

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年4月12日(2007.4.12)

【公表番号】特表2006-520783(P2006-520783A)

【公表日】平成18年9月14日(2006.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2006-036

【出願番号】特願2006-507176(P2006-507176)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/14	(2006.01)
C 0 7 D 221/20	(2006.01)
C 0 7 D 211/18	(2006.01)
C 0 7 D 295/14	(2006.01)
C 0 7 D 487/10	(2006.01)
C 0 7 D 211/22	(2006.01)
C 0 7 D 211/52	(2006.01)
C 0 7 D 309/14	(2006.01)
C 0 7 D 401/06	(2006.01)
C 0 7 D 211/58	(2006.01)
C 0 7 D 211/42	(2006.01)
C 0 7 D 401/04	(2006.01)
C 0 7 D 405/06	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
A 6 1 K 31/438	(2006.01)
A 6 1 K 31/451	(2006.01)
A 6 1 K 31/495	(2006.01)
A 6 1 K 31/437	(2006.01)
A 6 1 K 31/351	(2006.01)
A 6 1 K 31/444	(2006.01)
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)
A 6 1 K 31/4468	(2006.01)
A 6 1 K 31/4465	(2006.01)
A 6 1 K 31/454	(2006.01)
A 6 1 K 31/4725	(2006.01)
C 0 7 D 471/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/4375	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/02	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 37/08	(2006.01)
A 6 1 P 27/16	(2006.01)
A 6 1 P 17/00	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
C 0 7 D 405/12	(2006.01)
A 6 1 K 31/4433	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/14

C 0 7 D 221/20 C S P  
C 0 7 D 211/18  
C 0 7 D 295/14 A  
C 0 7 D 487/10  
C 0 7 D 211/22  
C 0 7 D 211/52  
C 0 7 D 309/14  
C 0 7 D 401/06  
C 0 7 D 211/58  
C 0 7 D 211/42  
C 0 7 D 401/04  
C 0 7 D 405/06  
C 0 7 D 401/12  
A 6 1 K 31/438  
A 6 1 K 31/451  
A 6 1 K 31/495  
A 6 1 K 31/437  
A 6 1 K 31/351  
A 6 1 K 31/444  
A 6 1 K 31/4545  
A 6 1 K 31/4468  
A 6 1 K 31/4465  
A 6 1 K 31/454  
A 6 1 K 31/4725  
C 0 7 D 471/04 1 1 3  
A 6 1 K 31/4375  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 27/16  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 27/02  
C 0 7 D 405/12  
A 6 1 K 31/4433

**【誤訳訂正書】**

【提出日】平成19年2月19日(2007.2.19)

**【誤訳訂正1】**

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

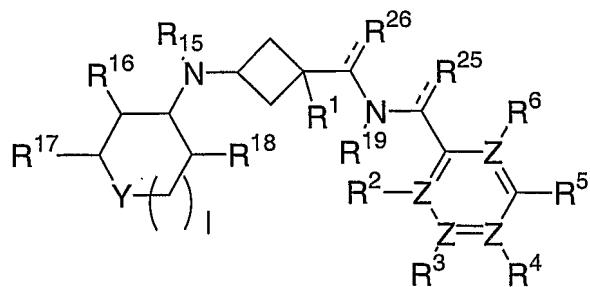
**【訂正の内容】**

【特許請求の範囲】

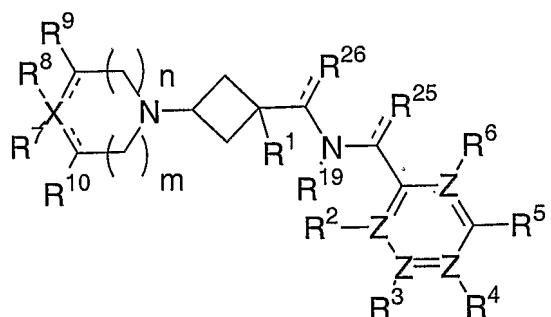
**【請求項1】**

式I又は式II：

【化1】



I



II

(式中、

Xは、O、N、S、SO<sub>2</sub>又はCであり；Yは、-O-、-NR<sup>1-2</sup>-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>-、-NSO<sub>2</sub>R<sup>1-4</sup>-、-NCOR<sup>1-3</sup>-、-CR<sup>1-2</sup>COR<sup>1-1</sup>-、-CR<sup>1-2</sup>OOCOR<sup>1-3</sup>-及び-CO-から選択され；、R<sup>1-1</sup>は、ヒドロキシ、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル及びC<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；R<sup>1-2</sup>は、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル及びC<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；R<sup>1-3</sup>は、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル及びC<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；R<sup>1-4</sup>は、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル、及びトリフルオロメチルから独立に選択され；

各Zは、独立に、C又はNから選択され、Zのうち最大2個がNであり；

R<sup>1</sup>は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) - C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル、
- ( c ) - C<sub>0</sub>~<sub>6</sub> アルキル - O - C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル、
- ( d ) - C<sub>0</sub>~<sub>6</sub> アルキル - S - C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル、
- ( e ) - ( C<sub>0</sub>~<sub>6</sub> アルキル) - ( C<sub>3</sub>~<sub>7</sub> シクロアルキル) - ( C<sub>0</sub>~<sub>6</sub> アルキル )、
- ( f ) ヒドロキシ、
- ( g ) 複素環、
- ( h ) - CN、
- ( i ) - NR<sup>1~2</sup> R<sup>1~2</sup>、
- ( j ) - NR<sup>1~2</sup> COR<sup>1~3</sup>、
- ( k ) - NR<sup>1~2</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>1~4</sup>
- ( l ) - COR<sup>1~1</sup>
- ( m ) - CONR<sup>1~2</sup> R<sup>1~2</sup>、及び
- ( n ) フェニル

から選択され；

前記アルキル及びシクロアルキルは、置換されていないか、又は1から7個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、-O-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、-O-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、-COR<sup>1~1</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>1~4</sup>、-NHCOC<sub>1</sub>H<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-複素環、=O、-CNから独立に選択され、前記フェニル及び複素環は、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、-COR<sup>1~1</sup>、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルコキシ及びトリフルオロメチルから独立に選択される1から3個の置換基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、
- ( c ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、
- ( d ) ヒドロキシ、
- ( e ) クロロ、
- ( f ) フルオロ、
- ( g ) ブロモ、
- ( h ) フェニル、
- ( i ) 複素環、及び
- ( j ) 不存在又はO (R<sup>2</sup> に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>3</sup> は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、
- ( c ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、
- ( d ) ヒドロキシ、
- ( e ) クロロ、
- ( f ) フルオロ、
- ( g ) ブロモ、
- ( h ) フェニル、
- ( i ) 複素環、及び
- ( j ) 不存在又はO (R<sup>3</sup> に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>4</sup> は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1</sub>~<sub>3</sub> アルキル、

