

【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17日 (2012.5.17)

【公開番号】特開2011-144183(P2011-144183A)

【公開日】平成23年7月28日 (2011.7.28)

【年通号数】公開・登録公報2011-030

【出願番号】特願2011-33491(P2011-33491)

【国際特許分類】

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 213/90 (2006.01)

C 0 7 D 215/22 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/549 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 213/90 C S P

C 0 7 D 215/22

C 0 7 D 471/04 1 1 4 A

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/549

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月18日 (2011.3.18)

【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

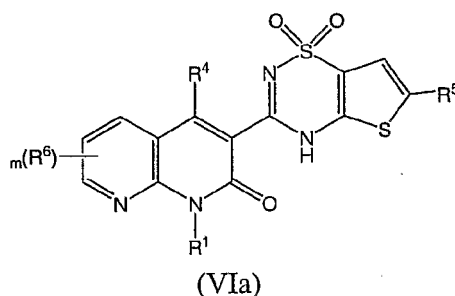
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (V I a) の化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩又は立体異性体。

【化 1】



[式中、

R¹ は、水素、アルケニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルファニルアルキル、アルキルスルフ

イニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキニル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、アリールスルファニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、カルボキシアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルケニル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールスルホニルアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロアルキル、 $R_a R_b N-$ 、 $R_a R_b N$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)O$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)NR_c$ アルキル-、 $R_f R_g C=N-$ および $R_k O-$ からなる群から選択され； R^1 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_c)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_c R_e)$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_e)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_e$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R^4 は、アルコキシ、アリールアルコキシ、アリールオキシ、ハロ、ヒドロキシ、 $R_a R_b N-$ 、 N_3- 、 $R_e S-$ からなる群から選択され； R^4 は、ハロ、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、および $-COOH$ からなる群から選択される 0、1 または 2 個の置換基で置換されており；

R^5 は、 $R_a SO_2 N(R_f)-$ 、 $R_a SO_2 N(R_f)$ アルキル-、 $R_a R_b NSO_2 N(R_f)-$ 及び $R_a R_b NSO_2 N(R_f)$ アルキル- からなる群から選択され；

R^6 は各場合で独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、複素環アルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_k)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_a R_b)$ 、 $-SR_a$ 、 $-S(O)R_a$ 、 $-S(O)_2 R_a$ 、 $-OR_k$ 、 $-N(R_a)(R_b)$ 、 $-C(O)R_a$ 、 $-C(O)OR_a$ および $-C(O)NR_a R_b$ からなる群から選択され；各 R^6 は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-OR_a$ 、 $-NR_a R_b$ 、 $-SR_a$ 、 $-SOR_a$ 、 $-SO_2 R_a$ 、 $-C(O)OR_a$ 、 $-C(O)NR_a R_b$ および $-NC(O)R_a$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_a および R_b は各場合で独立に、水素、アルケニル、アルキル、アルキルスルファニルアルキル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキルカルボニル、ニトロアルキル、 $R_c R_d N-$ 、 $R_c R_d N$ アルキル-、 $R_c R_d NC(O)$ アルキル-、 $R_c SO_2-$ 、 $R_c SO_2$ アルキル-、 $R_c C(O)-$ 、 $R_c C(O)$ アルキル-、 $R_c OC(O)-$ 、 $R_c OC(O)$ アルキル-、 $R_c R_d N$ アルキル $C(O)-$ 、 $R_c R_d NC(O)-$ 、 $R_c R_d NC(O)O$ アルキル-、 $R_c R_d NC(O)N(R_e)$ アルキル- からなる群から選択され； R_a および R_b は、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_c)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_c R_d)$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_d)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_d$ からなる群から選択される 0、1 または 2 個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_a および R_b はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される 3～6 員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリ

ールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル) (OR_c)、- (アルキル) (NR_cR_d)、- アルキルSO₂NR_cR_d、- アルキルC(O)NR_cR_d、- SR_c、- S(O)R_c、- S(O)₂R_c、- OR_c、- N(R_c)(R_d)、- C(O)R_c、- C(O)OR_c および - C(O)NR_cR_d からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R_c および R_d は各場合で独立に、水素、- NR_fR_h、- OR_f、- CO(R_f)、- SR_f、- SO₂R_f、- S(O)NR_fR_h、- SO₂NR_fR_h、- C(O)OR_f、アルケニル、アルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、アリール、アリールアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環および複素環アルキルからなる群から選択され；各 R_c および R_d は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル) (OR_f)、- (アルキル) (NR_fR_h)、- SR_f、- S(O)R_f、- S(O)₂R_f、- OR_f、- N(R_f)(R_h)、- C(O)R_f、- C(O)OR_f、- C(O)NR_fR_h、- C(O)N(H)NR_fR_h、- N(R_e)C(O)OR_f、- N(R_e)SO₂NR_fR_h、- N(R_e)C(O)NR_fR_h、- アルキルN(R_e)C(O)OR_f、- アルキルN(R_e)SO₂NR_fR_h および - アルキルN(R_e)C(O)NR_fR_h からなる群から選択される0、1、2、または3個の置換基で置換されており；

あるいは、R_c および R_d はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される3～6員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル) (OR_f)、- (アルキル) (NR_fR_h)、- SR_f、- S(O)R_f、- S(O)₂R_f、- OR_f、- N(R_f)(R_h)、- C(O)R_f、- C(O)OR_f および - C(O)NR_fR_h からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R_e は、水素、アルケニル、アルキルおよびシクロアルキルからなる群から選択され；

R_f、R_g および R_h は各場合で独立に、水素、アルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、複素環、複素環アルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；各 R_f、R_g および R_h は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロ、オキソ、ニトロ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、- OH、- O(アルキル)、- NH₂、- N(H)(アルキル)、- N(アルキル)₂、- S(アルキル)、- S(O)(アルキル)、- SO₂アルキル、- アルキル-OH、- アルキル-O-アルキル、- アルキルNH₂、- アルキルN(H)(アルキル)、- アルキルN(アルキル)₂、- アルキルS(アルキル)、- アルキルS(O)(アルキル)、- アルキルSO₂アルキル、- N(H)C(O)NH₂、- C(O)OH、- C(O)O(アルキル)、- C(O)アルキル、- C(O)NH₂、- C(O)NH₂、- C(O)N(H)(アルキル) および - C(O)N(アルキル)₂ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

あるいは、R_f および R_g はそれらが結合している炭素原子と一体となって、シクロアルキル、シクロアルケニルおよび複素環からなる群から選択される3～7員環を形成しており；

あるいは、R_f および R_h はそれらが結合している窒素原子と一体となって、複素環およびヘテロアリールからなる群から選択される3～7員環を形成しており；前記複素環およびヘテロアリールはそれぞれ独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハ

口、オキソ、ニトロ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $-OH$ 、 $-O$ (アルキル)、 $-NH_2$ 、 $-N(H)$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-S$ (アルキル)、 $-S$ (アルキル)、 $-S(O)$ (アルキル)、 $-アルキル-OH$ 、 $-アルキル-O-アルキル$ 、 $-アルキルNH_2$ 、 $-アルキルN(H)$ (アルキル)、 $-アルキルS$ (アルキル)、 $-アルキルS(O)$ (アルキル)、 $-アルキルSO_2$ アルキル、 $-アルキルN$ (アルキル) $_2$ 、 $-N(H)C(O)NH_2$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O$ (アルキル)、 $-C(O)$ アルキル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)N(H)$ (アルキル) および $-C(O)N$ (アルキル) $_2$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_k は、水素、アルケニル、アルキル、アリール、アリールアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルキル、ニトロアルキル、 $R_a R_b N$ アルキル -、 $R_a O$ アルキル -、 $R_a R_b NC(O)$ -、 $R_a R_b NC(O)$ アルキル、 $R_a S$ -、 $R_a S(O)$ -、 $R_a SO_2$ -、 $R_a S$ アルキル -、 $R_a (O) S$ アルキル -、 $R_a SO_2$ アルキル -、 $R_a OC(O)$ -、 $R_a OC(O)$ アルキル -、 $R_a C(O)$ -、 $R_a C(O)$ アルキル - からなる群から選択され；各 R_k は、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(アルキル)(OR_c)$ 、 $-(アルキル)(NR_c R_d)$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_d)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_d$ からなる群から選択される 0、1、2、または 3 個の置換基で置換されており；

