

【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21年3月19日(2009.3.19)

【公表番号】特表2008-526869(P2008-526869A)

【公表日】平成20年7月24日(2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-029

【出願番号】特願2007-550462(P2007-550462)

【国際特許分類】

C 07 D 233/90	(2006.01)
A 61 K 31/4164	(2006.01)
C 07 D 231/14	(2006.01)
A 61 K 31/415	(2006.01)
C 07 D 333/38	(2006.01)
A 61 K 31/381	(2006.01)
C 07 D 207/34	(2006.01)
A 61 K 31/40	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/433	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
A 61 K 31/4025	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
A 61 K 31/404	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 K 31/428	(2006.01)
A 61 K 31/4178	(2006.01)
A 61 K 31/4155	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/422	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 15/08	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 21/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 233/90	C S P A
C 07 D 233/90	C
A 61 K 31/4164	

C 0 7 D 231/14
A 6 1 K 31/415
C 0 7 D 333/38
A 6 1 K 31/381
C 0 7 D 207/34
A 6 1 K 31/40
A 6 1 K 31/454
C 0 7 D 417/12
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 31/433
C 0 7 D 405/12
A 6 1 K 31/4025
C 0 7 D 401/12
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/5377
C 0 7 D 403/12
A 6 1 K 31/404
A 6 1 K 31/4709
C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
A 6 1 K 31/519
A 6 1 K 31/428
A 6 1 K 31/4178
A 6 1 K 31/4155
C 0 7 D 413/12
A 6 1 K 31/422
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 15/08
A 6 1 P 19/08
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 37/00
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 21/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月6日(2009.1.6)

【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

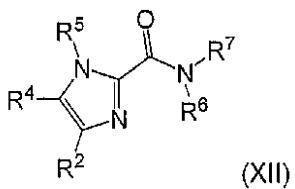
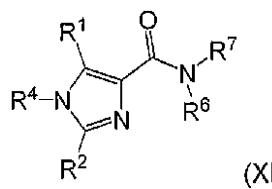
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

単一異性体、異性体混合物として、あるいは異性体のラセミ混合物として；あるいは溶媒和物または多形物として；あるいはプロドラッグまたは代謝物として；あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩としての、式(XI)または(XII)の化合物：

【化1】



ここで：

R¹ および R² は、それぞれ別個に、水素、シアノ、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換したヘテロアラルキルである；

R⁵ は、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換したヘテロアラルキルである；

R⁴ は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、-R⁸-OR⁹、-R⁸-SR⁹、-R⁸-S(O)_tR¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)₂、-R⁸-CN、-R⁸-C(O)R⁹、-R⁸-C(S)R⁹、-R⁸-C(NR⁹)R⁹、-R⁸-C(O)OR⁹、-R⁸-C(S)OR⁹、-R⁸-C(NR⁹)OR⁹、-R⁸-C(O)N(R⁹)₂、-R⁸-C(S)N(R⁹)₂、-R⁸-C(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-C(O)SR⁹、-R⁸-C(S)SR⁹、-R⁸-C(NR⁹)SR⁹、-R⁸-S(O)_tOR⁹（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N=C(R⁹)₂、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)R¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)C(O)R¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)OR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(NR⁹)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(S)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)N(R⁹)₂、-R⁸-N(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-N(R⁹)S(O)_tR¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-OC(O)R¹⁰、-R⁸-OC(NR⁹)R¹⁰、-R⁸-OC(S)R¹⁰、-R⁸-OC(O)OR¹⁰、-R⁸-OC(NR⁹)OR¹⁰、-R⁸-OC(S)OR¹⁰、-R⁸-OC(O)SR⁹、-R⁸-OC(O)N(R⁹)₂、-R⁸-OC(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-OC(S)N(R⁹)₂、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(O)R⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(NR⁹)R⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(O)OR⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(S)

) OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹
 - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ -
 C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)S
 R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)SR⁹ および - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C
 (NR⁹)SR⁹ からなる群から選択される；あるいは

R⁴ は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 - R⁸ - OR⁹、 - R⁸ - SR⁹、 - R⁸ - S(O)_tR¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - N(R⁹)₂、 - R⁸ - CN、 - R⁸ - C(O)R⁹、 - R⁸ - C(S)R⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)R⁹、 - R⁸ - C(O)OR⁹、 - R⁸ - C(S)OR⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O)SR⁹、 - R⁸ - C(S)SR⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)SR⁹、 - R⁸ - S(O)_tOR⁹ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂ = C(R⁹)₂、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(O)R¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(O)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)R¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)OR¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)SR¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)S(O)_tR¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - OC(O)R¹⁰、 - R⁸ - OC(NR⁹)R¹⁰、 - R⁸ - OC(S)R¹⁰、 - R⁸ - OC(O)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(NR⁹)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(S)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(O)SR⁹、 - R⁸ - OC(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - OC(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - OC(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(CNR⁹)R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)SR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)SR⁹ および - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)SR⁹ からなる群から選択される；

