

【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20年1月24日(2008.1.24)

【公表番号】特表2007-512349(P2007-512349A)

【公表日】平成19年5月17日(2007.5.17)

【年通号数】公開・登録公報2007-018

【出願番号】特願2006-541442(P2006-541442)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/20 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 5 C

C 0 7 D 471/14 1 0 2

C 0 7 D 471/14 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 7 E

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 P 31/16
 A 6 1 P 31/20
 A 6 1 P 31/14
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 33/02
 A 6 1 P 33/06
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 17/12
 A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年11月26日(2007.11.26)

【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

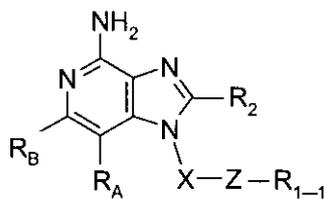
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(II)：

【化1】



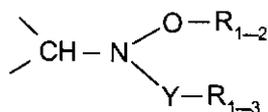
II

[式中：

Zは - C (= N - O - R₁₋₂) -

または

【化 2】



であり；

X は、以下：

- CH (R₉) - 、
- CH (R₉) - アルキレン - 、 および
- CH (R₉) - アルケニレン - 、

からなる群より選択され、

ここで当該アルキレンおよびアルケニレンは、場合によっては、1個または複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

R₁₋₁ は、以下：

- 水素、
- アルキル、
- アリール、
- アルキレン - アリール、
- ヘテロアリール、
- アルキレン - ヘテロアリール、 および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- アルキルチオ、
- ハロアルキル、
- ハロアルコキシ、
- アルキル、
- NH - SO₂ - R₁₋₄、
- NH - C (O) - R₁₋₄、
- NH - C (O) - NH₂、
- NH - C (O) - NH - R₁₋₄、 および
- N₃からなる群より選択され；

R₁₋₂ および R₁₋₃ は、独立して以下：

- 水素、
- アルキル、
- アルケニル、
- アリール、
- アリールアルキレニル、
- ヘテロアリール、
- ヘテロアリールアルキレニル、
- ヘテロシクリル、
- ヘテロシクリルアルキレニル、 および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アルケニル、アリール、アリーラルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリーラルキレニル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキレニルからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

ヒドロキシ、

アルキル、

ハロアルキル、

ヒドロキシアルキル、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

- S(O)₀₋₂ - アルキル、

- S(O)₀₋₂ - アリール、

- NH - S(O)₂ - アルキル、

- NH - S(O)₂ - アリール、

ハロアルコキシ、

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

アリールオキシ、

アリーラルキレンオキシ、

- C(O) - O - アルキル、

- C(O) - N(R₈)₂、

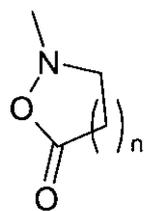
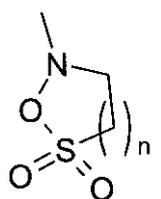
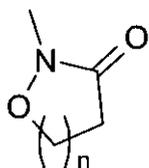
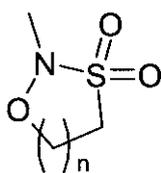
- N(R₈) - C(O) - アルキル、

- O - (CO) - アルキル、および

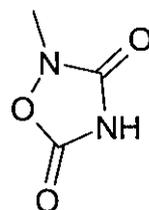
- C(O) - アルキルからなる群より選択され、

または、R₁₋₂基とR₁₋₃基は一緒になって、以下：

【化3】



, および



(ここで $n = 0, 1, 2, \text{または} 3$ である)
 からなる群より選択される環構造を形成し;

R_{1-4} は、以下:

アルキル、

アリアル、

アルキレン - アリアル、

ヘテロアリアル、

アルキレン - ヘテロアリアル、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリアル、アルキレン - アリ

- $N(R_9)_2$ からなる群より選択され；

または、 R_A と R_B は一緒になって、縮合アリアル環または N および S からなる群より選択される 1 個のヘテロ原子を含むヘテロアリアル環を形成するが、ここで当該アリアル環またはヘテロアリアル環は、非置換であるか、または、1 個または複数の R 基で置換されているか、または 1 個の R_3 基で置換されているか、または 1 個の R_3 基と 1 個の R 基で置換されているか；

または、 R_A と R_B は一緒になって、場合によっては N および S からなる群より選択される 1 個のヘテロ原子を含み、非置換であっても、あるいは 1 個または複数の R 基によって置換されていてもよい、飽和 5 ~ 7 員縮合環を形成し；

R は、以下：

ハロゲン、
 ヒドロキシ、
 アルキル、
 アルケニル、
 ハロアルキル、
 アルコキシ、
 アルキルチオ、および

- $N(R_9)_2$ からなる群より選択され；

R_2 は、水素または非妨害置換基であり；

R_3 は、以下：

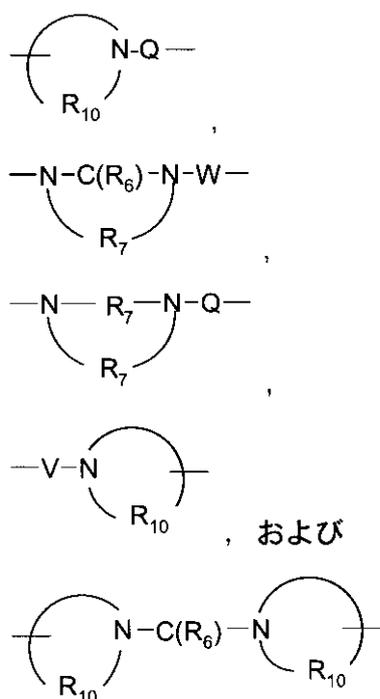
- $Z' - R_4$ 、
 - $Z' - X' - R_4$ 、
 - $Z' - X' - Y' - R_4$ 、および
 - $Z' - X' - R_5$ からなる群より選択され；

