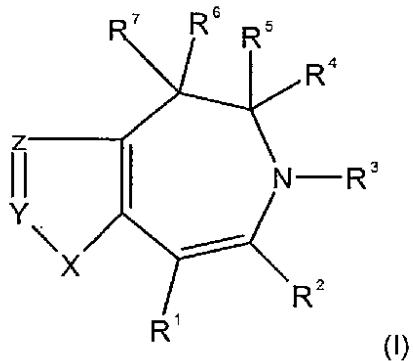
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)を有する化合物であつて、

【化1】



Xは、 N R^9 、O、又は S(O)_t (t は0~2)、

Yは、 C R^3 又はN、

Zは、 C R^3 又はN、

R^3 と R^3 は、それぞれ独立して、ハロ、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたシクロアルキルアルキル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-O R^3 ²、-SR³²、-N(R^3 ³)R³⁴、-N(R^3 ³)S(O)₂R²³、-N(R^3 ⁵)N(R^3 ³)R³⁴、-N(R^3 ⁵)N(R^3 ³)S(O)₂R²³、-C(O) R^3 ⁶、-C(O)OR³²、-C(S)OR³²、-C(O)SR³²、-C(O)N(R^3 ³)R²³、-C(S)N(R^3 ³)R³⁴、-C(O)N(R^3 ³)S(O)₂R²³、-C(O)N(R^3 ⁵)N(R^3 ³)R³⁴、-C(S)N(R^3 ⁵)N(R^3 ³)R³⁴、及び-C(O)N(R^3 ⁵)N(R^3 ³)S(O)₂R²³からなる群より選択され、又は

R^3 と R^3 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたシクロアルケニル環、随意に置換されたシクロアルキニル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、随意に置換されたヘテロアリール環、又は随意に置換されたアリール(但し、置換又は非置換のフェニル、置換又は非置換のナフチルを除く)を形成し、

R^3 ²、 R^3 ³、 R^3 ⁴、 R^3 ⁵、及び R^3 ⁶は下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^3 ²、 R^3 ³、 R^3 ⁴、 R^3 ⁵、及び R^3 ⁶は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) R^3 ³と R^3 ⁴は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^3 ²、 R^3 ³、 R^3 ⁴、 R^3 ⁵、及び R^3 ⁶の他のものは前記(a)のように選択され、

R^1 と R^2 は、それぞれ独立して、ハロ、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-OR¹⁴、-SR¹⁴、-N(R^1 ⁵)R¹⁶、-N(R^1 ⁵)S(O)₂R²³、-N(R^1 ⁷)N(R^1 ⁵)R¹⁶、-N(R^1 ⁷)N(R^1 ⁵)S(O)₂R²³、-C(O)R¹⁸、-C(O)OR¹⁴、-C(S)OR¹⁴、-C(O)SR¹⁴、-C(O)N(

$R^{1-5})R^{1-6}$ 、 $-C(O)N(R^{1-5})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-C(O)N(R^{1-5})N$
 $=R^{1-6}$ 、 $-C(O)N(R^{1-7})N(R^{1-5})R^{1-6}$ 、及び $-C(O)N(R^{1-7})N$
 $(R^{1-5})S(O)_2R^{2-3}$ からなる群より選択され、

R^3 は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアラルキル、 $-C(O)R^{1-0}$ 、 $-C(O)OR^{1-0}$ 、
 $-S(O)_2R^{1-0}$ 、 $-C(O)N(R^{1-1})R^{1-2}$ 、 $-C(O)N(R^{1-1})S(O)$
 $_2R^{2-3}$ 、 $-C(O)N(R^{1-3})N(R^{1-1})R^{1-2}$ 、 $-C(O)N(R^{1-3})N(R$
 $^{1-1})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-N(R^{1-3})C(O)R^{1-0}$ 、 $-N(R^{1-3})C(O)N$
 $(R^{1-1})R^{1-2}$ 、 $-N(R^{1-3})C(O)N(R^{1-1})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-N(R^{1-0})$
 $C(O)N(R^{1-3})N(R^{1-1})R^{1-2}$ 、 $-N(R^{1-0})C(O)N(R^{1-3})N$
 $(R^{1-1})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-N(R^{1-3})C(O)OR^{1-0}$ 、 $-P(O)OR^{1-0}$ 、又
 $は-P(O)(OR^{1-9})OR^{1-2}$ であり、

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ独立して、水素、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、 $-OR^{1-4}$ 、 $-SR^{1-4}$ 、 $-S(O)_2R^{1-4}$ 、 $-N(R^{1-5})R^{1-6}$ 、 $-N$
 $(R^{1-5})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-N(R^{1-5})C(O)R^{2-3}$ 、 $-C(O)R^{1-8}$ 、 $-C(O)OR^{2-0}$ 、 $-C(O)N(R^{2-1})R^{2-2}$ 、 $-C(O)N(R^{2-1})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-C(O)N(R^{2-4})N(R^{2-1})R^{2-2}$ 、及び $-C(O)N(R^{2-4})N(R^{2-1})S(O)_2R^{2-3}$ からなる群より選択され、又は

R^6 と R^7 は、一緒に、オキソ、チオキソ、随意に置換されたイミノ、随意に置換されたオキシム、又は随意に置換されたヒドロゾンを形成し、あるいは、 R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換された環外二重結合を形成し、 R^4 と R^5 は前記の通りであり、

R^4 と R^5 は、一緒に、オキソ、チオキソ、随意に置換されたイミノ、随意に置換されたオキシム、又は随意に置換されたヒドロゾンを形成し、あるいは、 R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換された環外二重結合を形成し、 R^6 と R^7 は前記の通りであり、

R^4 と R^5 、又は R^4 と R^6 、又は R^4 と R^7 、又は R^5 と R^6 、又は R^5 と R^7 、又は R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、又は一緒に二重結合を形成し、 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 のうちのそれ以外は、前記の通りであり、あるいは、 R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、及び R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、

R^9 は、水素、随意に置換されたアルキル、 $-C(O)R^{1-8}$ 、 $-C(O)OR^{2-0}$ 、又は $-S(O)_2R^{2-3}$ であり、

R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキル、

(b) R^{1-1} と R^{1-2} 又は R^{1-2} と R^{1-9} は、それらが結合する原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通

りであり、

$R^{1\sim 4}$ 、 $R^{1\sim 5}$ 、 $R^{1\sim 6}$ 、 $R^{1\sim 7}$ 、及び $R^{1\sim 8}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され

(a) $R^{1\sim 4}$ 、 $R^{1\sim 5}$ 、 $R^{1\sim 6}$ 、 $R^{1\sim 7}$ 、及び $R^{1\sim 8}$ は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{1\sim 5}$ と $R^{1\sim 6}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{1\sim 4}$ 、 $R^{1\sim 5}$ 、 $R^{1\sim 6}$ 、 $R^{1\sim 7}$ 、及び $R^{1\sim 8}$ のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通りであり、