- (c) 必要に応じて 1 から 3 個のフルオロ口で置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル、
- (d) ヒドロキシ、
- (e) クロロ、
- (f) フルオロ、
- (g) ブロモ、
- (h) フェニル、
- (i) 複素環、 及び
- (j) 不存在又は O (R<sup>4</sup> に結合している Z が N であるとき)

から選択され；

R<sup>5</sup> は、

(a) C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されており、及び、必要に応じてヒドロキシルで置換されている。)、

(b) - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されている。)、

(c) - CO - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されている。)、

(d) - S - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されている。)、

(e) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル及び COR<sup>1</sup> から選択される一以上の置換基で置換されているピリジル、

(f) フルオロ、

(g) クロロ、

(h) ブロモ、

(i) - C<sub>4</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、

(j) - O - C<sub>4</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、

(k) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル及び COR<sup>1</sup> から選択される一以上の置換基で置換されているフェニル、

(l) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル及び COR<sup>1</sup> から選択される一以上の置換基で置換されている - O - フェニル、

(m) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されている。)、

(n) - O - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換されている。)、

(o) 複素環、

(p) - CN、 及び

(q) - COR<sup>1</sup>

から選択され；

R<sup>6</sup> は、

(a) 水素、

(b) 必要に応じて 1 から 3 個のフルオロ口で置換された C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル、

(c) 必要に応じて 1 から 3 個のフルオロ口で置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル、

(d) ヒドロキシ、

(e) クロロ、

(f) フルオロ、

(g) ブロモ、

(h) フェニル、

(i) 複素環、 及び

(j) 不存在 (R<sup>6</sup> に結合している Z が N であるとき)

から選択され；

R<sup>7</sup> は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - フェニル、
- ( c ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - 複素環、
- ( d ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - C<sub>3</sub> - 7 シクロアルキル、
- ( e ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - COR<sup>1 1</sup>、
- ( f ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - (アルケン) - COR<sup>1 1</sup>、
- ( g ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - SO<sub>3</sub>H、
- ( h ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - W - C<sub>0</sub> - 4 アルキル、
- ( i ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - CONR<sup>1 2</sup> - フェニル、
- ( j ) ( C<sub>0</sub> - 6 アルキル) - CONR<sup>2 0</sup> - V - COR<sup>1 1</sup>、及び
- ( k ) XがO、S又はSO<sub>2</sub>である場合には、不存在

から選択され、

Wは、単結合、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO<sub>2</sub>-、CONR<sup>1 2</sup>及び-NR<sup>1 2</sup>-から選択され、Vは、C<sub>1</sub> - 6 アルキル又はフェニルから選択され、

R<sup>2 0</sup>は、水素、C<sub>1</sub> - 4 アルキルであり、又は、1から5個の炭素を介して、Vの炭素の一つに結合して、環を形成しており、前記C<sub>0</sub> - 6 アルキルは、置換されていないか、又は1から5個の置換基で置換されており、

前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、-C<sub>0</sub> - 6 アルキル、-O-C<sub>1</sub> - 3 アルキル、トリフルオロメチル及び-C<sub>0</sub> - 2 アルキル-フェニルから独立に選択され、

前記フェニル、複素環、シクロアルキル及びC<sub>0</sub> - 4 アルキルは、置換されていないか、又は、1から5個の置換基で置換されており、前記置換基は、ハロ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> - 3 アルキル、-O-C<sub>1</sub> - 3 アルキル、-C<sub>0</sub> - 3 - CO R<sup>1 1</sup>、-CN、-NR<sup>1 2</sup> R<sup>1 2</sup>、-CONR<sup>1 2</sup> R<sup>1 2</sup>及び-C<sub>0</sub> - 3 - 複素環から独立に選択されるか、又は、フェニル及び複素環は融合して、それ自体置換されていない別の複素環となり、又は、ヒドロキシ、ハロ、-COR<sup>1 1</sup>及び-C<sub>1</sub> - 3 アルキルから独立に選択される1から2個の置換基で置換された別の複素環となり、

アルケンは、置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub> - 3 アルキル、フェニル及び複素環から独立に選択される1から3個の置換基で置換されており；

R<sup>8</sup>は、

- ( a ) 水素

( b ) XがO、S、SO<sub>2</sub>若しくはNである場合、又はR<sup>7</sup>とR<sup>1 0</sup>が結合している炭素を二重結合が連結する場合には、不存在、

- ( c ) ヒドロキシ、
- ( d ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル、
- ( e ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル-ヒドロキシ、
- ( f ) -O-C<sub>1</sub> - 3 アルキル、
- ( g ) -COR<sup>1 1</sup>、
- ( h ) -CONR<sup>1 2</sup> R<sup>1 2</sup>、及び
- ( i ) -CN

から選択され、

又は、R<sup>7</sup>とR<sup>8</sup>は互いに結合して、

- ( a ) 1H - インデン、
- ( b ) 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン、
- ( c ) 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン、
- ( d ) 1, 3 - ジヒドロ - イソベンゾフラン、
- ( e ) 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾチオフラン、
- ( f ) 1, 3 - ジヒドロ - イソベンゾチオフラン、
- ( g ) 6H - シクロペンタ [d] イソキサゾール - 3 - オール、

( h ) シクロペンタン、及び

( i ) シクロヘキサン

から選択される環を形成し、

形成された環は、置換されていないか、若しくは、ハロ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、 $C_{1-3}$ アルキル、-O-C<sub>1-3</sub>アルキル、-C<sub>0-3</sub>-COR<sup>1-1</sup>、-CN、-NR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、-CONR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>及び-C<sub>0-3</sub>-複素環から独立に選択される1から5個の置換基で置換されており、

又は、R<sup>7</sup>とR<sup>9</sup>若しくはR<sup>8</sup>とR<sup>1-0</sup>は、互いに結合して、フェニル若しくは複素環である環を形成し、該環は、置換されていないか、若しくは、ハロ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、 $C_{1-3}$ アルキル、-O-C<sub>1-3</sub>アルキル、-COR<sup>1-1</sup>、-CN、-NR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>及び-CONR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>から独立に選択される1から7個の置換基で置換されており、