m は 0、1、2、3 または 4 であり；

ただし、 R^4 がアルコキシ、アリールオキシ、ヒドロキシまたは $R_e S$ - であり、 R^5 が $R_a SO_2 N(R_f)$ - であり、 R^6 がアルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、シアノ、ニトロ、アリール、ヘテロアリール、複素環アルキル、 $-SR_a$ 、 $-S(O)R_a$ 、 $-S(O)_2 R_a$ 、 $-OR_k$ 、 $-N(R_a)(R_b)$ 、 $-C(O)R_a$ 、 $-C(O)OR_a$ および $-C(O)NR_a R_b$ である場合、 R^1 は水素、アルケニル、アルキル、アルキニル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルケニル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、複素環アルケニルおよび複素環アルキルではない。]

【請求項 2】

R^4 がヒドロキシである請求項 1 に記載の化合物、塩又は立体異性体。

【請求項 3】

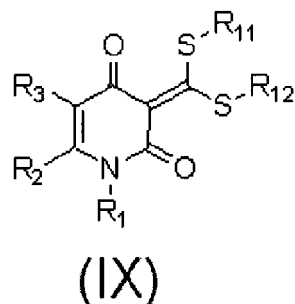
R^1 が、水素、アルケニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキル、アルキニル、アリールアルケニル、アリールアルキル、カルボキシアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルケニル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキル、 $R_a R_b N$ -、 $R_a R_b N$ アルキル -、 $R_a R_b NC(O)$ アルキル -、 $R_f R_g C=N$ - および $R_k O$ - からなる群から選択される請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

下記式 (IX) を有する化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩又は立体異性体

。

【化 2】



[式中、

R^1 は、水素、アルケニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルファニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキニル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、アリールスルファニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、カルボキシアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルケニル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールスルホニルアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロアルキル、 $R_a R_b N-$ 、 $R_a R_b N$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)O$ アルキル-、 $R_a R_b NC(O)NR_c$ アルキル-、 $R_f R_g C=N-$ および $R_k O-$ からなる群から選択され； R^1 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_c)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_c R_e)$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_e)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_e$ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R^2 および R^3 は、それらが結合している炭素原子と一体となって、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される5員または6員環を形成しており、前記アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールおよび複素環は $(R^6)_m$ で置換されていても良く；

R^6 は各場合で独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、複素環アルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_k)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_a R_b)$ 、 $-SR_a$ 、 $-S(O)R_a$ 、 $-S(O)_2 R_a$ 、 $-OR_k$ 、 $-N(R_a)(R_b)$ 、 $-C(O)R_a$ 、 $-C(O)OR_a$ および $-C(O)NR_a R_b$ からなる群から選択され；各 R^6 は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-OR_a$ 、 $-NR_a R_b$ 、 $-SR_a$ 、 $-SOR_a$ 、 $-SO_2 R_a$ 、 $-C(O)OR_a$ 、 $-C(O)NR_a R_b$ および $-NC(O)R_a$ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R_a および R_b は各場合で独立に、水素、アルケニル、アルキル、アルキルスルファニルアルキル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキルカルボニル、ニトロアルキル、 $R_c R_d N-$ 、 $R_c R_d N$ アルキル-、 $R_c R_d NC(O)$ アルキル-、 $R_c SO_2-$ 、 $R_c SO_2$ アルキル-、 $R_c C(O)-$ 、 $R_c C(O)$ アルキル-、 $R_c OC(O)-$ 、 $R_c OC(O)$ アルキル-、 R