$R^{2\sim 0}$ 、 $R^{2\sim 1}$ 、 $R^{2\sim 2}$ 、及び $R^{2\sim 4}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され

(a) $R^{2\sim 0}$ 、 $R^{2\sim 1}$ 、 $R^{2\sim 2}$ 、及び $R^{2\sim 4}$ は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{2\sim 1}$ と $R^{2\sim 2}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{2\sim 0}$ 、 $R^{2\sim 1}$ 、 $R^{2\sim 2}$ 、及び $R^{2\sim 4}$ のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通りであり、

$R^{2\sim 3}$ は、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

$R^{1\sim 8}$ と $R^{3\sim 1}$ ～ $R^{3\sim 8}$ の各々は、置換される場合、それぞれ Q^1 から独立して選択される1つ以上の置換基で置換され、

各々の Q^1 は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1～2の二重結合を有するアルケニル、1～2の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR⁷₀、-SR⁷₀、-R⁶₀-C(J)R⁷₁、-R⁶₀-N(R⁷₀)C(J)R⁷₁、-OC(O)R⁷₁、-R⁶₀-N(R⁷₅)(R⁷₆)、-N⁺(R⁷₇)₃、-P(R⁷₈)₂、-P(O)(R⁷₈)₂、-OP(O)(R⁷₈)₂、-N(R⁷₀)S(O)₂R⁷₁、-S(O)₂R⁷₁、-S(O)R⁸₂、-OS(O)R⁸₃、-OS(O)₂R⁸₃、又は-Si(R⁸₃)₃から独立して選択され、

1, 2又は1, 3の位置で原子を置換する2つの Q^1 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、あるいは、

各々の Q^1 は、 Q^2 からそれぞれ独立して選択された1つ以上の置換基で独立して置換され又は置換されず、

各々の Q^2 は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1～2の二重結合を有するアルケニル、1～2の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR⁷₀、-SR⁷₀、-R⁶₀-C

(J) R ⁷ ¹ 、 - R ⁶ ⁰ - N (R ⁷ ⁰) C (J) R ⁷ ¹ 、 - O C (O) R ⁷ ¹ 、 - R ⁶ ⁰ - N (R ⁷ ⁵) (R ⁷ ⁶) 、 - N ⁺ (R ⁷ ⁷) ₃ 、 - P (R ⁷ ⁸) ₂ 、 - P (O) (R ⁷ ⁸) ₂ 、 - O P (O) (R ⁷ ⁸) ₂ 、 - N (R ⁷ ⁰) S (O) ₂ R ⁷ ¹ 、 - S (O) ₂ R ⁷ ¹ 、 - S (O) R ⁸ ² 、 - O S (O) R ⁸ ³ 、 - O S (O) ₂ R ⁸ ³ 、 又は - S i (R ⁸ ³) ₃ から独立して選択され、

1, 2 又は 1, 3 の位置で原子を置換する 2 つの Q ² 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、

各々の J は、独立して、O、S、又は - N R ⁷ ⁰ であり、

各々の R ⁶ ⁰ は、独立して、直接結合又はアルキレンであり、

各々の R ⁷ ⁰ は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、又はヘテロアラルキルであり、

各々の R ⁷ ¹ は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキル、- O R ⁷ ² 、又は - N (R ⁷ ³) R ⁷ ⁴ であり、

R ⁷ ² 、 R ⁷ ³ 、及び R ⁷ ⁴ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

R ⁷ ³ と R ⁷ ⁴ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

R ⁷ ⁵ と R ⁷ ⁶ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、又はヘテロシクリルアルキルであり、あるいは、

R ⁷ ⁵ と R ⁷ ⁶ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

各々の R ⁷ ⁷ は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

R ⁷ ⁸ は、アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール、- O R ⁷ ⁹ 、又は - N (R ⁸ ⁰) R ⁸ ¹ であり、

R ⁷ ⁹ は、水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

R ⁸ ⁰ と R ⁸ ¹ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

R ⁸ ⁰ と R ⁸ ¹ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

R ⁸ ² は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、又は O R ⁸ ³ であり、及び

各々の R ⁸ ³ は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

単一異性体、異性体混合物、又は異性体のラセミ混合物としての、又は溶媒和物もしくは多形体としての、又はプロドラッグとしての、又はそれらの薬学的に受容可能な塩としての化合物。

【請求項 2】

R ¹ が、 - C (O) R ¹ ⁸ 、 - C (O) O R ¹ ⁴ 、 - C (S) O R ¹ ⁴ 、 - C (O) S R ¹ ⁴ 、 - C (O) N (R ¹ ⁵) R ¹ ⁶ 、 - C (O) N (R ¹ ⁵) S (O) ₂ R ² ³ 、 - C (O) N (R ¹ ⁵) N = R ¹ ⁶ 、 - C (O) N (R ¹ ⁷) N (R ¹ ⁵) R ¹ ⁶ 、 又は - C (O) N (R ¹ ⁷) N (R ¹ ⁵) S (O) ₂ R ² ³ であり、

R ¹ ⁴ 、 R ¹ ⁵ 、 R ¹ ⁶ 、 R ¹ ⁷ 、及び R ² ³ が請求項 1 に記載のものである、請求項

1に記載の化合物。

【請求項3】

R^3 が、 $-C(O)R^{1\ 0}$ 、 $-C(O)OR^{1\ 0}$ 、 $-S(O)_2R^{1\ 0}$ 、又は $-C(O)N(R^{1\ 1})R^{1\ 2}$ であり、かつ $R^{1\ 0}$ 、 $R^{1\ 1}$ 、及び $R^{1\ 2}$ が請求項1に記載のものである請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^2 が、水素、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、又は随意に置換されたアルキニルである請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 が、下記の a)、b)、c)、d)、e)、f)、g)、h)、及びi) から選択される請求項4に記載の化合物：

a) R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、 R^6 と R^7 は、随意に置換されたアルキルである；

b) R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、 R^4 と R^5 は、随意に置換されたアルキルである；

c) R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ随意に置換されたアルキルである；

d) R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成する；

e) R^4 と R^5 は、随意に置換されたアルキルであり、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成する；

f) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロである；

g) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、随意に置換されたアルキルである；

h) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル環又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル環又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成する；

i) R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロである。

【請求項6】

Y は、 $CR^{3\ 0}$ であり、かつ

$R^{3\ 0}$ は、ハロ、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたシクロアルキルアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルアルキル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、 $-OR^{3\ 2}$ 、 $-SR^{3\ 2}$ 、 $-N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-N(R^{3\ 3})S(O)_2R^{2\ 3}$ 、 $-N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})S(O)_2R^{2\ 3}$ 、 $-C(O)R^{3\ 6}$ 、 $-C(O)OR^{3\ 2}$ 、 $-C(S)OR^{3\ 2}$ 、 $-C(O)SR^{3\ 2}$ 、 $-C(O)N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(S)N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(O)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(S)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、又は $-C(O)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})S(O)_2R^{2\ 3}$ であり、