X' は、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、ヘテロアリーレン、およびヘテロシクリレンからなる群より選択されるが、ここで当該アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、場合によってはアリーレン、ヘテロアリーレンまたはヘテロシクリレンによって分断されるか末端封止されていてもよいし、また、場合によっては 1 個もしくは複数の $-O-$ 基によって分断されていてもよく；

Y' は、以下：

- $O-$ 、
 - $S(O)_{0-2}-$ 、
 - $S(O)_2 - N(R_8)-$ 、
 - $C(R_6)-$ 、
 - $C(R_6) - O-$ 、
 - $O - C(R_6)-$ 、
 - $O - C(O) - O-$ 、
 - $N(R_8) - Q-$ 、
 - $C(R_6) - N(R_8)-$ 、
 - $O - C(R_6) - N(R_8)-$ 、
 - $C(R_6) - N(OR_9)-$ 、および

【化 6】



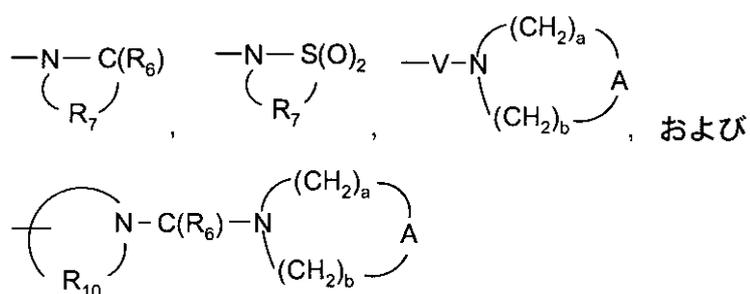
からなる群より選択され；

Z' は、単結合または - O - であり；

R₄ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリルからなる群より選択されるが、ここで当該アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリル基は、非置換であっても、あるいは、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、およびアルキル、アルケニル、アルキニルおよびヘテロシクリルの場合には、オキソ、からなる群より独立して選択される 1 個または複数の置換基により置換されていてもよく；

R₅ は、以下：

【化 7】



からなる群より選択され；

R₆は、=Oおよび=Sからなる群より選択され；

R₇は、C₂₋₇アルキレンであり；

R₈は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヒドロキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヘテロアリール-C₁₋₁₀アルキレニル、およびアリール-C₁₋₁₀アルキレニルからなる群より選択され；

R₉は、水素およびアルキルからなる群より選択され；

R₁₀は、C₃₋₈アルキレンであり；

Aは、-O-、-C(O)-、-S(O)₀₋₂-、-CH₂-、および-N(R₄)-からなる群より選択され；

Qは、単結合、-C(R₆)-、-C(R₆)-C(R₆)-、-S(O)₂-、-C(R₆)-N(R₈)-W-、-S(O)₂-N(R₈)-、-C(R₆)-O-、-C(R₆)-S-、および-C(R₆)-N(OR₉)-からなる群より選択され；

Vは、-C(R₆)-、-O-C(R₆)-、-N(R₈)-C(R₆)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；

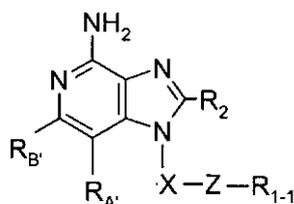
Wは、単結合、-C(O)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；そして
aとbは独立して、1~6の整数であるが、ただしa+b≦7である。]

で表わされる化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

式(III)：

【化 8】



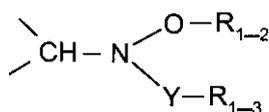
III

[式中：

Zは-C(=N-O-R₁₋₂)-

または

【化 9】



であり；

X は、以下：

- CH (R₉) -、
- CH (R₉) - アルキレン -、および
- CH (R₉) - アルケニレン - からなる群より選択され；

ここで当該アルキレンおよびアルケニレンは、場合によっては、1個または複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

R₁₋₁ は、以下：

- 水素、
- アルキル、
- アリール、
- アルキレン - アリール、
- ヘテロアリール、
- アルキレン - ヘテロアリール、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- アルキルチオ、
- ハロアルキル、
- ハロアルコキシ、
- アルキル、
- NH - SO₂ - R₁₋₄、
- NH - C (O) - R₁₋₄、
- NH - C (O) - NH₂、
- NH - C (O) - NH - R₁₋₄、および
- N₃ からなる群より選択され；

R₁₋₂ および R₁₋₃ は、独立して以下：

- 水素、
- アルキル、
- アルケニル、
- アリール、
- アリールアルケニル、
- ヘテロアリール、
- ヘテロアリールアルケニル、
- ヘテロシクリル、
- ヘテロシクリルアルケニル、および

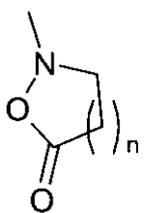
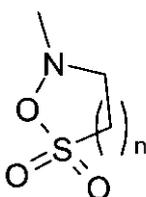
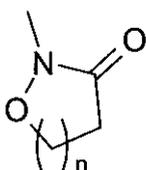
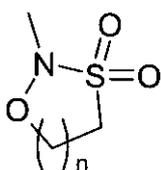
1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アルケニル、アリール、アリ

ールアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキレニルからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

