

【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28年9月1日(2016.9.1)

【公表番号】特表2015-526411(P2015-526411A)

【公表日】平成27年9月10日(2015.9.10)

【年通号数】公開・登録公報2015-057

【出願番号】特願2015-521942(P2015-521942)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/64 (2006.01)

C 0 7 D 239/36 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/4412 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/64 C S P

C 0 7 D 239/36

C 0 7 D 498/04 1 1 2 Q

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 413/10
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/4412
 A 6 1 K 31/513
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/5383
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成28年7月13日(2016.7.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

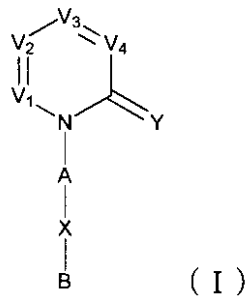
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



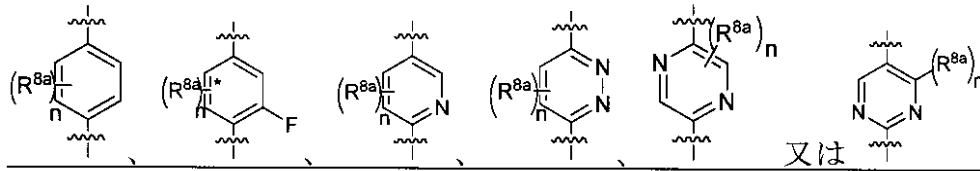
【式中、 V_1 は CR^1 であり、 V_2 は N であり、 V_3 は CR^3 であり、 V_4 は CR^4 であり、

X は一つの結合、 NR^5 、 C_{1-10} アルキレン、 C_{2-10} アルケニレン、又は C_{2-10} アルキニレンであり、

Y は O 又は S であり、

A は、

【化 1 - 2】



であり、

ここで、各 n は、独立に、0、1、2 又は 3 であり、

各 R^{8a} は、独立に、H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $R^{7a}R^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7NR^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^{7a}$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^{7a})-$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、

B は $-NR^7R^{7a}$ 、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} 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、縮合ピシクリル、縮合ヘテロピシクリル、スピロピシクリル、又はスピロヘテロピシクリルであり、ここで、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} 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、縮合ピシクリル、縮合ヘテロピシクリル、スピロピシクリル、及びスピロヘテロピシクリルの各々は、少なくとも一つの置換基で置換されていてもよく、ここで、当該置換基は、ハロアルキル、オキシ(=O)、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} アルキルチオ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシであり、ここで、 $-NR^7R^{7a}$ は、少なくとも一つの置換基で置換されていてもよく、ここで、当該置換基は、ハロアルキル、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} アルキルチオ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシであり、

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、脂肪族、ハロアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アミノアルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキルオキシ、アリールアルコキシ、アリールアルキルアミノ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルキルアミノ、アリールオキシアルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシアルコキシ、カルボシクリルオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アジドアルコキシ、ヘテロシクリル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール

、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリール脂肪族、ヘテロアリール脂肪族、アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又はシクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)N(R⁷)-、-OC(=O)N(R⁷)-、-OC(=O)-、-N(R⁷)C(=O)N(R⁷)-、-(R⁷)N-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は-OS(=O)_tN(R⁷)-であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、或いはアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、及びシクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - の各々は、少なくとも一つの置換基で置換されていてもよく、ここで、当該置換基は、ハロアルキル、オキソ(=O)、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、C₁₋₁₀アルコキシ、C₁₋₁₀アルキルアミノ、C₁₋₁₀アルキルチオ、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、メルカプト、ニトロ、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、C₂₋₁₀ヘテロシクリル、C₆₋₁₀アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルコキシ、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - C(=O)-、C₁₋₆アルキル - C(=O)-、C₁₋₆アルキル - S(=O)-、C₁₋₆アルキル - S(=O)₂-、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - S(=O)-、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - S(=O)₂-、又はカルボキシC₁₋₆アルコキシであり、

R³はH、F、Cl、I、シアノ、脂肪族、C₂₋₁₀ハロアルキル、アリール - C₂₋₁₀アルコキシ、ヘテロアリール - C₃₋₁₀アルコキシ、シクロアルキル - C₂₋₁₀アルコキシ、C₁₋₄ヘテロアリール、置換されたアリール、ヘテロシクリル、シクロアルキル、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、C₁₋₄ヘテロアリール脂肪族、ヘテロシクリルアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アミノアルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アリール - C₂₋₁₀アルコキシ、ヘテロシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、アリールオキシアルコキシ、アリールアミノアルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシアルコキシ、カルボシクリルオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、シクロアルキルオキシ、アジドアルコキシ、アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又はシクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)N(R⁷)-、-OC(=O)N(R⁷)-、-OC(=O)-、-N(R⁷)C(=O)N(R⁷)-、-(R⁷)N-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は-OS(=O)_tN(R⁷)-であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、或いは、アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、及びシクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - の各々は、一つの置換基で置換されていてもよく、ここで、当該置換基は、ハロアルキル、オキソ(=O)、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、C₁₋₁₀アルコキシ、C₁₋₁₀アルキルアミノ、C₁₋₁₀アルキルチオ、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、メルカプト、ニトロ、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、C₂₋₁₀ヘテロシクリル、C₆₋₁₀アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルコキシ、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - C(=O)-、C₁₋₆アルキル - C(=O)-、C₁₋₆アルキル - S(=O)-、C₁₋₆アルキル - S(=O)₂-、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - S(=O)-、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル - S(=O)₂-、又はカルボキシC₁₋₆アルコキシであり、

R⁴はHであり、

各 R⁵ は独立に H、脂肪族、ハロ脂肪族、ヒドロキシ脂肪族、アミノ脂肪族、アルコキシ脂肪族、アルキルアミノ脂肪族、アルキルチオ脂肪族、アリーール脂肪族、ヘテロアリーール脂肪族、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリーールオキシ脂肪族、ヘテロシクリルオキシ脂肪族、シクロアルキルオキシ脂肪族、アリーールアミノ脂肪族、ヘテロシクリルアミノ脂肪族、シクロアルキルアミノ脂肪族、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル又はカルボシクリルであり、

各 R⁷ は独立に H、脂肪族、ハロ脂肪族、ヒドロキシ脂肪族、アミノ脂肪族、アルコキシ脂肪族、アルキルアミノ脂肪族、アルキルチオ脂肪族、アリーール脂肪族、ヘテロアリーール脂肪族、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリーールオキシ脂肪族、ヘテロシクリルオキシ脂肪族、シクロアルキルオキシ脂肪族、アリーールアミノ脂肪族、ヘテロシクリルアミノ脂肪族、シクロアルキルアミノ脂肪族、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル又はカルボシクリルであり、及び、

各 R^{7a} は独立に、脂肪族、ハロ脂肪族、ヒドロキシ脂肪族、アミノ脂肪族、アルコキシ脂肪族、アルキルアミノ脂肪族、アルキルチオ脂肪族、アリーール脂肪族、ヘテロアリーール脂肪族、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリーールオキシ脂肪族、ヘテロシクリルオキシ脂肪族、シクロアルキルオキシ脂肪族、アリーールアミノ脂肪族、ヘテロシクリルアミノ脂肪族、シクロアルキルアミノ脂肪族、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル又はカルボシクリルであり、ただし、R⁷ 及び R^{7a} が同じ窒素原子と結合している場合、R⁷ 及び R^{7a} は、それらが結合している窒素原子と一緒に、任意に置換又は無置換の 3 - 8 員環、又は置換又は無置換のスピロビシクロ環又は縮合ビシクロ環を形成していてもよい]の化合物、又はその立体異性体、幾何異性体、互変異性体、N - オキシド、水和物、溶媒和物、代謝産物、薬学的に許容され得る塩又はプロドラッグ。

【請求項 2】

B は - NR⁷ R^{7a}、C₄₋₁₂ カルボシクリル、C₄₋₁₂ シクロアルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル、C₆₋₁₀ アリーール、C₁₋₉ ヘテロアリーール、C₅₋₁₂ 縮合ビシクリル、C₅₋₁₂ 縮合ヘテロビシクリル、C₅₋₁₂ スピロビシクリル、又は C₅₋₁₂ スピロヘテロビシクリルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ は H、F、Cl、Br、I、シアノ、C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆ アミノアルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ シクロアルキルオキシ、C₆₋₁₀ アリーール C₁₋₆ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリーール C₁₋₆ アルキルアミノ、C₁₋₉ ヘテロアリーール C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリーール C₁₋₆ アルキルアミノ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルキルアミノ、C₃₋₁₀ シクロアルキルアミノ、C₃₋₁₀ カルボシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ カルボシクリル C₁₋₆ アルキルアミノ、C₆₋₁₀ アリーールオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリーールオキシ、C₁₋₉ ヘテロアリーールオキシ、C₁₋₉ ヘテロアリーールオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ カルボシクリルオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルオキシ、C₁₋₆ アジドアルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル、C₃₋₁₀ シクロアルキル、C₆₋₁₀ アリーール、C₁₋₉ ヘテロアリーール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリーール C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリーール C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、C₁₋₉ ヘテロアリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又は C₃₋₁₀ シクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は -OS(=O)_tNH- であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独

立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 は H、F、Cl、I、シアノ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール - C_{3-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{1-4} ヘテロアリール、置換された C_{6-10} アリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-4} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{1-6} アジドアルコキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は -OS(=O)_tNH- であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R^4 は H であり、

各 R^5 は独立に H、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロ脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、 C_{1-6} アミノ脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、

各 R^7 は独立に H、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロ脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、 C_{1-6} アミノ脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、及び、

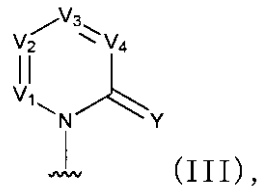
各 R^{7a} は独立に C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロ脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、

C₁₋₆ アミノ脂肪族、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルアミノC₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリールC₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリールC₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルC₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキルC₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリールオキシC₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルオキシC₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキルオキシC₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリールアミノC₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルアミノC₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキルアミノC₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又はC₃₋₁₀ カルボシクリルであり、ただし、R⁷ 及び R^{7a} が同じ窒素原子と結合している場合、R⁷ 及び R^{7a} は、それらに結合している窒素原子と一緒に、任意に置換又は無置換の3-8員環、又は置換又は無置換のC₅₋₁₂ スピロビシクロ環又はC₅₋₁₂ 縮合ビシクロ環を形成していてもよい請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

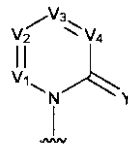
式(I)のN、V₁、V₂、V₃、V₄及びC(=Y)は式(III)

【化6】



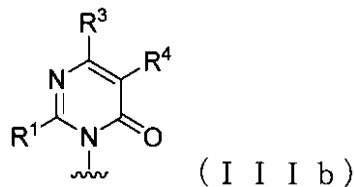
を有する基を規定し、

【化7】



は、

【化8】



であり、

各R¹はH、F、Cl、Br、I、シアノ、C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ ハロアルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆ アミノアルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノC₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ シクロアルキルオキシ、C₆₋₁₀ アリールC₁₋₆ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリールC₁₋₆ アルキルアミノ、C₁₋₉ ヘテロアリールC₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリールC₁₋₆ アルキルアミノ、C₃₋₁₀ シクロアルキルアミノ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルC₁₋₆ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリールオキシ、C₁₋₉ ヘテロアリールオキシ、C₁₋₉ ヘテロアリールオキシC₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル、C₃₋₁₀ シクロアルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルC₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキルC₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉

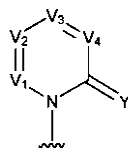
ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F 、 Cl 、 Br 、 I 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

各 R^3 は H 、 F 、 Cl 、 I 、シアノ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{2-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール - C_{3-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{2-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-4} ヘテロアリール、置換された C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、及び

各 R^4 は H である請求項 1 に記載の化合物。

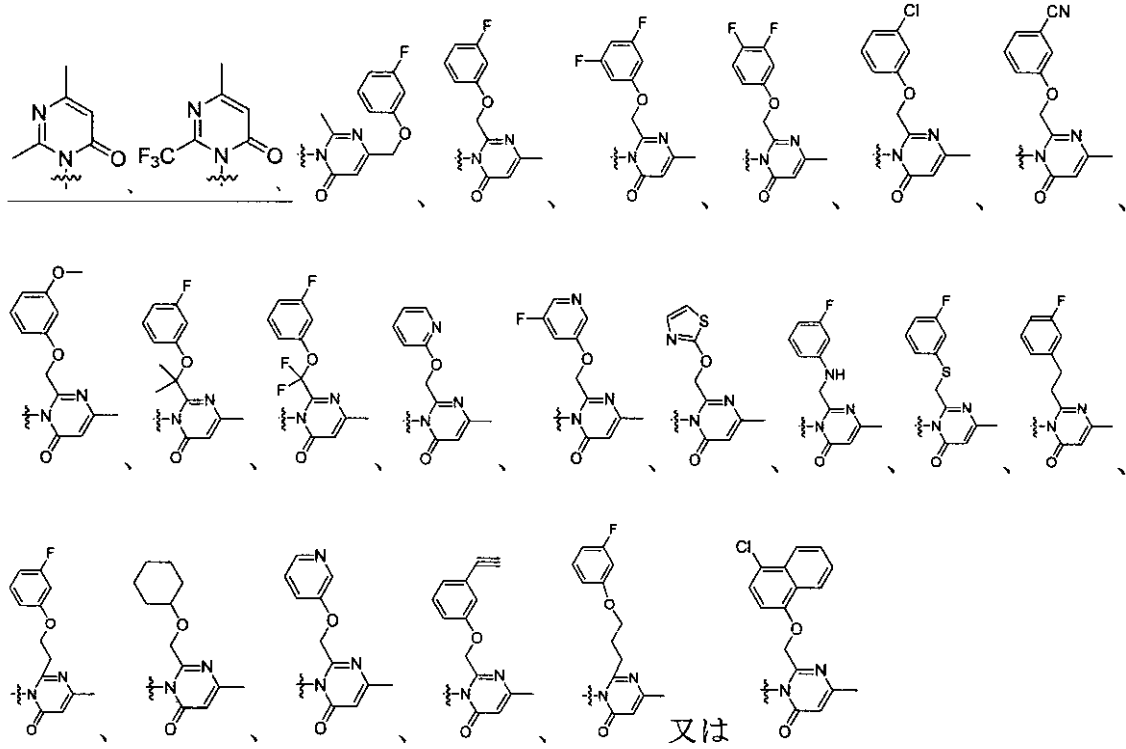
【請求項 5】

【化 9】



は、

【化10】

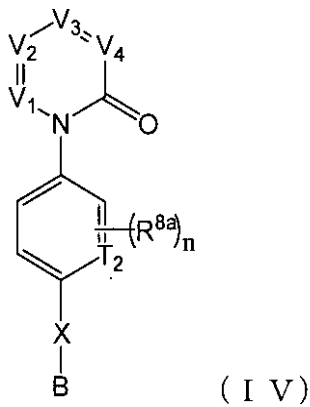


である請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

式(I V)：

【化13】



(I V)

を有し、

ただし、 V_1 は CR^1 であり、

V_2 は N であり、 V_3 は CR^3 であり、

V_4 は CR^4 であり、

T_2 は N 又は CR^{10} であり、

X は1つの結合、 NR^5 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-CH=CH-$ 、又は $-CH-CH-$ であり、ただし、各 m は0、1、2又は3であり、

B は $-NR^7R^{7a}$ 、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{5-12} 縮合ピシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル、又は C_{5-12} スピロヘテロピシクリルであり、ただし、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シ

クロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{5-12} 縮合ピシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル、及び C_{5-12} スピロヘテロピシクリルの各々は、任意にオキシ(=O)、ヒドロキシ、アミノ、ハロ、シアノ、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリーールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシで置換されていてもよく、

R^1 はH、F、Cl、Br、I、シアノ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{1-9} ヘテロアリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{2-10} ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又は C_{3-10} シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は-OS(=O)_tNH-であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、或いは C_{6-10} アリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{1-9} ヘテロアリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{2-10} ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、及び C_{3-10} シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-の各々は、1つ又はそれ以上のF、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 はH、F、Cl、I、シアノ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリーール-C₂₋₆アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール-C₃₋₆アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル-C₂₋₆アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-4} ヘテロアリーール、置換された C_{6-10} アリーール、 C_{1-4} ヘテロアリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール-C₂₋₁₀アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{1-9} ヘテロアリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{2-10} ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又は C_{3-10} シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)

NH -、 - OC(=O) -、 - NHC(=O)NH -、 - HN - S(=O)_t -、 - OS(=O)_t -、又は - OS(=O)_tNH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R⁴ は H であり、

各 R⁵ は独立に H、C₁₋₃ アルキル、C₁₋₃ ハロアルキル、C₁₋₃ ヒドロキシアルキル、C₁₋₃ アミノアルキル、C₁₋₃ アルコキシ C₁₋₃ アルキル、C₁₋₃ アルキルアミノ C₁₋₃ アルキル、C₁₋₃ アルキルチオ C₁₋₃ アルキル、C₆₋₁₀ アリール C₁₋₃ アルキル、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₃ アルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₃ アルキル、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₃ アルキル、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、

各 R⁷ は独立に H、C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ ハロ脂肪族、C₁₋₆ ヒドロキシ脂肪族、C₁₋₆ アミノ脂肪族、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、

各 R^{7a} は独立に C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ ハロ脂肪族、C₁₋₆ ヒドロキシ脂肪族、C₁₋₆ アミノ脂肪族、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、ただし、R⁷ 及び R^{7a} が同じ窒素原子と結合している場合、R⁷ 及び R^{7a} は、それらと結合している窒素原子と一緒に、任意に置換又は無置換の 3 - 8 員環を形成していてもよく、

各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、-N(CH₃)₂、シアノ、ニトロ、メルカプト、C₁₋₄ アルキル、トリフルオロメチル、C₁₋₄ アルコキシ、C₁₋₄ アルキルアミノ、C₁₋₄ アルキルチオ、C₆₋₁₀ アリール、又は C₁₋₉ ヘテロアリールであり、

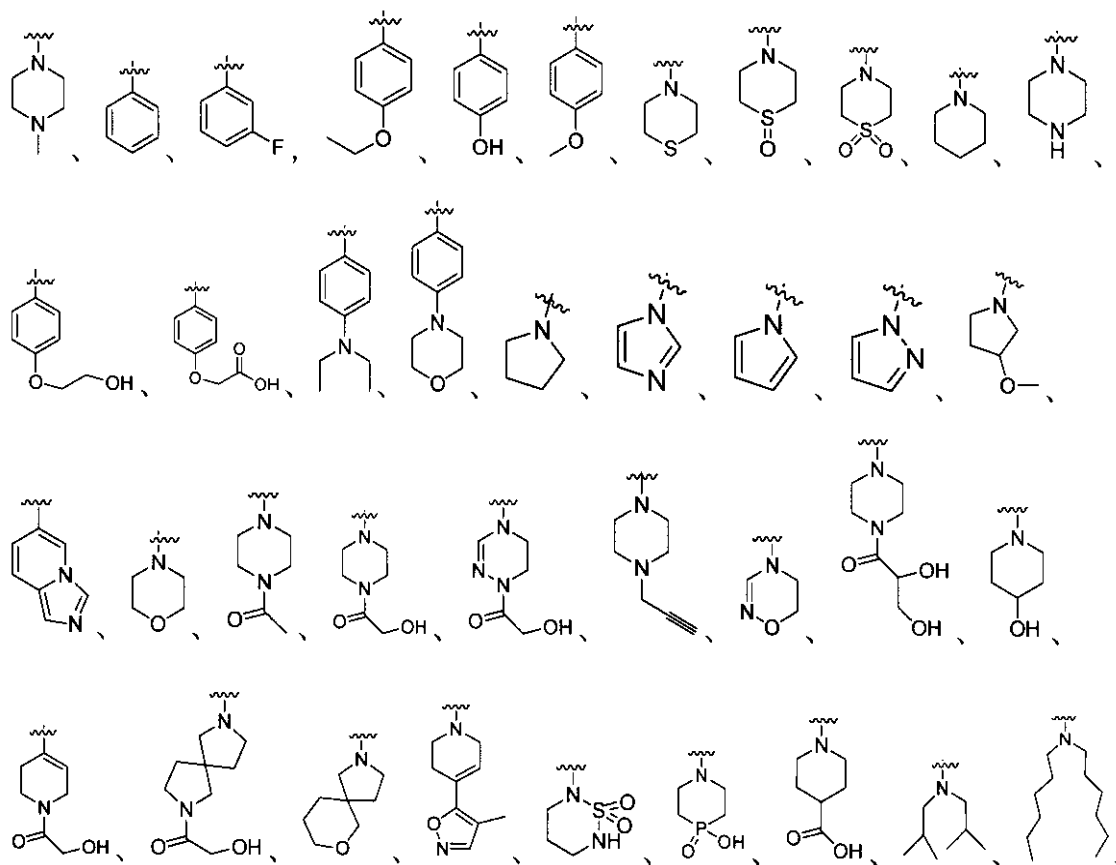
n は 0、1、2 又は 3 であり、及び

各 R¹⁰ は独立に H 又は F である請求項 1 記載の化合物。

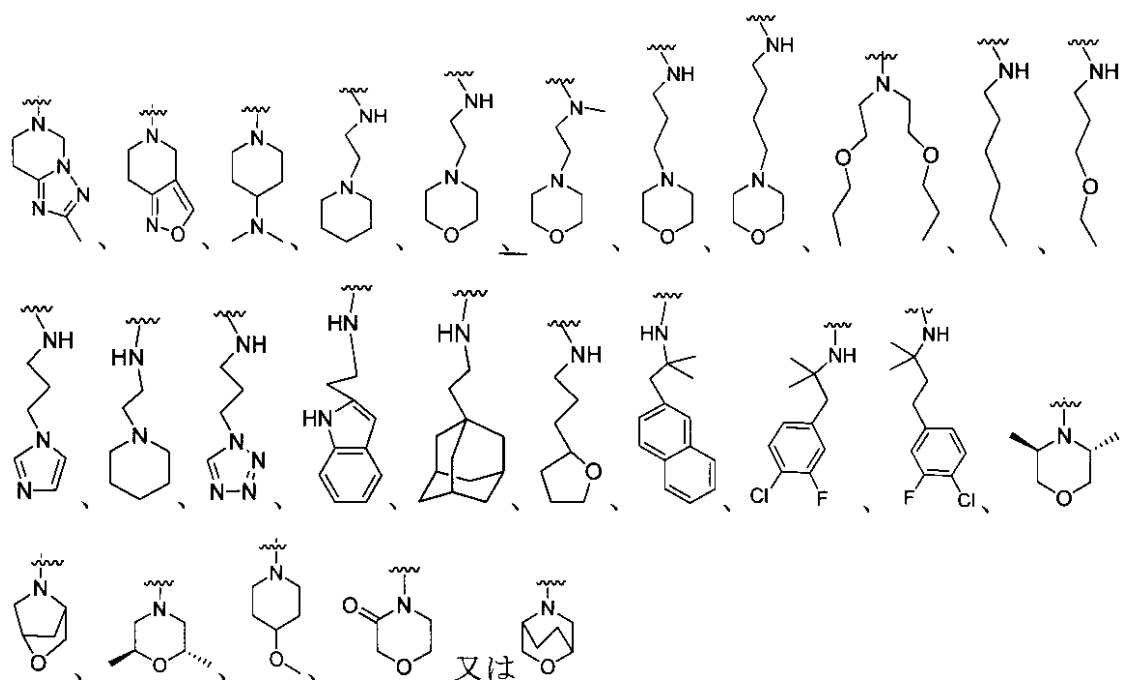
【請求項 7】

B は -N(CH₃)₂、-N(CH₂CH₃)₂、-N(CH₂CH₂CH₃)₂、-N(CH₂CH₂CH₂CH₃)₂、

【化 1 4 - 1】



【化 1 4 - 2】



であり、

R¹はH、F、Cl、Br、I、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、フェニル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、(フルオロ置換フェニル)-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、チアゾリル-(C