$R_c R_d N$ アルキル $C(O)-$ 、 $R_c R_d NC(O)-$ 、 $R_c R_d NC(O)O$ アルキル-、 $R_c R_d NC(O)N(R_e)$ アルキル-からなる群から選択され； R_a および R_b は、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_c)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_c R_d)$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_d)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_d$ からなる群から選択される0、1または2個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_a および R_b はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される3～6員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_c)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_c R_d)$ 、 $-アルキルSO_2 NR_c R_d$ 、 $-アルキルC(O)NR_c R_d$ 、 $-SR_c$ 、 $-S(O)R_c$ 、 $-S(O)_2 R_c$ 、 $-OR_c$ 、 $-N(R_c)(R_d)$ 、 $-C(O)R_c$ 、 $-C(O)OR_c$ および $-C(O)NR_c R_d$ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R_c および R_d は各場合で独立に、水素、 $-NR_f R_h$ 、 $-OR_f$ 、 $-CO(R_f)$ 、 $-SR_f$ 、 $-SOR_f$ 、 $-SO_2 R_f$ 、 $-C(O)NR_f R_h$ 、 $-SO_2 NR_f R_h$ 、 $-C(O)OR_f$ 、アルケニル、アルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、アリール、アリールアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環および複素環アルキルからなる群から選択され；各 R_c および R_d は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_f)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_f R_h)$ 、 $-SR_f$ 、 $-S(O)R_f$ 、 $-S(O)_2 R_f$ 、 $-OR_f$ 、 $-N(R_f)(R_h)$ 、 $-C(O)R_f$ 、 $-C(O)OR_f$ 、 $-C(O)NR_f R_h$ 、 $-C(O)N(H)NR_f R_h$ 、 $-N(R_e)C(O)OR_f$ 、 $-N(R_e)SO_2 NR_f R_h$ 、 $-N(R_e)C(O)NR_f R_h$ 、 $-アルキルN(R_e)C(O)OR_f$ 、 $-アルキルN(R_e)SO_2 NR_f R_h$ および $-アルキルN(R_e)C(O)NR_f R_h$ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_c および R_d はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される3～6員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(OR_f)$ 、 $-(\text{アルキル})(NR_f R_h)$ 、 $-SR_f$ 、 $-S(O)R_f$ 、 $-S(O)_2 R_f$ 、 $-OR_f$ 、 $-N(R_f)(R_h)$ 、 $-C(O)R_f$ 、 $-C(O)OR_f$ および $-C(O)NR_f R_h$ からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R_e は、水素、アルケニル、アルキルおよびシクロアルキルからなる群から選択され；

R_f 、 R_g および R_h は各場合で独立に、水素、アルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、複素環、複素環アルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；各 R_f 、 R_g および R_h は独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロ、オキソ、ニトロ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $-OH$ 、 $-O(\text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(H)(\text{アルキル})$ 、 $-N(\text{アルキル})_2$ 、 $-S(\text{アルキル})$ 、 $-S(O)(\text{アルキル})$ 、 $-SO_2 \text{アルキル}$ 、 $-アルキル-OH$ 、 $-アル$

キル - O - アルキル、 - アルキル NH_2 、 - アルキル $\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 - アルキル $\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 - アルキル $\text{S}(\text{アルキル})$ 、 - アルキル $\text{S}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 - アルキル SO_2 アルキル、 - $\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{アルキル})$ 、 - $\text{C}(\text{O})$ アルキル、 - $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ および - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_f および R_g はそれらが結合している炭素原子と一体となって、シクロアルキル、シクロアルケニルおよび複素環からなる群から選択される 3 ~ 7 員環を形成しており；

あるいは、 R_f および R_h はそれらが結合している窒素原子と一体となって、複素環およびヘテロアリアルからなる群から選択される 3 ~ 7 員環を形成しており；前記複素環およびヘテロアリアルはそれぞれ独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロ、オキソ、ニトロ、アリアル、アリアルアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルアルキル、 - OH、 - O(アルキル)、 - NH_2 、 - $\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 - $\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 - S(アルキル)、 - S(アルキル)、 - S(O)(アルキル)、 - アルキル - OH、 - アルキル - O - アルキル、 - アルキル NH_2 、 - アルキル $\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 - アルキル $\text{S}(\text{アルキル})$ 、 - アルキル $\text{S}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 - アルキル SO_2 アルキル、 - アルキル $\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 - $\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{アルキル})$ 、 - $\text{C}(\text{O})$ アルキル、 - $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ および - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_k は、水素、アルケニル、アルキル、アリアル、アリアルアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルアルキル、複素環、複素環アルキル、ニトロアルキル、 $\text{R}_a\text{R}_b\text{N}$ アルキル -、 R_aO アルキル -、 $\text{R}_a\text{R}_b\text{NC}(\text{O})$ -、 $\text{R}_a\text{R}_b\text{NC}(\text{O})$ アルキル、 R_aS -、 $\text{R}_a\text{S}(\text{O})$ -、 R_aSO_2 -、 R_aS アルキル -、 $\text{R}_a(\text{O})\text{S}$ アルキル -、 R_aSO_2 アルキル -、 $\text{R}_a\text{OC}(\text{O})$ -、 $\text{R}_a\text{OC}(\text{O})$ アルキル -、 $\text{R}_a\text{C}(\text{O})$ -、 $\text{R}_a\text{C}(\text{O})$ アルキル - からなる群から選択され；各 R_k は、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリアル、ヘテロアリアル、複素環、アリアルアルキル、ヘテロアリアルアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 - (アルキル)(OR_c)、 - (アルキル)(NR_cR_d)、 - SR_c 、 - $\text{S}(\text{O})\text{R}_c$ 、 - $\text{S}(\text{O})_2\text{R}_c$ 、 - OR_c 、 - $\text{N}(\text{R}_c)(\text{R}_d)$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{R}_c$ 、 - $\text{C}(\text{O})\text{OR}_c$ および - $\text{C}(\text{O})\text{NR}_c\text{R}_d$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