R⁶ は、水素である；

R⁷ は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ニトロ、ハロ、 - OR¹⁴、 - SR¹⁴、 - S(O)_tR¹⁵ (ここで、tは、1または2である)、 - N(R¹⁴)₂、 - CN、 - C(O)R¹⁴、 - C(S)R¹⁴、 - C(NR¹⁴)R¹⁴、 - C(O)OR¹⁴、 - C(S)OR¹⁴、 - C(NR¹⁴)OR¹⁴、 - C(O)N(R¹⁴)₂、 - C(S)N(R¹⁴)₂、 - C(NR¹⁴)N(R¹⁴)₂、 - C(O)S

R^{1-4} 、 $-C(S)SR^{1-4}$ 、 $-C(NR^{1-4})SR^{1-4}$ 、 $-S(O)_tOR^{1-4}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})N= C(R^{1-4})_2$ 、 $-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-N(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)OR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(S)SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})S(O)_tR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-OC(O)R^{1-5}$ 、 $-OC(NR^{1-4})R^{1-5}$ 、 $-OC(S)R^{1-5}$ 、 $-OC(O)OR^{1-5}$ 、 $-OC(NR^{1-4})OR^{1-5}$ 、 $-OC(S)OR^{1-5}$ 、 $-OC(O)SR^{1-4}$ 、 $-OC(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-OC(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-OC(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)R^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)R^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)SR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)SR^{1-4}$ および $-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})SR^{1-4}$ からなる群から選択される；

あるいは R^7 は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^{1-3}-OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-S(O)_tR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-CN$ 、 $-R^{1-3}-C(O)R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(S)R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(O)SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(S)SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})S$ 、 R^{1-4} 、 $-R^{1-3}-S(O)_tOR^{1-4}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})N=C(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(NR^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)OR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)SR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})SR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(S)SR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-O(C(O)R^{1-5})$ 、 $-R^{1-3}-O(C(NR^{1-4})R^{1-5})$ 、 $-R^{1-3}-O(C(S)R^{1-5})$

R^1 ⁵、- R^1 ³- O $\text{C}(\text{O})\text{OR}^1$ ⁵、- R^1 ³- O $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) OR^1 ⁵、- R^1 ³
 - O $\text{C}(\text{S})\text{OR}^1$ ⁵、- R^1 ³- O $\text{C}(\text{O})\text{SR}^1$ ⁴、- R^1 ³- O $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、
 - R^1 ³- O $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) $\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、- R^1 ³- O $\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、
 - R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})\text{R}^1$ ⁴、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})\text{R}^1$ ⁴、
 - R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) R^1 ⁴、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
 - R^1 ⁶- $\text{C}(\text{O})\text{OR}^1$ ⁴、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{S})\text{OR}^1$ ⁴、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) OR^1 ⁴、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{S})\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) $\text{N}(\text{R}^1$ ⁴)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{O})$
)₂、- R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{S})\text{SR}^1$ ⁴ および - R^1 ³- $\text{C}(\text{O})\text{-R}^1$ ⁶- $\text{C}(\text{NR}^1$ ⁴) SR^1 ⁴ からなる群から選択される ;

ここで、各 R^8 および R^1 ³ は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、または必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各 R^9 は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2 個の R^9 は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各 R^1 ⁴ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2 個の R^1 ⁴ は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各 R^1 ⁰ および R^1 ⁵ は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；そして

ここで、各 R^1 ¹ および R^1 ⁶ は、それぞれ別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

但し、式(XI)の R^1 および R^2 の少なくとも 1 個は、水素ではない；そして

但し、式(XII)の R^2 および R^5 の少なくとも 1 個は、水素ではなく、そして

但し、式(XI)は、以下を除外する：

2, 5-ジメチル-1-フェニル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸フェニルアミド；

1-(4-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-メチル-N-フェニル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド；

2, 5-ジメチル-N、1-ジフェニル-1H-イミダゾール-4-カルボキサミド；

1-[4-[5-(アセチルアミノ-メチル)-2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル]-2-フルオロ-フェニル]-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(2, 6-ジメトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド；