$H_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、ピリジル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、フェニルエチル、シクロヘキシル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、ナフチル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又はモルホリニル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いはフェニル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、(フルオロ置換フェニル) - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、チアゾリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、ピリジル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、フェニルエチル、シクロヘキシル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、ナフチル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、及びモルホリニル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 は H、F、Cl、I、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、フェニル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、(フルオロ置換フェニル) - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、チアゾリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又はモルホリニル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R^4 は H であり、

各 R^5 は独立に H、 C_{1-3} アルキル、フェニル、ベンジル、ピリジル又はモルホリノメチルであり、

各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $-N(CH_3)_2$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール C_{1-4} アルキル又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、

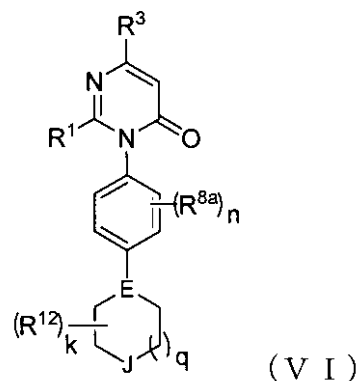
n は 0、1、2 又は 3 であり、及び

各 R^{10} は独立に H 又は F である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

式 (VI) :

【化 17】



を有し、

ただし、E は N 又は CR^{10} であり、

J は O、S、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 NR^{13} 又は $CR^{14}R^{14a}$ であり、

k は 0、1、2、3 又は 4 であり、

q は 0、1 又は 2 であり、

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキル、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 は H、F、Cl、I、シアノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、

各 R^5 は独立に H、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{1-3} ヒドロキシアルキル、 C_{1-3} アミノアルキル、 C_{1-3} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} アルキル、 C_{6-10} アリール C_{1-3} アルキル、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-3} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、

各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $-N(CH_3)_2$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、

n は 0、1、2 又は 3 であり、

R^{10} は独立に H 又は F であり、

各 R^{12} はオキソ $(=O)$ 、ヒドロキシ、アミノ、ハロ、シアノ、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} アルキルチオ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $C(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $C(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2-$ 、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $S(=O)-$ 、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2-$ 、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシであり、

R^{13} は H、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} カルボキシアルコキシ、 C_{1-4} アルキルカルボニル又はヒドロキシ置換 C_{1-4} アルキルカルボニルであり、及び

各 R^{14} 及び R^{14a} は独立に H、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又は C_{1-6} アルキルアミノである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

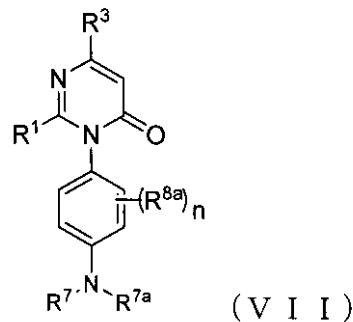
R^1 は独立に H、F、Cl、Br、I、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、 C_{6-8} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 又は C_{4-6} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は NR^5 、O 又は S であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、或いは C_{6-8} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 及び C_{4-6} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 は独立に H、F、Cl、I、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、 C_{6-8} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 又は C_{4-6} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 又は S であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

式 (VII) :

【化 18】



を有し、

ただし、 R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、シアノ、エチニル、メトキシ、エトキシ又はプロピニルで任意に置換されていてもよく、

R^3 は H、F、Cl、I、シアノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、

各 R^5 は独立に H、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{1-3} ヒドロキシアルキル、 C_{1-3} アミノアルキル、 C_{1-3} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキルチオ C_{1-3} アルキル、 C_{6-10} アリ

ール C₁₋₃ アルキル、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₃ アルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₃ アルキル、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₃ アルキル、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、

各 R⁷ は独立に H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロ脂肪族、C₁₋₆ ヒドロキシ脂肪族、C₁₋₆ アミノ脂肪族、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、

各 R^{7a} は独立に C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロ脂肪族、C₁₋₆ ヒドロキシ脂肪族、C₁₋₆ アミノ脂肪族、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₉ ヘテロアリール C₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₉ ヘテロアリール、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル又は C₃₋₁₀ カルボシクリルであり、

R⁷ 及び R^{7a} が同じ窒素原子に結合している場合、R⁷ 及び R^{7a} はそれらが結合している窒素原子と一緒に、任意に、置換又は無置換の 3 - 8 員環を形成していてもよく、

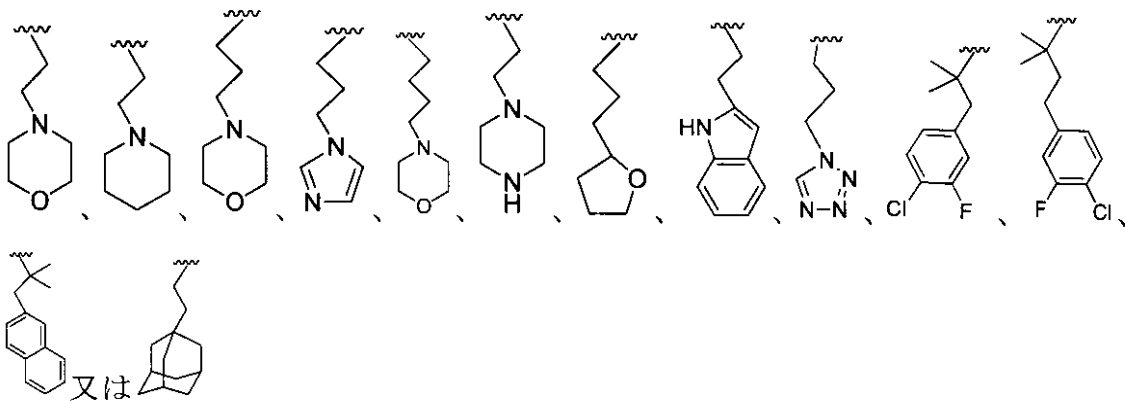
各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、-N(CH₃)₂、シアノ、ニトロ、メルカプト、C₁₋₄ アルキル、トリフルオロメチル、C₁₋₄ アルコキシ、C₁₋₄ アルキルアミノ、C₁₋₄ アルキルチオ、C₆₋₁₀ アリール又は C₁₋₉ ヘテロアリールであり、及び

n は 0、1、2 又は 3 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

各 R⁷ は独立に H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、

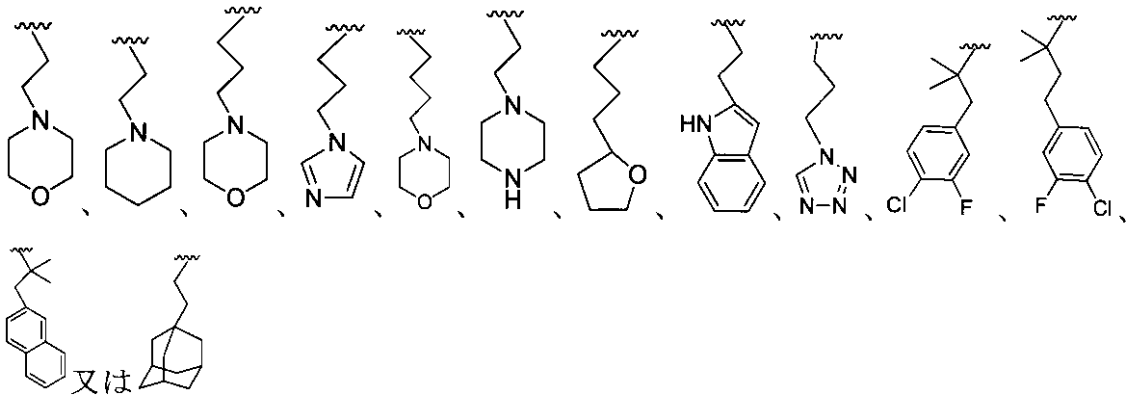
【化 19】



であり、

各 R^{7a} は独立に C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、

【化 2 0】

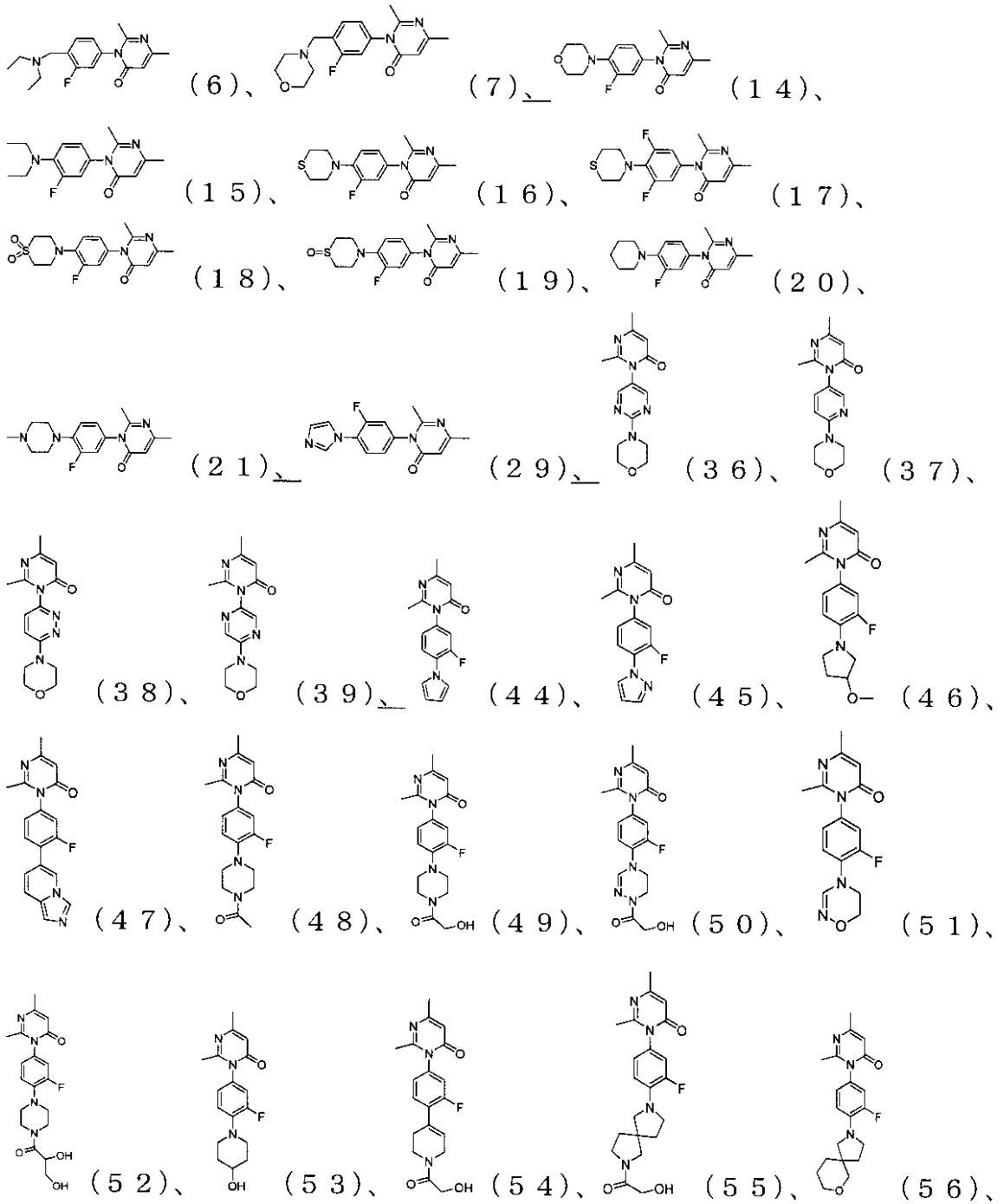


である請求項 1 0 に記載の化合物。

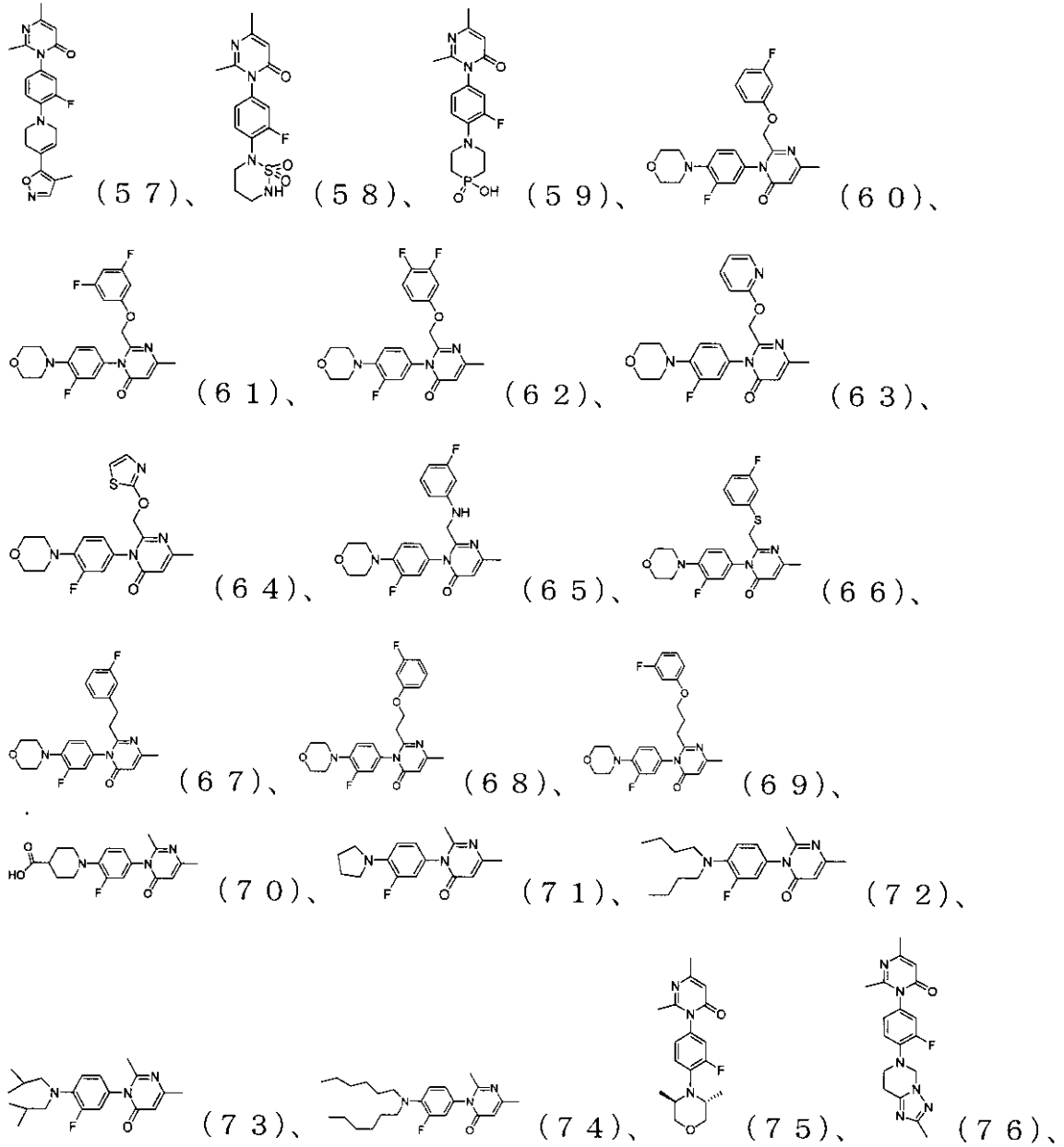
【請求項 1 2】

下記構造の一つを有する請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの立体異性体、幾何異性体、互変異性体、N - オキシド、水和物、溶媒和物、若しくは薬学的に許容され得る塩。

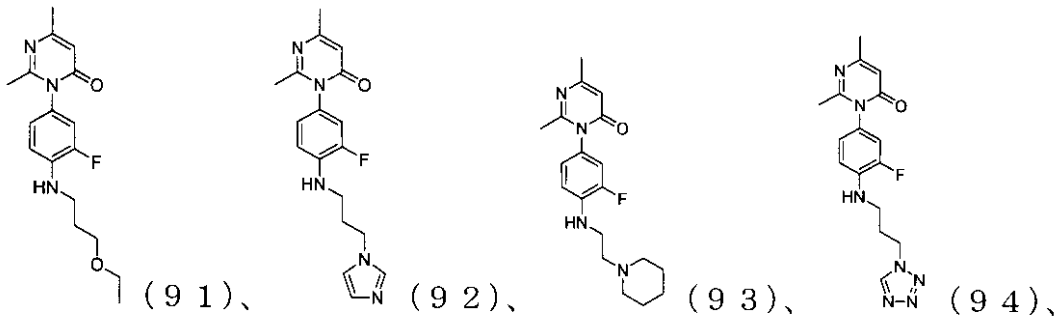
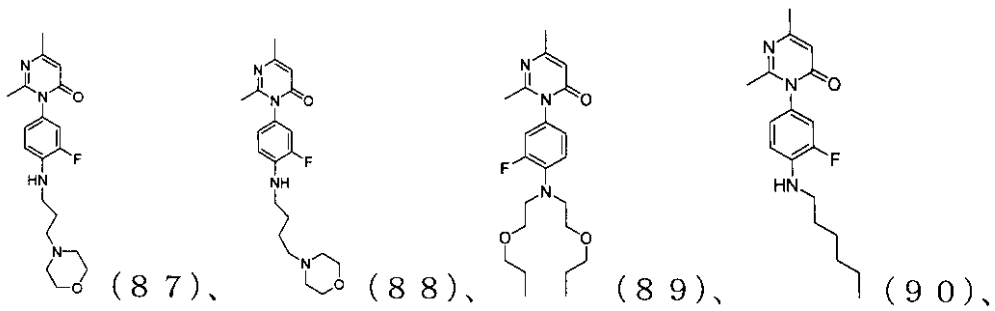
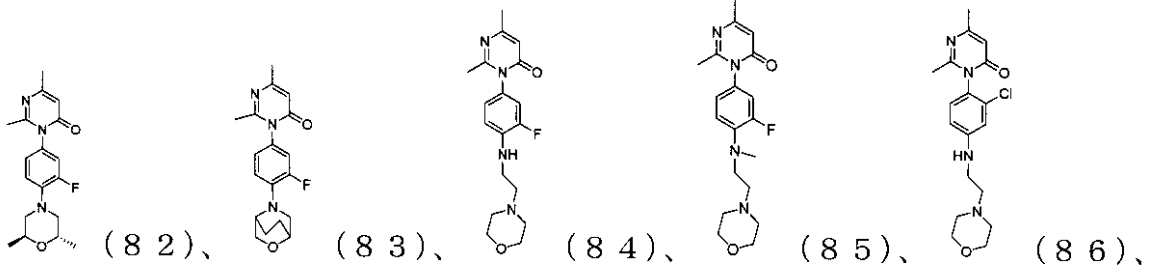
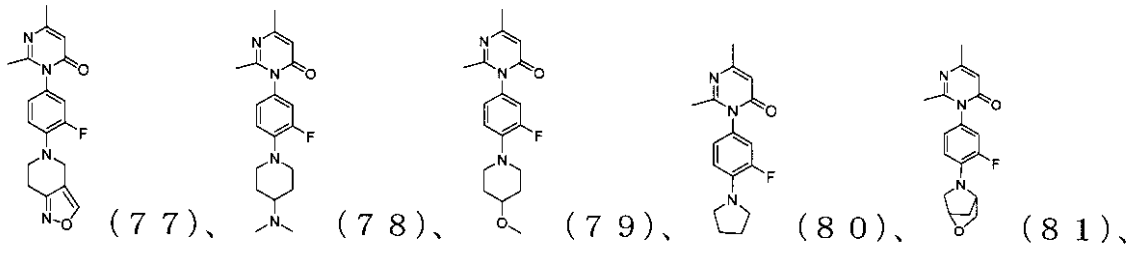
【化 2 1 - 1】