ここで、 $R^{2\ 3}$ は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテ

ロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ、

$R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3\ 3}$ と $R^{3\ 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 は、-C(O)OR¹⁻⁴、-C(S)OR¹⁻⁴、-C(O)SR¹⁻⁴、-C(O)N(R¹⁻⁵)R¹⁻⁶、-C(O)N(R¹⁻⁵)S(O)₂R²⁻³、-C(O)N(R¹⁻⁵)N(R¹⁻⁶)、-C(O)N(R¹⁻⁷)N(R¹⁻⁵)R¹⁻⁶、及び-C(O)N(R¹⁻⁷)N(R¹⁻⁵)S(O)₂R²⁻³であり、

R^2 は、水素、ハロ、又は隨意に置換されたアルキルであり、

R^3 は、-C(O)R¹⁻⁰であり、

R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、又は

R^4 と R^5 は、それぞれ、隨意に置換されたアルキルであり、

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、又は

R^6 と R^7 は、それぞれ、隨意に置換されたアルキルであり、又は

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、隨意に置換されたシクロアルキル環又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、

R^9 は、水素、隨意に置換されたアルキル、-C(O)R¹⁻⁸、又は-S(O)₂R²⁻³であり、

R^{1-0} は、隨意に置換されたアリール又は隨意に置換されたヘテロアリールであり、

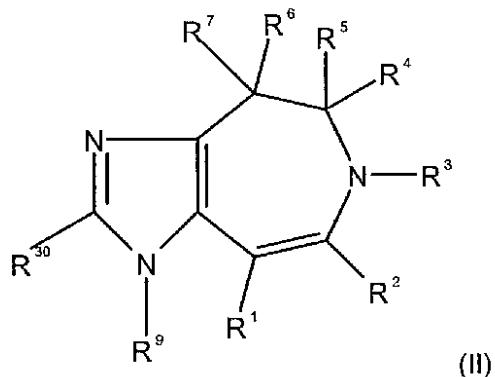
R^{1-4} 、 R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} 、及び R^{1-8} は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

R^{2-3} は、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ

R^{3-0} は、ハロ、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたシクロアルキルアルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロシクリルアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたヘテロアラルキル、-OR³⁻²、-SR³⁻²、-N(R³⁻³)R³⁻⁴、-N(R³⁻³)S(O)₂R²⁻³、-N(R³⁻⁵)N(R³⁻³)R³⁻⁴、-N(R³⁻⁵)N(R³⁻³)S(O)₂R²⁻³、-C(O)R³⁻⁶、-C(O)OR³⁻²、-C(S)OR³⁻²、-C(O)SR³⁻²、-C(O)N(R³⁻³)R³⁻⁴、-C(S)N(R³⁻³)R³⁻⁴、-C(O)N(R³⁻⁵)S(O)₂R²⁻³、-C(O)N(R³⁻⁵)N(R³⁻³)R³⁻⁴、-C(S)N(R³⁻⁵)N(R³⁻³)R³⁻⁴、又は-C(O)N(R³⁻⁵)N(R³⁻³)S(O)₂R²⁻³である。

式(I)を有する請求項6に記載の化合物、又はその薬学的に受容可能な誘導体。

【化2】



【請求項8】

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ R^{30} は、水素、ハロ、 $-C(O)R^{36}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(S)N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(O)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$ 、 $-C(S)N(R^{33})S(O)_2R^{23}$ 、 $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ 、及び $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$ からなる群より選択され、

ここで、 R^{23} は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ

R^{32} 、 R^{33} 、 R^{34} 、 R^{35} 、及び R^{36} は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^{32} 、 R^{33} 、 R^{34} 、 R^{35} 、及び R^{36} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) R^{33} と R^{34} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{32} 、 R^{33} 、 R^{34} 、 R^{35} 、及び R^{36} の他のものは前記(a)のように選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

前記化合物が、6-(4-フルオロ-ベンゾイル)-3,6,7,8-テトラヒドロ-イミダゾ[4,5-d]アゼピン-4-カルボン酸エチルエステルである請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ

R^6 と R^7 は、随意に置換されたアルキルであり、又は

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル環を形成した、請求項7に記載の化合物。

【請求項11】

R^2 が、水素、ハロ、又は随意に置換されたアルキルであり、かつ、 R^9 が水素である請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

R^{30} は、 $-C(O)R^{36}$ 、 $-C(O)OR^{32}$ 、 $-C(S)OR^{32}$ 、 $-C(O)SR^{32}$ 、 $-C(O)N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(S)N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(S)N(R^{35})N(R^{33})R^{34}$ 、 $-C(O)N(R^{35})N(R^{33})S(O)_2R^{23}$ からなる群より選択され、

$N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-C(S)N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-C(O)$
 $N(R^{3,5})N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-C(S)N(R^{3,5})N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、及び
 $-C(O)N(R^{3,5})N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ からなる群より「選択され、

$R^{2,3}$ は、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ

$R^{3,2}$ 、 $R^{3,3}$ 、 $R^{3,4}$ 、 $R^{3,5}$ 、及び $R^{3,6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3,2}$ 、 $R^{3,3}$ 、 $R^{3,4}$ 、 $R^{3,5}$ 、及び $R^{3,6}$ は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3,3}$ と $R^{3,4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3,2}$ 、 $R^{3,3}$ 、 $R^{3,4}$ 、 $R^{3,5}$ 、及び $R^{3,6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

R^1 は、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)OCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-C(O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NH$ (シクロブロピル)、 $-C(O)NH$ (シクロペンチル)、 $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、又は $-C(O)N(CH_3)$ (シクロプロピル)である請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

Z は、 $CR^{3,1}$ であり、かつ

$R^{3,1}$ は、八口、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたシクロアルキルアルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロシクリルアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたヘテロアラルキル、 $-OR^{3,2}$ 、 $-SR^{3,2}$ 、 $-N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-N(R^{3,5})N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-N(R^{3,5})N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-C(O)R^{3,6}$ 、 $-C(O)OR^{3,2}$ 、 $-C(S)OR^{3,2}$ 、 $-C(O)SR^{3,2}$ 、 $-C(O)N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-C(S)N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-C(O)N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-C(S)N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ 、 $-C(O)N(R^{3,5})N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、 $-C(S)N(R^{3,5})N(R^{3,3})R^{3,4}$ 、及び $-C(O)N(R^{3,5})N(R^{3,3})S(O)_2R^{2,3}$ からなる群より独立して選択され、

ここで、 $R^{2,3}$ は、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ、

$R^{3,2}$ 、 $R^{3,3}$ 、 $R^{3,4}$ 、 $R^{3,5}$ 、及び $R^{3,6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3,2}$ 、 $R^{3,3}$ 、 $R^{3,4}$ 、 $R^{3,5}$ 、及び $R^{3,6}$ は、それぞれ独立して、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3\ 3}$ と $R^{3\ 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項15】