1-[4-[5-(アセチルアミノ-メチル)-2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル]-2-フルオロ-フェニル]-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(5-アセチル

アミノ - ピリジン - 2 - イル) - アミド ;

1 - { 4 - [5 - (アセチルアミノ - メチル) - 2 - オキソ - オキサゾリジン - 3 - イル] - 2 - フルオロ - フェニル} - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (5 - メチル - ピリジン - 2 - イル) - アミド ;

1 - { 4 - [5 - (アセチルアミノ - メチル) - 2 - オキソ - オキサゾリジン - 3 - イル] - 2 - フルオロ - フェニル} - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (5 - プロモ - ピリジン - 2 - イル) - アミド ;

1 - { 4 - [5 - (アセチルアミノ - メチル) - 2 - オキソ - オキサゾリジン - 3 - イル] - 2 - フルオロ - フェニル} - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリミジン - 5 - イル) - アミド ;

1 - (3 - シアノ - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (2' - 第三級ブチルスルフィナモイル - ビフェニル - 4 - イル) - アミド ; および

1 - (3 - カルバムイミドイル - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (2' - 第三級ブチルスルフィナモイル - ビフェニル - 4 - イル) - アミド ; そして、但し、式(XII)は、以下を除外する :

N - (4 - クロロフェニル) - 4 - エチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

N - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

N - (4 - プロモフェニル) - 4 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

N - (4 - エトキシフェニル) - 4 - エチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

N - (4 - エトキシフェニル) - 4 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

N , 5 - ジフェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボキサミド ;

5 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミド ;

4 - エチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - エトキシ - フェニル) - アミド ;

4 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - エトキシ - フェニル) - アミド ;

5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - エトキシ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ビス - (4 - メトキシ - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - エトキシ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ジフェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - エトキシ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ビス - (4 - クロロ - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - フルオロ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ジフェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - ニトロ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ジフェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - クロロ - フェニル) - アミド ;

4 , 5 - ジフェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - プロモ - フェニル) - アミド ; および

4 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - クロロ - フェニル) - アミド。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで：

R^4 は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)_2$ 、 $-R^8-CN$ 、 $-R^8-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)S(R^9)$ 、 $-R^8-C(S)SR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tOR^9$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)N=C(R^9)_2$ 、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(O)R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)C(O)R^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-OOC(O)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)SR^9$ 、 $-R^8-OOC(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)SR^9$ および $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)SR^9$ からなる群から選択される；そして

R⁷は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、-R¹₃-OR¹₄、-R¹₃-SR¹₄、-R¹₃-S(O)_tR¹₅(ここで、tは、1または2である)、-R¹₃-N(R¹₄)₂、-R¹₃-CN、-R¹₃-C(O)R¹₄、-R¹₃-C(S)R¹₄、-R¹₃-C(NR¹₄)R¹₄、-R¹₃-C(O)OR¹₄、-R¹₃-C(S)OR¹₄、-R¹₃-C(NR¹₄)O R¹₄、-R¹₃-C(O)N(R¹₄)₂、-R¹₃-C(S)N(R¹₄)₂、-R

R^{1-3} - C(NR¹⁻⁴)N(R¹⁻⁴)₂、-R¹⁻³-C(O)SR¹⁻⁴、-R¹⁻³-C(S)SR¹⁻⁴、-R¹⁻³-C(NR¹⁻⁴)SR¹⁻⁴、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)₂（ここで、tは、1または2である）、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)N(R¹⁻⁴)₂（ここで、tは、1または2である）、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)N=C(R¹⁻⁴)₂、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)C(O)R¹⁻⁵（ここで、tは、1または2である）、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)C(O)N(R¹⁻⁴)₂（ここで、tは、1または2である）、-R¹⁻³-S(O)_tN(R¹⁻⁴)C(NR¹⁻⁴)N(R¹⁻⁴)₂（ここで、tは、1または2である）および-R¹⁻³-N(R¹⁻⁴)S(O)_tR¹⁻⁵（ここで、tは、1または2である）からなる群から選択される；

ここで、各R⁸およびR¹⁻³は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各R⁹は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR⁹は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各R¹⁻⁴は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR¹⁻⁴は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各R¹⁻⁰およびR¹⁻⁵は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；そして