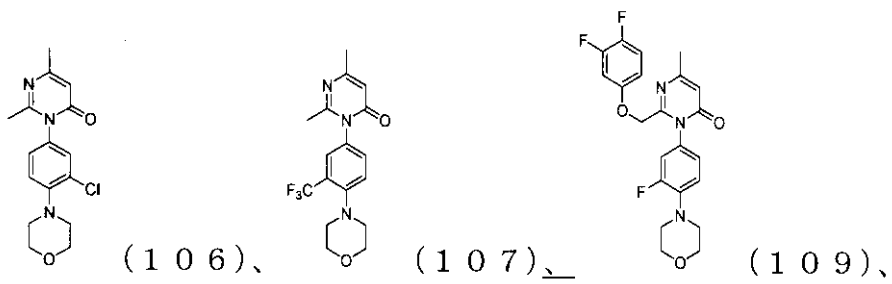
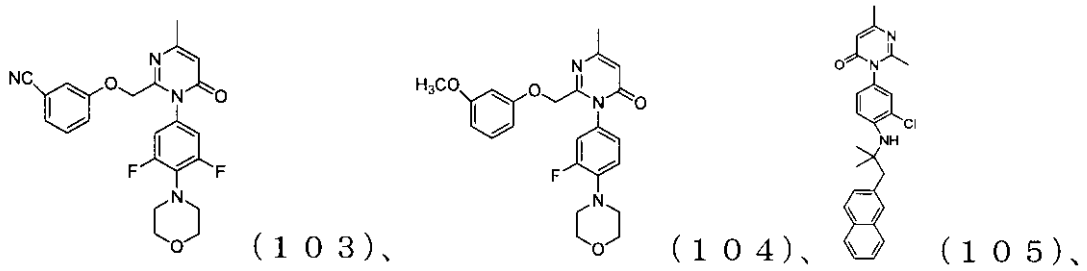
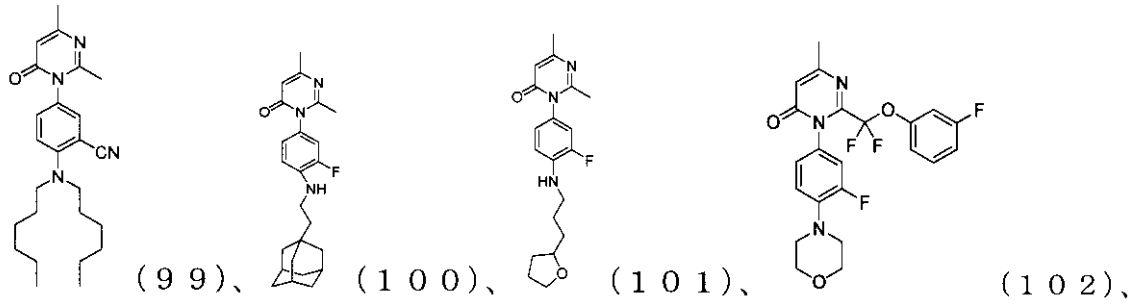
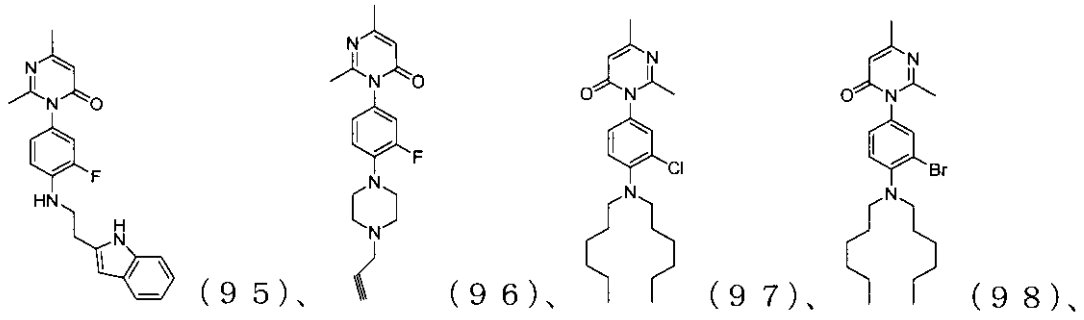
【化 2 1 - 2】



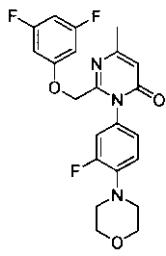
【化 2 1 - 3】



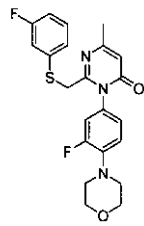
【化 2 1 - 4】



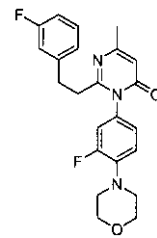
【化 2 1 - 5】



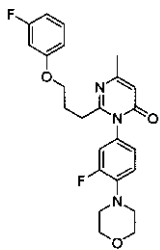
(110)、



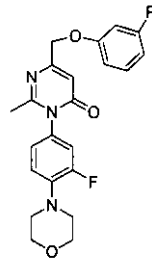
(111)、



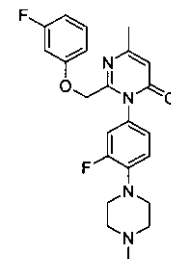
(112)、



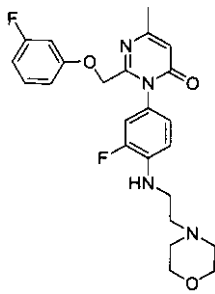
(113)、



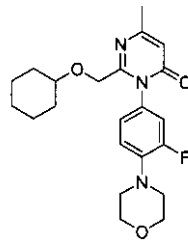
(114)、



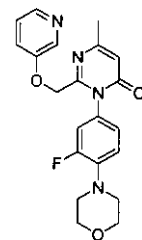
(115)、



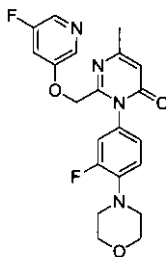
(117)、



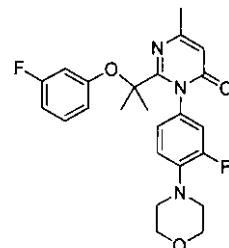
(118)、



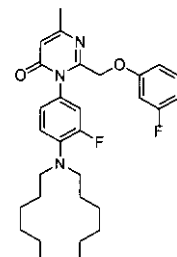
(119)、



(120)、

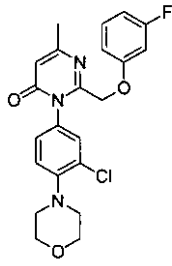


(121)、

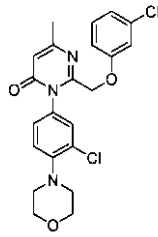


(122)、

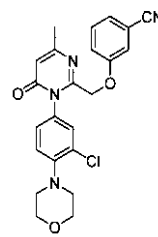
【化 2 1 - 6】



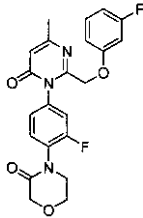
(123)、



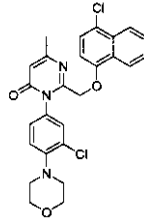
(124)、



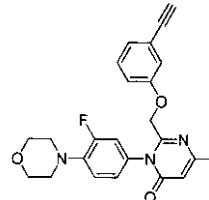
(125)、



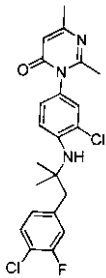
(126)、



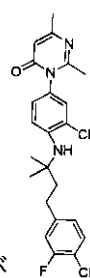
(127)、



(128)、



(131)、及び



(132)。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物、及び薬学的に許容され得る担体、賦形剤、希釈剤、アジュバント、ビヒクル、又はそれらの組み合わせを有効量で含む抗線維化医薬組成物。

【請求項 1 4】

患者における組織又は器官の線維化疾患を予防、処置、治療又はその重症度を軽減する医薬品の用途に用いられる請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記組織又は器官の線維化疾患が、腎間質線維化、糸球体硬化、肝線維化、肺線維化、腹膜線維化、心筋線維化、皮膚線維化、術後癒着、良性前立腺過形成、骨格筋線維化、強皮症、多発性硬化症、膵臓線維化、肝硬変、筋肉腫、神経線維腫、肺間質線維化、糖尿病性腎症、アルツハイマー病又は血管線維化疾患であり、

前記術後癒着が癒着治療である請求項 1 4 に記載の化合物又は医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 2 4 6

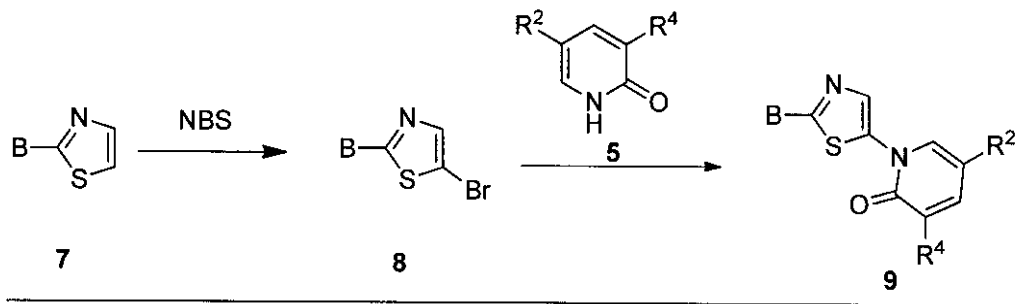
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 2 4 6】

反応スキーム 3

【化 4 7】



【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0659

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0659】

PFDとの比率（倍数）：当該化合物 IC₅₀ からのピルフェニドン IC₅₀ の比率がある：倍数が大きいほど、化合物の阻害活性が高い。

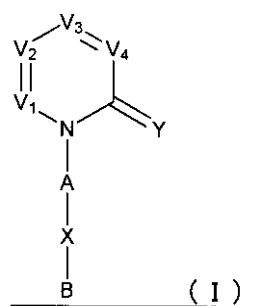
臓器線維化の共通の特徴は、細胞外マトリックス（ECM）の拡大と、臓器および組織の構造リモデリングであり、そこにおいて、多くのサイトカイン（CK）がそのプロセスに関与する。インビトロでの実験的なスクリーニングにおいて、ここに開示された化合物がピルフェンドよりも高い活性があること、一部の化合物はピルフェニドンの20倍以上であることが示された。ここに開示された化合物はピルフェニドンにより引き起こされる光毒性反応を回避することができ、それは抗線維化に有効である。

以下に、本願出願の当初の特許請求の範囲に記載された発明を付記する。

[1]

式 (I) :

【化 1 2 3】



[式中、V₁ は N 又は CR¹ であり、V₂ は N 又は CR² であり、V₃ は N 又は CR³ であり、V₄ は N 又は CR⁴ であり、ただし、V₁、V₂、V₃ 及び V₄ は多くとも一つが N であり、

X は一つの結合、NR⁵、O、S、C₁₋₁₀ アルキレン、C₂₋₁₀ アルケニレン、C₂₋₁₀ アルキニレン、-R⁶-C(=Y)-、-R⁶-C(=Y)-O-、-R⁶-C(=Y)-N(R⁵)-、-R⁶-S(=O)_t-、-R⁶-S(=O)_t-N(R⁷)-、又は -R⁶-Y- であり、ただし、各 t は 1 又は 2 であり、

Y は O 又は S であり、

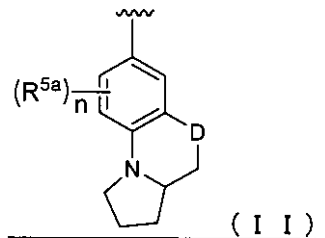
A は、ヘテロシクリレン、カルボシクリレン、縮合ピシクリレン、縮合ヘテロピシクリレン、スピロピシクリレン、スピロヘテロピシクリレン、アリーレン又はヘテロアリーレ

ンであり、

Bはアルコキシ、ヒドロキシ置換アルコキシ、 $-NR^7R^{7a}$ 、 $-C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^{7a}$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_+$ 、 $R^7S(=O)_+$ 、 $R^7-S(=O)_+$ 、 $-N(R^{7a})-$ 、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} 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、縮合ビシクリル、縮合ヘテロビシクリル、スピロビシクリル、又はスピロヘテロビシクリルであり、

又はA、X及びBは一緒になって式(I I)：

【化124】



を有する基を形成し、

ただし、Dは NR^5 、O、S、又は CR^7R^{7a} であり、

R^1 はH、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $R^{7a}R^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^{7a}$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_+$ 、 $R^7S(=O)_+$ 、 $R^7S(=O)_+N(R^{7a})-$ 、 $R^{7a}R^7N-$ アルキル、 $R^7S(=O)_+$ アルキル、 $R^7R^{7a}N-C(=O)$ アルキル、 $R^{7a}R^7N-$ アルコキシ、 $R^7S(=O)_+$ アルコキシ、 $R^7R^{7a}N-C(=O)$ アルコキシ、脂肪族、ハロアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、ハロアルコキシ、アミノ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、ヒドロキシ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、シクロアルキルオキシ、アリールアルコキシ、アリールアルキルアミノ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルキルアミノ、ヘテロシクリル(ヒドロキシアルコキシ)、カルボシクリル(ヒドロキシアルコキシ)、アリール(ヒドロキシアルコキシ)、アリールオキシアルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシアルコキシ、カルボシクリルオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アジドアルコキシ、縮合ビシクリル、縮合ヘテロビシクリル、縮合ビシクリル脂肪族、縮合ヘテロビシクリル脂肪族、縮合ビシクロキシ、縮合ヘテロビシクロキシ、縮合ビシクリルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアミノ、縮合ビシクリルアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアルコキシ、縮合ビシクリルアルキルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアルキルアミノ、縮合ビシクロキシアルコキシ、縮合ヘテロビシクロキシアルコキシ、縮合ビシクリルアミノアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアミノアルコキシ、縮合ビシクリル $-C(=O)-$ 、縮合ビシクリル $-C(=O)O-$ 、縮合ヘテロビシクリル $-C(=O)-$ 、縮合ヘテロビシクリル $-C(=O)O-$ 、縮合ビシクリルアミノ $-C(=O)-$ 、縮合ヘテロビシクリルアミノ $-C(=O)-$ 、縮合ビシクリル $-C(=O)N(R^7)-$ 、縮合ヘテロビシクリル $-C(=O)N(R^7)-$ 、スピロビシクリル、スピロヘテロビシクリル、スピロビシクリル脂肪族、スピロヘテロビシクリル脂肪族、スピロビシクロキシ、スピロヘテロビシクロキシ、スピロビシクリルアミノ、スピロヘテロビシクリルアミノ、スピロビシクリルアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアルコキシ、スピロビシクリルアルキルアミノ、スピロヘテロビシクリルアルキルアミノ、ス

ピロピシクロキシャルコキシ、スピロヘテロピシクロキシャルコキシ、スピロピシクリル
 アミノアルコキシ、スピロヘテロピシクリルアミノアルコキシ、スピロピシクリル - C (= O) -
 、スピロピシクリル - C (= O) O - 、スピロヘテロピシクリル - C (= O) -
 、スピロヘテロピシクリル - C (= O) O - 、スピロピシクリルアミノ - C (= O) - 、
 スピロヘテロピシクリルアミノ - C (= O) - 、スピロピシクリル - C (= O) N (R ⁷)
) - 、スピロヘテロピシクリル - C (= O) N (R ⁷) - 、ヘテロシクリル、シクロアル
 キル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリ
 ール脂肪族、ヘテロアリール脂肪族、アリール - (CH ₂) _p - G - (CH ₂) _m - 、ヘ
 テロアリール - (CH ₂) _p - G - (CH ₂) _m - 、ヘテロシクリル - (CH ₂) _p - G
 - (CH ₂) _m - 、又はシクロアルキル - (CH ₂) _p - G - (CH ₂) _m - であり、た
 だし、各 G は O 、 S 、 NR ⁵ 、 S (= O) 、 S (= O) ₂ 、 C (= O) 、 - C (= O) N
 (R ⁷) - 、 - OC (= O) N (R ⁷) - 、 - OC (= O) - 、 - N (R ⁷) C (= O)
 N (R ⁷) - 、 - (R ⁷) N - S (= O) _t - 、 - OS (= O) _t - 、又は - OS (= O
) _t N (R ⁷) - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0 、 1 、 2 、 3 又
 は 4 であり、或いは C ₆₋₁₀ アリール - (CH ₂) _p - G - (CH ₂) _m - 、 C ₁₋₉
 ヘテロアリール - (CH ₂) _p - G - (CH ₂) _m - 、 C ₂₋₁₀ ヘテロシクリル - (C
 H ₂) _p - G - (CH ₂) _m - 、及び C ₃₋₁₀ シクロアルキル - (CH ₂) _p - G - (C
 H ₂) _m - は 1 つ又はそれ以上の F 、 Cl 、 Br 、 I 、 C ₁₋₆ アルキル、C ₂₋₆ ア
 ルキニル、C ₁₋₆ アルコキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、
 R ² は H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、シアノ、ヒドロキシ、R ^{7 a} R ⁷ N - 、 - C (= O)
 NR ⁷ R ^{7 a} 、 - OC (= O) NR ⁷ R ^{7 a} 、 - OC (= O) OR ⁷ 、 - N (R ⁷) C (= O) NR ⁷ R ^{7 a} 、
 - N (R ⁷) C (= O) OR ^{7 a} 、 - N (R ⁷) C (= O) - R ^{7 a} 、 R ⁷ R ^{7 a} N - S (= O) _t - 、
 R ⁷ S (= O) _t - 、 R ⁷ S (= O) _t N (R ^{7 a}) - 、 R ^{7 a} R ⁷ N - アルキル、
 R ⁷ S (= O) _t - アルキル、R ⁷ R ^{7 a} N - C (= O) - アルキル、R ^{7 a} R ⁷ N - アルコキシ、
 R ⁷ S (= O) _t - アルコキシ、R ⁷ R ^{7 a} N - C (= O) - アルコキシ、脂肪族、ハロアルキル、
 アルコキシ、ヒドロキシャルコキシ、アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、
 ハロアルコキシ、アミノ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、ヒドロキシ置換
 ハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アリールアルコキシ、
 アリールアルキルアミノ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロアリールアルキルアミノ、
 ヘテロシクリルアルキルアミノ、シクロアルキルオキシ、シクロアルキルアミノ、ヘテロシクリル
 アルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルキルアミノ、ヘテロシクリル
 (ヒドロキシャルコキシ) 、カルボシクリル (ヒドロキシャルコキシ) 、アリール (ヒドロキシ
 アルコキシ) 、アリールオキシャルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘ
 テロアリールオキシャルコキシ、ヘテロシクリルオキシャルコキシ、カルボシクリルオキ
 シアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アジドアルコキシ、縮合ピシクリル、縮合ヘテロ
 ピシクリル、縮合ピシクリル脂肪族、縮合ヘテロピシクリル脂肪族、縮合ピシクロキシ、
 縮合ヘテロピシクロキシ、縮合ピシクリルアミノ、縮合ヘテロピシクリルアミノ、縮合ピ
 シクリルアルコキシ、縮合ヘテロピシクリルアルコキシ、縮合ピシクリルアルキルアミノ
 、縮合ヘテロピシクリルアルキルアミノ、縮合ピシクロキシャルコキシ、縮合ヘテロピシ
 クロキシャルコキシ、縮合ピシクリルアミノアルコキシ、縮合ヘテロピシクリルアミノア
 ルコキシ、縮合ピシクリル - C (= O) - 、縮合ピシクリル - C (= O) O - 、縮合ヘテ
 ロピシクリル - C (= O) - 、縮合ヘテロピシクリル - C (= O) O - 、縮合ピシクリル
 アミノ - C (= O) - 、縮合ヘテロピシクリルアミノ - C (= O) - 、縮合ピシクリル -
 C (= O) N (R ⁷) - 、縮合ヘテロピシクリル - C (= O) N (R ⁷) - 、スピロピシ
 クリル、スピロヘテロピシクリル、スピロピシクリル脂肪族、スピロヘテロピシクリル脂
 肪族、スピロピシクロキシ、スピロヘテロピシクロキシ、スピロピシクリルアミノ、スピ
 ロヘテロピシクリルアミノ、スピロピシクリルアルコキシ、スピロヘテロピシクリルアル
 コキシ、スピロピシクリルアルキルアミノ、スピロヘテロピシクリルアルキルアミノ、ス
 ピロピシクロキシャルコキシ、スピロヘテロピシクロキシャルコキシ、スピロピシクリル

アミノアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアミノアルコキシ、スピロビシクリル - C (= O) - 、スピロビシクリル - C (= O) O - 、スピロヘテロビシクリル - C (= O) - 、スピロヘテロビシクリル - C (= O) O - 、スピロビシクリルアミノ - C (= O) - 、スピロヘテロビシクリルアミノ - C (= O) - 、スピロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、スピロヘテロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、ヘテロシクリル、シクロアルキル、アリール、C₁₋₄ヘテロアリール、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリール脂肪族、ヘテロアリール脂肪族、アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 、ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 、ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 、又はシクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S (= O)、S (= O)₂、C (= O)、- C (= O) N (R⁷) - 、- OC (= O) N (R⁷) - 、- OC (= O) - 、- N (R⁷) C (= O) N (R⁷) - 、- (R⁷) N - S (= O)_t - 、- OS (= O)_t - 、又は - OS (= O)_t N (R⁷) - であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、