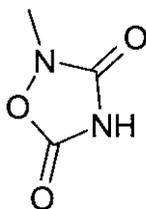
- ヒドロキシ、
- アルキル、
- ハロアルキル、
- ヒドロキシアルキル、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- S (O) ₀₋₂ - アルキル、
- S (O) ₀₋₂ - アリール、
- NH - S (O) ₂ - アルキル、
- NH - S (O) ₂ - アリール、
- ハロアルコキシ、
- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アリール、
- ヘテロアリール、
- ヘテロシクリル、
- アリールオキシ、
- アリールアルキレンオキシ、
- C (O) - O - アルキル、
- C (O) - N (R₈) ₂、
- N (R₈) - C (O) - アルキル、
- O - (C O) - アルキル、および
- C (O) - アルキルからなる群より選択され；

または、R₁₋₂基とR₁₋₃基は一緒になって、以下：

【化 1 0】



, および



(ここで $n = 0, 1, 2, \text{または} 3$ である)
 からなる群より選択される環構造を形成し;

R_{1-4} は、以下:

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、および

1 個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリ

アルキルチオ、および

- N (R₉)₂ からなる群より選択され ;

R₂ は、以下 :

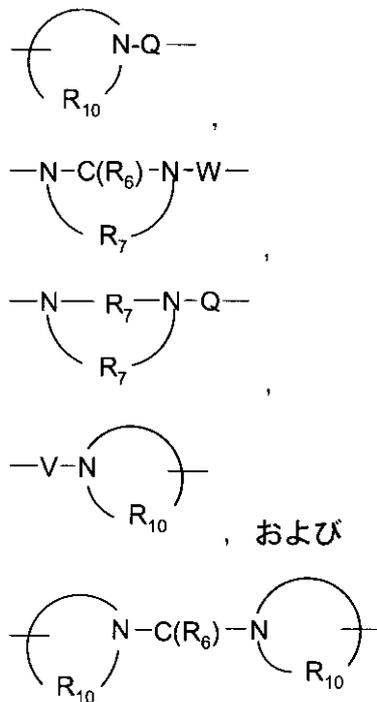
- R₄、
- X' - R₄、
- X' - Y' - R₄、および
- X' - R₅ からなる群より選択され ;

X' は、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、ヘテロアリーレン、およびヘテロシクリレンからなる群より選択されるが、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、場合によってはアリーレン、ヘテロアリーレンまたはヘテロシクリレンによって分断されるか末端封止されているか、また、場合によっては 1 個もしくは複数の - O - 基によって分断されているか ;

Y' は、以下 :

- O - 、
- S (O)₀₋₂ - 、
- S (O)₂ - N (R₈) - 、
- C (R₆) - 、
- C (R₆) - O - 、
- O - C (R₆) - 、
- O - C (O) - O - 、
- N (R₈) - Q - 、
- C (R₆) - N (R₈) - 、
- O - C (R₆) - N (R₈) - 、
- C (R₆) - N (O R₉) - 、および

【化 1 3】



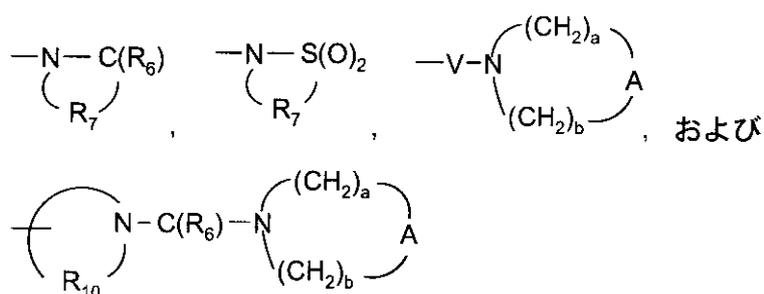
からなる群より選択され ;

R₄ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリー

ルアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリルからなる群より選択されるが、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリル基は、非置換であっても、あるいは、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、およびアルキル、アルケニル、アルキニルおよびヘテロシクリルの場合には、オキソ、からなる群より独立して選択される1個または複数の置換基により置換されていてもよく；

R₅は、以下：

【化14】



からなる群より選択され；

R₆は、=Oおよび=Sからなる群より選択され；

R₇は、C₂₋₇アルキレンであり；

R₈は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヒドロキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヘテロアリール-C₁₋₁₀アルキレニル、およびアリール-C₁₋₁₀アルキレニルからなる群より選択され；

R₉は、水素およびアルキルからなる群より選択され；

R₁₀は、C₃₋₈アルキレンであり；

Aは、-O-、-C(O)-、-S(O)₀₋₂-、-CH₂-、および-N(R₄)-からなる群より選択され；

Qは、単結合、-C(R₆)-、-C(R₆)-C(R₆)-、-S(O)₂-、-C(R₆)-N(R₈)-W-、-S(O)₂-N(R₈)-、-C(R₆)-O-、-C(R₆)-S-、および-C(R₆)-N(OR₉)-からなる群より選択され；

Vは、-C(R₆)-、-O-C(R₆)-、-N(R₈)-C(R₆)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；

Wは、単結合、-C(O)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；そして

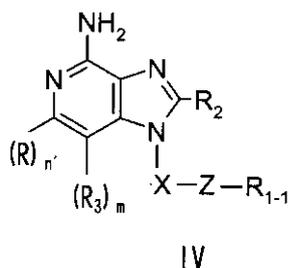
aとbはそれぞれ独立して、1~6の整数であるが、ただしa+b≦7である。]

で表わされる化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

式(I V)：

【化 1 5】

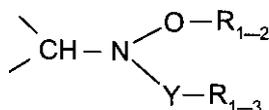


[式中 :

Z は - C (= N - O - R₁₋₂) -

または

【化 1 6】



であり ;