Z は、 $CR^{3\ 1}$ であり、かつ

$R^{3\ 1}$ は、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアラルキル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、-C(O)R^{3 6}、-C(O)OR^{3 2}、-C(S)OR^{3 2}、-C(O)SR^{3 2}、-C(O)N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(S)N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(O)N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}、-C(S)N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}、-C(O)N(R^{3 5})N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(S)N(R^{3 5})N(R^{3 3})R^{3 4}、及び-C(O)N(R^{3 5})N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}からなる群より独立して選択され、

ここで、 $R^{2\ 3}$ は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ、

$R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3\ 3}$ と $R^{3\ 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

X がO又はS(O)_t(tは0~2)である請求項14に記載の化合物。

【請求項17】

$R^{4\ 0}$ 、 $R^{5\ 0}$ 、 $R^{6\ 0}$ 、及び $R^{7\ 0}$ は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ
 $R^{3\ 0}$ は、水素、ハロ、-C(O)R^{3 6}、-C(O)OR^{3 2}、-C(S)OR^{3 2}、-C(O)SR^{3 2}、-C(O)N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(S)N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(O)N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}、-C(S)N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}、-C(O)N(R^{3 5})N(R^{3 3})R^{3 4}、-C(S)N(R^{3 5})N(R^{3 3})R^{3 4}、及び-C(O)N(R^{3 5})N(R^{3 3})S(O)₂R^{2 3}からなる群より選択され、

ここで、 $R^{2\ 3}$ は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ

$R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3\ 3}$ と $R^{3\ 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

前記化合物が、6-(3,4-ジフルオロ-ベンゾイル)-5,6-ジヒドロ-4H-チエノ[2,3-d]アゼピン-8-カルボン酸エチルエステルである請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ

R^6 と R^7 は、随意に置換されたアルキルであり、又は

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素と一緒に、独立して、随意に置換されたシクロアルキル環を形成した、請求項16に記載の化合物。

【請求項20】

R^2 が、水素、ハロ、又は随意に置換されたアルキルであり、かつ、 R^9 が水素である請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

$R^{3\ 0}$ は、 $-C(O)R^{3\ 6}$ 、 $-C(O)OR^{3\ 2}$ 、 $-C(S)OR^{3\ 2}$ 、 $-C(O)SR^{3\ 2}$ 、 $-C(O)N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(S)N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(O)N(R^{3\ 3})S(O)R^{2\ 3}$ 、 $-C(S)N(R^{3\ 3})S(O)R^{2\ 3}$ 、 $-C(O)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、 $-C(S)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})R^{3\ 4}$ 、及び $-C(O)N(R^{3\ 5})N(R^{3\ 3})S(O)R^{2\ 3}$ から選択され、

$R^{2\ 3}$ は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、かつ

$R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3\ 3}$ と $R^{3\ 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ 、及び $R^{3\ 6}$ の他のものは前記(a)のように選択される、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

R^1 は、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)OCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-C(O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NH$ (シクロプロピル)、 $-C(O)NH$ (シクロペンチル)、 $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、又は $-C(O)N(CH_3)$ (シクロプロピル)であり、かつ

R^3 は、 $-C(O)R^{1\ 0}$ であり、 $R^{1\ 0}$ は、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたアルキル、又は随意に置換されたアラルキルである、請求項21に記載の化合物。

【請求項23】

前記化合物が、6-(3,4-ジフルオロ-ベンゾイル)-4,4-ジメチル-5,6-ジヒドロ-4H-チエノ[2,3-d]アゼピン-8-カルボン酸エチルエステルである請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

X は、 $N R^9$ であり、

R^9 は、 水素、 隨意に置換されたアルキル、 $-C(O)R^{1-8}$ 、 又は $-S(O)_2R^2$
 R^3 であり、 R^{1-8} と R^{2-3} は、 それぞれ独立して、 隨意に置換されたアルキル、 隨意に置換されたアルケニル、 隨意に置換されたアルキニル、 隨意に置換されたシクロアルキル、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたアラルキル、 隨意に置換されたヘテロシクリル、 隨意に置換されたヘテロアリール、 又は隨意に置換されたヘテロアラルキルである、 請求項 1 4 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^4 と R^5 は、 それぞれ独立して、 水素又はハロであり、 かつ

R^6 と R^7 は、 隨意に置換されたアルキルであり、 又は

R^6 と R^7 は、 それらが結合する炭素と一緒に、 独立して、 隨意に置換されたシクロアルキル環を形成した、 請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^2 が、 水素、 ハロ、 又は隨意に置換されたアルキルであり、 かつ、 R^9 が水素である
 請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

請求項 2 6 に記載の化合物であって、

R^{3-0} は、 $-C(O)R^{3-6}$ 、 $-C(O)OR^{3-2}$ 、 $-C(S)OR^{3-2}$ 、 $-C(O)$
 SR^{3-2} 、 $-C(O)N(R^{3-3})R^{3-4}$ 、 $-C(S)N(R^{3-3})R^{3-4}$ 、 $-C(O)$
 $N(R^{3-3})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-C(S)N(R^{3-3})S(O)_2R^{2-3}$ 、 $-C(O)$
 $N(R^{3-5})N(R^{3-3})R^{3-4}$ 、 $-C(S)N(R^{3-5})N(R^{3-3})R^{3-4}$ 、 及び
 $-C(O)N(R^{3-5})N(R^{3-3})S(O)_2R^{2-3}$ からなる群より選択され、

R^{2-3} は、 隨意に置換されたアルキル、 隨意に置換されたアルケニル、 隨意に置換されたアルキニル、 隨意に置換されたシクロアルキル、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたアラルキル、 隨意に置換されたヘテロシクリル、 隨意に置換されたヘテロアリール、 又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、 かつ

R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 、 R^{3-5} 、 及び R^{3-6} は、 下記の (a) 又は (b) のように選択され、

(a) R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 、 R^{3-5} 、 及び R^{3-6} は、 それぞれ独立して、 水素、 隨意に置換されたアルキル、 隨意に置換されたアルケニル、 隨意に置換されたアルキニル、 隨意に置換されたシクロアルキル、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたアラルキル、 隨意に置換されたヘテロシクリル、 隨意に置換されたヘテロアリール、 又は隨意に置換されたヘテロアラルキルである；

(b) R^{3-3} と R^{3-4} は、 それらが結合する窒素原子と一緒に、 隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{3-2} 、 R^{3-3} 、 R^{3-4} 、 R^{3-5} 、 及び R^{3-6} の他のものは前記 (a) のように選択される、 化合物。

【請求項 2 8】

R^1 は、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)OCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-C(O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NH$ (シクロプロピル)、 $-C(O)NH$ (シクロペンチル)、 $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、 又は $-C(O)N(CH_3)$ (シクロプロピル) であり、 かつ