ここで、各R¹⁻¹は、別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である、

化合物。

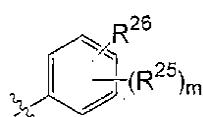
【請求項3】

R⁷が、必要に応じて置換したアリールである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R⁷が、以下である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物：

【化2】



ここで、

mは、0または1である；

R²⁻⁵は、八口、必要に応じて置換したアルキル、-R¹⁻³-N(R¹⁻⁴)₂または-

$R^{1\sim 3}$ - O $R^{1\sim 4}$ である；

$R^{2\sim 6}$ は、 - $R^{1\sim 3}$ - C(O) $R^{1\sim 4}$ 、 - $R^{1\sim 3}$ - S(O)_t $R^{1\sim 5}$ (ここで、tは、1または2である)、 - $R^{1\sim 3}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - $R^{8\sim 10}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - $R^{8\sim 10}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$)₂ = C($R^{1\sim 4}$)₂、 - $R^{1\sim 3}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$) C(O) $R^{1\sim 5}$ (ここで、tは、1または2である)、 - $R^{1\sim 3}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$) C(O) N($R^{1\sim 4}$)₂ (ここで、tは、1または2である) または - $R^{1\sim 3}$ - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$) C(NR $^{1\sim 4}$) N($R^{1\sim 4}$)₂ (ここで、tは、1または2である) である；

ここで、各 $R^{1\sim 3}$ は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各 $R^{1\sim 4}$ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個の $R^{1\sim 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；そして

ここで、各 $R^{1\sim 5}$ は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される、

化合物。

【請求項5】

$R^{2\sim 6}$ が、 - C(O) $R^{1\sim 4}$ 、 - S(O)_t $R^{1\sim 5}$ (ここで、tは、1または2である) または - S(O)_t N($R^{1\sim 4}$)₂ (ここで、tは、1または2である) である、請求項4に記載の化合物であって；

ここで、各 $R^{1\sim 4}$ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個の $R^{1\sim 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；そして

ここで、各 $R^{1\sim 5}$ は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される、

化合物。

【請求項6】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物であって、ここで、式(XI)の R^1 および R^2 または式(XII)の R^2 および R^5 は、両方共に、必要に応じて置換したアルキルである；あるいは式(XI)の R^1 および R^2 の一方は、必要に応じて置換したアルキルであり、そして式(XI)の R^1 および R^2 の他方は、フェニルである；あるいは式(X

I I) の R² および R⁵ の一方は、必要に応じて置換したアルキルであり、そして式(X I I) の R² および R⁵ の他方は、フェニルである、化合物。

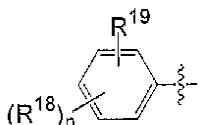
【請求項 7】

R⁴ が、必要に応じて置換したアリールである、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

R⁴ が、以下である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 3】



ここで：

n は、0 ~ 4 である；

各 R^{1~8} は、別個に、ハロ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリールまたは必要に応じて置換したアラルケニルである；

R^{1~9} は、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリール、 - R⁸ - OR⁹、 - R⁸ - C(O)OR⁹ または - R⁸ - C(O)N(R⁹)₂ である；

ここで、各 R⁸ は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；そして

ここで、各 R⁹ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2 個の R⁹ は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する、化合物。

【請求項 9】

R^{1~9} が、オルト位置にあり、そして n が、0 ~ 1 である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^{2~6} が、パラ位置にて、 - S(O)₂R^{1~5} または - S(O)₂N(R^{1~4})₂ であり、ここで、R^{1~4} および R^{1~5} が、必要に応じて置換したアルキルである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

以下からなる群から選択される、請求項 10 に記載の化合物：

5 - メチル - 1 - (2 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (4 - メタンスルホニル - フェニル) - アミド；

2 - エチル - 5 - メチル - 1 - (2 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 (4 - メタンスルホニル - フェニル) - アミド；および

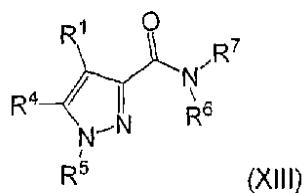
1, 4 -ジメチル - 5 - (2 - フェノキシ - フェニル) - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 (4 - メタンスルホニル - フェニル) - アミド。