R<sup>9</sup>とR<sup>1-0</sup>は、

( a ) 水素、

( b ) ヒドロキシ、

( c ) C<sub>1-6</sub>アルキル、

( d ) C<sub>1-6</sub>アルキル-COR<sup>1-1</sup>、

( e ) C<sub>1-6</sub>アルキル-ヒドロキシ、

( f ) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、

( g ) =O(R<sup>9</sup>又はR<sup>1-0</sup>が、二重結合を介して環に結合している場合)、及び

( h ) ハロ、

から独立に選択され、

R<sup>1-5</sup>は、水素であり、又は、置換されていないC<sub>1-6</sub>アルキルであり若しくはハロ、ヒドロキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>C<sub>1-6</sub>アルキル及び-O-C<sub>1-3</sub>アルキルから独立に選択される1から3個の置換基で置換されたC<sub>1-6</sub>アルキルであり；

R<sup>1-6</sup>は、

( a ) 水素、

( b ) C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>から選択される1から6個の置換基で置換されている。)、

( c ) フルオロ、

( d ) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から3個のフルオロで置換されている。)、

( e ) C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、

( f ) -O-C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、

( g ) ヒドロキシ、

( h ) -COR<sup>1-1</sup>、

( i ) -OCOR<sup>1-3</sup>、

から選択され、

又は、R<sup>1-5</sup>とR<sup>1-6</sup>は、C<sub>2-4</sub>アルキル若しくはC<sub>0-2</sub>アルキル-O-C<sub>1-3</sub>アルキル鎖を介して、互いに連結されて、5から7員環を形成し；

R<sup>1-7</sup>は、

( a ) 水素、

( b ) C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>から選択される1から6個の置換基で置換されている。)、

( c ) COR<sup>1-1</sup>、

( d ) ヒドロキシ、及び

( e ) -O-C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>から選択される1から6個の置換基で置

換されている。)、

又は、 $R^{1-6}$  と  $R^{1-7}$  は、 $C_{1-4}$  アルキル鎖若しくは  $C_{0-3}$  アルキル - O -  $C_{0-3}$  アルキル鎖によって、互いに連結されて、3から6員環を形成し；  
 $R^{1-8}$  は、

(a) 水素、及び

(b)  $C_{1-6}$  アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されている。)、

(c) フルオロ、

(d) -O-C<sub>3-6</sub> シクロアルキル、及び

(e) -O-C<sub>1-3</sub> アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されている。)

から選択され、

又は  $R^{1-6}$  と  $R^{1-8}$  は、 $C_{2-3}$  アルキル鎖によって互いに連結されて5から6員環を形成し、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>、 $C_{1-3}$  アルキル及び $C_{1-3}$  アルコキシから独立に選択される1から3個の置換基で置換されており、

又は  $R^{1-6}$  と  $R^{1-8}$  は、 $C_{1-2}$  アルキル - O -  $C_{1-2}$  アルキル鎖によって互いに連結されて6から8員環を形成し、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>、 $C_{1-3}$  アルキル及び $C_{1-3}$  アルコキシから独立に選択される1から3個の置換基で置換されており、

又は  $R^{1-6}$  と  $R^{1-8}$  は、-O-C<sub>1-2</sub> アルキル - O - 鎖によって互いに連結されて6から7員環を形成し、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、-COR<sup>1-1</sup>、 $C_{1-3}$  アルキル及び $C_{1-3}$  アルコキシから独立に選択される1から3個の置換基で置換されており；

$R^{1-9}$  は、

(a) 水素、

(b) フェニル、

(c) 置換されていないか、又は以下の置換基：-COR<sup>1-1</sup>、ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、-O-C<sub>1-3</sub> アルキルの1から6個で置換された $C_{1-6}$  アルキル、  
 から選択され、

又は  $R^2$  と  $R^{1-9}$  は、

(a) -CH<sub>2</sub>(CR<sup>2-8</sup>R<sup>2-8</sup>)<sub>1-3</sub>-、

(b) -CH<sub>2</sub>NR<sup>2-9</sup>-、

(c) -NR<sup>2-9</sup>CR<sup>2-8</sup>R<sup>2-8</sup>-、

(d) -CH<sub>2</sub>O、

(e) -CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-、

(f) -CH<sub>2</sub>SO-、

(g) -CH<sub>2</sub>S-、

(h) -CR<sup>2-8</sup>R<sup>2-8</sup>

から選択されるリンカーによって、互いに連結されて複素環を形成し、

$R^{2-8}$  は、

(a) 水素、

(b) ヒドロキシ、

(c) ハロ、

(d)  $C_{1-3}$  アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ及びヒドロキシから独立に選択される1から6個の置換基で置換されている。)

(e) -NR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、

(f) -COR<sup>1-1</sup>、

(g) -CONR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、

(h) -NR<sup>1-2</sup>COR<sup>1-3</sup>、

- ( i ) - O C O N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> 、  
 ( j ) - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> C O N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> 、  
 ( k ) - 複素環、  
 ( l ) - C N 、  
 ( m ) - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> - S O<sub>2</sub> - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> 、  
 ( n ) - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> - S O<sub>2</sub> - R<sup>1</sup> R<sup>4</sup> 、  
 ( o ) - S O<sub>2</sub> - N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> 、及び  
 ( p ) = O ( R<sup>2</sup> R<sup>8</sup> が、二重結合を介して前記環に結合されており、同じ位置にある他方の R<sup>2</sup> R<sup>8</sup> が不存在である場合 )

から選択され、

R<sup>2</sup> R<sup>9</sup> は、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル（アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、ヒドロキシ、C O R<sup>1</sup> R<sup>3</sup>、S O<sub>2</sub> R<sup>1</sup> R<sup>4</sup> 及び S O<sub>2</sub> N R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> から独立に選択される 1 から 6 個の置換基で置換されている。）から選択され；、

R<sup>2</sup> R<sup>5</sup> 及び R<sup>2</sup> R<sup>6</sup> は、

( a ) = O ( R<sup>2</sup> R<sup>5</sup> 及び / 又は R<sup>2</sup> R<sup>6</sup> が水素であり、二重結合を介して結合されている場合 )、

( b ) 水素、

( c ) フェニル、

( d ) 以下の置換基：- C O R<sup>1</sup> R<sup>1</sup> 、ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、- O - C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルの 1 から 6 個で置換され、又は置換されていない C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、

から独立に選択され；

m は、0、1 又は 2 から選択され；

n は、1 又は 2 から選択され；

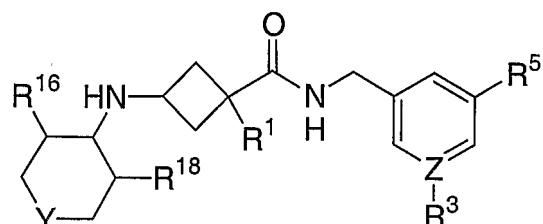
破線は、単結合又は二重結合を表す。）

の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

### 【請求項 2】

式 I a :