m は 0、1、2、3 または 4 であり；

R^{11} および R^{12} は独立にアルキル、アルケニルおよびアルキニルからなる群から選択される。]

【請求項 5】

1 - ベンジル - 3 - (ビス(メチルチオ)メチレン) - 1H - キノリン - 2, 4(1H, 3H) - ジオン；

3 - [ビス(メチルチオ)メチレン] - 1 - ブチル - 1, 8 - ナフチリジン - 2, 4(1H, 3H) - ジオン；

3 - [ビス(メチルチオ)メチレン] - 1 - (1, 3 - ジオキソ - 1, 3 - ジヒドロ - 2H - イソインドール - 2 - イル)キノリン - 2, 4(1H, 3H) - ジオン；

3 - [ビス(メチルチオ)メチレン] - 1 - [(シクロプロピルメチル)アミノ]キノリン - 2, 4(1H, 3H) - ジオン；

3 - [ビス(メチルチオ)メチレン] - 1 - (3 - メチルブチル)ピリジン - 2, 4(1H, 3H) - ジオン；

1 - ベンジル - 3 - [ビス (メチルチオ) メチレン] ピリジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;

3 - [ビス (メチルチオ) メチレン] - 1 - (シクロブチルアミノ) キノリン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ; および

3 - [ビス (メチルチオ) メチレン] - 1 - (シクロブチルメチル) ピリジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン

からなる群から選択される請求項4に記載の化合物あるいは該化合物の製薬上許容される塩又は立体異性体。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

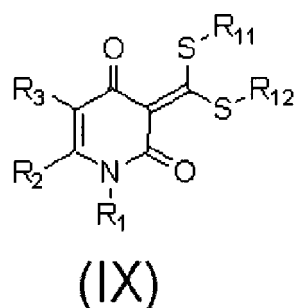
【補正対象項目名】0305

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0305】

【化28】



式中、

R¹ は、水素、アルケニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキル、アルキルカルボニルアルキル、アルキルスルファニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキニル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、アリールスルファニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、カルボキシアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル)アルケニル、(シクロアルキル)アルキル、ホルミルアルキル、ハロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールスルホニルアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキル、ニトロアルキル、R_aR_bN-、R_aR_bNアルキル-、R_aR_bNC(O)アルキル-、R_aR_bNC(O)Oアルキル-、R_aR_bNC(O)NR_cアルキル-、R_fR_gC=N- および R_kO- からなる群から選択され； R¹ は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、-(アルキル)(OR_c)、-(アルキル)(NR_cR_e)、-SR_c、-S(O)R_c、-S(O)₂R_c、-OR_c、-N(R_c)(R_e)、-C(O)R_c、-C(O)OR_c および -C(O)NR_cR_e からなる群から選択される0、1、2または3個の置換基で置換されており；

R² および R³ は独立に、水素、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、複素環、ヘテロアリールアルキル、シアノ、ハロ、-N(R_a)(R_b)、R_aR_bNC(O)-、-SR_a、-S(O)R_a、-S(O)₂R_a および R_aC(O)- からなる群から選択され； R² および R³ は独立に、独立に R_a、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、-(アルキル)(OR_k)、-(アルキル