R³はH、F、Cl、I、シアノ、R^{7a}R⁷N - 、- C (= O) NR⁷R^{7a}、- OC (= O) NR⁷R^{7a}、- OC (= O) OR⁷、- N (R⁷) C (= O) NR⁷R^{7a}、- N (R⁷) C (= O) OR^{7a}、- N (R⁷) C (= O) - R^{7a}、R⁷R^{7a}N - S (= O)_t - 、R⁷S (= O)_t - 、R⁷S (= O)_tN (R^{7a}) - 、R^{7a}R⁷N - アルキル、R⁷S (= O)_t - アルキル、R⁷R^{7a}N - C (= O) - アルキル、R^{7a}R⁷N - アルコキシ、R⁷S (= O)_t - アルコキシ、R⁷R^{7a}N - C (= O) - アルコキシ、脂肪族、C₂₋₁₀ハロアルキル、アリール - C₂₋₁₀アルコキシ、ヘテロアリール - C₃₋₁₀アルコキシ、シクロアルキル - C₂₋₁₀アルコキシ、縮合ビシクリル - C₂₋₁₀アルコキシ、C₁₋₄ヘテロアリール、置換されたアリール、ヘテロシクリル、シクロアルキル、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、C₁₋₄ヘテロアリール脂肪族、置換されたアリールC₃₋₁₀アルキル、ヘテロシクリルアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、ハロアルコキシ、アミノ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、ヒドロキシ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アリール - C₂₋₁₀アルコキシ、ヘテロシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、ヘテロシクリル (ヒドロキシアルコキシ)、カルボシクリル (ヒドロキシアルコキシ)、アリール (ヒドロキシアルコキシ)、アリールオキシアルコキシ、アリールアミノアルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシアルコキシ、カルボシクリルオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、シクロアルキルオキシ、アジドアルコキシ、縮合ビシクリル、縮合ヘテロビシクリル、縮合ビシクリル脂肪族、縮合ヘテロビシクリル脂肪族、縮合ビシクロキシ、縮合ヘテロビシクロキシ、縮合ビシクリルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアミノ、縮合ビシクリルアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアルコキシ、縮合ビシクリルアルキルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアルキルアミノ、縮合ビシクロキシアルコキシ、縮合ヘテロビシクロキシアルコキシ、縮合ビシクリルアミノアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアミノアルコキシ、縮合ビシクリル - C (= O) - 、縮合ビシクリル - C (= O) O - 、縮合ヘテロビシクリル - C (= O) - 、縮合ヘテロビシクリル - C (= O) O - 、縮合ビシクリルアミノ - C (= O) - 、縮合ヘテロビシクリルアミノ - C (= O) - 、縮合ビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、縮合ヘテロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、スピロビシクリル、スピロヘテロビシクリル、スピロビシクリル脂肪族、スピロヘテロビシクリル脂肪族、スピロビシクロキシ、スピロヘテロビシクロキシ、スピロビシクリルアミノ、スピロヘテロビシクリルアミノ、スピロビシクリルアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアルコキシ、スピロビシクリルアルキルアミノ、スピロヘテロビシクリルアルキルアミノ、スピロビシクロキシアルコキシ、スピロヘテロビシクロキシアルコキシ、スピロビシクリルアミノアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアミノアルコキシ、スピロビシクリル - C (= O) - 、スピロビシクリル - C (= O) O - 、スピロヘテロビシクリル - C (= O) - 、スピロヘテロビシクリル - C (= O)

$O-$ 、スピロビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、スピロヘテロビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、スピロビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、スピロヘテロビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、アリーール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロアリーール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロシクリル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、又はシクロアルキル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、各GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)N(R^7)-$ 、 $-OC(=O)N(R^7)-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-N(R^7)C(=O)N(R^7)-$ 、 $-(R^7)N-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tN(R^7)-$ であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、及び R^4 はH、F、I、シアノ、ヒドロキシ、 $R^7^aR^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^7^a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7^a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7^a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7^a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7^a$ 、 $R^7R^7^aN-S(=O)_t-$ 、 $R^7S(=O)_t-$ 、 $R^7S(=O)_tN(R^7^a)-$ 、 $R^7^aR^7N-$ アルキル、 $R^7S(=O)_t-$ アルキル、 $R^7R^7^aN-C(=O)-$ アルキル、 $R^7^aR^7N-$ アルコキシ、 $R^7S(=O)_t-$ アルコキシ、 $R^7R^7^aN-C(=O)-$ アルコキシ、脂肪族、ハロアルキル、 C_{2-10} アルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、ハロアルコキシ、アミノ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノハロアルコキシ、ヒドロキシ置換ハロアルコキシ、アルキルアミノアルコキシ、アルコキシアルコキシ、 C_{3-5} シクロアルキルオキシ、アリーールアルコキシ、ヘテロアリーールアルコキシ、ヘテロアリーールアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルキルアミノ、 C_{7-10} シクロアルコキシ、シクロアルキルアミノ、ヘテロシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルコキシ、カルボシクリルアルキルアミノ、ヘテロシクリル(ヒドロキシアルコキシ)、カルボシクリル(ヒドロキシアルコキシ)、アリーール(ヒドロキシアルコキシ)、アリーールオキシアルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシアルコキシ、カルボシクリルオキシアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、アジドアルコキシ、縮合ビシクリル、縮合ヘテロビシクリル、縮合ビシクリル脂肪族、縮合ヘテロビシクリル脂肪族、縮合ビシクロキシ、縮合ヘテロビシクロキシ、縮合ビシクリルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアミノ、縮合ビシクリルアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアルコキシ、縮合ビシクリルアルキルアミノ、縮合ヘテロビシクリルアルキルアミノ、縮合ビシクロキシアルコキシ、縮合ヘテロビシクロキシアルコキシ、縮合ビシクリルアミノアルコキシ、縮合ヘテロビシクリルアミノアルコキシ、縮合ビシクリル- $C(=O)-$ 、縮合ビシクリル- $C(=O)O-$ 、縮合ヘテロビシクリル- $C(=O)-$ 、縮合ヘテロビシクリル- $C(=O)O-$ 、縮合ビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、縮合ヘテロビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、縮合ビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、縮合ヘテロビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、スピロビシクリル、スピロヘテロビシクリル、スピロビシクリル脂肪族、スピロヘテロビシクリル脂肪族、スピロビシクロキシ、スピロヘテロビシクロキシ、スピロビシクリルアミノ、スピロヘテロビシクリルアミノ、スピロビシクリルアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアルコキシ、スピロビシクリルアルキルアミノ、スピロヘテロビシクリルアルキルアミノ、スピロビシクロキシアルコキシ、スピロヘテロビシクロキシアルコキシ、スピロビシクリルアミノアルコキシ、スピロヘテロビシクリルアミノアルコキシ、スピロビシクリル- $C(=O)-$ 、スピロビシクリル- $C(=O)O-$ 、スピロヘテロビシクリル- $C(=O)-$ 、スピロヘテロビシクリル- $C(=O)O-$ 、スピロビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、スピロヘテロビシクリルアミノ- $C(=O)-$ 、スピロビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、スピロヘテロビシクリル- $C(=O)N(R^7)-$ 、ヘテロシクリル、シクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリーール C_{2-10} 脂肪族、ヘテロアリーール脂肪族、アリーール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロアリーール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロシクリル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、又はシクロアルキル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、各GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$

O)、 $-C(=O)N(R^7)-$ 、 $-OC(=O)N(R^7)-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-N(R^7)C(=O)N(R^7)-$ 、 $-(R^7)N-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tN(R^7)-$ であり、各 t は1又は2であり、各 p 及び m は独立に0、1、2、3又は4であり、

各 R^5 は独立に H 、 $R^7R^7aN(C=O)-$ 、 $R^7OC(=O)-$ 、 $R^7C(=O)-$ 、 $R^7R^7aN(S=O)-$ 、 $R^7OS(=O)-$ 、 $R^7S(=O)-$ 、 $R^7R^7aN(S=O)_2-$ 、 $R^7OS(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、脂肪族、八口脂肪族、ヒドロキシ脂肪族、アミノ脂肪族、アルコキシ脂肪族、アルキルアミノ脂肪族、アルキルチオ脂肪族、アリール脂肪族、ヘテロアリール脂肪族、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリールオキシ脂肪族、ヘテロシクリルオキシ脂肪族、シクロアルキルオキシ脂肪族、アリールアミノ脂肪族、ヘテロシクリルアミノ脂肪族、シクロアルキルアミノ脂肪族、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル又はカルボシクリルであり、

各 R^{5a} は独立に H 、ヒドロキシ、アミノ、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、シアノ、オキソ($=O$)、 R^7aR^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 R^7aR^7N- アルキル、 $R^7S(=O)-$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-$ アルキル、 R^7aR^7N- アルコキシ、 $R^7S(=O)-$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-$ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、アラキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリールアルキルアミノ、ヘテロアリールアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、アリールアルコキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルコキシ、ヘテロシクリルアミノ、ヘテロシクリルアルキルアミノ又はアリールオキシであり、

各 R^6 は独立に1つの結合、 C_{1-10} アルキレン、 C_{2-10} アルケニレン、又は C_{2-10} アルキニレンであり、及び

各 R^7 及び R^{7a} は独立に H 、脂肪族、八口脂肪族、ヒドロキシ脂肪族、アミノ脂肪族、アルコキシ脂肪族、アルキルアミノ脂肪族、アルキルチオ脂肪族、アリール脂肪族、ヘテロアリール脂肪族、ヘテロシクリル脂肪族、シクロアルキル脂肪族、アリールオキシ脂肪族、ヘテロシクリルオキシ脂肪族、シクロアルキルオキシ脂肪族、アリールアミノ脂肪族、ヘテロシクリルアミノ脂肪族、シクロアルキルアミノ脂肪族、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル又はカルボシクリルであり、 R^7 及び R^{7a} が同じ窒素原子に結合している場合、 R^7 及び R^{7a} はそれらが結合している窒素原子と一緒に任意に、置換又は無置換の3-8員環又は、置換又は無置換のスピロビシクロ環若しくは縮合ビシクロ環を形成していてもよく、

ただし、 NR^5 、 $-R^6-C(=Y)-$ 、 $-R^6-C(=Y)-O-$ 、 $-R^6-C(=Y)-N(R^5)-$ 、 $-R^6-S(=O)_t-$ 、 $-R^6-S(=O)_t-N(R^7)-$ 、 $-R^6-Y-$ 、 R^7aR^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a-$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_t-$ 、 $R^7S(=O)_t-$ 、 $R^7S(=O)_tN(R^7a)-$ 、 R^7aR^7N- アルキル、 $R^7S(=O)_t-$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-$ アルコキシ、 $R^7R^7aN(C=O)-$ 、 $R^7OC(=O)-$ 、 $R^7C(=O)-$ 、 $R^7R^7aN(S=O)-$ 、 $R^7OS(=O)-$ 、 $R^7S(=O)-$ 、 $R^7R^7aN(S=O)_2-$ 、 $R^7OS(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 R^7aR^7N- 脂肪族、アリール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロアリール- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヘテロシクリル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、シクロアルキル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル- $C(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル

- C (= O) - 、 C_{1 - 6} アルキル - S (= O) - 、 C_{1 - 6} アルキル - S (= O)₂ -
、 ヒドロキシ置換 C_{1 - 6} アルキル - S (= O) - 、 ヒドロキシ置換 C_{1 - 6} アルキル -
S (= O)₂ - 、 カルボキシ C_{1 - 6} アルコキシ、 ハロアルキル、 ヘテロシクリルアルキ
ル、 ヘテロシクリルアルコキシ、 ヘテロシクリルアルキルアミノ、 ヘテロシクリルアミノ
、 シクロアルキル、 シクロアルキル脂肪族、 シクロアルキルアミノ、 シクロアルキルオキ
シ脂肪族、 シクロアルキルアルコキシ、 シクロアルキルアルキルアミノ、 カルボシクリル
脂肪族、 アリールアルキル、 アリールオキシアルキル、 ヘテロアリールオキシ脂肪族、 脂
肪族、 アルコキシ、 ヒドロキシアルコキシ、 アミノアルコキシ、 ヒドロキシ置換 C_{1 - 6}
アルコキシ、 ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、 ハロアルコキシ、 アミノ置換ハロアルコ
キシ、 アルキルアミノハロアルコキシ、 ヒドロキシ置換ハロアルコキシ、 アルキルアミノ
アルコキシ、 アルコキシアルコキシ、 アリールアルコキシ、 アリールアルキルアミノ、 ヘ
テロシクリルアルコキシ、 カルボシクリルアルコキシ、 ヘテロシクリル (ヒドロキシアル
コキシ) 、 カルボシクリル (ヒドロキシアルコキシ) 、 アリール (ヒドロキシアルコキシ
) 、 アリールオキシアルコキシ、 ヘテロアリールオキシアルコキシ、 アリールオキシ、 ア
リールアミノ、 ヘテロシクリルオキシアルコキシ、 カルボシクリルオキシアルコキシ、 シ
クロアルキルオキシ、 アジドアルコキシ、 縮合ビシクリル、 縮合ヘテロビシクリル、 縮合
ビシクリル脂肪族、 縮合ヘテロビシクリル脂肪族、 縮合ビシクロキシ、 縮合ヘテロビシク
ロキシ、 縮合ビシクリルアミノ、 縮合ヘテロビシクリルアミノ、 縮合ビシクリルアルコキ
シ、 縮合ヘテロビシクリルアルコキシ、 縮合ビシクリルアルキルアミノ、 縮合ヘテロビシ
クリルアルキルアミノ、 縮合ビシクロキシアルコキシ、 縮合ヘテロビシクロキシアルコキ
シ、 縮合ビシクリルアミノアルコキシ、 縮合ヘテロビシクリルアミノアルコキシ、 縮合ビ
シクリル - C (= O) - 、 縮合ビシクリル - C (= O) O - 、 縮合ヘテロビシクリル - C
(= O) - 、 縮合ヘテロビシクリル - C (= O) O - 、 縮合ビシクリルアミノ - C (= O
) - 、 縮合ヘテロビシクリルアミノ - C (= O) - 、 縮合ビシクリル - C (= O) N (R
⁷) - 、 縮合ヘテロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、 スピロビシクリル、 スピロヘ
テロビシクリル、 スピロビシクリル脂肪族、 スピロヘテロビシクリル脂肪族、 スピロビシ
クロキシ、 スピロヘテロビシクロキシ、 スピロビシクリルアミノ、 スピロヘテロビシクリ
ルアミノ、 スピロビシクリルアルコキシ、 スピロヘテロビシクリルアルコキシ、 スピロビ
シクリルアルキルアミノ、 スピロヘテロビシクリルアルキルアミノ、 スピロビシクロキシ
アルコキシ、 スピロヘテロビシクロキシアルコキシ、 スピロビシクリルアミノアルコキシ
、 スピロヘテロビシクリルアミノアルコキシ、 スピロビシクリル - C (= O) - 、 スピロ
ビシクリル - C (= O) O - 、 スピロヘテロビシクリル - C (= O) - 、 スピロヘテロビ
シクリル - C (= O) O - 、 スピロビシクリルアミノ - C (= O) - 、 スピロヘテロビシ
クリルアミノ - C (= O) - 、 スピロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、 スピロヘテ
ロビシクリル - C (= O) N (R⁷) - 、 アリール、 ヘテロアリール、 アリール脂肪族、
ヘテロアリール脂肪族、 ヘテロアリールオキシ、 ヘテロアリールアミノ、 ヘテロアリール
アルコキシ、 ヘテロアリールアルキルアミノ、 ハロ脂肪族、 ヒドロキシ脂肪族、 アミノ脂
肪族、 アルコキシ脂肪族、 アルキルアミノ脂肪族、 アルキルチオ脂肪族、 シクロアルキル
、 ヘテロシクリル脂肪族、 アリールオキシ脂肪族、 ヘテロシクリルオキシ脂肪族、 シクロ
アルキルオキシ脂肪族、 アリールアミノ脂肪族、 ヘテロシクリルアミノ脂肪族、 シクロア
ルキルアミノ脂肪族、 ヘテロシクリル、 カルボシクリル、 ヘテロシクリレン、 カルボシク
リレン、 縮合ビシクリレン、 縮合ヘテロビシクリレン、 スピロビシクリレン、 スピロヘテ
ロビシクリレン、 アリールレン及びヘテロアリールレンの各々は、 無置換であるか、 少なくと
も1つの置換基で置換されており、 その置換基は、 ハロアルキル、 オキソ (= O) 、 ヒド
ロキシ、 アミノ、 F、 Cl、 Br、 I、 シアノ、 C_{1 - 10} アルコキシ、 C_{1 - 10} アル
キルアミノ、 C_{1 - 10} アルキルチオ、 C_{1 - 10} アルキル、 C_{2 - 10} アルケニル、 C
{2 - 10} アルキニル、 メルカプト、 ニトロ、 C{6 - 10} アリール、 C_{1 - 9} ヘテロアリール、
C_{2 - 10} ヘテロシクリル、 C_{6 - 10} アリールオキシ、 カルボキシ、 ヒドロキシ置
換 C_{1 - 6} アルコキシ、 ヒドロキシ置換 C_{1 - 6} アルキル - C (= O) - 、 C_{1 - 6} アル
キル - C (= O) - 、 C_{1 - 6} アルキル - S (= O) - 、 C_{1 - 6} アルキル - S (= O)

2 -、ヒドロキシ置換 C₁₋₆ アルキル - S (=O) -、ヒドロキシ置換 C₁₋₆ アルキル - S (=O)₂ -、又はカルボキシ C₁₋₆ アルコキシである]の化合物、又はその立体異性体、幾何異性体、互変異性体、N - オキシド、水和物、溶媒和物、代謝産物、薬学的に許容され得る塩又はプロドラッグ。

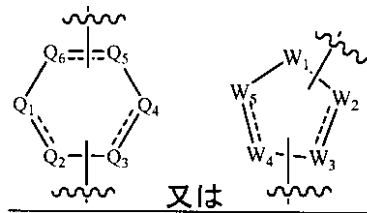
[2]

A は、C₂₋₁₀ ヘテロシクリレン、C₃₋₁₀ カルボシクリレン、C₅₋₁₂ 縮合ピシクリレン、C₅₋₁₂ 縮合ヘテロピシクリレン、C₅₋₁₂ スピロピシクリレン、C₅₋₁₂ スピロヘテロピシクリレン、C₆₋₁₀ アリーレン、又は C₁₋₉ ヘテロアリーレンである [1] に記載の化合物。

[3]

A は

【化 1 2 5】



であり、

ただし、各 Q₁、Q₂、Q₃、Q₄、Q₅ 及び Q₆ は独立に N、NR⁵、O、S、CR⁷R^{7a}、又は CR⁸ であり、且つ Q₁、Q₂、Q₃、Q₄、Q₅ 及び Q₆ は多くとも四つが N 又は NR⁵ であり、

W₁ は NR⁵、O、S、又は CR⁷R^{7a} であり、各 W₂、W₃、W₄ 及び W₅ は独立に N、NR⁵、O、S、CR⁷R^{7a}、又は CR⁸ であり、

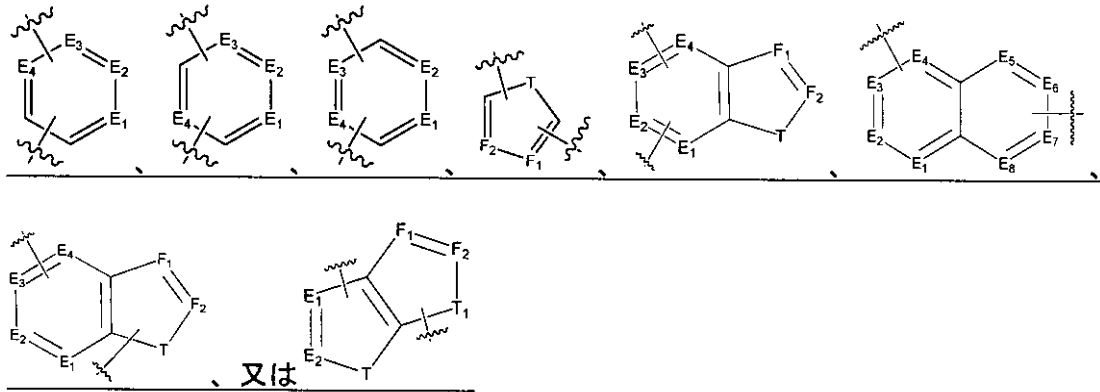
且つ W₁、W₂、W₃、W₄ 及び W₅ は多くとも四つが N 又は NR⁵ であり、

各 R⁸ は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、R^{7a}R^{7N} -、-C(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R^{7a}、-N(R⁷)C(=O)OR^{7a}、-N(R⁷)C(=O)-R^{7a}、R⁷R^{7a}N-S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂N(R^{7a})-、R^{7a}R⁷N-アルキル、R⁷S(=O)-アルキル、R⁷R^{7a}N-C(=O)-アルキル、R^{7a}R⁷N-アルコキシ、R⁷S(=O)-アルコキシ、R⁷R^{7a}N-C(=O)-アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、アラルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリールアルキルアミノ、ヘテロアリールアルキルアミノ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、アリールアルコキシ、ヘテロアリールアルコキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルコキシ、ヘテロシクリルアミノ、ヘテロシクリルアルキルアミノ又はアリールオキシである [1] に記載の化合物。

[4]

A は

【化 1 2 6】



であり、

ただし、各 E_1 、 E_2 、 E_3 、 E_4 、 E_5 、 E_6 、 E_7 、 E_8 、 F_1 及び F_2 は独立に N 又は CR^9 であり、

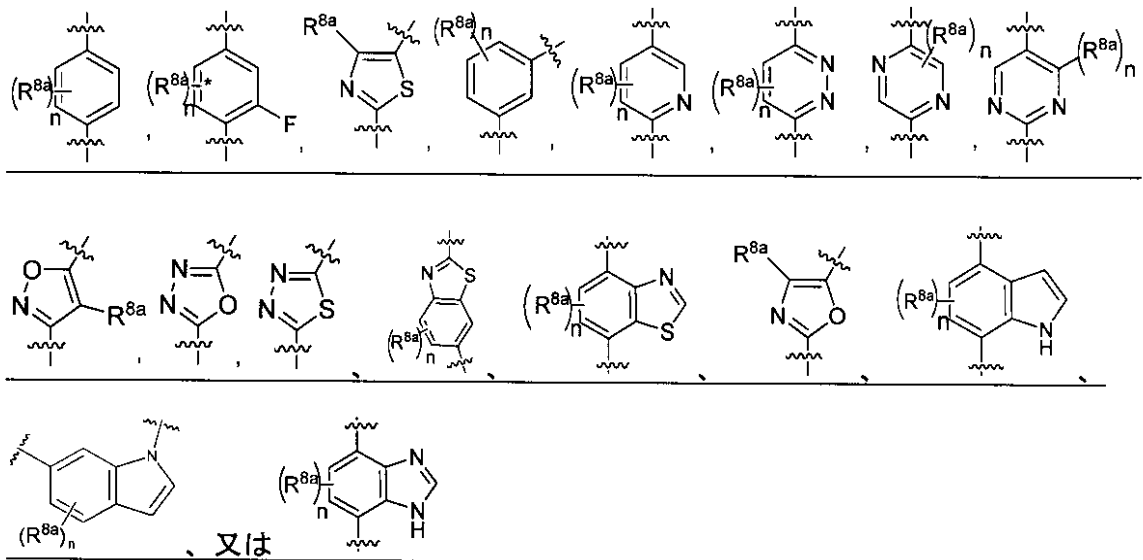
各 T 及び T_1 は独立に NR^5 、 O 、 S 又は CR^9R^{9a} であり、