### 【化 2】



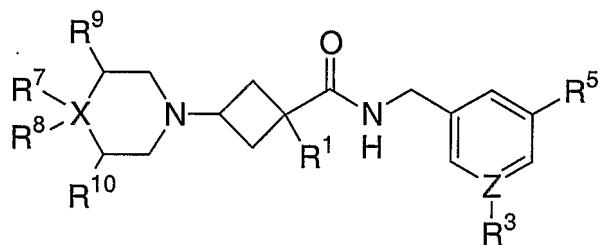
Ia

( R<sup>1</sup> 、 R<sup>3</sup> 、 R<sup>5</sup> 、 R<sup>1</sup> R<sup>6</sup> 、 R<sup>1</sup> R<sup>7</sup> 、 Y 及び Z は、請求項 1 に定義されている。 ) の、請求項 1 に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

### 【請求項 3】

式 I I a :

## 【化3】



IIa

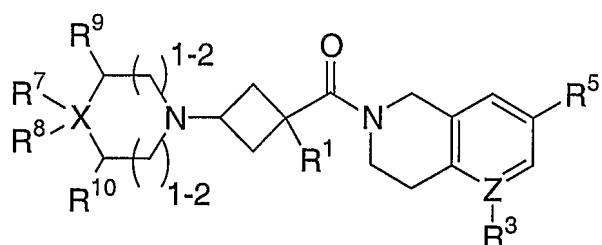
(R<sup>1</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、X及びZは、請求項1に記載されている。)

の、請求項1に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

## 【請求項4】

式I I b :

## 【化4】



IIIb

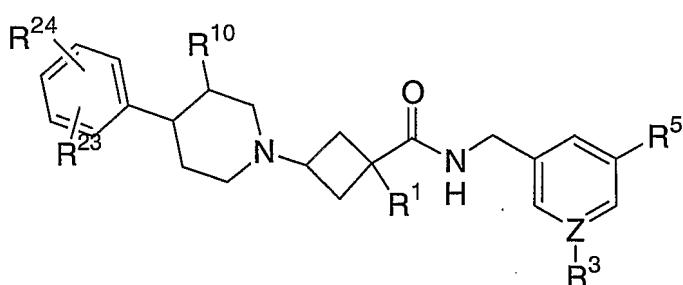
(R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、X及びZは、請求項1に定義されている。)

の、請求項1に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

## 【請求項5】

式I I c :

## 【化5】



IIc

(R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>10</sup>及びZは、請求項1に記載されており、R<sup>2</sup><sub>3</sub>及びR<sup>2</sup><sub>4</sub>は、

- (a) 水素、
- (b) ハロ、
- (c) トリフルオロメチル、
- (d) ヒドロキシ、

- (e)  $C_1 - C_3$  アルキル、
- (f)  $-O - C_1 - C_3$  アルキル、
- (g)  $-C_0 - C_3 - CO_2 H$ 、
- (h)  $-C_0 - C_3 - CO_2 C_1 - C_3$  アルキル、
- (i)  $-CN$ 、及び
- (j)  $-C_0 - C_3$  - 複素環、

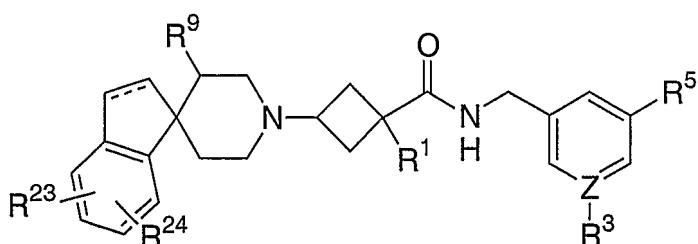
から独立に選択され、

又は、 $R^{2^3}$  と  $R^{2^4}$  は、互いに連結されて複素環を形成し、該複素環はフェニル環に縮合されており、それ自体、置換されていないか、又はヒドロキシ、ハロ、 $-COR^{1^1}$  及び  $-C_1 - C_3$  アルキルから独立に選択される 1 から 2 個の置換基で置換されている。) の、請求項 1 に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

#### 【請求項 6】

式 I I d :

#### 【化 6】



IIId

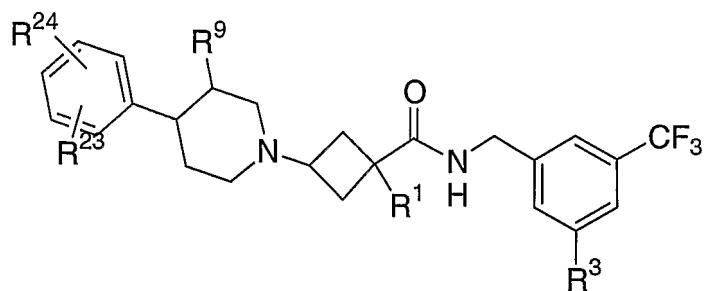
( $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $R^9$ 、 $R^{2^3}$ 、 $R^{2^4}$  及び  $Z$  は、請求項 1 に定義されており、破線は、単結合又は二重結合を表す。)

の、請求項 1 に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩およびそれらの各ジアステレオマー。

#### 【請求項 7】

式 I I e :

#### 【化 7】



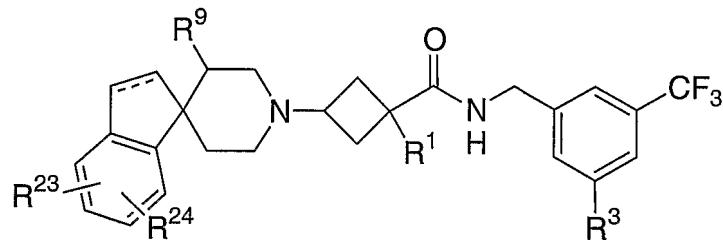
IIle

( $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $R^{1^0}$ 、 $R^{2^3}$  及び  $R^{2^4}$  は、請求項 1 に記載されている。) の、請求項 1 に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

#### 【請求項 8】

式 I I f :

## 【化8】



IIIf

(R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>2-3</sup>及びR<sup>2-4</sup>は、請求項1に定義されている。)の、請求項1に記載の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマー。

## 【請求項9】

R<sup>1</sup>が、水素、フェニル、複素環、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>0-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル及び-(C<sub>0-6</sub>アルキル)-(C<sub>3-7</sub>シクロアルキル)-(C<sub>0-6</sub>アルキル)から選択され、

前記アルキル、フェニル、複素環及びシクロアルキルは、置換されていないか、又は、

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、
- (f) C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (g) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (h) -COR<sup>1-1</sup>、
- (i) -CN、
- (j) -NR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、及び
- (k) -CONR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>