) (NR_aR_b)、-SR_a、-S(O)R_a、-S(O)₂R_a、-OR_k、-N(R_a)(R_b)、-C(O)R_a、-C(O)OR_a および -C(O)NR_aR_b からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

あるいは、R² および R³ が、それらが結合している炭素原子と一体となって、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される 5 員または 6 員環を形成しており、前記アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールおよび複素環は (R⁶)_m で置換されていても良く；

R⁶ は各場合で独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、複素環アルキル、- (アルキル)(OR_k)、- (アルキル)(NR_aR_b)、-SR_a、-S(O)R_a、-S(O)₂R_a、-OR_k、-N(R_a)(R_b)、-C(O)R_a、-C(O)OR_a および -C(O)NR_aR_b からなる群から選択され；各 R⁶ は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、-OR_a、-NR_aR_b、-SR_a、-SOR_a、-SO₂R_a、-C(O)OR_a、-C(O)NR_aR_b および -NC(O)R_a からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_a および R_b は各場合で独立に、水素、アルケニル、アルキル、アルキルスルファニルアルキル、アリール、アリールアルケニル、アリールアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキル、複素環、複素環アルケニル、複素環アルキル、ヒドロキシアルキルカルボニル、ニトロアルキル、R_cR_dN-、R_kO-、R_kOアルキル-、R_cR_dNアルキル-、R_cR_dNC(O)アルキル-、R_cSO₂-、R_cSO₂アルキル-、R_cC(O)-、R_cC(O)アルキル-、R_cOC(O)-、R_cOC(O)アルキル-、R_cR_dNアルキルC(O)-、R_cR_dNC(O)-、R_eR_dNC(O)Oアルキル-、R_cR_dNC(O)N(R_e)アルキル- からなる群から選択され；R_a および R_b は、アルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル)(OR_c)、- (アルキル)(NR_cR_d)、-SR_c、-S(O)R_c、-S(O)₂RC、-OR_c、-N(R_c)(R_d)、-C(O)R_c、-C(O)OR_c および -C(O)NR_cR_d からなる群から選択される 0、1 または 2 個の置換基で置換されており；

あるいは、R_a および R_b はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される 3 ~ 6 員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル)(OR_c)、- (アルキル)(NR_cR_d)、-アルキルSO₂NR_cR_d、-アルキルC(O)NR_cR_d、-SR_c、-S(O)R_c、-S(O)₂R_c、-OR_c、-N(R_c)(R_d)、-C(O)R_c、-C(O)OR_c および -C(O)NR_cR_d からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_c および R_d は各場合で独立に、水素、-NR_fR_h、-OR_f、-CO(R_f)、-SR_f、-SOR_f、-SO₂R_f、-C(O)NR_fR_h、-SO₂NR_fR_h、-C(O)OR_f、アルケニル、アルキル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、アリール、アリールアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複素環および複素環アルキルからなる群から選択され；各 R_c および R_d は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシア

ルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(\text{OR}_f)$ 、 $-(\text{アルキル})(\text{NR}_f\text{R}_h)$ 、 $-\text{SR}_f$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}_f$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_f$ 、 $-\text{OR}_f$ 、 $-\text{N}(\text{R}_f)(\text{R}_h)$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_f$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_f$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_f\text{R}_h$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{NR}_f\text{R}_h$ 、 $-\text{N}(\text{R}_e)\text{C}(\text{O})\text{OR}_f$ 、 $-\text{N}(\text{R}_e)\text{SO}_2\text{NR}_f\text{R}_h$ 、 $-\text{N}(\text{R}_e)\text{C}(\text{O})\text{NR}_f\text{R}_h$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{R}_e)\text{C}(\text{O})\text{OR}_f$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{R}_e)\text{SO}_2\text{NR}_f\text{R}_h$ および $-\text{アルキルN}(\text{R}_e)\text{C}(\text{O})\text{NR}_f\text{R}_h$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_c および R_d はそれらが結合している窒素原子と一体となって、ヘテロアリールおよび複素環からなる群から選択される 3 ~ 6 員環を形成しており；前記ヘテロアリールおよび複素環は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、 $-(\text{アルキル})(\text{OR}_f)$ 、 $-(\text{アルキル})(\text{NR}_f\text{R}_h)$ 、 $-\text{SR}_f$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}_f$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}_f$ 、 $-\text{OR}_f$ 、 $-\text{N}(\text{R}_f)(\text{R}_h)$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}_f$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_f$ および $-\text{C}(\text{O})\text{NR}_f\text{R}_h$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_e は、水素、アルケニル、アルキルおよびシクロアルキルからなる群から選択され；