各 R^9 及び R^{9a} は独立に H 、ヒドロキシ、アミノ、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、シアノ、 R^7aR^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリールアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリールアミノ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{6-10} アリールオキシである [1] に記載の化合物。

[5]

A は

【化 1 2 7】



であり、

ただし、各 n は 0、1、2 又は 3 であり、及び

各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 R^7aR^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、又は C_{1-9} ヘテロアリールである [2] に記載の化合物。

[6]

B は C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、 $-NR^7R^7a$ 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{5-12} 縮合ビシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル、 C_{5-12} スピロビシクリル、又は C_{5-12} スピロヘテロビシクリルである [1] に記載の化合物。

[7]

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7aR^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシ置換アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、アミノ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール

C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{3-10} カルボシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリーール (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリーールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{1-6} アジドアルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - C(=O)O -、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - C(=O)O -、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - C(=O)N(R⁷) -、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - C(=O)N(R⁷) -、 C_{5-12} スピロビシクリル、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル、 C_{5-12} スピロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロビシクロキシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクロキシ、 C_{5-12} スピロビシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} スピロビシクリル - C(=O)O -、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル - C(=O)O -、 C_{5-12} スピロビシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} スピロビシクリル - C(=O)N(R⁷) -、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル - C(=O)N(R⁷) -、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{1-9} ヘテロアリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又は C_{3-10} シクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH -、-OC(=O)NH -、-OC(=O) -、-NHC(=O)NH -、-HN - S(=O)_t -、-OS(=O)_t -、又は -OS(=O)_tNH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いは C_{6-10} アリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{1-9} ヘテロアリーール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、及び C_{3-10} シクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、 C_{1-6}

アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^2 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 a R^7 N -、 $-C(=O)$ NR⁷ R⁷ a、 $-OC(=O)$ NR⁷ R⁷ a、 $-OC(=O)$ OR⁷、 $-N(R^7)C(=O)$ NR⁷ R⁷ a、 $-N(R^7)C(=O)$ OR⁷ a、 $-N(R^7)C(=O)-R^7$ a、 $R^7 R^7$ a N - S(=O)₂ -、 $R^7 S(=O)$ ₂ -、 $R^7 S(=O)$ ₂ N(R⁷ a) -、 R^7 a R^7 N - C_{1-6} アルキル、 $R^7 S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7 R^7$ a N - $C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 R^7 a R^7 N - C_{1-6} アルコキシ、 $R^7 S(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7 R^7$ a N - $C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、アミノ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{3-10} カルボシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリール (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{1-6} アジドアルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル、 C_{5-12} 縮合ピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ピシクリルオキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリルアミノ - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - $C(=O)N(R^7)-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - $C(=O)N(R^7)-$ 、 C_{5-12} スピロピシクリル、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロピシクロキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクロキシ、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクロキシ C_{5-12} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} スピロピシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ - C

(=O) -、 C_{5-12} スピロビシクリル - $C(=O)N(R^7)$ -、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル - $C(=O)N(R^7)$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、

R^3 はH、F、Cl、I、シアノ、 R^7 、 R^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール - C_{3-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{2-10} アルコキシ、 C_{5-10} 縮合ビシクリル - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{1-4} ヘテロアリール、置換された C_{6-10} アリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-4} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、置換された C_{6-10} アリール C_{3-6} アルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、アミノ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{3-10} カルボシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリール (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{1-6} アジドアルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - $C(=O)O-$ 、 C_{5-12} 縮合ビシクリルアミノ - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ - $C(=O)-$ 、 C_{5-12} 縮合ビシクリル - $C(=O)$

$\text{NR}^7 -$ 、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル - $\text{C}(\text{=O})\text{NR}^7 -$ 、 C_{5-12} スピロ
 ビシクリル、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル、 C_{5-12} スピロビシクリル C_{1-6}
 脂肪族、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロビシクロ
 キシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクロキシ、 C_{5-12} スピロビシクリルアミノ、 C_{5-12}
 スピロヘテロビシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロビシクリル C_{1-6} アルコキシ
 、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリル
 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、
 C_{5-12} スピロビシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロビシクロキ
 シ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12}
 スピロヘテロビシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロビシクリル -
 $\text{C}(\text{=O}) -$ 、 C_{5-12} スピロビシクリル - $\text{C}(\text{=O})\text{O} -$ 、 C_{5-12} スピロヘテロ
 ビシクリル - $\text{C}(\text{=O}) -$ 、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリル - $\text{C}(\text{=O})\text{O} -$ 、 C_{5-12}
 スピロビシクリルアミノ - $\text{C}(\text{=O}) -$ 、 C_{5-12} スピロヘテロビシクリルアミ
 ノ - $\text{C}(\text{=O}) -$ 、 C_{5-12} スピロビシクリル - $\text{C}(\text{=O})\text{NR}^7 -$ 、 C_{5-12} スピ
 ロヘテロビシクリル - $\text{C}(\text{=O})\text{NR}^7 -$ 、 C_{6-10} アリール - $(\text{CH}_2)_p - \text{G} -$ (CH_2)_m -、 C_{1-9}
 ヘテロアリール - $(\text{CH}_2)_p - \text{G} -$ (CH_2)_m -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(\text{CH}_2)_p - \text{G} -$ (CH_2)_m -、
 又は C_{3-10} シクロアルキル - $(\text{CH}_2)_p - \text{G} -$ (CH_2)_m - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $\text{S}(\text{=O})$
 $\text{S}(\text{=O})_2$ 、 $\text{C}(\text{=O})$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NH} -$ 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NH} -$ 、 $-\text{OC}(\text{=O}) -$ 、 $-\text{NHC}(\text{=O})\text{NH} -$ 、
 $-\text{HN} - \text{S}(\text{=O})_t -$ 、 $-\text{OS}(\text{=O})_t -$ 、又は $-\text{OS}(\text{=O})_t\text{NH} -$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、
 各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、及び

R^4 は H、F、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 、 $\text{R}^7\text{N} -$ 、 $-\text{C}(\text{=O})\text{NR}^7$ 、 R^7 、 R^7a 、
 $-\text{OC}(\text{=O})\text{NR}^7$ 、 R^7a 、 $-\text{OC}(\text{=O})\text{OR}^7$ 、 $-\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{=O})\text{NR}^7$ 、 R^7a 、
 $-\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{=O})\text{OR}^7\text{a}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{=O}) - \text{R}^7\text{a}$ 、 $\text{R}^7\text{R}^7\text{a}$ 、
 $\text{R}^7\text{R}^7\text{a}$ 、 $-\text{S}(\text{=O}) -$ 、 $\text{R}^7\text{S}(\text{=O}) -$ 、 $\text{R}^7\text{S}(\text{=O})\text{N}(\text{R}^7\text{a}) -$ 、 R^7a 、 R^7N 、
 $-\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{R}^7\text{S}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{R}^7\text{R}^7\text{a}$ 、 $\text{N} - \text{C}(\text{=O}) -$ 、
 C_{1-6} アルキル、 R^7a 、 $\text{R}^7\text{N} - \text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 $\text{R}^7\text{S}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アル
 コキシ、 $\text{R}^7\text{R}^7\text{a}$ 、 $\text{N} - \text{C}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10}
 アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、ヒドロキシ置
 換 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、アミノ置換 C_{1-6} ハロアルコ
 キシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハロアルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} ハロア
 ルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アル
 コキシ、 C_{3-5} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9}
 ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルア
 ミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6}
 アルキルアミノ、 C_{7-10} シクロアルキルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ
 、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アル
 キルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{3-10}
 カルボシクリル (C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリール (C_{1-6} ヒ
 ドロキシアルコキシ)、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリ
 ールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アル
 コキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシク
 リルオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{1-6} アジドアル
 コキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル、 C_{5-12} 縮合
 ビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12}
 縮合ビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクロキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリルア
 ミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリルアミノ、 C_{5-12} 縮合ビシクリル C_{1-6} アル
 コキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ビシクリ
 ル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} 縮合ヘテロビシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、

C_{5-12} 縮合ピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - C(=O) O -、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - C(=O) O -、 C_{5-12} 縮合ピシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} 縮合ピシクリル - C(=O) NR⁷ -、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル - C(=O) NR⁷ -、 C_{5-12} スピロピシクリル、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{5-12} スピロピシクロキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクロキシ、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{5-12} スピロピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクロキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{5-12} スピロピシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} スピロピシクリル - C(=O) O -、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル - C(=O) -、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル - C(=O) O -、 C_{5-12} スピロピシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリルアミノ - C(=O) -、 C_{5-12} スピロピシクリル - C(=O) N(R⁷) -、 C_{5-12} スピロヘテロピシクリル - C(=O) N(R⁷) -、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{2-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{1-9} ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又は C_{3-10} シクロアルキル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH -、-OC(=O)NH -、-OC(=O) -、-NHC(=O)NH -、-HN - S(=O)_t -、-OS(=O)_t -、又は -OS(=O)_tNH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 である [1] に記載の化合物。

[8]

各 R⁵ は独立に水素、R⁷R^{7a}NC(=O) -、R⁷OC(=O) -、R⁷C(=O) -、R⁷R^{7a}NS(=O) -、R⁷OS(=O) -、R⁷S(=O) -、R⁷R^{7a}NS(=O)₂ -、R⁷OS(=O)₂ -、R⁷S(=O)₂ -、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロ脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、 C_{1-6} アミノ脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルである [1] に記載の化合物。

[9]

各 R^{5a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、オキソ(=O)、R^{7a}R⁷N -、-C(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R^{7a}、-N(R⁷)C(=O)OR^{7a}、-N(R⁷)C(=O) - R^{7a}、R⁷R^{7a}N - S(=O)₂ -、R⁷S(=O)

$\text{R}^7 \text{S}(\text{=O})_2 \text{N}(\text{R}^{7a}) -$ 、 $\text{R}^{7a} \text{R}^7 \text{N} - \text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{R}^7 \text{S}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{R}^7 \text{R}^{7a} \text{N} - \text{C}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{R}^{7a} \text{R}^7 \text{N} - \text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 $\text{R}^7 \text{S}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 $\text{R}^7 \text{R}^{7a} \text{N} - \text{C}(\text{=O}) - \text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリールアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリールアミノ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルキルアミノ又は C_{6-10} アリールオキシである [1] に記載の化合物。

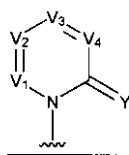
[1 0]

各 R^7 及び R^{7a} は独立に H 、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} 八口脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、 C_{1-6} アミノ脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリールアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、 R^7 及び R^{7a} が同じ窒素原子に結合している場合、 R^7 及び R^{7a} はそれらが結合している窒素原子と一緒に任意に、置換又は無置換の 3 - 8 員環、又は置換又は無置換の C_{5-12} 縮合ビシクロ環若しくは C_{5-12} スピロビシクロ環を形成していてもよい [1] に記載の化合物。

[1 1]

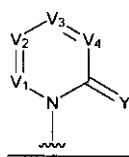
式 (I) の N 、 V_1 、 V_2 、 V_3 、 V_4 及び $\text{C}(\text{=Y})$ は式 (I I I)

【化 1 2 8】



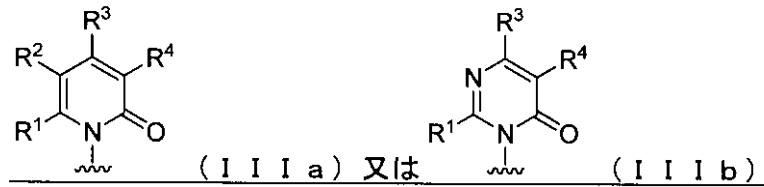
を有する基を規定し、

【化 1 2 9】



は、

【化130】



であり、

各 R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $R^{7a}R^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{5a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^{7a}$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^{7a})-$ 、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、N、 R^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^2 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $R^{7a}R^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{5a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^{7a}$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^{7a})-$ 、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C

C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリアル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリアル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリアル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は -OS(=O)_tNH- であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

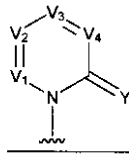
各 R³ は H、F、Cl、I、シアノ、R^{7a}R^{7N}-、-C(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R^{7a}、-N(R⁷)C(=O)OR^{7a}、-N(R⁷)C(=O)-R^{7a}、R⁷R^{7a}N-S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂N(R^{7a})-、R^{7a}R⁷N-C₁₋₆ アルキル、R⁷S(=O)-C₁₋₆ アルキル、R⁷R^{7a}N-C(=O)-C₁₋₆ アルキル、R^{7a}R⁷N-C₁₋₆ アルコキシ、R⁷S(=O)-C₁₋₆ アルコキシ、R⁷R^{7a}N-C(=O)-C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ 脂肪族、C₂₋₆ ハロアルキル、C₆₋₁₀ アリアル-C₂₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリアル-C₃₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリアルオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ シクロアルキル-C₂₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル、C₃₋₁₀ シクロアルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ 脂肪族、C₃₋₁₀ シクロアルキル C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₄ ヘテロアリアル、置換された C₆₋₁₀ アリアル、C₁₋₄ ヘテロアリアル C₁₋₆ 脂肪族、置換された C₆₋₁₀ アリアル C₃₋₆ アルキル、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆ アミノアルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリアル-C₂₋₁₀ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ カルボシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリルオキシ、C₃₋₁₀ シクロアルキルオキシ、C₆₋₁₀ アリアル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリアル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は -OS(=O)_tNH- であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、及び

各 R⁴ は H、F、I、シアノ、ヒドロキシ、R^{7a}R^{7N}-、-C(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R^{7a}、-N(R⁷)C(=O)OR^{7a}、-N(R⁷)C(=O)-R^{7a}、R⁷R^{7a}N-S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂N(R^{7a})-、R^{7a}R⁷N-C₁₋₆ アルキル、R⁷S(=O)-C₁₋₆ アルキル、R⁷R^{7a}N-C(=O)-C₁₋₆ アルキル、R^{7a}R⁷N-C₁₋₆ アルコキシ、R⁷S(=O)-C₁₋₆ アルコキシ、R⁷R^{7a}N-C(=O)-C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ 脂肪族、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₁₀ アルコキシ、C₁₋₆ ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆ アミノアルコキシ、C₁₋₆ ハロアルコキシ、C₁₋₆ アルキルアミノ C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₅ シクロアルキルオキシ、C₆₋₁₀ アリアル C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリアル C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリアルオキシ C₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₉ ヘテロアリアル C₁₋₆ アルキルアミノ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルキルアミノ、C₃₋₁₀ シクロアルキルアミノ、C₂₋₁₀ ヘテロシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ カルボシクリル C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₁₀ カルボシクリル C₁₋₆ アルキルアミノ、C₆₋₁₀ アリアルオキシ、C₁₋₁₀ ヘテロアリアルオキ

シ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル
 C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9}
 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{2-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6}
 C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロ
アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、
又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、
- $C(=O)NH$ -、- $OC(=O)NH$ -、- $OC(=O)$ -、- $NHC(=O)N$
H -、- $HN-S(=O)_t$ -、- $OS(=O)_t$ -、又は - $OS(=O)_tNH$ - であ
り、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 である [1] に記
載の化合物。

[1 2]

【化 1 3 1】



は、

C_{1-9} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{5-12} 縮合ビスクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビスクリル、 C_{5-12} スピロビスクリル、又は C_{5-12} スピロヘテロビスクリルであり、ただし、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{5-12} 縮合ビスクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロビスクリル、 C_{5-12} スピロビスクリル、及び C_{5-12} スピロヘテロビスクリルの各々は、任意にオキソ(=O)、ヒドロキシ、アミノ、ハロゲン、シアノ、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリーールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-C(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、 C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル-S(=O)-、ヒドロキシで置換された C_{1-6} アルキル-S(=O)₂-、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシで置換されていてもよく、

R^1 はH、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 a R^7 N -、-C(=O)NR⁷R⁷ a、-OC(=O)NR⁷R⁷ a、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R⁷ a、-N(R⁷)C(=O)OR⁵ a、-N(R⁷)C(=O)-R⁷ a、 R^7 R⁷ a N-S(=O)₂-、 R^7 S(=O)₂-、 R^7 S(=O)₂N(R⁷ a)-、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{1-9} ヘテロアリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{2-10} ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又は C_{3-10} シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は-OS(=O)_tNH-であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、或いは C_{6-10} アリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{1-9} ヘテロアリーール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、 C_{2-10} ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、及び C_{3-10} シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-の各々は、1つ又はそれ以上のF、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^2 はH、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 a R^7 N -、-C(=O)NR⁷R⁷ a、-OC(=O)NR⁷R⁷ a、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R⁷ a、-N(R⁷)C(=O)OR⁵ a、-N(R⁷)C(=O)-R⁷ a、 R^7 R⁷ a N-S(=O)₂-、 R^7 S(=O)₂-、 R^7 S(=O)₂N(R⁷ a)-、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリーール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール

C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル
 C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9}
 ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10}
 シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル
 C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{1-6}
 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シ
 クロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独
 立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R^3 は H 、 F 、 Cl 、 I 、シアノ、 R^7 R^7 $N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^7$ 、 $-O$
 $C(=O)NR^7R^7$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7$
 $-N(R^7)C(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7$ 、 R^7R^7 $N-$
 $S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7)$ 、 R^7R^7 $N-$
 C_{1-6} アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 R^7R^7 $N-C(=O)-$
 C_{1-6} アルキル、 R^7R^7 $N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アル
 コキシ、 R^7R^7 $N-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-6} ハ
 口アルキル、 C_{6-10} アリール - C_{2-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール - C_3
 - C_{6-10} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロ
 アルキル - C_{2-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル
 、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族
 、 C_{1-4} ヘテロアリール、置換された C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール C_{1-6}
 脂肪族、置換された C_{6-10} アリール C_{3-6} アルキル、 C_{2-10} ヘテロシク
 リル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6}
 アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハ口アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} ハ口アル
 コキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アル
 コキシ、 C_{6-10} アリール - C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6}
 アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシク
 リルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G -
 $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10}
 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキ
 ル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、
 又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1
 、2、3 又は 4 であり、

R^4 は H 、 F 、 I 、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 R^7 $N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^7$ a
 $-OC(=O)NR^7R^7$ a 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7$
 R^7 a 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7$ a 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7$ a 、 R^7R^7
 a $N-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7)$ a 、 R^7 a
 R^7 $N-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 R^7R^7 a $N-C(=O)-$
 C_{1-6} アルキル、 R^7R^7 a $N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$
 a アルコキシ、 R^7R^7 a $N-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6}
 a ハ口アルキル、 C_{2-10} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} ア
 ミノアルコキシ、 C_{1-6} ハ口アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ
 、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-5} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10}
 アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘ

テロアリアルオキシC₁₋₆アルコキシ、C₁₋₉ヘテロアリアルC₁₋₆アルキルアミノ、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₆アルコキシ、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₆アルキルアミノ、C₃₋₁₀シクロアルキルアミノ、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₆アルコキシ、C₃₋₁₀カルボシクリルC₁₋₆アルコキシ、C₃₋₁₀カルボシクリルC₁₋₆アルキルアミノ、C₆₋₁₀アリアルオキシ、C₁₋₁₀ヘテロアリアルオキシ、C₂₋₁₀ヘテロシクリル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₆脂肪族、C₃₋₁₀シクロアルキルC₁₋₆脂肪族、C₆₋₁₀アリアル、C₁₋₉ヘテロアリアル、C₆₋₁₀アリアルC₂₋₆脂肪族、C₁₋₉ヘテロアリアルC₁₋₆脂肪族、C₆₋₁₀アリアル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₁₋₉ヘテロアリアル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₂₋₁₀ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又はC₃₋₁₀シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、S(=O)、S(=O)₂、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)NH-、-HN-S(=O)_t-、-OS(=O)_t-、又は-OS(=O)_tNH-であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、

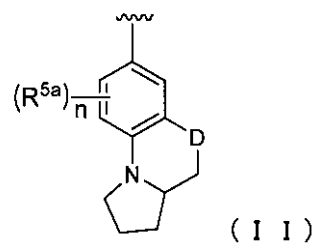
各R⁵は独立にH、R⁷R^{7a}NC(=O)-、R⁷OC(=O)-、R⁷C(=O)-、R⁷R^{7a}NS(=O)-、R⁷OS(=O)-、R⁷S(=O)-、R⁷R^{7a}NS(=O)₂-、R⁷OS(=O)₂-、R⁷S(=O)₂-、C₁₋₃アルキル、C₁₋₃ハロアルキル、C₁₋₃ヒドロキシアルキル、C₁₋₃アミノアルキル、C₁₋₃アルコキシC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルキルアミノC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルキルチオC₁₋₃アルキル、C₆₋₁₀アリアルC₁₋₃アルキル、C₁₋₉ヘテロアリアルC₁₋₃アルキル、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₃アルキル、C₃₋₁₀シクロアルキルC₁₋₃アルキル、C₆₋₁₀アリアル、C₁₋₉ヘテロアリアル、C₂₋₁₀ヘテロシクリル又はC₃₋₁₀カルボシクリルであり、及び

各R⁷及びR^{7a}は独立にH、C₁₋₆脂肪族、C₁₋₆ハロ脂肪族、C₁₋₆ヒドロキシ脂肪族、C₁₋₆アミノ脂肪族、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆脂肪族、C₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆脂肪族、C₁₋₆アルキルチオC₁₋₆脂肪族、C₆₋₁₀アリアルC₁₋₆脂肪族、C₁₋₉ヘテロアリアルC₁₋₆脂肪族、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₆脂肪族、C₃₋₁₀シクロアルキルC₁₋₆脂肪族、C₆₋₁₀アリアル、C₁₋₉ヘテロアリアル、C₂₋₁₀ヘテロシクリル又はC₃₋₁₀カルボシクリルであり、R⁷及びR^{7a}が同じ窒素原子に結合している場合、R⁷及びR^{7a}はそれらが結合している窒素原子と一緒に任意に、置換又は無置換の3-8員環を形成している[1]に記載の化合物。