X は、以下 :

- CH (R₉) - 、

- CH (R₉) - アルキレン - 、 および

- CH (R₉) - アルケニレン - からなる群より選択され ;

ここで前記アルキレンおよびアルケニレンは、場合によっては、1個または複数の - O - 基によって分断されていてもよく ;

R₁₋₁ は、以下 :

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下 :

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO₂ - R₁₋₄、

- NH - C (O) - R₁₋₄、
- NH - C (O) - NH₂、
- NH - C (O) - NH - R₁₋₄、および
- N₃からなる群より選択され；

R₁₋₂およびR₁₋₃は、独立して以下：

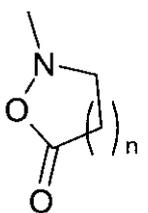
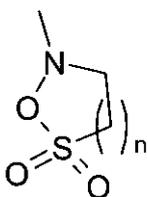
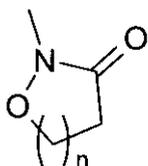
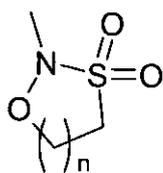
- 水素、
- アルキル、
- アルケニル、
- アリール、
- アリールアルキレニル、
- ヘテロアリール、
- ヘテロアリールアルキレニル、
- ヘテロシクリル、
- ヘテロシクリルアルキレニル、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキレニルからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

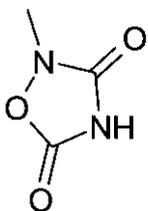
- ヒドロキシ、
- アルキル、
- ハロアルキル、
- ヒドロキシアルキル、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- S (O)₀₋₂ - アルキル、
- S (O)₀₋₂ - アリール、
- NH - S (O)₂ - アルキル、
- NH - S (O)₂ - アリール、
- ハロアルコキシ、
- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アリール、
- ヘテロアリール、
- ヘテロシクリル、
- アリールオキシ、
- アリールアルキレンオキシ、
- C (O) - O - アルキル、
- C (O) - N (R₈)₂、
- N (R₈) - C (O) - アルキル、
- O - (C O) - アルキル、および
- C (O) - アルキルからなる群より選択され；

または、R₁₋₂基とR₁₋₃基は一緒になって、以下：

【化 17】



, および



(ここで $n = 0, 1, 2$, または 3 である)
 からなる群より選択される環構造を形成し;

R_{1-4} は、以下:

アルキル;

アリール;

アルキレン - アリール;

ヘテロアリール;

アルキレン - ヘテロアリール; および

アルキルチオ、および

- $N(R_9)_2$ からなる群より選択され；

R_2 は、以下：

- R_4 、

- $X' - R_4$ 、

- $X' - Y' - R_4$ 、および

- $X' - R_5$ からなる群より選択され；

R_3 は、以下：

- $Z' - R_4$ 、

- $Z' - X' - R_4$ 、

- $Z' - X' - Y' - R_4$ 、および

- $Z' - X' - R_5$ からなる群より選択され；

n' は、0 ~ 4 の整数であり；

m は、0 または 1 であり；但し、 m が 1 のとき、 n' は 0 または 1 であり；

X' は、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、ヘテロアリーレン、およびヘテロシクリレンからなる群より選択されるが、ここで当該アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、場合によってはアリーレン、ヘテロアリーレンまたはヘテロシクリレンによって分断されるか末端封止されていてもよいし、また、場合によっては 1 個もしくは複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

Y' は、以下：

- O -、

- $S(O)_{0-2}$ -、

- $S(O)_2 - N(R_8)$ -、

- $C(R_6)$ -、

- $C(R_6) - O$ -、

- $O - C(R_6)$ -、

- $O - C(O) - O$ -、

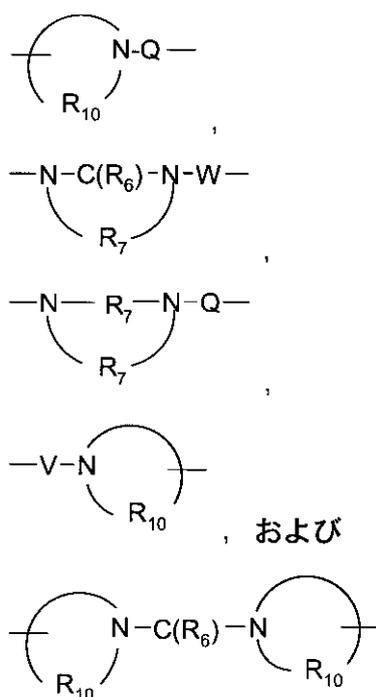
- $N(R_8) - Q$ -、

- $C(R_6) - N(R_8)$ -、

- $O - C(R_6) - N(R_8)$ -、

- $C(R_6) - N(OR_9)$ -、および

【化 2 0】



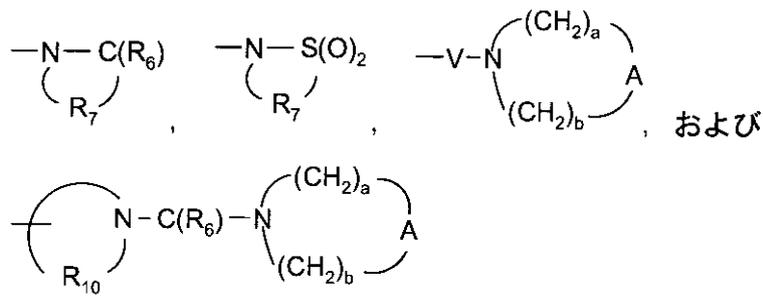
からなる群より選択され；

Z' は、単結合または - O - であり；

R₄ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリルからなる群より選択されるが、ここで当該アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリル基は、非置換であっても、あるいは、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、およびアルキル、アルケニル、アルキニルおよびヘテロシクリルの場合には、オキシ、からなる群より独立して選択される 1 個または複数の置換基により置換されていてもよく；