R^3 は、 $-C(O)R^{1-0}$ であり、 R^{1-0} は、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたヘテロアリール、 隨意に置換されたアルキル、 又は隨意に置換されたアラルキルである、 請求項 2 7 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

前記化合物が、 6 - (3, 4 - ジフルオロ - ベンゾイル) - 4, 4 - ジメチル - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピロロ [2, 3 - d] アゼピン - 2, 8 - ジカルボン酸ジエチルエステル、 及び 6 - (3, 4 - ジフルオロ - ベンゾイル) - 4, 4 - ジメチル - 1, 4

, 5 , 6 - テトラヒドロ - ピロロ [2 , 3 - d] アゼピン - 2 , 8 - ジカルボン酸 2 - エチルエステル 8 - イソプロピルエステルからなる群より選択された請求項 2 8 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R^4 、 R^5 、 R^6 、 及び R^7 は、 それぞれ独立して、 水素又はハロであり、 かつ
 $R^3 0$ は、 水素、 ハロ、 - C (O) $R^{3 6}$ 、 - C (O) OR $R^{3 2}$ 、 - C (S) OR $R^{3 2}$
、 - C (O) SR $R^{3 2}$ 、 - C (O) N (R $3 3$) R $3 4$ 、 - C (S) N (R $3 3$) R $3 4$
、 - C (O) N (R $3 3$) S (O) $R^{2 3}$ 、 - C (S) N (R $3 3$) S (O) $R^{2 3}$
、 - C (O) N (R $3 5$) N (R $3 3$) R $3 4$ 、 - C (S) N (R $3 5$) N (R $3 3$) R
 $3 4$ 、 及び - C (O) N (R $3 5$) N (R $3 3$) S (O) $R^{2 3}$ からなる群より選択され、

$R^{2 3}$ は、 隨意に置換されたアルキル、 隨意に置換されたアルケニル、 隨意に置換されたアルキニル、 隨意に置換されたシクロアルキル、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたアラルキル、 隨意に置換されたヘテロシクリル、 隨意に置換されたヘテロアリール、 又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、 かつ

$R^{3 2}$ 、 $R^{3 3}$ 、 $R^{3 4}$ 、 $R^{3 5}$ 、 及び $R^{3 6}$ は、 下記の (a) 又は (b) のように選択され、

(a) $R^{3 2}$ 、 $R^{3 3}$ 、 $R^{3 4}$ 、 $R^{3 5}$ 、 及び $R^{3 6}$ は、 それぞれ独立して、 水素、 隨意に置換されたアルキル、 隨意に置換されたアルケニル、 隨意に置換されたアルキニル、 隨意に置換されたシクロアルキル、 隨意に置換されたアリール、 隨意に置換されたアラルキル、 隨意に置換されたヘテロシクリル、 隨意に置換されたヘテロアリール、 又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) $R^{3 3}$ と $R^{3 4}$ は、 それらが結合する窒素原子と一緒に、 隨意に置換されたヘテロシクリル環又は隨意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 $R^{3 2}$ 、 $R^{3 3}$ 、 $R^{3 4}$ 、 $R^{3 5}$ 、 及び $R^{3 6}$ の他のものは前記 (a) のように選択される、 請求項 2 9 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

前記化合物が、 6 - (3 , 4 - ジフルオロ - ベンゾイル) - 1 , 4 , 4 - トリメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピロロ [2 , 3 - d] アゼピン - 2 , 8 - ジカルボン酸 2 - エチルエステル 8 - イソプロピルエステルである請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

Y は、 $CR^{3 0}$ であり、

Z は、 $CR^{3 1}$ であり、 かつ

$R^{3 0}$ と $R^{3 1}$ は、 それらが結合する炭素原子と一緒に、 隨意に置換されたシクロアルキル環、 隨意に置換されたシクロアルケニル環、 隨意に置換されたシクロアルキニル環、 隨意に置換されたヘテロシクリル環、 隨意に置換されたヘテロアリール環、 又は隨意に置換されたアリール環を形成した (但し、 置換又は非置換のフェニル、 置換又は非置換のナフチルを除く) 、 請求項 5 に記載の化合物。

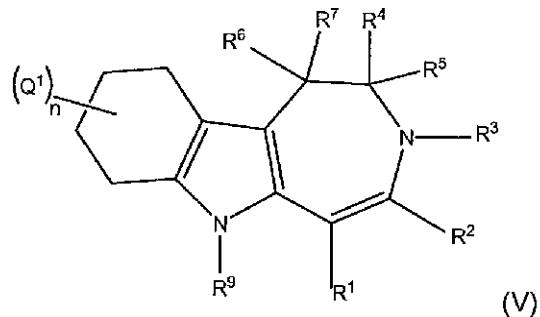
【請求項 3 3】

前記隨意に置換されたシクロアルキル環が、 隨意に置換されたシクロペンチル、 隨意に置換されたシクロヘキシル、 隨意に置換されたシクロヘプチル、 又は隨意に置換されたシクロオクチルである請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

式 (V) を有する化合物、 又はその薬学的に受容可能な誘導体であって、

【化3】



nは、0～8であり、

R¹とR²は、それぞれ独立して、ハロ、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-OR¹₄、-SR¹₄、-N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-N(R¹₇)N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₇)N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-C(O)R¹₈、-C(O)OR¹₄、-C(S)OR¹₄、-C(O)SR¹₄、-C(O)N(R¹₅)R¹₆、-C(O)N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R¹₅)N(R¹₆)、-C(O)N(R¹₇)N(R¹₅)R¹₆、及び-C(O)N(R¹₇)N(R¹₅)S(O)₂R²₃からなる群より選択され、

R³は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-C(O)R¹₀、-C(O)OR¹₀、-S(O)₂R¹₀、-C(O)N(R¹₁)R¹₂、-C(O)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R¹₃)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₃)C(O)R¹₀、-N(R¹₃)C(O)N(R¹₁)R¹₂、-N(R¹₃)C(O)N(R¹₃)N(R¹₁)R¹₂、-N(R¹₃)C(O)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₀)C(O)N(R¹₃)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₃)C(O)OR¹₀、-P(O)OR¹₀又は-P(O)(OR¹₉)OR¹₂であり、

R⁴、R⁵、R⁶、及びR⁷は、それぞれ独立して、水素、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-OR¹₄、-SR¹₄、-S(O)₂R¹₄、-N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-N(R¹₅)C(O)R²₃、-C(O)R¹₈、-C(O)OR²₀、-C(O)N(R²₁)R²₂、-C(O)N(R²₁)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R²₄)N(R²₁)R²₂、及び-C(O)N(R²₄)N(R²₁)S(O)₂R²₃からなる群より選択され、又は