[1 4]

A、X及びBは式(I I)：

【化 1 3 4】



を有する基を規定し、

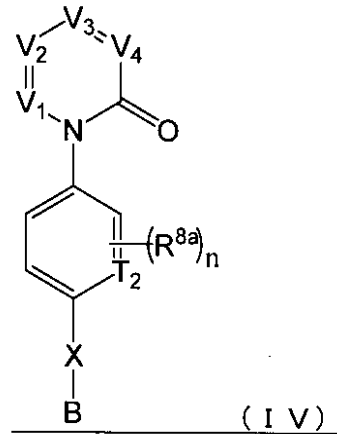
ただし、DはOであり、nは0、1又は2であり、及び

各R^{5a}は独立にH、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、R^{7a}R⁷N-、-C(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)NR⁷R^{7a}、-OC(=O)OR⁷、-N(R⁷)C(=O)NR⁷R^{7a}、-N(R⁷)C(=O)OR^{7a}、-N(R⁷)C(=O)-R^{7a}、R⁷R^{7a}N-S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂-、R⁷S(=O)₂

$N(R^{7a})$ -、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、又は C_{1-9} ヘテロアリールである [1] に記載の化合物。

[15]

式 (I V) :
【化 135】



を有し、

ただし、 V_1 は N 又は CR^1 であり、
 V_2 は N 又は CR^2 であり、 V_3 は N 又は CR^3 であり、
 V_4 は N 又は CR^4 であり、

ただし、 V_1 、 V_2 、 V_3 及び V_4 は多くとも一つが N であり、
 T_2 は N 又は CR^{10} であり、

X は 1 つの結合、 NR^5 、O、S、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_m-Y-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-CH=CH-$ 、又は $-C-C-$ であり、ただし、各 m は 0、1、2 又は 3 であり、

B は $-NR^7R^{7a}$ 、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{5-12} 縮合ピシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル、又は C_{5-12} スピロヘテロピシクリルであり、ただし、 C_{4-12} カルボシクリル、 C_{4-12} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{5-12} 縮合ピシクリル、 C_{5-12} 縮合ヘテロピシクリル、 C_{5-12} スピロピシクリル、及び C_{5-12} スピロヘテロピシクリルの各々は、任意にオキソ (= O)、ヒドロキシ、アミノ、ハロ、シアノ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $C(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $C(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)-$ 、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2-$ 、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $S(=O)-$ 、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2-$ 、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシで置換されていてもよく、

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $R^{7a}R^7N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^{7a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^{5a}$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7$ 、 $R^7R^{7a}N-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^{7a})-$ 、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロ

アルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いは C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、及び C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F 、 Cl 、 Br 、 I 、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^2 は H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 a R^7 $N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^5a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-10} アリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{1-9} ヘテロアリールオキシ C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-4} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{1-9} ヘテロアリール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_{2-10} ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_{3-10} シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R^3 は H 、 F 、 Cl 、 I 、シアノ、 R^7 a R^7 $N-$ 、 $-C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7R^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-6} ハロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{2-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリール - C_3

C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} シクロ
 アルキル、 C_{2-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル
 、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{1-6} 脂肪族
 、 C_{1-4} ヘテロアリーール、置換された C_{6-10} アリーール、 C_{1-4} ヘテロアリーール、 C_{1-6}
 C_{1-6} 脂肪族、置換された C_{6-10} アリーール、 C_{3-6} アルキル、 C_{2-10} ヘテロシク
 リル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6}
 アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} ハロアル
 コキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アル
 コキシ、 C_{6-10} アリーール、 C_{2-10} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6}
 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシク
 リルオキシ、 C_{3-10} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10} アリーール、 $(CH_2)_p - G -$
 $(CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10}
 C_{2-10} ヘテロシクリル、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、又は C_{3-10} シクロアルキ
 ル、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC$
 $(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、
 又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1
 、2、3 又は 4 であり、

R^4 は H、F、I、シアノ、ヒドロキシ、 R^7 、 R^7N- 、 $-C(=O)NR^7R^7a$
 、 $-OC(=O)NR^7R^7a$ 、 $-OC(=O)OR^7$ 、 $-N(R^7)C(=O)NR^7$
 R^7a 、 $-N(R^7)C(=O)OR^7a$ 、 $-N(R^7)C(=O)-R^7a$ 、 R^7R^7
 $aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2N(R^7a)-$ 、 R^7a
 R^7N-C_{1-6} アルキル、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7R^7aN-C(=$
 $O)-C_{1-6}$ アルキル、 $R^7aR^7N-C_{1-6}$ アルコキシ、 $R^7S(=O)-C_{1-6}$
 C_{1-6} アルコキシ、 $R^7R^7aN-C(=O)-C_{1-6}$ アルコキシ、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6}
 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-10} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} ア
 ミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{1-6} アルコキシ
 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-5} シクロアルキルオキシ、 C_{6-10}
 アリーール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘ
 テロアリーールオキシ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{1-6} アルキルアミ
 ノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6}
 アルキルアミノ、 C_{3-10} シクロアルキルアミノ、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6}
 アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-10} カルボシクリル
 C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{6-10} アリーールオキシ、 C_{1-10} ヘテロアリーールオキシ
 、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{1-6}
 C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-9}
 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{6-10} アリーール、 C_{2-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリーール、 C_{1-6}
 C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリーール、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{1-9} ヘテロア
 リール、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$ 、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 $(CH_2)_p$
 $-G-(CH_2)_m-$ 、又は C_{3-10} シクロアルキル、 $(CH_2)_p - G - (CH_2)_m -$
 $m-$ であり、ただし、各 G は O、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、
 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH$
 $-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり
 、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

各 R^5 は独立に H、 $R^7R^7aN-C(=O)-$ 、 $R^7OC(=O)-$ 、 $R^7C(=O)$
 $-$ 、 $R^7R^7aN-S(=O)_2-$ 、 $R^7OS(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 R^7R^7aN
 $S(=O)_2-$ 、 $R^7OS(=O)_2-$ 、 $R^7S(=O)_2-$ 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3}
 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{1-3} ヒドロキシアルキル、 C_{1-3} アミノアルキル、 C_{1-3} アル
 コキシ、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキルアミノ、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキ
 ルチオ、 C_{1-3} アルキル、 C_{6-10} アリーール、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-9} ヘテロアリー

ル C_{1-3} アルキル、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-3} アルキル、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、

各 R^7 及び R^{7a} は独立に H、 C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} 八口脂肪族、 C_{1-6} ヒドロキシ脂肪族、 C_{1-6} アミノ脂肪族、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{1-9} ヘテロアリール C_{1-6} 脂肪族、 C_{2-10} ヘテロシクリル C_{1-6} 脂肪族、 C_{3-10} シクロアルキル C_{1-6} 脂肪族、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル又は C_{3-10} カルボシクリルであり、 R^7 及び R^{7a} が同じ窒素原子に結合している場合、 R^7 及び R^{7a} はそれらが結合している窒素原子と一緒に任意に、置換又は無置換の 3 - 8 員環を形成していてもよく、

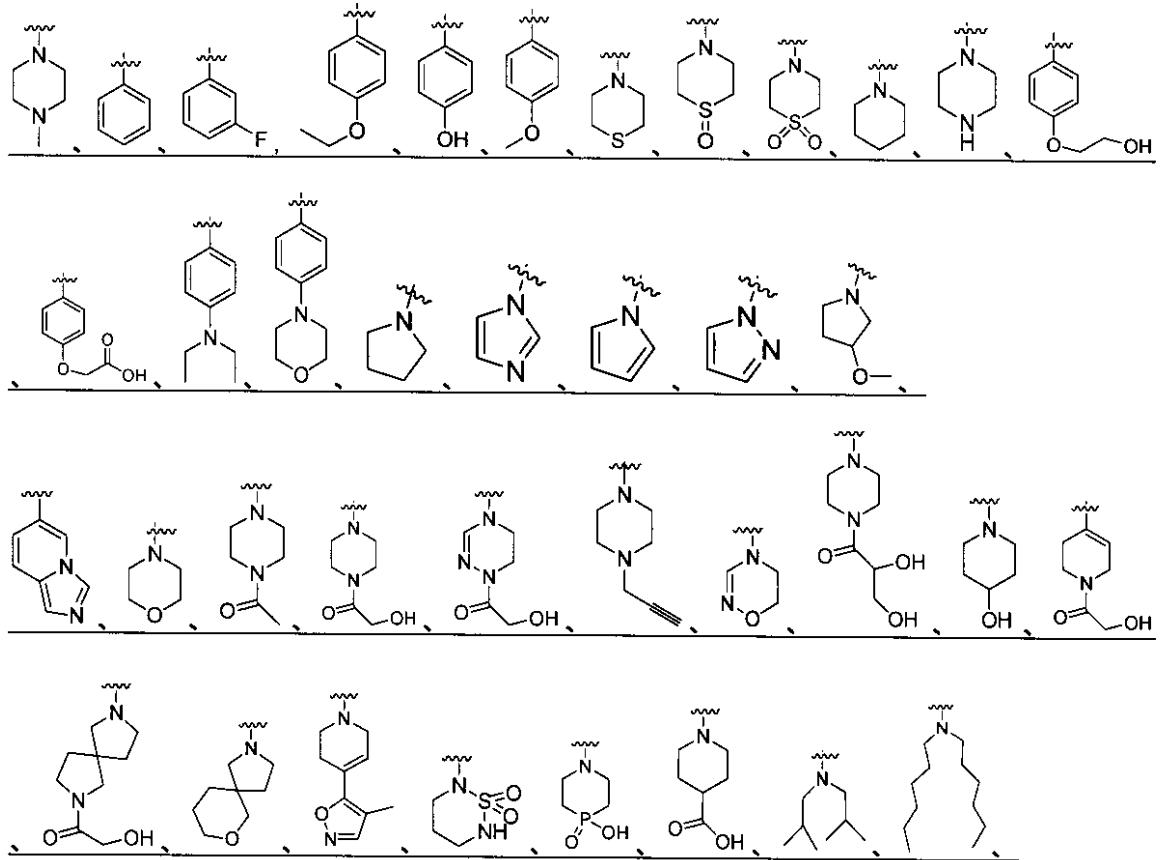
各 R^{8a} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール C_{1-4} アルキル又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、 n は 0、1、2 又は 3 であり、及び

各 R^{10} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、又は C_{1-4} アルキルチオである [1] 記載の化合物。

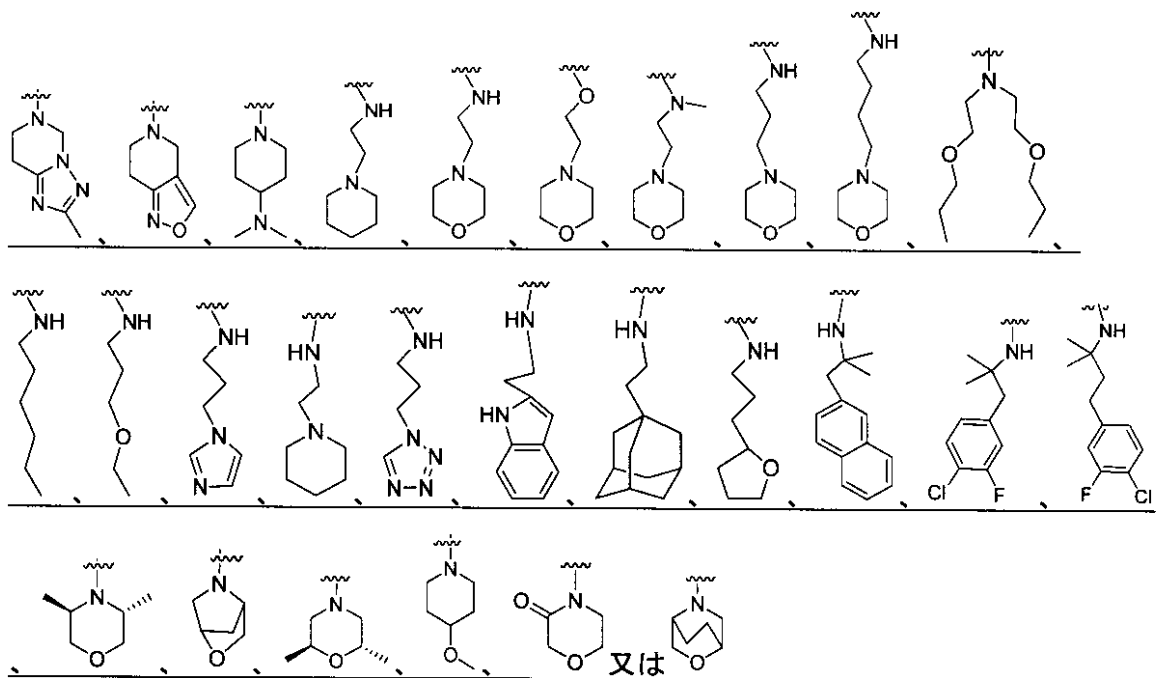
[16]

B は $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_2CH_2CH_3)_2$ 、

【化 1 3 6 - 1】



【化 1 3 6 - 2】



であり、

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル-NH-S

(=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ NH -、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、フェニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、(フルオロ置換フェニル) - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、チアゾリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ピリジル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、フェニルエチル、シクロヘキシル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ナフチル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又はモルホリニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S (=O)、S (=O)₂、C (=O)、-C (=O)NH -、-OC (=O)NH -、-OC (=O) -、-NHC (=O)NH -、-HN - S (=O)_t -、-OS (=O)_t -、又は -OS (=O)_t NH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、或いはフェニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、(フルオロ置換フェニル) - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、チアゾリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ピリジル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、フェニルエチル、シクロヘキシル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、ナフチル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、及びモルホリニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R² は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、-N(CH₃)₂、-C (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O) - C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルキル - NH - S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ NH -、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、フェニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、(フルオロ置換フェニル) - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、チアゾリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又はモルホリニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S (=O)、S (=O)₂、C (=O)、-C (=O)NH -、-OC (=O)NH -、-OC (=O) -、-NHC (=O)NH -、-HN - S (=O)_t -、-OS (=O)_t -、又は -OS (=O)_t NH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R³ は H、F、Cl、I、シアノ、ヒドロキシ、-N(CH₃)₂、-C (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O) - C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルキル - NH - S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ NH -、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、フェニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、(フルオロ置換フェニル) - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、チアゾリル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、又はモルホリニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O、S、NR⁵、S (=O)、S (=O)₂、C (=O)、-C (=O)NH -、-OC (=O)NH -、-OC (=O) -、-NHC (=O)NH -、-HN - S (=O)_t -、-OS (=O)_t -、又は -OS (=O)_t NH - であり、各 t は 1 又は 2 であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2、3 又は 4 であり、

R⁴ は H、F、I、シアノ、ヒドロキシ、-N(CH₃)₂、-C (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-OC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)NH - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O)O - C₁₋₄ アルキル、-NHC (=O) - C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルキル - NH - S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ -、C₁₋₄ アルキル S (=O)₂ NH -、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、フェニル - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m -、(フルオロ置換フェニル) - (CH₂)_p - G - (

$(CH_2)_m-$ 、チアゾリル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ 、又はモルホリニル- $(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、各GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-HN-S(=O)_t-$ 、 $-OS(=O)_t-$ 、又は $-OS(=O)_tNH-$ であり、各tは1又は2であり、各p及びmは独立に0、1、2、3又は4であり、

各 R^5 は独立にH、 C_{1-3} アルキル、フェニル、ベンジル、ピリジル又はモルホリノメチルであり、

各 R^{8a} は独立にH、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル、 $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール C_{1-4} アルキル又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、

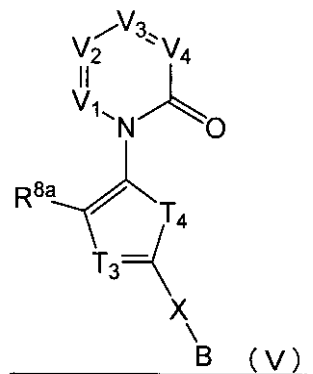
nは0、1、2又は3であり、及び

各 R^{10} は独立にH、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、又は C_{1-4} アルキルチオである[15]に記載の化合物。

[17]

式(V)：

【化137】



を有し、

ただし、 V_1 はN又は CR^1 であり、

V_2 はN又は CR^2 であり、

V_3 はN又は CR^3 であり、

V_4 はN又は CR^4 であり、

ただし、 V_1 、 V_2 、 V_3 及び V_4 は多くとも一つがNであり、

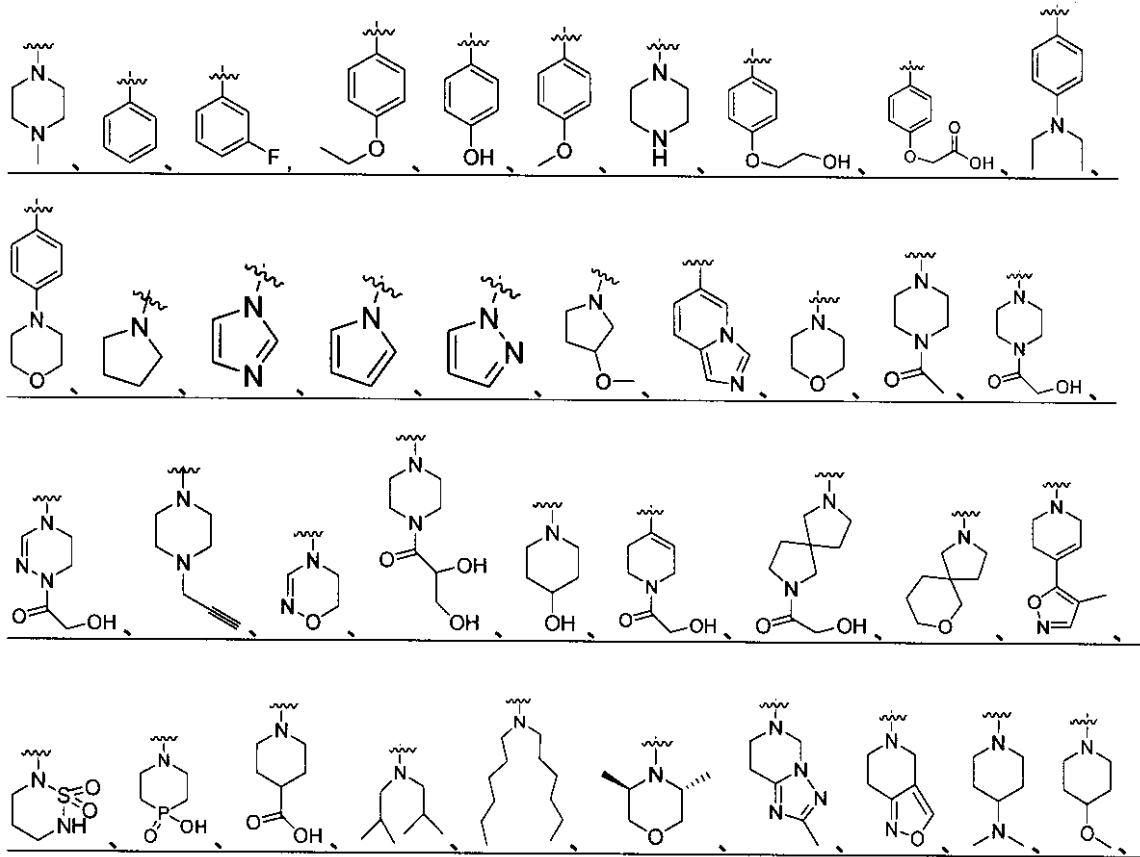
T_3 はN又は CR^{10} であり、

T_4 は NR^5 、O、S又は $CR^{11}R^{11a}$ であり、

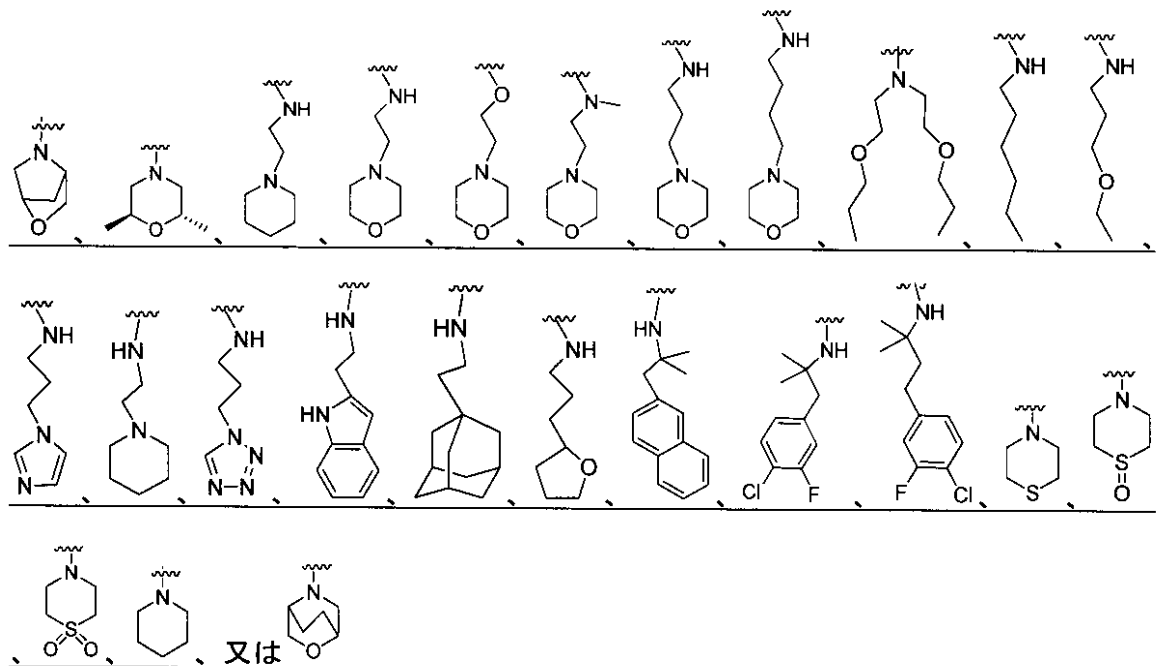
Xは1つの結合、 NR^5 、O、S、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-(CH_2)_m-Y-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-CH=CH-$ 、又は $-C-C-$ であり、ただし、各mは0、1、2又は3であり、