R₅ は、以下：

【化 2 1】



からなる群より選択され；

R₆は、=Oおよび=Sからなる群より選択され；

R₇は、C₂₋₇アルキレンであり；

R₈は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヒドロキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヘテロアリール-C₁₋₁₀アルキレニル、およびアリール-C₁₋₁₀アルキレニルからなる群より選択され；

R₉は、水素およびアルキルからなる群より選択され；

R₁₀は、C₃₋₈アルキレンであり；

Aは、-O-、-C(O)-、-S(O)₀₋₂-、-CH₂-、および-N(R₄)-からなる群より選択され；

Qは、単結合、-C(R₆)-、-C(R₆)-C(R₆)-、-S(O)₂-、-C(R₆)-N(R₈)-W-、-S(O)₂-N(R₈)-、-C(R₆)-O-、-C(R₆)-S-、および-C(R₆)-N(OR₉)-からなる群より選択され；

Vは、-C(R₆)-、-O-C(R₆)-、-N(R₈)-C(R₆)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；

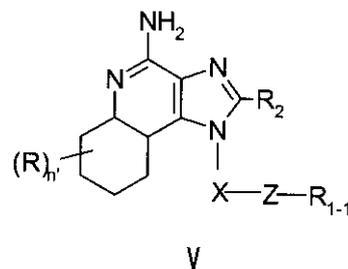
Wは、単結合、-C(O)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；そして
aとbは独立して、1~6の整数であるが、ただしa+b≦7である。]

で表わされる化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

式(V)：

【化 2 2】

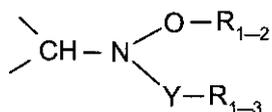


[式中：

Zは -C(=N-O-R₁₋₂)-

または

【化 2 3】



であり；

X は、以下：

- CH (R₉) -、
- CH (R₉) - アルキレン -、および
- CH (R₉) - アルケニレン - からなる群より選択され、

ここで前記アルキレンおよびアルケニレンは、場合によっては、1個または複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

R₁₋₁ は、以下：

- 水素、
- アルキル、
- アリール、
- アルキレン - アリール、
- ヘテロアリール、
- アルキレン - ヘテロアリール、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- アルキルチオ、
- ハロアルキル、
- ハロアルコキシ、
- アルキル、
- NH - SO₂ - R₁₋₄、
- NH - C (O) - R₁₋₄、
- NH - C (O) - NH₂、
- NH - C (O) - NH - R₁₋₄、および
- N₃ からなる群より選択され；

R₁₋₂ および R₁₋₃ は、独立して以下：

- 水素、
- アルキル、
- アルケニル、
- アリール、
- アリールアルケニル、
- ヘテロアリール、
- ヘテロアリールアルケニル、
- ヘテロシクリル、
- ヘテロシクリルアルケニル、および

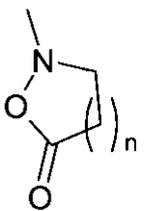
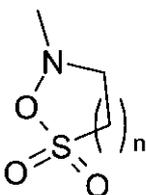
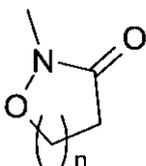
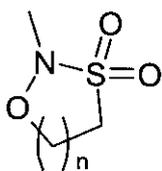
1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アルケニル、アリール、アリ

ールアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキレニルからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

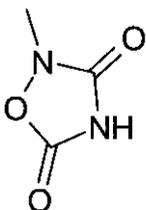
- ヒドロキシ、
- アルキル、
- ハロアルキル、
- ヒドロキシアルキル、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- S (O) ₀₋₂ - アルキル、
- S (O) ₀₋₂ - アリール、
- NH - S (O) ₂ - アルキル、
- NH - S (O) ₂ - アリール、
- ハロアルコキシ、
- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アリール、
- ヘテロアリール、
- ヘテロシクリル、
- アリールオキシ、
- アリールアルキレンオキシ、
- C (O) - O - アルキル、
- C (O) - N (R₈)₂、
- N (R₈) - C (O) - アルキル、
- O - (C O) - アルキル、および
- C (O) - アルキルからなる群より選択され；

または、R₁₋₂基とR₁₋₃基は一緒になって、以下：

【化 2 4】



, および



(ここで $n = 0, 1, 2$, または 3 である)
 からなる群より選択される環構造を形成し;

R_{1-4} は、以下:

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

ハロゲン、
シアノ、
ニトロ、
アルコキシ、
ジアルキルアミノ、
アルキルチオ、
ハロアルキル、
ハロアルコキシ、
アルキル、および

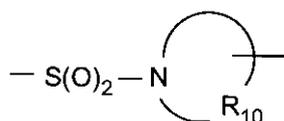
- N₃からなる群より選択され；

Yは、以下：

単結合、

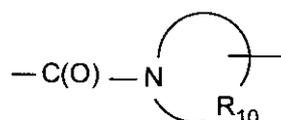
- C (O) - 、
- C (S) - 、
- S (O)₂ - 、
- S (O)₂ - N (R₈) - 、

【化 2 5】



- C (O) - O - 、
- C (O) - N (R₈) - 、
- C (S) - N (R₈) - 、
- C (O) - N (R₈) - S (O)₂ - 、
- C (O) - N (R₈) - C (O) - 、
- C (S) - N (R₈) - C (O) - 、