R⁴とR⁵、又はR⁴とR⁶、又はR⁴とR⁷、又はR⁵とR⁶、又はR⁵とR⁷、又はR⁶とR⁷は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、又は一緒に二重結合を形成し、R⁴、R⁵、R⁶、及びR⁷のうちのそれ以外は、前記の通りであり、あるいは、R⁶とR⁷は、一緒に、オキソ、チオキソ、随意に置換されたイミノ、随意に置換されたオキシム、又は随意に置換されたヒドロゾンを形成し、あるいは、R⁶とR⁷は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換された環外二重結合

を形成し、R⁴ と R⁵ は前記の通りであり、

R⁹ は、水素、随意に置換されたアルキル、-C(O)R^{1~8}、又は-S(O)₂R²³ であり、

R^{1~0}、R^{1~1}、R^{1~2}、R^{1~3}、及び R^{1~9} は、下記の (a) 又は (b) のように選択され、

(a) R^{1~0}、R^{1~1}、R^{1~2}、R^{1~3}、及び R^{1~9} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキル、

(b) R^{1~1} と R^{1~2} 又は R^{1~2} と R^{1~9} は、それらが結合する原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、R^{1~0}、R^{1~1}、R^{1~2}、R^{1~3}、及び R^{1~9} のうちのそれ以外は、前記 (a) において選択した通りであり、

R^{1~4}、R^{1~5}、R^{1~6}、R^{1~7}、及び R^{1~8} は、下記の (a) 又は (b) のように選択され、

(a) R^{1~4}、R^{1~5}、R^{1~6}、R^{1~7}、及び R^{1~8} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) R^{1~5} と R^{1~6} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、R^{1~4}、R^{1~5}、R^{1~6}、R^{1~7}、及び R^{1~8} のうちのそれ以外は、前記 (a) において選択した通りであり、

R^{2~0}、R^{2~1}、R^{2~2}、及び R^{2~4} は、下記の (a) 又は (b) のように選択され、(a) R^{2~0}、R^{2~1}、R^{2~2}、及び R^{2~4} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b) R^{2~1} と R^{2~2} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、R^{2~0}、R^{2~1}、R^{2~2}、及び R^{2~4} のうちのそれ以外は、前記 (a) において選択した通りであり、

R^{2~3} は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

R^{1~} ~ R^{2~4} の各々は、置換される場合、それぞれ Q¹ から独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換され、

各々の Q¹ は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1~2 の二重結合を有するアルケニル、1~2 の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR^{7~0}、-SR^{7~0}、-R^{6~0}-C(J)R^{7~1}、-R^{6~0}-N(R^{7~0})C(J)R^{7~1}、-OC(O)R^{7~1}、-R^{6~0}-N(R^{7~5})(R^{7~6})、-N⁺(R^{7~7})₃、-P(R^{7~8})₂、-P(O)(R^{7~8})₂、-OP(O)(R^{7~8})₂、-N(R^{7~0})S(O)₂R^{7~1}、-S(O)₂R^{7~1}、-S(O)₂R^{8~2}、-OS(O)R^{8~3}、-OS(O)₂R^{8~3}、又は -Si(R^{7~1})₂

$R^{8,3}$)₃ から独立して選択され、

1, 2 又は 1, 3 の位置で原子を置換する 2 つの Q^1 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、あるいは、

各々の Q^1 は、 Q^2 からそれぞれ独立して選択された 1 つ以上の置換基で独立して置換され又は置換されず、

各々の Q^2 は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1~2 の二重結合を有するアルケニル、1~2 の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR^{7,0}、-SR^{7,0}、-R^{6,0}-C(J)R^{7,1}、-R^{6,0}-N(R^{7,0})C(J)R^{7,1}、-OC(O)R^{7,1}、-R^{6,0}-N(R^{7,5})(R^{7,6})、-N⁺(R^{7,7})₃、-P(R^{7,8})₂、-P(O)(R^{7,8})₂、-OP(O)(R^{7,8})₂、-N(R^{7,0})S(O)₂R^{7,1}、-S(O)₂R^{7,1}、-S(O)R^{8,2}、-OS(O)R^{8,3}、-OS(O)₂R^{8,3}、又は-Si(R^{8,3})₃ から独立して選択され、

1, 2 又は 1, 3 の位置で原子を置換する 2 つの Q^2 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、

各々の J は、独立して、O、S、又は -NR^{7,0} であり、

各々の R^{6,0} は、独立して、直接結合又はアルキレンであり、

各々の R^{7,0} は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、又はヘテロアラルキルであり、

各々の R^{7,1} は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキル、-OR^{7,2}、又は -N(R^{7,3})R^{7,4} であり、

R^{7,2}、R^{7,3}、及び R^{7,4} は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

R^{7,3} と R^{7,4} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

R^{7,5} と R^{7,6} は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、又はヘテロシクリルアルキルであり、あるいは、

R^{7,5} と R^{7,6} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環、又はヘテロアリール環を形成し、

各々の R^{7,7} は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

R^{7,8} は、アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール、-OR^{7,9}、又は -N(R^{8,0})R^{8,1} であり、

R^{7,9} は、水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

R^{8,0} と R^{8,1} は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

R^{8,0} と R^{8,1} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環、又はヘテロアリール環を形成し、

R^{8-2} は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、又は OR^{8-3} であり、及び

各々の R^{8-3} は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルである、化合物、又はその薬学的に受容可能な誘導体。

【請求項 35】

R^3 が、 $-C(O)R^{1-0}$ であり、 R^{1-0} が、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたアルキル、又は隨意に置換されたアラルキルである請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 36】

R^1 が、 $-C(O)R^{1-8}$ 、 $-C(O)OR^{1-4}$ 、又は $-C(O)N(R^{1-5})R^{1-6}$ であり、 R^{1-4} と R^{1-5} が、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたシクロアルキル、又は隨意に置換されたヘテロシクリルであり、 R^{1-6} が水素であり、及び R^{1-8} が隨意に置換されたアルキルである請求項 35 に記載の化合物。

【請求項 37】

R^2 は、ハロ、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたアラルキル、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルである請求項 36 に記載の化合物。

【請求項 38】

R^2 が、水素、ハロ、又は隨意に置換されたアルキルであり、 R^9 が、水素又は隨意に置換されたアルキルである請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 39】

a) R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ R^6 と R^7 は、隨意に置換されたアルキルであり、

b) R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ R^4 と R^5 は、隨意に置換されたアルキルであり、

c) R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ隨意に置換されたアルキルであり、

d) R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、

e) R^4 と R^5 は、隨意に置換されたアルキルであり、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、

f) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、

g) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、隨意に置換されたアルキルであり、

h) R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル環又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、かつ

R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル環又は隨意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、及び

i) R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロである、 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 が、上記の a)、b)、c)、d)、e)、f)、g)、及び h) から選択される請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

R^4 と R^5 は、それぞれ独立して、水素又はハロであり、かつ

R^6 と R^7 は、隨意に置換されたアルキルであり、又は
 R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素と一緒に、独立して、隨意に置換されたシクロアルキル環を形成した、請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