Bは $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_2CH_3)_2$ 、 $-N(CH_2CH_2CH_2CH_3)_2$ 、

【化138-1】



【化138-2】



であり、

R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル-NH-S

$(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、又は C_{6-10} アリール $-(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、又は $C(=O)$ であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、或いは C_{6-10} アリール $-(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ は、1つ又はそれ以上のF、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく

R^2 はH、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、トリフルオロメチル、又は C_{6-10} アリール $-(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、又は $C(=O)$ であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、

R^3 はH、F、Cl、I、シアノ、ヒドロキシ、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)N-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、t-ブチル、又は C_{6-10} アリール $-(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、又は $C(=O)$ であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、

R^4 はH、F、I、シアノ、ヒドロキシ、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、又は C_{6-10} アリール $-(CH_2)_p-G-(CH_2)_m-$ であり、ただし、GはO、S、 NR^5 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、又は $C(=O)$ であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、

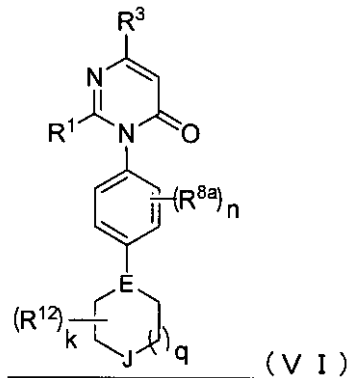
各 R^5 は独立にH、 C_{1-4} アルキル、フェニル、ベンジル、ピリジル又はモルホリノメチルであり、及び

各 R^{8a} 、 R^{10} 、 R^{11} 、及び R^{11a} は独立にH、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-OC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)NH-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-NHC(=O)-C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} アルキル $-NH-S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2-$ 、 C_{1-4} アルキル $S(=O)_2NH-$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{1-4} アルキルチオ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール C_{1-4} アルキル又は C_{1-9} ヘテロアリールである[1]に記載の化合物。

[18]

式(VI)：

【化 1 3 9】



を有し、

ただし、EはN又はCR¹⁰であり、JはO、S、S(=O)、S(=O)₂、NR¹³又はCR¹⁴R^{14a}であり、

kは0、1、2、3又は4であり、

qは0、1又は2であり、

R¹はH、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆アミノアルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₆₋₁₀アリールC₁₋₆アルキル、C₆₋₁₀アリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₁₋₉ヘテロアリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₂₋₁₀ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又はC₃₋₁₀シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-又は-NHC(=O)NH-であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、或いはC₆₋₁₀アリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₁₋₉ヘテロアリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₂₋₁₀ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₆₋₁₀アリールC₁₋₆アルキル、及びC₃₋₁₀シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-の各々は、1つ又はそれ以上のF、Cl、Br、I、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ、エトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R³はH、F、Cl、I、シアノ、ヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ヒドロキシアルコキシ、C₁₋₆アミノアルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₆₋₁₀アリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₁₋₉ヘテロアリール-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、C₂₋₁₀ヘテロシクリル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-、又はC₃₋₁₀シクロアルキル-(CH₂)_p-G-(CH₂)_m-であり、ただし、各GはO、S、NR⁵、C(=O)、-C(=O)NH-、-OC(=O)NH-、-OC(=O)-又は-NHC(=O)NH-であり、各p及びmは独立に0、1、2又は3であり、

各R⁵は独立にH、R⁷R^{7a}NC(=O)-、R⁷OC(=O)-、R⁷C(=O)-、C₁₋₃アルキル、C₁₋₃ハロアルキル、C₁₋₃ヒドロキシアルキル、C₁₋₃アミノアルキル、C₁₋₃アルコキシC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルキルアミノC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルキルチオC₁₋₃アルキル、C₆₋₁₀アリールC₁₋₃アルキル、C₁₋₉ヘテロアリールC₁₋₃アルキル、C₂₋₁₀ヘテロシクリルC₁₋₃アルキル、C₃₋₁₀シクロアルキルC₁₋₃アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₉ヘテロアリール、C₂₋₁₀ヘテロシクリル又はC₃₋₁₀カルボシクリルであり、

各R^{8a}は独立にH、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、-N(CH₃)₂、シアノ、ニトロ、メルカプト、C₁₋₄アルキル、トリフルオロメチル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルキルアミノ、C₁₋₄アルキルチオ、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀

0 アリール C_{1-4} アルキル又は C_{1-9} ヘテロアリールであり、
n は 0、1、2 又は 3 であり、

R^{10} は独立に H、ヒドロキシ、アミノ、F、Cl、Br、I、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_{1-4} アルキル、トリフルオロメチル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキルアミノ、又は C_{1-4} アルキルチオであり、

各 R^{12} はオキソ (=O)、ヒドロキシ、アミノ、ハロ、シアノ、 C_{1-10} アルコキシ、 C_{1-10} アルキルアミノ、 C_{1-10} アルキルチオ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、メルカプト、ニトロ、 C_{6-10} アリール、 C_{1-9} ヘテロアリール、 C_{2-10} ヘテロシクリル、 C_{6-10} アリールオキシ、カルボキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - C(=O) -、 C_{1-6} アルキル - C(=O) -、 C_{1-6} アルキル - S(=O) -、 C_{1-6} アルキル - S(=O)₂ -、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - S(=O) -、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル - S(=O)₂ -、又はカルボキシ C_{1-6} アルコキシであり、

R^{13} は H、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ、ヒドロキシ置換 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} カルボキシアルコキシ、 C_{1-4} アルキルカルボニル又はヒドロキシ置換 C_{1-4} アルキルカルボニルであり、及び

各 R^{14} 及び R^{14a} は独立に H、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ又は C_{1-6} アルキルアミノである [1] に記載の化合物。

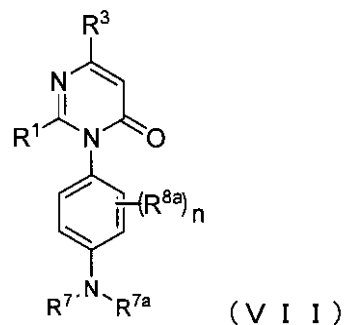
[19]

R^1 は独立に H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、 C_{6-8} アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 又は C_{4-6} ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は NR⁵、O 又は S であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 であり、或いは C_{6-8} アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 及び C_{4-6} ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - の各々は、1 つ又はそれ以上の F、Cl、Br、メチル、エチル、プロピル、エチニル、プロピニル、ブチニル、メトキシ又はシアノで任意に置換されていてもよく、

R^3 は独立に H、F、Cl、I、シアノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ter-ブチル、 C_{6-8} アリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - 又は C_{4-6} ヘテロアリール - (CH₂)_p - G - (CH₂)_m - であり、ただし、各 G は O 又は S であり、各 p 及び m は独立に 0、1、2 又は 3 である [18] に記載の化合物。

[20]

式 (VII) :
 【化 140】



を有し、

ただし、 R^1 は H、F、Cl、Br、I、シアノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ヒドロキシアルコキシ、 C_{1-6} アミノアルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{6-10} アリール - (CH₂)_p - G - (

C_2 - m -、 C_1 - 9 ヘテロアリーール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_3 - 1 - 0 シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0 、 1 、 2 又は 3 であり、或いは C_6 - 1 - 0 アリーール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_1 - 9 ヘテロアリーール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、及び C_3 - 1 - 0 シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - の各々は、1 つ又はそれ以上の F 、 Cl 、 Br 、 I 、メチル、エチル、プロピル、シアノ、エチニル、メトキシ、エトキシ又はプロピニルで任意に置換されていてもよく、

R^3 は H 、 F 、 Cl 、 I 、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - 6 アルキル、 C_1 - 6 ハロアルキル、 C_1 - 6 アルコキシ、 C_1 - 6 ヒドロキシアルコキシ、 C_1 - 6 アミノアルコキシ、 C_1 - 6 ハロアルコキシ、 C_6 - 1 - 0 アリーール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_1 - 9 ヘテロアリーール - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ -、又は C_3 - 1 - 0 シクロアルキル - $(CH_2)_p$ - G - $(CH_2)_m$ - であり、ただし、各 G は O 、 S 、 NR^5 、 $C(=O)$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-OC(=O)-$ 又は $-NHC(=O)NH-$ であり、各 p 及び m は独立に 0 、 1 、 2 又は 3 であり、

各 R^5 は独立に H 、 R^7 R^7^a $NC(=O)-$ 、 R^7 $OC(=O)-$ 、 R^7 $C(=O)-$ 、 C_1 - 3 アルキル、 C_1 - 3 ハロアルキル、 C_1 - 3 ヒドロキシアルキル、 C_1 - 3 アミノアルキル、 C_1 - 3 アルコキシ C_1 - 3 アルキル、 C_1 - 3 アルキルアミノ C_1 - 3 アルキル、 C_1 - 3 アルキルチオ C_1 - 3 アルキル、 C_6 - 1 - 0 アリーール C_1 - 3 アルキル、 C_1 - 9 ヘテロアリーール C_1 - 3 アルキル、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル C_1 - 3 アルキル、 C_3 - 1 - 0 シクロアルキル C_1 - 3 アルキル、 C_6 - 1 - 0 アリーール、 C_1 - 9 ヘテロアリーール、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル又は C_3 - 1 - 0 カルボシクリルであり、

各 R^7 は独立に H 、 C_1 - 6 アルキル、 C_1 - 6 ハロ脂肪族、 C_1 - 6 ヒドロキシ脂肪族、 C_1 - 6 アミノ脂肪族、 C_1 - 6 アルコキシ C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 6 アルキルアミノ C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 6 アルキルチオ C_1 - 6 脂肪族、 C_6 - 1 - 0 アリーール C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 9 ヘテロアリーール C_1 - 6 脂肪族、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル C_1 - 6 脂肪族、 C_3 - 1 - 0 シクロアルキル C_1 - 6 脂肪族、 C_6 - 1 - 0 アリーール、 C_1 - 9 ヘテロアリーール、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル又は C_3 - 1 - 0 カルボシクリルであり、

各 R^7^a は独立に C_1 - 6 アルキル、 C_1 - 6 ハロ脂肪族、 C_1 - 6 ヒドロキシ脂肪族、 C_1 - 6 アミノ脂肪族、 C_1 - 6 アルコキシ C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 6 アルキルアミノ C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 6 アルキルチオ C_1 - 6 脂肪族、 C_6 - 1 - 0 アリーール C_1 - 6 脂肪族、 C_1 - 9 ヘテロアリーール C_1 - 6 脂肪族、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル C_1 - 6 脂肪族、 C_3 - 1 - 0 シクロアルキル C_1 - 6 脂肪族、 C_6 - 1 - 0 アリーール、 C_1 - 9 ヘテロアリーール、 C_2 - 1 - 0 ヘテロシクリル又は C_3 - 1 - 0 カルボシクリルであり、

R^7 及び R^7^a が同じ窒素原子に結合している場合、 R^7 及び R^7^a はそれらが結合している窒素原子と一緒に、任意に、置換又は無置換の 3 - 8 員環を形成していてもよく、

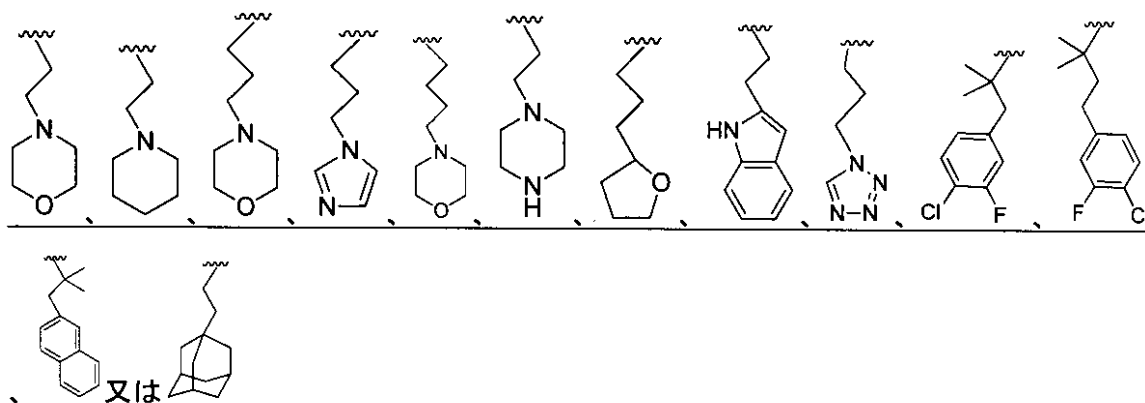
各 R^8^a は独立に H 、ヒドロキシ、アミノ、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-N(CH_3)_2$ 、シアノ、ニトロ、メルカプト、 C_1 - 4 アルキル、トリフルオロメチル、 C_1 - 4 アルコキシ、 C_1 - 4 アルキルアミノ、 C_1 - 4 アルキルチオ、 C_6 - 1 - 0 アリーール、 C_6 - 1 - 0 アリーール C_1 - 4 アルキル又は C_1 - 9 ヘテロアリーールであり、及び

n は 0 、 1 、 2 又は 3 である [1] に記載の化合物。

[2 1]

各 R^7 は独立に H 、 C_1 - 6 アルキル、 C_1 - 4 アルコキシ C_1 - 6 アルキル、

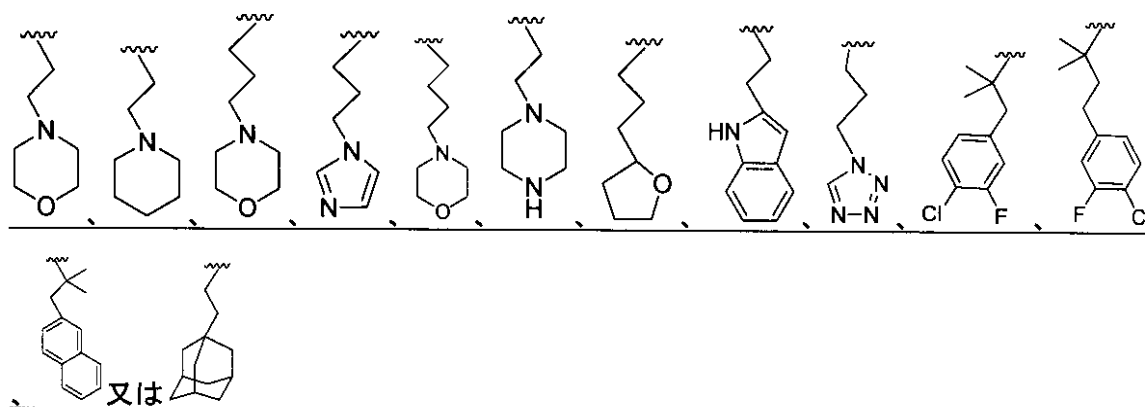
【化 1 4 1】



であり、

各 R^{7a} は独立に C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、

【化 1 4 2】

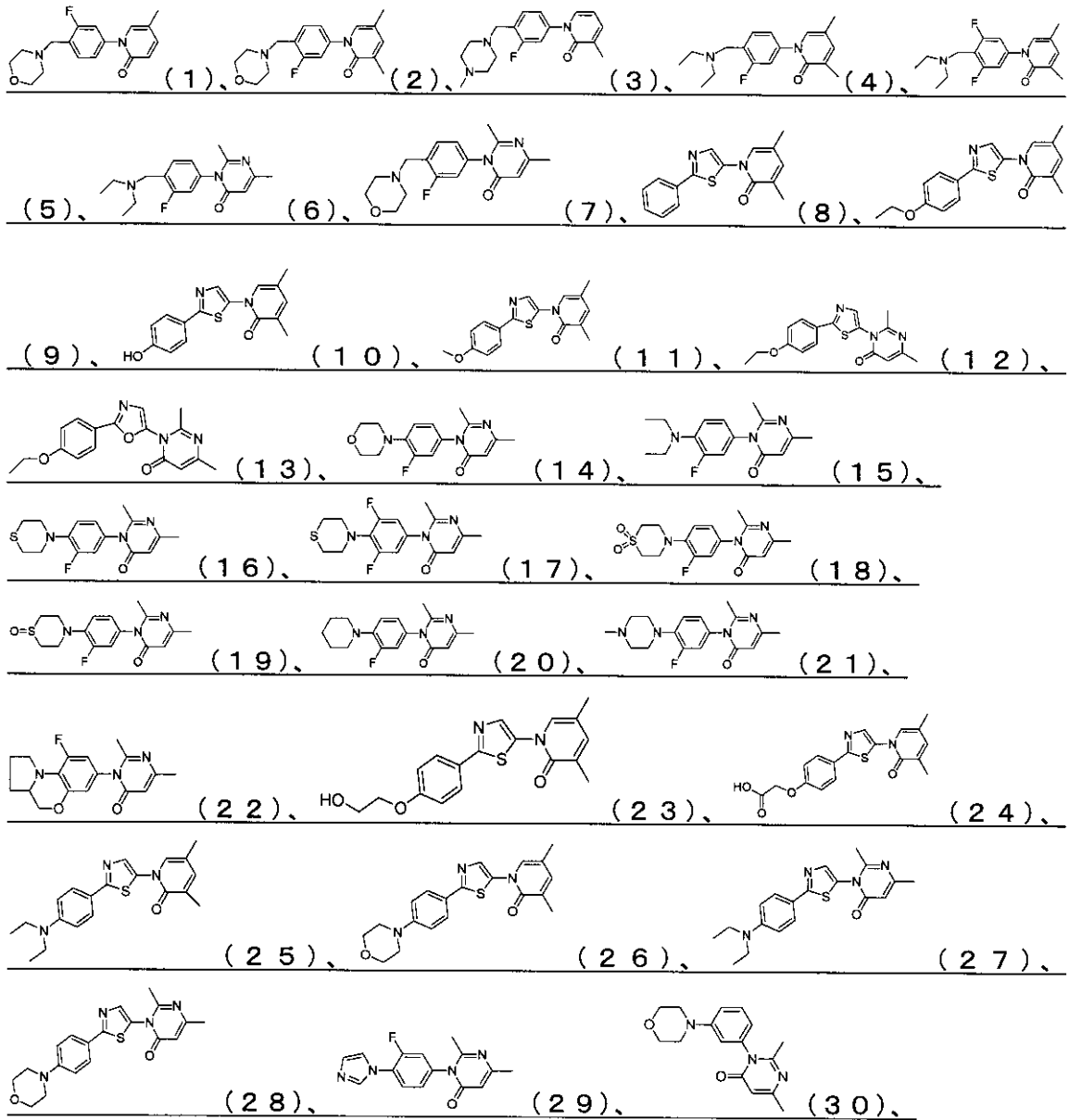


である [2 0] に記載の化合物。

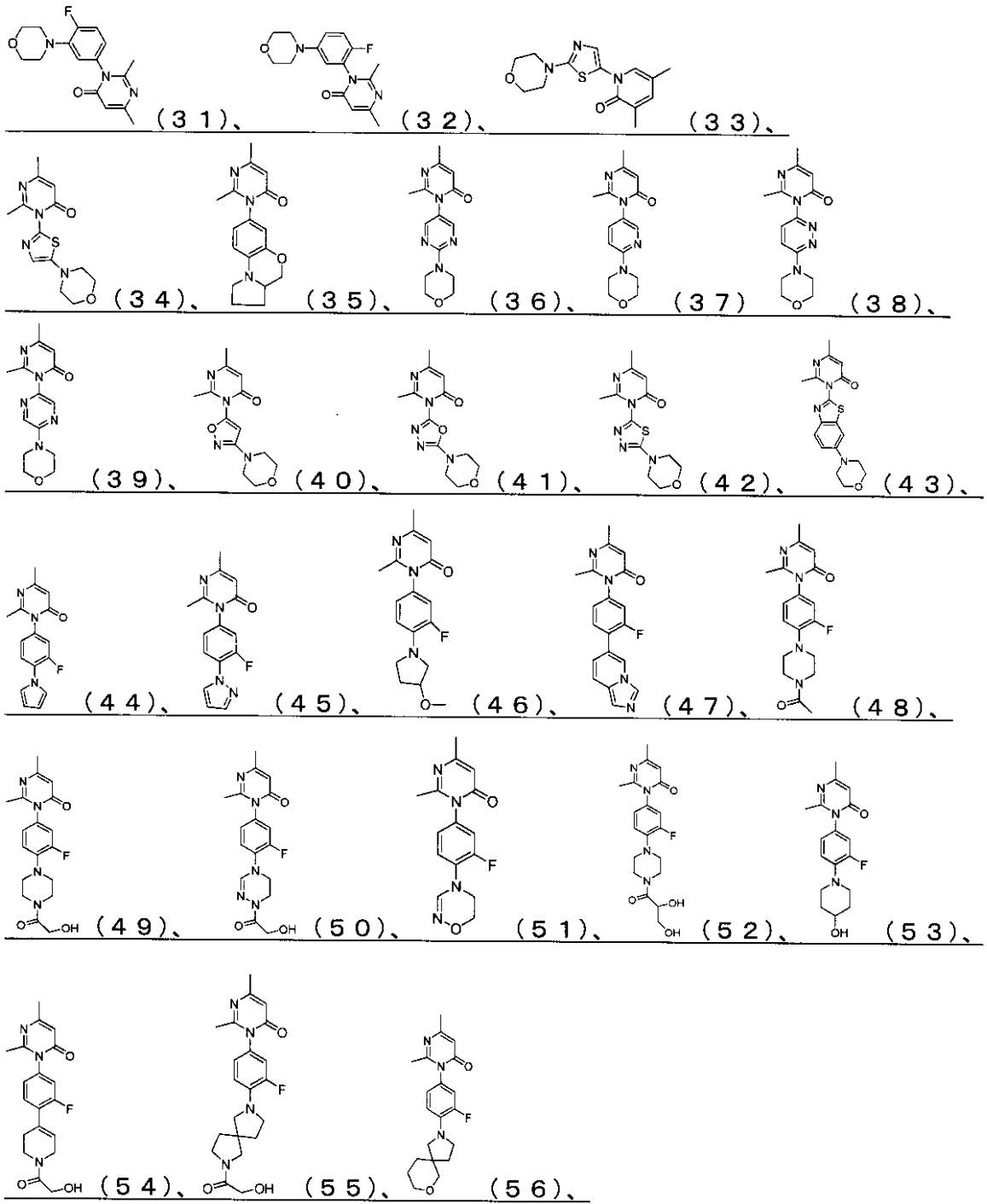
[2 2]