【化 2 6】



- C (O) - C (O) - 、
- C (O) - C (O) - O - 、 および
- C (= N H) - N (R₈) - からなる群より選択され；

Rは、以下：

ハロゲン、
ヒドロキシ、
アルキル、

アルケニル、
 ハロアルキル、
 アルコキシ、
 アルキルチオ、および

- $N(R_9)_2$ からなる群より選択され；

R_2 は、以下：

- R_4 、
- $X' - R_4$ 、
- $X' - Y' - R_4$ 、および
- $X' - R_5$ からなる群より選択され；

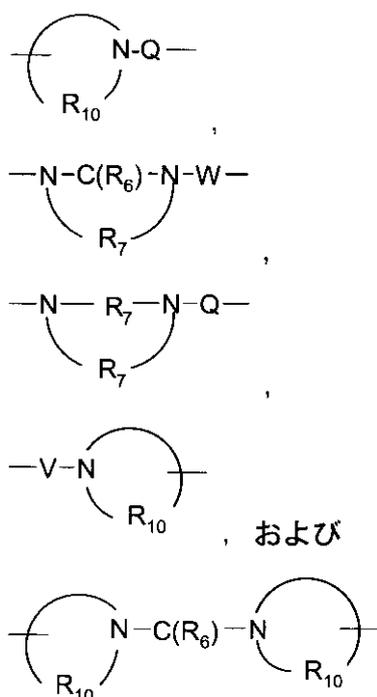
n' は、0 ~ 4 の整数であり；

X' は、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、ヘテロアリーレン、およびヘテロシクリレンからなる群より選択されるが、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、場合によってはアリーレン、ヘテロアリーレンまたはヘテロシクリレンによって分断されるか末端封止されていてもよいし、また、場合によっては1個もしくは複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

Y' は、以下：

- O - 、
- $S(O)_{0-2}$ - 、
- $S(O)_2 - N(R_8)$ - 、
- $C(R_6)$ - 、
- $C(R_6) - O$ - 、
- $O - C(R_6)$ - 、
- $O - C(O) - O$ - 、
- $N(R_8) - Q$ - 、
- $C(R_6) - N(R_8)$ - 、
- $O - C(R_6) - N(R_8)$ - 、
- $C(R_6) - N(OR_9)$ - 、および

【化 27】

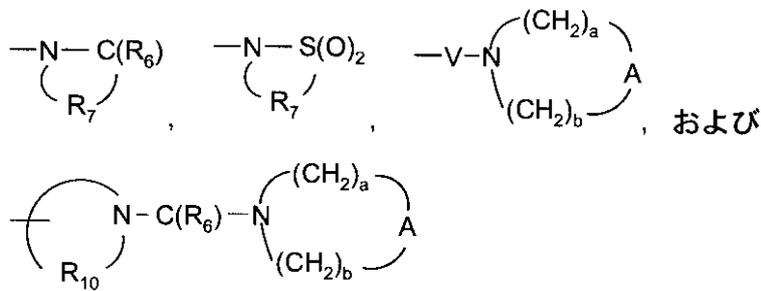


からなる群より選択され；

R_4 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリルからなる群より選択されるが、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリル基は、非置換であっても、あるいは、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、およびアルキル、アルケニル、アルキニルおよびヘテロシクリルの場合には、オキソ、からなる群より独立して選択される1個または複数の置換基により置換されていてもよく；

R_5 は、以下：

【化 2 8】



からなる群より選択され

R₆は、=Oおよび=Sからなる群より選択され；

R₇は、C₂₋₇アルキレンであり；

R₈は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヒドロキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヘテロアリール-C₁₋₁₀アルキレニル、およびアリール-C₁₋₁₀アルキレニルからなる群より選択され；

R₉は、水素およびアルキルからなる群より選択され；

R₁₀は、C₃₋₈アルキレンであり；

Aは、-O-、-C(O)-、-S(O)₀₋₂-、-CH₂-、および-N(R₄)-からなる群より選択され；

Qは、単結合、-C(R₆)-、-C(R₆)-C(R₆)-、-S(O)₂-、-C(R₆)-N(R₈)-W-、-S(O)₂-N(R₈)-、-C(R₆)-O-、-C(R₆)-S-、および-C(R₆)-N(OR₉)-からなる群より選択され；

Vは、-C(R₆)-、-O-C(R₆)-、-N(R₈)-C(R₆)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；

Wは、単結合、-C(O)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；そして

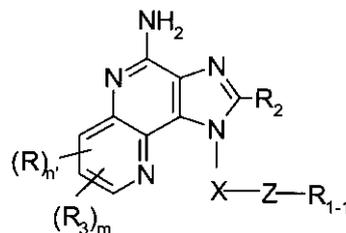
aとbはそれぞれ独立して、1~6の整数であるが、ただしa+b≦7である。]

で表わされる化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

式(VI)：

【化 2 9】



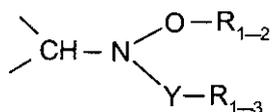
VI

[式中：

Zは -C(=N-O-R₁₋₂)-

または

【化 3 0】



であり；

X は、以下：

- CH (R₉) -、
- CH (R₉) - アルキレン -、および
- CH (R₉) - アルケニレン - からなる群より選択され、

ここで前記アルキレンおよびアルケニレンは、場合によっては、1個または複数の - O - 基によって分断されていてもよく；

R₁₋₁ は、以下：

- 水素、
- アルキル、
- アリール、
- アルキレン - アリール、
- ヘテロアリール、
- アルキレン - ヘテロアリール、および

1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- アルキルチオ、
- ハロアルキル、
- ハロアルコキシ、
- アルキル、
- NH - SO₂ - R₁₋₄、
- NH - C (O) - R₁₋₄、
- NH - C (O) - NH₂、
- NH - C (O) - NH - R₁₋₄、および
- N₃ からなる群より選択され；