から独立に選択される1から7個の置換基で置換されている、請求項8に記載の化合物。

## 【請求項10】

R<sup>1</sup>が、

- (1) 置換されていない-C<sub>1-6</sub>アルキル、又は、
  - (a) ハロ、
  - (b) ヒドロキシ、
  - (c) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
  - (d) トリフルオロメチル、及び
  - (e) -COR<sup>1-1</sup>

から独立に選択される1から6個の置換基で置換されている-C<sub>1-6</sub>アルキル、

- (2) 置換されていない-C<sub>0-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-、又は、
  - (a) ハロ、
  - (b) トリフルオロメチル、及び
  - (c) -COR<sup>1-1</sup>

から独立に選択される1から6個の置換基で置換されている-C<sub>0-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-、

- (3) 置換されていない-(C<sub>3-5</sub>シクロアルキル)-(C<sub>0-6</sub>アルキル)、又は、
  - (a) ハロ、
  - (b) ヒドロキシ、

- (c) - O - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、及び
- (e) - COR<sup>1</sup><sup>1</sup>

から独立に選択される 1 から 7 個の置換基で置換されている - (C<sub>3</sub> -<sub>5</sub> シクロアルキル)  
- (C<sub>0</sub> -<sub>6</sub> アルキル)、

- (4) 置換されていないフェニル若しくは複素環、又は、
- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) - O - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、及び
- (e) - COR<sup>1</sup><sup>1</sup>

から独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されているフェニル若しくは複素環、  
から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 1】

R<sup>1</sup> が、

- (a) 水素、
- (b) 置換されていない C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、又はフルオロ及びヒドロキシから独立に  
選択される 1 から 6 個の置換基で置換されている C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、
- (c) フェニル、及び
- (d) ピリジル、

から選択される、請求項 1 0 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 2】

Z が C であり、R<sup>3</sup> が、

- (a) 水素
- (b) ハロ
- (c) ヒドロキシ
- (d) C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ及びヒド  
ロキシから独立に選択される 1 から 6 個の置換基で置換されている。)
- (e) - COR<sup>1</sup><sup>1</sup>、
- (f) - CONR<sup>1</sup><sup>2</sup> R<sup>1</sup><sup>2</sup>、
- (g) - 複素環、
- (h) - NR<sup>1</sup><sup>2</sup> - SO<sub>2</sub> - NR<sup>1</sup><sup>2</sup> R<sup>1</sup><sup>2</sup>、
- (i) - NR<sup>1</sup><sup>2</sup> - SO<sub>2</sub> - R<sup>1</sup><sup>4</sup>、
- (j) - SO<sub>2</sub> - NR<sup>1</sup><sup>2</sup> R<sup>1</sup><sup>2</sup>、
- (k) - ニトロ、及び
- (l) - NR<sup>1</sup><sup>2</sup> R<sup>1</sup><sup>2</sup>

から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 3】

Z が C であり、R<sup>3</sup> が、

- (a) フルオロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) 水素

から選択される、請求項 1 2 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 4】

R<sup>5</sup> が、

- (a) 1 から 6 個のフルオロで置換された C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、
- (b) 1 から 6 個のフルオロで置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、
- (c) クロロ、
- (d) プロモ、及び
- (e) フェニル

から選択される、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 15】

$R^7$  がフェニル、複素環、 $C_{3\sim7}$  シクロアルキル、 $C_{1\sim6}$  アルキル、 $-COR^{1\sim1}$  及び $-CONH-V-COR^{1\sim1}$  であり、V は  $C_{1\sim6}$  アルキル又はフェニルから選択され、前記フェニル、複素環、 $C_{3\sim7}$  シクロアルキル及び  $C_{1\sim6}$  アルキルは、置換されていないか、又は、

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) ヒドロキシ、
- (d)  $C_{1\sim3}$  アルキル、
- (e)  $-O-C_{1\sim3}$  アルキル、
- (f)  $-COR^{1\sim1}$  、
- (g)  $-CN$  、
- (h) 複素環、及び
- (i)  $-CORN^{1\sim2}R^{1\sim2}$

から独立に選択される 1 から 5 の置換基で置換されている、

請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 16】

$X$  が O でない場合に、 $R^7$  がフェニル、複素環、 $C_{1\sim4}$  アルキル、 $-COR^{1\sim1}$  又は $-CONH-V-COR^{1\sim1}$  であり；

V が  $C_{1\sim6}$  アルキル又はフェニルから選択され；

前記フェニル、複素環及び  $C_{1\sim4}$  アルキルが、置換されていないか、又は、

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c)  $C_{1\sim3}$  アルキル、
- (d)  $-O-C_{1\sim3}$  アルキル、
- (e)  $-COR^{1\sim1}$  、及び
- (f) 複素環

から独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されている、

請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

$R^{1\sim0}$  が、

- (a) 水素、
- (b) ヒドロキシ、
- (c)  $-CH_3$  、
- (d)  $-O-CH_3$  、及び
- (e)  $=O(R^9)$  ( $R^9$  が、二重結合を介して前記環に連結されている場合)

から選択される、

請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 18】

$R^{1\sim6}$  が、

- (a) 水素、
- (b) 置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換されている  $C_{1\sim3}$  アルキル、
- (c)  $-O-C_{1\sim3}$  アルキル、
- (d) フルオロ、及び
- (e) ヒドロキシ

から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 19】

$R^{1\sim6}$  が、

- ( a ) 水素、
- ( b ) トリフルオロメチル、
- ( c ) メチル、
- ( d ) メトキシ、
- ( e ) エトキシ、
- ( f ) エチル、
- ( g ) フルオロ、及び
- ( h ) ヒドロキシ