R^2 が、水素、ハロ、又は隨意に置換されたアルキルであり、かつ、 R^9 が水素である請求項 4 0 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

R^1 は、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)OCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OCH_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH_3$ 、 $-C(O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(O)NHC(H_3)_2$ 、 $-C(O)NH$ (シクロプロピル)、 $-C(O)NH$ (シクロペンチル)、 $-C(O)NCH(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、又は $-C(O)N(CH_3)$ (シクロプロピル)であり、かつ

R^3 は、 $-C(O)R^{10}$ であり、 R^{10} は、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたアルキル、又は隨意に置換されたアラルキルである、請求項 4 1 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

前記化合物が、3-(4-フルオロ-ベンゾイル)-1,1-ジメチル-1,2,3,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-アゼピノ[4,5-b]インドール-5-カルボン酸エチルエステルである請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 は、それぞれ独立して、水素又はハロである請求項 3 9 に記載の化合物。

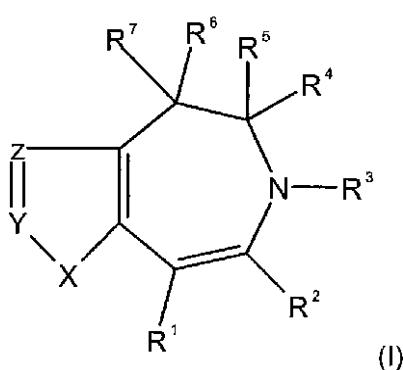
【請求項 4 5】

前記化合物が、3-(4-フルオロ-ベンゾイル)-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10-デカヒドロ-アゼピノ[4,5-b]インドール-5-カルボン酸エチルエステル、又は3-(4-フルオロ-ベンゾイル)-1,2,3,6,7,8,9,10-オクタヒドロ-アゼピノ[4,5-b]インドール-5-カルボン酸エチルエステルである請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

式(I)を有する化合物を含む薬学的組成物であつて、

【化 4】



X は、 NR^9 、 O 、又は $S(O)_t$ (t は 0 ~ 2)、

Y は、 CR^{30} 又は N 、

Z は、 CR^{31} 又は N 、

R^{30} と R^{31} は、それぞれ独立して、ハロ、水素、隨意に置換されたアルキル、隨意に置換されたアルケニル、隨意に置換されたアルキニル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、隨意に置換されたシクロアルキル、隨意に置換されたシクロアルキルアルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロシク

リルアルキル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-O R³₂、-S R³₂、-N(R³₃)R³₄、-N(R³₃)S(O)₂R²₃、-N(R³₅)N(R³₃)R³₄、-N(R³₅)N(R³₃)S(O)₂R²₃、-C(O)R³₆、-C(O)OR³₂、-C(S)OR³₂、-C(O)SR³₂、-C(O)N(R³₃)R³₄、-C(S)N(R³₃)R³₄、-C(O)N(R³₃)S(O)R²₃、-C(S)N(R³₃)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R³₅)N(R³₄)R³₄、-C(S)N(R³₅)N(R³₃)R³₄、及び-C(O)N(R³₅)N(R³₃)S(O)R²₃からなる群より選択され、又は

R³₀とR³₁は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたシクロアルケニル環、随意に置換されたシクロアルキニル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、随意に置換されたヘテロアリール環、又は随意に置換されたアリール（但し、置換又は非置換のフェニル、置換又は非置換のナフチルを除く）を形成し、

R³₂、R³₃、R³₄、R³₅、及びR³₆は(a)又は(b)のように選択され、(a)R³₂、R³₃、R³₄、R³₅、及びR³₆は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、

(b)R³₃とR³₄は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、R³₂、R³₃、R³₄、R³₅、及びR³₆の他のものは前記(a)のように選択され、

R¹とR²は、それぞれ独立して、ハロ、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-OR¹₄、-SR¹₄、-N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-N(R¹₇)N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₇)N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-C(O)R¹₈、-C(O)OR¹₄、-C(S)OR¹₄、-C(O)SR¹₄、-C(O)N(R¹₅)R¹₆、-C(O)N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R¹₅)N(R¹₆)、-C(O)N(R¹₇)N(R¹₅)R¹₆、及び-C(O)N(R¹₇)N(R¹₅)S(O)₂R²₃からなる群より選択され、

R³は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-C(O)R¹₀、-C(O)OR¹₀、-S(O)₂R¹₀、-C(O)N(R¹₁)R¹₂、-C(O)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-C(O)N(R¹₃)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₃)C(O)R¹₀、-N(R¹₃)C(O)N(R¹₁)R¹₂、-N(R¹₃)C(O)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₀)C(O)N(R¹₃)N(R¹₁)S(O)₂R²₃、-N(R¹₃)C(O)OR¹₀、-P(O)OR¹₀、又は-P(O)(OR¹₉)OR¹₂であり、

R⁴、R⁵、R⁶、及びR⁷は、それぞれ独立して、水素、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロアラルキル、-OR¹₄、-SR¹₄、-S(O)₂R¹₄、-N(R¹₅)R¹₆、-N(R¹₅)S(O)₂R²₃、-N(R¹₅)C(O)R²₃、-C(O)R¹₈、-C(O)OR²₀、-C(O)N(R²₁)R²₂、-C(O)N(R²₁)S(O)₂R²₂

R^3 、 $-C(O)N(R^{2-4})N(R^{2-1})R^{2-2}$ 、及び $-C(O)N(R^{2-4})N(R^{2-1})S(O)_2R^{2-3}$ からなる群より選択され、又は

R^6 と R^7 は、一緒に、オキソ、チオキソ、随意に置換されたイミノ、随意に置換されたオキシム、又は随意に置換されたヒドロゾンを形成し、あるいは、 R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換された環外二重結合を形成し、 R^4 と R^5 は前記の通りであり、

R^4 と R^5 は、一緒に、オキソ、チオキソ、随意に置換されたイミノ、随意に置換されたオキシム、又は随意に置換されたヒドロゾンを形成し、あるいは、 R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換された環外二重結合を形成し、 R^6 と R^7 は前記の通りであり、

R^4 と R^5 、又は R^4 と R^6 、又は R^4 と R^7 、又は R^5 と R^6 、又は R^5 と R^7 、又は R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、又は一緒に二重結合を形成し、 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 のうちのそれ以外は、前記の通りであり、あるいは、 R^4 と R^5 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、及び R^6 と R^7 は、それらが結合する炭素原子と一緒に、随意に置換されたシクロアルキル環、随意に置換されたヘテロシクリル環、又は随意に置換されたシクロアルケニル環を形成し、

R^9 は、水素、随意に置換されたアルキル、 $-C(O)R^{1-8}$ 、 $-C(O)OR^{2-0}$ 、又は $-S(O)_2R^{2-3}$ であり、