R₁₋₂ および R₁₋₃ は、独立して以下：

- 水素、
- アルキル、
- アルケニル、
- アリール、
- アリールアルケニル、
- ヘテロアリール、
- ヘテロアリールアルケニル、
- ヘテロシクリル、
- ヘテロシクリルアルケニル、および

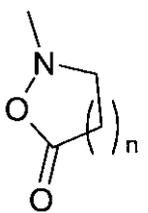
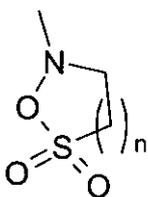
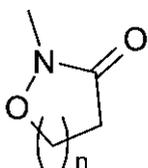
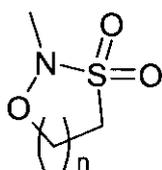
1個または複数の置換基により置換された、アルキル、アルケニル、アリール、アリ

ールアルキレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキレニルからなる群より選択され、当該1個または複数の置換基は以下：

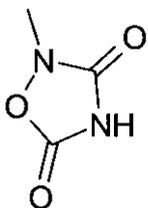
- ヒドロキシ、
- アルキル、
- ハロアルキル、
- ヒドロキシアルキル、
- アルコキシ、
- ジアルキルアミノ、
- S (O) ₀₋₂ - アルキル、
- S (O) ₀₋₂ - アリール、
- NH - S (O) ₂ - アルキル、
- NH - S (O) ₂ - アリール、
- ハロアルコキシ、
- ハロゲン、
- シアノ、
- ニトロ、
- アリール、
- ヘテロアリール、
- ヘテロシクリル、
- アリールオキシ、
- アリールアルキレンオキシ、
- C (O) - O - アルキル、
- C (O) - N (R₈) ₂、
- N (R₈) - C (O) - アルキル、
- O - (C O) - アルキル、および
- C (O) - アルキルからなる群より選択され；

または、R₁₋₂基とR₁₋₃基は一緒になって、以下：

【化 3 1】



, および



(ここで $n = 0, 1, 2, \text{または} 3$ である)
 からなる群より選択される環構造を形成し;

R_{1-4} は、以下:

アルキル、

アリアル、

アルキレン - アリアル、

ヘテロアリアル、

アルキレン - ヘテロアリアル、および

1 個または複数の置換基により置換された、アルキル、アリアル、アルキレン - アリ

ハロアルキル、

アルコキシ、

アルキルチオ、および

- N (R₉)₂ からなる群より選択され；

R₂ は、以下：

- R₄、

- X' - R₄、

- X' - Y' - R₄、および

- X' - R₅ からなる群より選択され；

R₃ は、以下：

Z' - R₄、

Z' - X' - R₄、

Z' - X' - Y' - R₄、および

Z' - X' - R₅ からなる群より選択され；

n' は、0 ~ 4 の整数であり；

m は、0 または 1 であり；但し、m が 1 のとき、n' は 0 または 1 であり；

X' は、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、ヘテロアリーレン、およびヘテロシクリレンからなる群より選択されるが、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、場合によってはアリーレン、ヘテロアリーレンまたはヘテロシクリレンによって分断されるか末端封止されているか、また、場合によっては 1 個もしくは複数の - O - 基によって分断されているかよく；

Y' は、以下：

- O - 、

- S (O)₀₋₂ - 、

- S (O)₂ - N (R₈) - 、

- C (R₆) - 、

- C (R₆) - O - 、

- O - C (R₆) - 、

- O - C (O) - O - 、

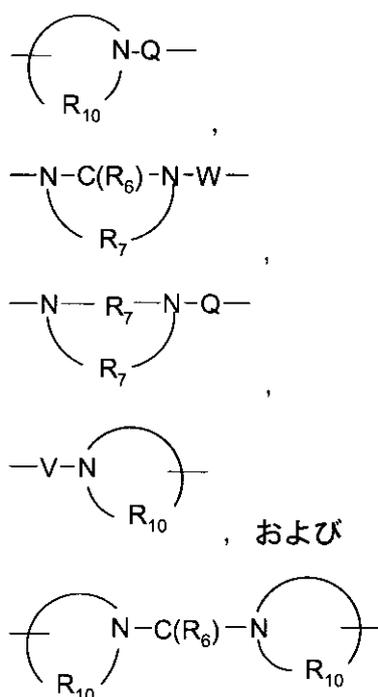
- N (R₈) - Q - 、

- C (R₆) - N (R₈) - 、

- O - C (R₆) - N (R₈) - 、

- C (R₆) - N (O R₉) - 、および

【化 3 4】



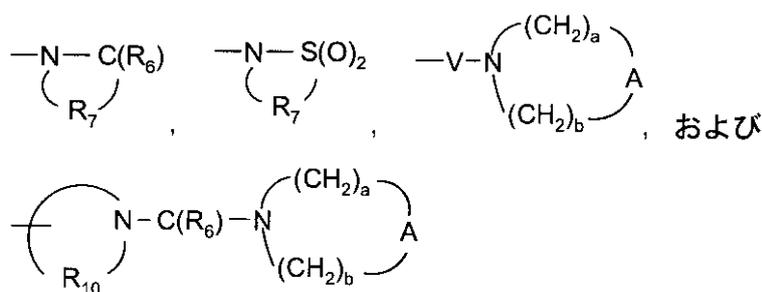
からなる群より選択され；

Z' は、単結合または - O - であり；

R_4 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリルからなる群より選択されるが、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、アルキルヘテロアリーレニル、およびヘテロシクリル基は、非置換であっても、あるいは、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、およびアルキル、アルケニル、アルキニルおよびヘテロシクリルの場合には、オキソ、からなる群より独立して選択される 1 個または複数の置換基により置換されていてもよく；