R_f 、 R_g および R_h は各場合で独立に、水素、アルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、複素環、複素環アルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリールアルキルからなる群から選択され；各 R_f 、 R_g および R_h は独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロ、オキソ、ニトロ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{S}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{S}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{SO}_2\text{アルキル}$ 、 $-\text{アルキル}-\text{OH}$ 、 $-\text{アルキル}-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $-\text{アルキルNH}_2$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{アルキルS}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルS}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルSO}_2\text{アルキル}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ および $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

あるいは、 R_f および R_g はそれらが結合している炭素原子と一体となって、シクロアルキル、シクロアルケニルおよび複素環からなる群から選択される 3 ~ 7 員環を形成しており；

あるいは、 R_f および R_h はそれらが結合している窒素原子と一体となって、複素環およびヘテロアリールからなる群から選択される 3 ~ 7 員環を形成しており；前記複素環およびヘテロアリールはそれぞれ独立に、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、ハロ、オキソ、ニトロ、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{S}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{S}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{S}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキル}-\text{OH}$ 、 $-\text{アルキル}-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $-\text{アルキルNH}_2$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{H})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルS}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルS}(\text{O})(\text{アルキル})$ 、 $-\text{アルキルSO}_2\text{アルキル}$ 、 $-\text{アルキルN}(\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{アルキル})$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{アルキル}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})(\text{アルキル})$ および $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{アルキル})_2$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

R_k は、水素、アルケニル、アルキル、アリール、アリールアルキル、シアノアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ホルミルアルキル、ハロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、複

素環、複素環アルキル、ニトロアルキル、 $R_a R_b N$ アルキル -、 $R_a O$ アルキル -、 $R_a R_b NC(O)$ -、 $R_a R_b NC(O)$ アルキル、 $R_a S$ -、 $R_a S(O)$ -、 $R_a SO_2$ -、 $R_a S$ アルキル -、 $R_a (O) S$ アルキル -、 $R_a SO_2$ アルキル -、 $R_a OC(O)$ -、 $R_a OC(O)$ アルキル -、 $R_a C(O)$ -、 $R_a C(O)$ アルキル - からなる群から選択され；各 R_k は、独立にアルキル、アルケニル、アルキニル、オキソ、ハロ、シアノ、ニトロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アリール、ヘテロアリール、複素環、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、- (アルキル) (OR_c)、- (アルキル) ($NR_c R_d$)、- SR_c 、- $S(O)R_c$ 、- $S(O)_2 R_c$ 、- OR_c 、- $N(R_c)(R_d)$ 、- $C(O)R_c$ 、- $C(O)OR_c$ および - $C(O)NR_c R_d$ からなる群から選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されており；

m は 0、1、2、3 または 4 であり；

R^{11} および R^{12} は独立にアルキル、アルケニルおよびアルキニルからなる群から選択される。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】1904

【補正方法】変更

【補正の内容】

【1904】

実施例 426B

1 - ベンジル - 3 - [ビス(メチルチオ)メチレン]ピリジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン

実施例 426A の生成物 (0.124 g、0.62 mmol) の 1, 4 - ジオキサン (6 mL) 溶液を、40 °C にて 15 分間にわたりピリジン (0.400 mL、4.96 mmol) およびメチル硫酸トリス(メチルチオ)メチル (文献 (Synthesis, 22-25, 1988; M. Barbero, S. Cadamuro, I. Degani, R. Fochi, A. Gatti, V. Regondi) の手順を用いて製造) (0.32 g、1.24 mmol) で処理した。追加のメチル硫酸トリス(メチルチオ)メチル (0.32 g、1.24 mmol) を加え、溶液を 90 °C で 1 時間加熱した。溶媒を温かい窒素気流下に除去し、残留物を 100% 塩化メチレンおよび次に 30% 酢酸エチル / 塩化メチレンを溶離液とする 1 グラムのオールテック・セブパックカートリッジを用いて精製して、標題化合物を得た (79 mg、42%)。