下記構造の一つを有する [1] に記載の化合物、又はそれらの立体異性体、幾何異性体、互変異性体、窒素酸化物、水和物、溶媒和物、若しくは薬学的に許容され得る塩。

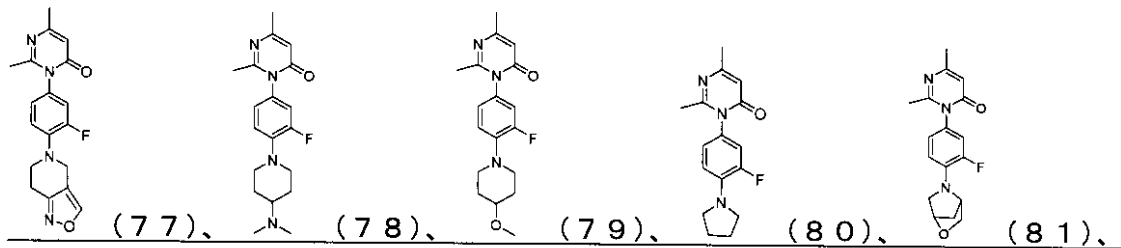
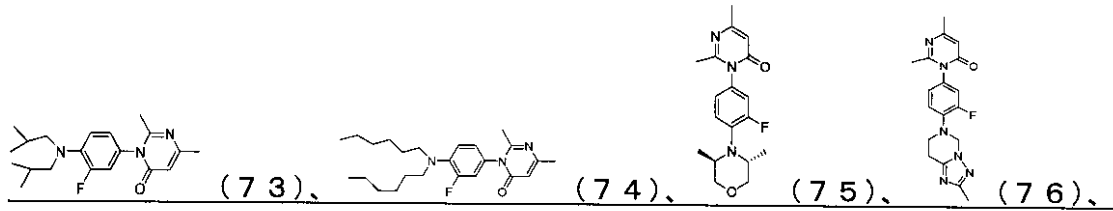
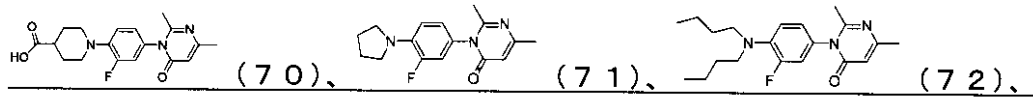
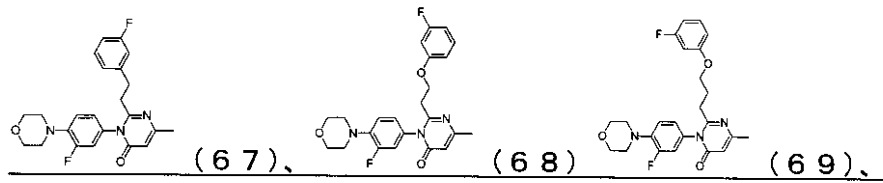
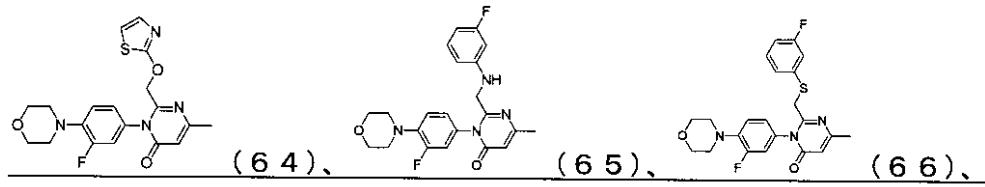
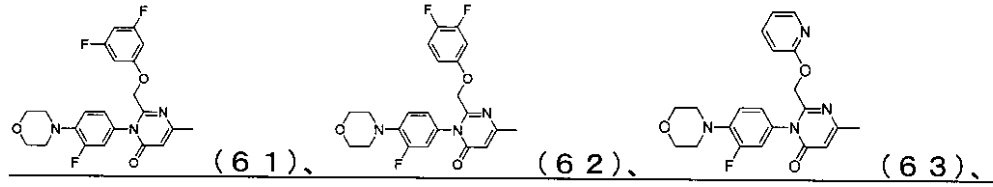
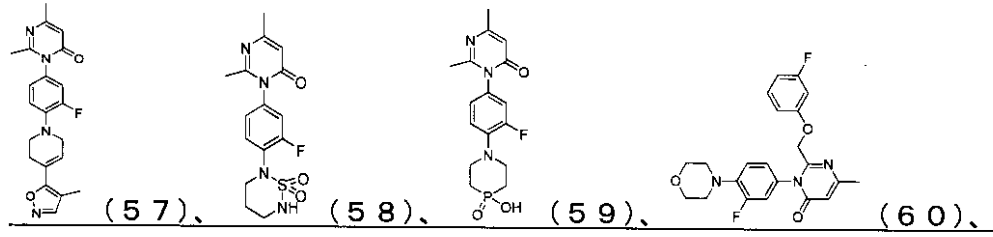
【化 1 4 3 - 1】



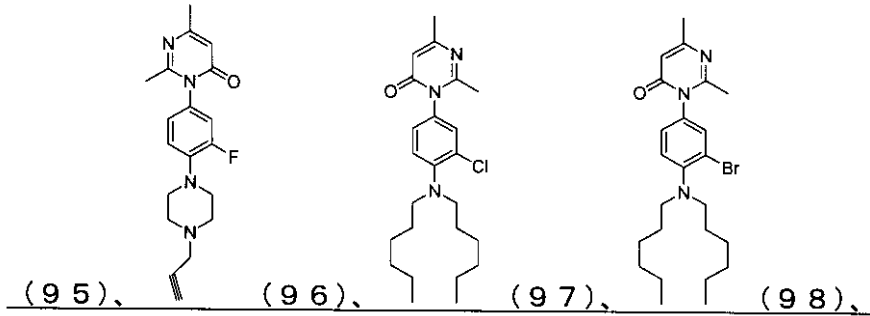
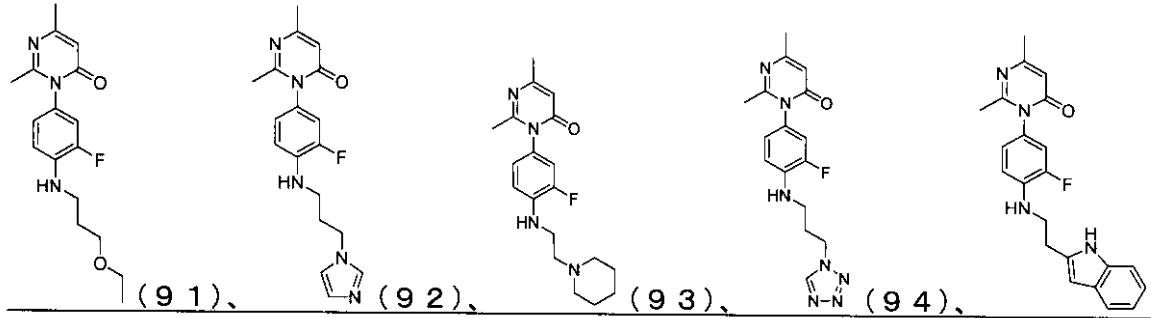
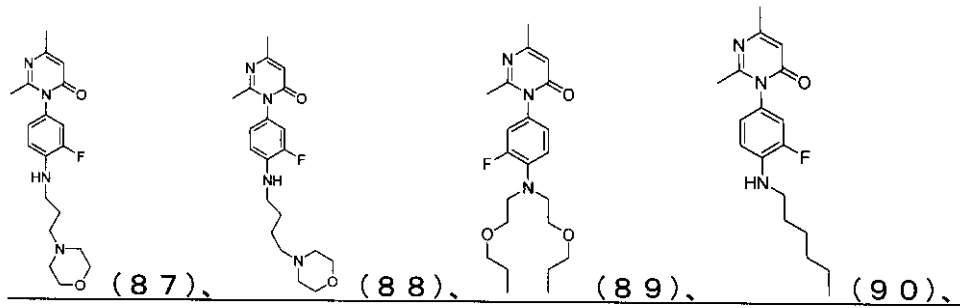
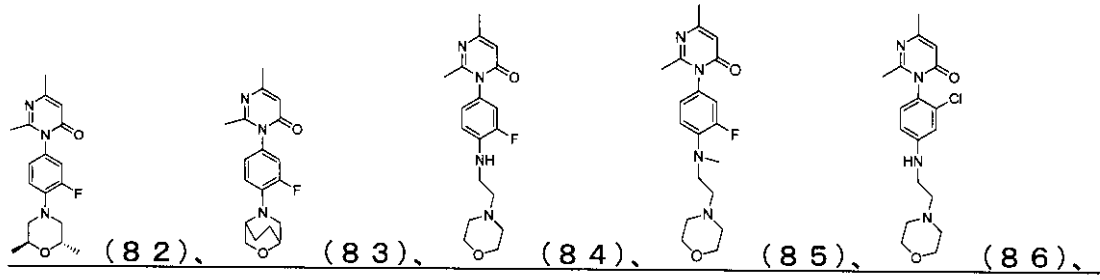
【化 1 4 3 - 2】



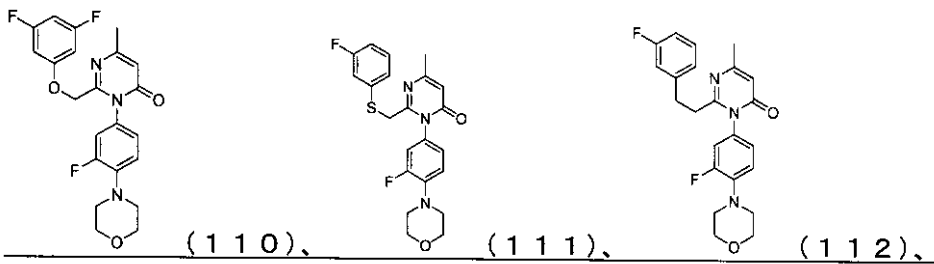
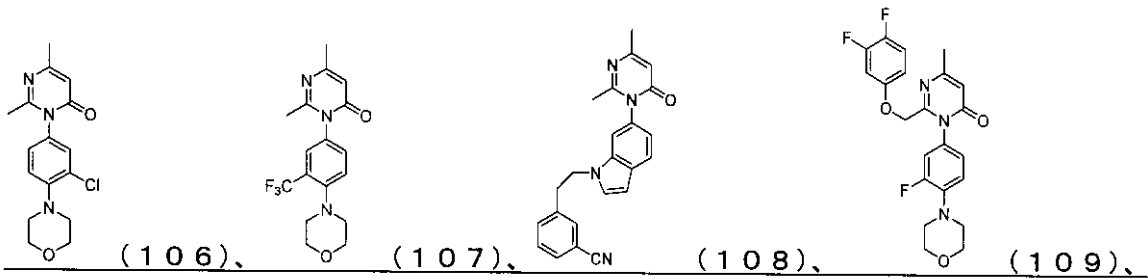
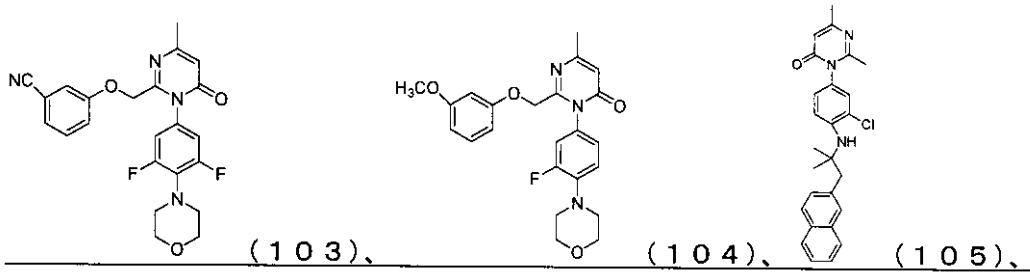
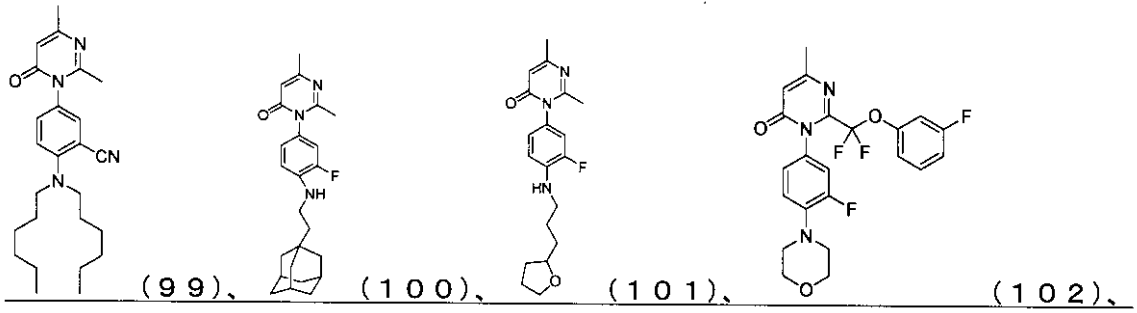
【化 1 4 3 - 3】



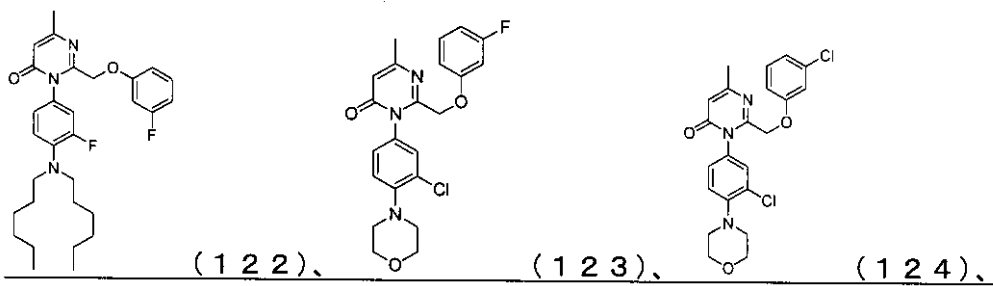
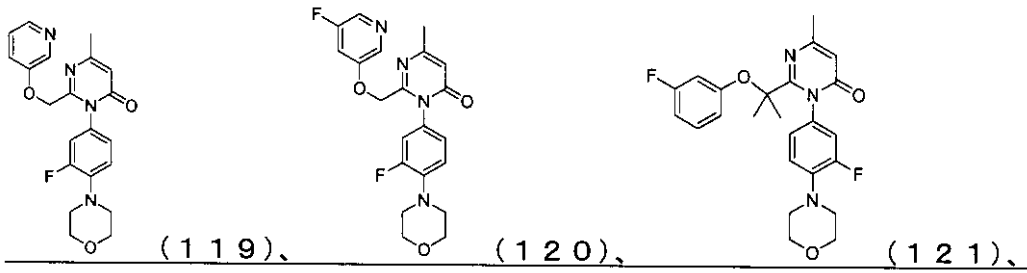
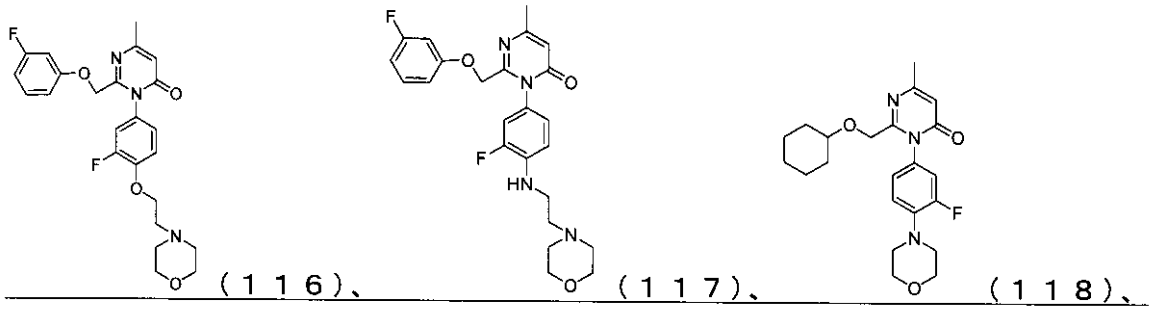
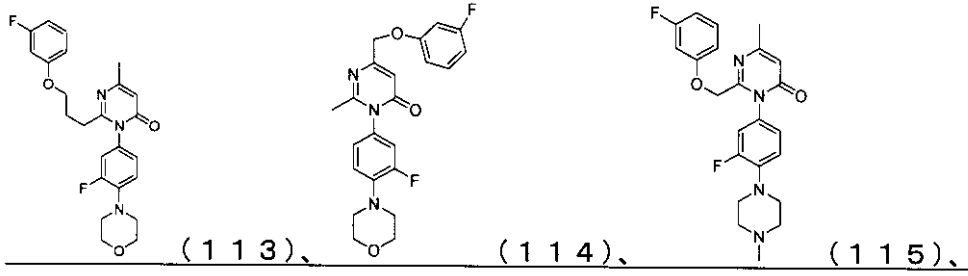
【化 1 4 3 - 4】



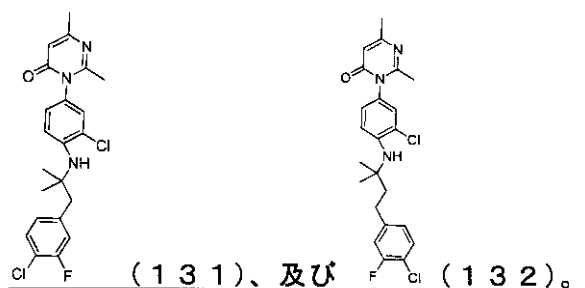
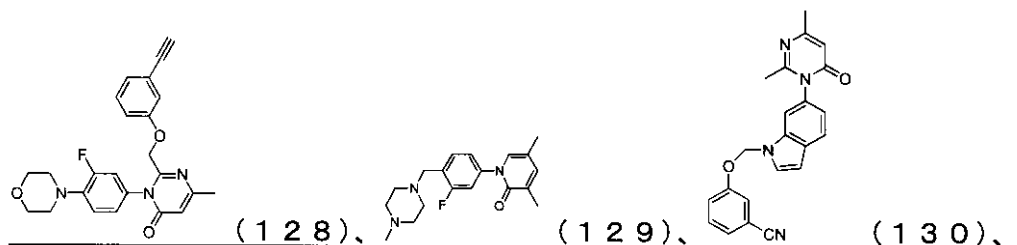
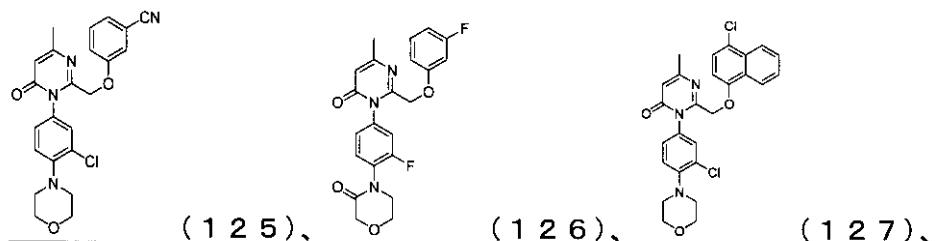
【化 1 4 3 - 5】



【化 1 4 3 - 6】



【化 1 4 3 - 7】



[2 3]

[1] ~ [2 2] のいずれか 1 つに記載の化合物、及び薬学的に許容され得る担体、賦形剤、希釈剤、アジュバント、ビヒクル、又はそれらの組み合わせを含む医薬組成物。

[2 4]

患者における組織又は器官の線維化疾患を予防、処置、治療又はその重症度を軽減する医薬品を製造するための [1] ~ [2 2] のいずれか 1 つに記載の化合物又は [2 3] に記載の医薬組成物の使用。

[2 5]

患者における組織又は器官の線維化疾患を予防、処置、治療又はその重症度を軽減する医薬品の用途に用いられる [1] ~ [2 2] のいずれか 1 つに記載の化合物又は [2 3] に記載の医薬組成物。

[2 6]

患者に有効治療量の [1] ~ [2 2] のいずれか 1 つに記載の化合物又は [2 3] に記載の医薬組成物を投与することを含む患者における組織又は器官の線維化疾患を予防、処置、治療又はその重症度を軽減する方法。

[2 7]

前記組織又は器官の線維化疾患が、腎間質線維化、糸球体硬化、肝線維化、肺線維化、腹膜線維化、心筋線維化、皮膚線維化、術後癒着、良性前立腺過形成、骨格筋線維化、強皮症、多発性硬化症、膵臓線維化、肝硬変、筋肉腫、神経線維腫、肺間質線維化、糖尿病性腎症、アルツハイマー病又は血管線維化疾患である [2 4] に記載の使用。

[2 8]

前記組織又は器官の線維化疾患が、腎間質線維化、糸球体硬化、肝線維化、肺線維化、腹膜線維化、心筋線維化、皮膚線維化、術後癒着、良性前立腺過形成、骨格筋線維化、強皮症、多発性硬化症、膵臓線維化、肝硬変、筋肉腫、神経線維腫、肺間質線維化、糖尿病性腎症、アルツハイマー病又は血管線維化疾患である [2 5] に記載の化合物又は医薬組成物。

[2 9]

前記組織又は器官の線維化疾患が、腎間質線維化、糸球体硬化、肝線維化、肺線維化、腹膜線維化、心筋線維化、皮膚線維化、術後癒着、良性前立腺過形成、骨格筋線維化、強皮症、多発性硬化症、膵臓線維化、肝硬変、筋肉腫、神経線維腫、肺間質線維化、糖尿病性腎症、アルツハイマー病又は血管線維化疾患である [2 6] に記載の方法。

[3 0]

術後癒着が癒痕治癒である [2 7] に記載の用途。

[3 1]

術後癒着が癒痕治癒である [2 8] に記載の化合物又は医薬組成物。

[3 2]

術後癒着が癒痕治癒である [2 9] に記載の方法。