から選択される、

請求項 1 8 に記載の化合物。

**【請求項 2 0】**

不活性担体と請求項 1 に記載の化合物とを含む、薬学的組成物。

**【請求項 2 1】**

請求項 1 に記載の化合物の有効量の投与を含む、哺乳動物のケモカイン受容体活性を調節する方法。

**【請求項 2 2】**

請求項 1 に記載の化合物の有効量を患者に投与することを含む、炎症性及び免疫調節疾患又は疾病のリスクを治療し、改善し、抑制し、又は低減する方法。

**【請求項 2 3】**

請求項 1 に記載の化合物の有効量を患者に投与することを含む、関節リウマチのリスクを治療し、改善し、抑制し、又は低減する方法。

**【誤訳訂正 2】**

**【訂正対象書類名】**明細書

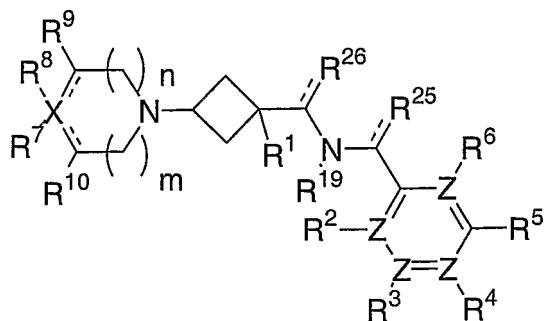
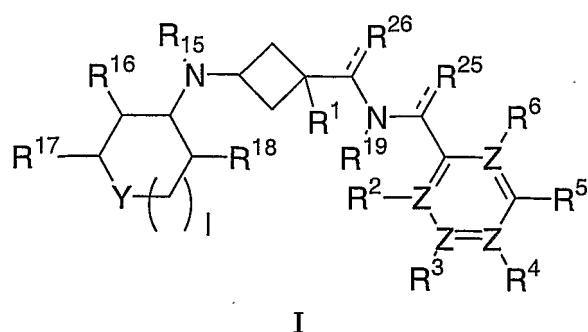
**【訂正対象項目名】**0 0 1 1

**【訂正方法】**変更

**【訂正の内容】**

**【0 0 1 1】**

**【化 9】**



(式中、

Xは、O、N、S、SO<sub>2</sub>又はCから選択され；

Yは、-O-、-NR<sup>1-2</sup>-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>-、-NSO<sub>2</sub>R<sup>1-4</sup>-、-NCOR<sup>1-3</sup>-、-CR<sup>1-2</sup>COR<sup>1-1</sup>-、-CR<sup>1-2</sup>OCONR<sup>1-3</sup>-、-CO-から選択され；、

R<sup>1-1</sup>は、ヒドロキシ、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルから独立に選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル、シクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されることができ、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；

R<sup>1-2</sup>は、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されることができ、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；

R<sup>1-3</sup>は、水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されることができ、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；

R<sup>1-4</sup>は、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、ベンジル、フェニル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され、前記アルキル、フェニル、ベンジル及びシクロアルキル基は、置換されていないか、又は1から3個の置換基で置換されることができ、前記置換基は、ハロ、ヒドロキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル及びトリフルオロメチルから独立に選択され；

Zは、独立に、C又はNから選択され、Zのうち最大2個がNであり；

R<sup>1</sup>は、

水素、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>0-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>0-6</sub>アルキル-S-C<sub>1-6</sub>アルキル、-(C<sub>0-6</sub>アルキル)-(C<sub>3-7</sub>シクロアルキル)-(C<sub>0-6</sub>アルキル)、ヒドロキシ、複素環、-CN、-NR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、-NR<sup>1-2</sup>COR<sup>1-3</sup>、-NR<sup>1-2</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1-4</sup>、-COR<sup>1-1</sup>、-CONR<sup>1-2</sup>R<sup>1-2</sup>、及びフェニル  
から選択され；

前記アルキル及びシクロアルキルは、置換されていないか、又は1から7個の置換基で置換されており、前記置換基は、

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (d) トリフルオロメチル、
- (f) C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (g) -O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (h) -COR<sup>1-1</sup>、
- (i) -SO<sub>2</sub>R<sup>1-4</sup>、
- (j) -NHCOC<sub>1-3</sub>、
- (k) -NH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、
- (l) 複素環、
- (m) =O、
- (n) -CN

から独立に選択され、

前記フェニル及び複素環は、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、-C<sub>OR<sup>1</sup></sub><sup>1</sup>、C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ及びトリフルオロメチルから独立に選択される1から3個の置換基で置換されており；

R<sup>2</sup>は、

- (a) 水素、
- (b) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1-3</sub>アルキル、
- (c) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (d) ヒドロキシ、
- (e) クロロ、
- (f) フルオロ、
- (g) ブロモ、
- (h) フェニル、
- (i) 複素環、及び
- (j) 無又はO(R<sup>2</sup>に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>3</sup>は、

- (a) 水素、
- (b) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1-3</sub>アルキル、
- (c) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (d) ヒドロキシ、
- (e) クロロ、
- (f) フルオロ、
- (g) ブロモ、
- (h) フェニル、
- (i) 複素環、及び
- (j) 無又はO(R<sup>3</sup>に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>4</sup>は、

- (a) 水素、
- (b) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1-3</sub>アルキル、
- (c) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1-3</sub>アルキル、
- (d) ヒドロキシ、
- (e) クロロ、
- (f) フルオロ、
- (g) ブロモ、
- (h) フェニル、
- (i) 複素環、及び
- (j) 無又はO(R<sup>4</sup>に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>5</sup>は、

- (a) C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることができ、及び、必要に応じてヒドロキシルで置換されている。)、
- (b) -O-C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることができる。)、
- (c) -CO-C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることがある。)、
- (d) -S-C<sub>1-6</sub>アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることがある。)、
- (e) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1-4</sub>アルキル及びC<sub>OR<sup>1</sup></sub><sup>1</sup>から選択される一以上の置換基で置換されることができるピリジル、

( f ) フルオロ、

( g ) クロロ、

( h ) ブロモ、

( i ) - C<sub>4</sub>-<sub>6</sub> シクロアルキル、

( j ) - O - C<sub>4</sub>-<sub>6</sub> シクロアルキル、

( k ) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル及びCOR<sup>1</sup><sup>1</sup> から選択される一以上の置換基で置換されることができるフェニル、

( l ) 置換されていないか、又は、ハロ、トリフルオロメチル、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル及びCOR<sup>1</sup><sup>1</sup> から選択される一以上の置換基で置換されることができる-O-フェニル、

( m ) - C<sub>3</sub>-<sub>6</sub> シクロアルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることができる。)、

( n ) - O - C<sub>3</sub>-<sub>6</sub> シクロアルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から6個のフルオロで置換されることができる。)、

( o ) 複素環、

( p ) - CN、及び

( q ) - COR<sup>1</sup><sup>1</sup>

から選択され；

R<sup>6</sup> は、

( a ) 水素、

( b ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換されたC<sub>1</sub>-<sub>3</sub> アルキル、

( c ) 必要に応じて1から3個のフルオロで置換された-O-C<sub>1</sub>-<sub>3</sub> アルキル、

( d ) ヒドロキシ、

( e ) クロロ、

( f ) フルオロ、

( g ) ブロモ、

( h ) フェニル、

( i ) 複素環、及び

( j ) 無又はO( R<sup>6</sup> に結合しているZがNであるとき)