R_5 は、以下：

【化 3 5】



からなる群より選択され

R₆は、=Oおよび=Sからなる群より選択され；

R₇は、C₂₋₇アルキレンであり；

R₈は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₁₋₁₀アルコキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヒドロキシ-C₁₋₁₀アルキレニル、ヘテロアリール-C₁₋₁₀アルキレニル、およびアリール-C₁₋₁₀アルキレニルからなる群より選択され；

R₉は、水素およびアルキルからなる群より選択され；

R₁₀は、C₃₋₈アルキレンであり；

Aは、-O-、-C(O)-、-S(O)₀₋₂-、-CH₂-、および-N(R₄)-からなる群より選択され；

Qは、単結合、-C(R₆)-、-C(R₆)-C(R₆)-、-S(O)₂-、-C(R₆)-N(R₈)-W-、-S(O)₂-N(R₈)-、-C(R₆)-O-、-C(R₆)-S-、および-C(R₆)-N(OR₉)-からなる群より選択され；

Vは、-C(R₆)-、-O-C(R₆)-、-N(R₈)-C(R₆)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；

Wは、単結合、-C(O)-、および-S(O)₂-からなる群より選択され；そして
aとbは独立して、1~6の整数であるが、ただしa+b≦7である。]

で表わされる化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

R_A、およびR_B、がいずれもメチルである、請求項 2 に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 7】

R_AおよびR_Bが、縮合アリール環または1個のNを含むヘテロアリール環を形成し、ここで前記アリール環またはヘテロアリール環が、非置換であるか、または、1個または複数のR基で置換されているか、または1個のR₃基で置換されているか、または1個のR₃基と1個のR基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 8】

R_AおよびR_Bが、場合によっては1個のNを含んでいてもよい、飽和5~7員縮合環を形成するが、ここで、その飽和環が、非置換であっても、あるいは1個または複数のR基によって置換されていてよい、請求項 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 9】

mが0である、請求項 3 または 5 に記載の化合物または塩。

【請求項 10】

n'が0である、請求項 3 ~ 5 のいずれか1項に記載の化合物または塩。

【請求項 11】

mおよびn'が共に0である、請求項 9 に記載の化合物または塩。

【請求項 12】

R₃が、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、5-(ヒドロキシメチル)ピリジ

ン - 3 - イル、および 2 - エトキシフェニルからなる群より選択される、請求項 4 もしくは 6、または請求項 3 または 5 に記載の化合物または塩。

【請求項 13】

R_2 が、以下：

水素、
アルキル、
アルケニル、
アリール、
ヘテロアリール、
ヘテロシクリル、
アルキレン - Y'' - アルキル、
アルキレン - Y'' - アリール、および

1 個または複数の置換基により置換されたアルキルまたはアルケニルからなる群より選択され、当該 1 個または複数の置換基は以下：

ヒドロキシ、
ハロゲン、
- $N(R_{11})_2$ 、
- $C(O) - C_{1-10}$ アルキル、
- $C(O) - O - C_{1-10}$ アルキル、
- $N(R_{11}) - C(O) - C_{1-10}$ アルキル、
アリール、
ヘテロアリール、
ヘテロシクリル、
- $C(O) -$ アリール、および
- $C(O) -$ ヘテロアリールからなる群より選択され；

ここで、

Y'' が、- O - または - $S(O)_{0-2}$ - であり；そして

R_{11} が、水素、 C_{1-10} アルキル、および C_{2-10} アルケニルからなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 14】

R_2 が、水素、ヒドロキシメチル、 C_{1-4} アルキル、および C_{1-4} アルキル - O - C_{1-4} アルキレニルからなる群より選択される、請求項 13 に記載の化合物または塩。

【請求項 15】

X が、- $(CH_2)_{1-6}$ 、- $CH_2C(CH_3)_2$ -、- $CH_2C(CH_3)_2CH_2$ -、- $(CH_2)_2OCH_2$ -、および - $(CH_2)_3OCH_2$ - からなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 16】

R_{1-1} が、水素、 C_{1-4} アルキル、およびフェニルからなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 17】

R_{1-2} が、水素、 C_{1-4} アルキル、ベンジル、およびピリジン - 2 - イルメチルからなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

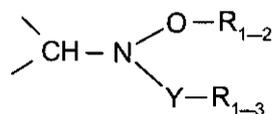
【請求項 18】

Z が、- $C(=N - O - R_{1-2})$ - である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 19】

Z が

【化 3 6】



である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 2 0】

R_{1-3} が、水素、 C_{1-6} アルキル、1 - ピロリジニル、フェニル、2 - クロロフェニル、3 - クロロフェニル、4 - クロロフェニル、*o* - トリル、*m* - トリル、*p* - トリル、およびピリジン - 3 - イルからなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 2 1】

Y が、

- C (O) - 、
- C (O) - O - 、
- S (O)₂ - 、
- C (O) - N (R₈) - 、および
- C (S) - N (R₈) -

からなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩。

【請求項 2 2】

R_8 が、H または CH_3 である、請求項 2 1 に記載の化合物または塩。

【請求項 2 3】

薬学的に許容される担体と組み合わせて、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩の治療有効量を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物または塩を含む、動物においてサイトカイン合成を誘導するための医薬組成物。