R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキル、又は(b) R^{1-1} と R^{1-2} 又は R^{1-2} と R^{1-9} は、それらが結合する原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{1-0} 、 R^{1-1} 、 R^{1-2} 、 R^{1-3} 、及び R^{1-9} のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通りであり、

R^{1-4} 、 R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} 、及び R^{1-8} は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^{1-4} 、 R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} 、及び R^{1-8} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、あるいは、(b) R^{1-5} と R^{1-6} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{1-4} 、 R^{1-5} 、 R^{1-6} 、 R^{1-7} 、及び R^{1-8} のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通りであり、

R^{2-0} 、 R^{2-1} 、 R^{2-2} 、及び R^{2-4} は、下記の(a)又は(b)のように選択され、

(a) R^{2-0} 、 R^{2-1} 、 R^{2-2} 、及び R^{2-4} は、それぞれ独立して、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール又は随意に置換されたヘテロアラルキルであり、あるいは、(b) R^{2-1} と R^{2-2} は、それらが結合する窒素原子と一緒に、随意に置換されたヘテロシクリル環又は随意に置換されたヘテロアリール環を形成し、 R^{2-0} 、 R^{2-1} 、 R^{2-2} 、及び R^{2-4} のうちのそれ以外は、前記(a)において選択した通りであり、

R^{2-3} は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたシクロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置

換されたアラルキル、隨意に置換されたヘテロシクリル、隨意に置換されたヘテロアリール、又は隨意に置換されたヘテロアラルキルであり、

$R^1 \sim R^{2 \sim 4}$ と $R^{3 \sim 1} \sim R^{3 \sim 8}$ の各々は、置換される場合、それぞれ Q^1 から独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換され、

各々の Q^1 は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1 ~ 2 の二重結合を有するアルケニル、1 ~ 2 の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR^{7 0}、-SR^{7 0}、-R^{6 0}-C(J)R^{7 1}、-R^{6 0}-N(R^{7 0})C(J)R^{7 1}、-OC(O)R^{7 1}、-R^{6 0}-N(R^{7 5})(R^{7 6})、-N⁺(R^{7 7})₃、-P(R^{7 8})₂、-P(O)(R^{7 8})₂、-OP(O)(R^{7 8})₂、-N(R^{7 0})S(O)₂R^{7 1}、-S(O)₂R^{7 1}、-S(O)R^{8 2}、-OS(O)R^{8 3}、-OS(O)₂R^{8 3}、又は-Si(R^{8 3})₃ から独立して選択され、

1, 2 又は 1, 3 の位置で原子を置換する 2 つの Q^1 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、あるいは、

各々の Q^1 は、 Q^2 からそれぞれ独立して選択された 1 つ以上の置換基で独立して置換され又は置換されず、

各々の Q^2 は、ハロ、擬ハロ、オキソ、チオキソ、シアノ、チオシアノ、イソシアノ、ニトロ、アジド、アルキル、ハロアルキル、1 ~ 2 の二重結合を有するアルケニル、1 ~ 2 の三重結合を有するアルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、アラルケニル、アラルキニル、ヘテロアリールアルキル、アルキリデン、アリールアルキリデン、アリールオキシアリールカルボニルアミノ、ヒドロキシカルボニルアルキルチオ、ハロスルホニル、-OR^{7 0}、-SR^{7 0}、-R^{6 0}-C(J)R^{7 1}、-R^{6 0}-N(R^{7 0})C(J)R^{7 1}、-OC(O)R^{7 1}、-R^{6 0}-N(R^{7 5})(R^{7 6})、-N⁺(R^{7 7})₃、-P(R^{7 8})₂、-P(O)(R^{7 8})₂、-OP(O)(R^{7 8})₂、-N(R^{7 0})S(O)₂R^{7 1}、-S(O)₂R^{7 1}、-S(O)R^{8 2}、-OS(O)R^{8 3}、-OS(O)₂R^{8 3}、又は-Si(R^{8 3})₃ から独立して選択され、

1, 2 又は 1, 3 の位置で原子を置換する 2 つの Q^2 基は、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロアルキル環、シクロアルケニル環、シクロアルキニル環、又はヘテロシクリル環を形成し、

各々の J は、独立して、O、S、又は-NR^{7 0} であり、

各々の $R^{6 0}$ は、独立して、直接結合又はアルキレンであり、

各々の $R^{7 0}$ は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、又はヘテロアラルキルであり、

各々の $R^{7 1}$ は、独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキル、-OR^{7 2}、又は-N(R^{7 3})R^{7 4} であり、

$R^{7 2}$ 、 $R^{7 3}$ 、及び $R^{7 4}$ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

$R^{7 3}$ と $R^{7 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

$R^{7 5}$ と $R^{7 6}$ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ア

リール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリル、又はヘテロシクリルアルキルであり、あるいは、

$R^{7\ 5}$ と $R^{7\ 6}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

各々の $R^{7\ 7}$ は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

$R^{7\ 8}$ は、アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール、-OR^{7 9}、又は-N(R^{8 0})R^{8 1} であり、

$R^{7\ 9}$ は、水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

$R^{8\ 0}$ と $R^{8\ 1}$ は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、あるいは、

$R^{8\ 0}$ と $R^{8\ 1}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロシクリル環又はヘテロアリール環を形成し、

$R^{8\ 2}$ は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、又はOR^{8 3} であり、及び

各々の $R^{8\ 3}$ は、独立して、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、

前記化合物は、单一異性体、異性体混合物、又は異性体のラセミ混合物としての、又は溶媒和物もしくは多形体としての、又はプロドラッグとしての、又はそれらの薬学的に受容可能な塩としての化合物である、薬学的組成物。

【請求項 4 7】

ファルネソイドX受容体活性が関与する疾患又は障害の1つ以上の症状を治療、予防、又は改善するための組成物であって、請求項1～46に記載のいずれか1項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 4 8】

前記疾患又は障害が、高脂質血症、高コレステロール血症、トリグリセリド過剰血、異常脂質血症、リポジストロフィー、アステローム性動脈硬化症、アステローム性動脈硬化性疾患、アステローム性動脈硬化発症、アステローム性心循環器疾患、シンドロームX、真性糖尿病、II型糖尿病、インスリン不感症、高血糖症、胆汁鬱滞、及び肥満から選択される請求項47に記載の組成物。

【請求項 4 9】

ファルネソイドX受容体活性が関与する疾患又は障害の1つ以上の症状を治療、予防、又は改善するための医薬の製造における、請求項1～46に記載のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項 5 0】

前記疾患又は障害が、高脂質血症、高コレステロール血症、トリグリセリド過剰血、異常脂質血症、リポジストロフィー、アステローム性動脈硬化症、アステローム性動脈硬化性疾患、アステローム性動脈硬化発症、アステローム性心循環器疾患、シンドロームX、真性糖尿病、II型糖尿病、インスリン不感症、高血糖症、胆汁鬱滞、及び肥満から選択される請求項49に記載の使用。