から選択され；

R<sup>7</sup> は、

水素、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-フェニル、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-複素環、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-C<sub>3</sub>-<sub>7</sub> シクロアルキル、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-COR<sup>1</sup><sup>1</sup>、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-(アルケン)-COR<sup>1</sup><sup>1</sup>、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-SO<sub>3</sub>H、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-W-C<sub>0</sub>-<sub>4</sub> アルキル、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-CONR<sup>1</sup><sup>2</sup>-フェニル、(C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル)-CONR<sup>2</sup><sup>0</sup>-V-COR<sup>1</sup><sup>1</sup>、不存在(XがO、S又はSO<sub>2</sub> である場合)

から選択され、

Wは、単結合、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO<sub>2</sub>-、CONR<sup>1</sup><sup>2</sup> 及び-NR<sup>1</sup><sup>2</sup>-から選択され、Vは、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub> アルキル又はフェニルから選択され、R<sup>2</sup><sup>0</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキルとことができ、又は、R<sup>2</sup><sup>0</sup>は、1から5個の炭素を介して、Vの炭素の一つに結合して、環を形成しており、前記C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキルは、置換されていないか、又は1から5個の置換基で置換されており、前記置換基は、

( a ) ハロ、

( b ) ヒドロキシ、

( c ) - C<sub>0</sub>-<sub>6</sub> アルキル、

( d ) - O - C<sub>1</sub>-<sub>3</sub> アルキル、

( e ) トリフルオロメチル、及び

( f ) - C<sub>0</sub>-<sub>2</sub> アルキル-フェニル

から独立に選択され、

前記フェニル、複素環、シクロアルキル及び $C_{0\sim 4}$ アルキルは、置換されていないか、又は、1から5個の置換基で置換されており、前記置換基は、

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) ヒドロキシ
- (d)  $C_{1\sim 3}$ アルキル、
- (e) -O-C<sub>1~3</sub>アルキル、
- (f) -C<sub>0~3</sub>-COR<sup>1~1</sup>、
- (g) -CN、
- (h) -NR<sup>1~2</sup>R<sup>1~2</sup>、
- (i) -CONR<sup>1~2</sup>R<sup>1~2</sup>、及び
- (j) -C<sub>0~3</sub>複素環、

から独立に選択されるか、

又は、前記フェニル及び複素環は縮合して、それ自体置換されていなくてもよい別の複素環となることができ、又は、ヒドロキシ、ハロ、-COR<sup>1~1</sup>及び-CNアルキルから独立に選択される1から2個の置換基で置換された別の複素環となることができる、

アルケンは、置換されていないか、又は、

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c)  $C_{1\sim 3}$ アルキル、
- (d) フェニル、及び
- (e) 複素環

から独立に選択される1から3個の置換基で置換されており、

$R^8$ は、

(a) 水素

(b) XがO、S、SO<sub>2</sub>若しくはNである場合、又はR<sup>7</sup>とR<sup>1~0</sup>が結合している炭素を二重結合が連結する場合には、不存在

- (c) ヒドロキシ、
- (d)  $C_{1\sim 6}$ アルキル、
- (e)  $C_{1\sim 6}$ アルキル-ヒドロキシ、
- (f) -O-C<sub>1~3</sub>アルキル、
- (g) -COR<sup>1~1</sup>、
- (h) -CONR<sup>1~2</sup>R<sup>1~2</sup>、及び
- (i) -CN

から選択され、

又は、R<sup>7</sup>とR<sup>8</sup>は互いに結合して、

- (a) 1H-インデン、
- (b) 2,3-ジヒドロ-1H-インデン、
- (c) 2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン、
- (d) 1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン、
- (e) 2,3-ジヒドロ-ベンゾチオフラン、
- (f) 1,3-ジヒドロ-イソベンゾチオフラン、
- (g) 6H-シクロペンタ[d]イソキサゾール-3-オール、
- (h) シクロペンタン、及び
- (i) シクロヘキサン

から選択される環を形成し、

形成された環は、置換されていないか、若しくは、

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、

- (c) ヒドロキシ、
- (d)  $C_1 \sim 3$  アルキル、
- (e) -O- $C_1 \sim 3$  アルキル、
- (f) - $C_0 \sim 3$ -COR<sup>1 1</sup>、
- (g) -CN、
- (h) -NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、
- (i) -CONR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、及び
- (j) -C<sub>0</sub><sub>~</sub>3複素環、

から独立に選択される1から5個の置換基で置換されることができ、

又は、R<sup>7</sup>とR<sup>9</sup>若しくはR<sup>8</sup>とR<sup>1 0</sup>は、互いに結合して、フェニル若しくは複素環である環を形成することができ、

該環は、置換されていないか、若しくは、

- (a) ハロ、
- (b) トリフルオロメチル、
- (c) ヒドロキシ、
- (d)  $C_1 \sim 3$  アルキル、
- (e) -O- $C_1 \sim 3$  アルキル、
- (f) -COR<sup>1 1</sup>、
- (g) -CN、
- (h) -NR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>、及び
- (i) -CONR<sup>1 2</sup>R<sup>1 2</sup>

から独立に選択される1から7個の置換基で置換されており、

R<sup>9</sup>とR<sup>1 0</sup>は、

- (a) 水素、
- (b) ヒドロキシ、
- (c)  $C_1 \sim 6$  アルキル、
- (d)  $C_1 \sim 6$  アルキル-COR<sup>1 1</sup>、
- (e)  $C_1 \sim 6$  アルキル-ヒドロキシ、
- (f) -O- $C_1 \sim 3$  アルキル、
- (g) =O(R<sup>9</sup>又はR<sup>1 0</sup>が、二重結合を介して環に結合している場合)、及び
- (h) ハロ、

から独立に選択され、

R<sup>1 5</sup>は、

- (a) 水素であり、及び

(b) 置換されていない $C_1 \sim 6$  アルキル又は(ハロ、ヒドロキシ、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub><sub>~</sub>6アルキル及び-O-C<sub>1</sub><sub>~</sub>3アルキルから独立に選択される1から3個の置換基で置換された)C<sub>1</sub><sub>~</sub>6アルキル；

から選択され、

R<sup>1 6</sup>は、

- (a) 水素、

(b)  $C_1 \sim 6$  アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、C<sub>1</sub><sub>~</sub>3アルコキシ、ヒドロキシ、-COR<sup>1 1</sup>から選択される1から6個の置換基で置換されることがある。)、

- (c) フルオロ、

(d) -O-C<sub>1</sub><sub>~</sub>3アルキル(アルキルは、置換されていないか、又は1から3個のフルオロで置換されることがある。)、及び

- (e) C<sub>3</sub><sub>~</sub>6シクロアルキル、
- (f) -O-C<sub>3</sub><sub>~</sub>6シクロアルキル、
- (g) ヒドロキシ、
- (h) -COR<sup>1 1</sup>、

( i ) - O C O R<sup>1-3</sup>、

から選択され、

又は、 R<sup>1-5</sup> と R<sup>1-6</sup> は、 C<sub>2-4</sub> アルキル若しくは C<sub>0-2</sub> アルキル - O - C<sub>1-3</sub> アルキル鎖を介して、互いに連結されて、 5 から 7 員環を形成することができ； R<sup>1-7</sup> は、

( a ) 水素、

( b ) C<sub>1-6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、 C<sub>1-3</sub> アルコキシ、ヒドロキシ、 - C O R<sup>1-1</sup> から選択される 1 から 6 個の置換基で置換されることができる。 )

( c ) - C O R<sup>1-1</sup>、

( d ) ヒドロキシ、及び

( e ) - O - C<sub>1-6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ、 C<sub>1-3</sub> アルコキシ、ヒドロキシ、 - C O R<sup>1-1</sup> から選択される 1 から 6 個の置換基で置換できることができる。 )

から選択され、

又は、 R<sup>1-6</sup> と R<sup>1-7</sup> は、 C<sub>1-4</sub> アルキル鎖若しくは C<sub>0-3</sub> アルキル - O - C<sub>0-3</sub> アルキル鎖によって、互いに連結されて、 3 から 6 員環を形成することができ；

R<sup>1-8</sup> は、

( a ) 水素、及び

( b ) C<sub>1-6</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換できることができる。 )、

( c ) フルオロ、

( d ) - O - C<sub>3-6</sub> シクロアルキル、及び

( e ) - O - C<sub>1-3</sub> アルキル (アルキルは、置換されていないか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換できることができる。 )

から選択され、

又は R<sup>1-6</sup> と R<sup>1-8</sup> は、 C<sub>2-3</sub> アルキル鎖によって互いに連結されて 5 から 6 員環を形成し、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、 - C O R<sup>1-1</sup> 、 C<sub>1-3</sub> アルキル及び C<sub>1-3</sub> アルコキシから独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されており、

又は R<sup>1-6</sup> と R<sup>1-8</sup> は、 C<sub>1-2</sub> アルキル - O - C<sub>1-2</sub> アルキル鎖によって互いに連結されて 6 から 8 員環を形成することができ、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、 - C O R<sup>1-1</sup> 、 C<sub>1-3</sub> アルキル及び C<sub>1-3</sub> アルコキシから独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されており、

又は R<sup>1-6</sup> と R<sup>1-8</sup> は、 - O - C<sub>1-2</sub> アルキル - O - 鎖によって互いに連結されて 6 から 7 員環を形成することができ、前記アルキルは、置換されていないか、又はハロ、ヒドロキシ、 - C O R<sup>1-1</sup> 、 C<sub>1-3</sub> アルキル及び C<sub>1-3</sub> アルコキシから独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されており、

R<sup>1-9</sup> は、

( a ) 水素、

( b ) フェニル、

( c ) 置換されていない C<sub>1-6</sub> アルキル、又は以下の置換基： - C O R<sup>1-1</sup> 、ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、 - O - C<sub>1-3</sub> アルキルの 1 から 6 個で置換できることできる C<sub>1-6</sub> アルキル、

から選択され、

又は、 R<sup>2</sup> と R<sup>1-9</sup> は、以下のリスト (リンカーの左側が、 R<sup>1-9</sup> のアミド窒素に結合される。 )

( a ) - C H<sub>2</sub> ( C R<sup>2-8</sup> R<sup>2-8</sup> )<sub>1-3</sub> - 、

( b ) - C H<sub>2</sub> N R<sup>2-9</sup> - 、

( c ) - N R<sup>2-9</sup> C R<sup>2-8</sup> R<sup>2-8</sup> - 、

- ( d ) - C H<sub>2</sub> O - ,
- ( e ) - C H<sub>2</sub> S O<sub>2</sub> - ,
- ( f ) - C H<sub>2</sub> S O - ,
- ( g ) - C H<sub>2</sub> S - ,
- ( h ) - C R<sup>2</sup><sub>8</sub> R<sup>2</sup><sub>8</sub> - ,

から選択されるリンカーによって、互いに連結されて複素環を形成することもでき、R<sup>2</sup><sub>8</sub>は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) ヒドロキシ、
- ( c ) ハロ、

( d ) C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ及びヒドロキシから独立に選択される1から6個の置換基で置換されている。)

- ( e ) - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> ,
- ( f ) - C O R<sup>1</sup><sub>1</sub> ,
- ( g ) - C O N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> ,
- ( h ) - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> C O R<sup>1</sup><sub>3</sub> ,
- ( i ) - O C O N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> ,
- ( j ) - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> C O N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> ,
- ( k ) - 複素環、
- ( l ) - C N ,
- ( m ) - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> - S O<sub>2</sub> - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> ,
- ( n ) - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> - S O<sub>2</sub> - R<sup>1</sup><sub>4</sub> ,
- ( o ) - S O<sub>2</sub> - N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub> , 及び

( p ) = O ( R<sup>2</sup><sub>8</sub> が、二重結合を介して前記環に結合されており、この場合、同じ位置にある他方の R<sup>2</sup><sub>8</sub> が不存在である。)

から選択され、

R<sup>2</sup><sub>9</sub>は、

- ( a ) 水素、
- ( b ) C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキル(アルキルは、置換されていないか、又はフルオロ及びヒドロキシから独立に選択される1から6個の置換基で置換されている。),
- ( c ) C O R<sup>1</sup><sub>3</sub> ,
- ( d ) S O<sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>4</sub> , 及び
- ( e ) S O<sub>2</sub> N R<sup>1</sup><sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub>

から選択され、

R<sup>2</sup><sub>5</sub> 及び R<sup>2</sup><sub>6</sub> は、

( a ) = O ( R<sup>2</sup><sub>5</sub> 及び / 又は R<sup>2</sup><sub>6</sub> が酸素であり、二重結合を介して結合されている場合)、

( b ) 水素、

( c ) フェニル、

( d ) 以下の置換基 : - C O R<sup>1</sup><sub>1</sub> , ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、- O - C<sub>1</sub> -<sub>3</sub> アルキルの1から6個で置換されることが可能、又は置換されていないC<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

から独立に選択され；

mは、0、1又は2から選択され；

nは、1又は2から選択され；

破線は、単結合又は二重結合を表す。)

の化合物並びに薬学的に許容されるそれらの塩及びそれらの各ジアステレオマーに関する。