【請求項 12】

単一異性体、異性体混合物として、あるいは異性体のラセミ混合物として；あるいは溶媒和物または多形物として；あるいはプロドラッグまたは代謝物として；あるいはそれらの

薬学的に受容可能な塩としての、式(XIII)の化合物：

【化4】



ここで：

R¹は、シアノ、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換したヘテロアラルキルである；

R⁵は、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換したヘテロアラルキルである；

R⁴は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、-R⁸-OR⁹、-R⁸-SR⁹、-R⁸-S(O)_tR¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)₂、-R⁸-CN、-R⁸-C(O)R⁹、-R⁸-C(S)R⁹、-R⁸-C(NR⁹)R⁹、-R⁸-C(O)OR⁹、-R⁸-C(S)OR⁹、-R⁸-C(NR⁹)OR⁹、-R⁸-C(O)N(R⁹)₂、-R⁸-C(S)N(R⁹)₂、-R⁸-C(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-C(O)SR⁹、-R⁸-C(S)SR⁹、-R⁸-C(NR⁹)SR⁹、-R⁸-S(O)_tOR⁹（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N=C(R⁹)₂、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)R¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)C(O)R¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)OR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(NR⁹)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(S)SR¹⁰、-R⁸-N(R⁹)C(O)N(R⁹)₂、-R⁸-N(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-N(R⁹)S(O)_tR¹⁰（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-OC(O)R¹⁰、-R⁸-OC(NR⁹)R¹⁰、-R⁸-OC(S)R¹⁰、-R⁸-OC(O)OR¹⁰、-R⁸-OC(NR⁹)OR¹⁰、-R⁸-OC(S)OR¹⁰、-R⁸-OC(O)SR⁹、-R⁸-OC(O)N(R⁹)₂、-R⁸-OC(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-OC(S)N(R⁹)₂、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(O)R⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(NR⁹)R⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(O)OR⁹、-R⁸-C(O)-R¹¹-C(S)

) OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹
 - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ -
 C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)S
 R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)SR⁹ および - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C
 (NR⁹)SR⁹ からなる群から選択される；あるいは

R⁴ は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 - R⁸ - OR⁹、 - R⁸ - SR⁹、 - R⁸ - S(O)_tR¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - N(R⁹)₂、 - R⁸ - CN、 - R⁸ - C(O)R⁹、 - R⁸ - C(S)R⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)R⁹、 - R⁸ - C(O)OR⁹、 - R⁸ - C(S)OR⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O)SR⁹、 - R⁸ - C(S)SR⁹、 - R⁸ - C(NR⁹)SR⁹、 - R⁸ - S(O)_tOR⁹ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂ = C(R⁹)₂、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(O)R¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(O)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - S(O)_tN(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)R¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)OR¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(O)SR¹⁰、 - R⁸ - N(R⁹)C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - N(R⁹)S(O)_tR¹⁰ (ここで、tは、1または2である)、 - R⁸ - OC(O)R¹⁰、 - R⁸ - OC(NR⁹)R¹⁰、 - R⁸ - OC(S)R¹⁰、 - R⁸ - OC(O)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(NR⁹)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(S)OR¹⁰、 - R⁸ - OC(O)SR⁹、 - R⁸ - OC(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - OC(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - OC(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(CNR⁹)R⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)OR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)N(R⁹)₂、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(O)SR⁹、 - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(S)SR⁹ および - R⁸ - C(O) - R¹¹ - C(NR⁹)SR⁹ からなる群から選択される；

R⁶ は、水素である；

R⁷ は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ニトロ、ハロ、 - OR¹⁴、 - SR¹⁴、 - S(O)_tR¹⁵ (ここで、tは、1または2である)、 - N(R¹⁴)₂、 - CN、 - C(O)R¹⁴、 - C(S)R¹⁴、 - C(NR¹⁴)R¹⁴、 - C(O)OR¹⁴、 - C(S)OR¹⁴、 - C(NR¹⁴)OR¹⁴、 - C(O)N(R¹⁴)₂、 - C(S)N(R¹⁴)₂、 - C(NR¹⁴)N(R¹⁴)₂、 - C(O)S

R^{1-4} 、 $-C(S)SR^{1-4}$ 、 $-C(NR^{1-4})SR^{1-4}$ 、 $-S(O)_tOR^{1-4}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_tN(R^{1-4})N= C(R^{1-4})_2$ 、 $-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-N(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)OR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(S)SR^{1-5}$ 、 $-N(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-N(R^{1-4})S(O)_tR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-OC(O)R^{1-5}$ 、 $-OC(NR^{1-4})R^{1-5}$ 、 $-OC(S)R^{1-5}$ 、 $-OC(O)OR^{1-5}$ 、 $-OC(NR^{1-4})OR^{1-5}$ 、 $-OC(S)OR^{1-5}$ 、 $-OC(O)SR^{1-4}$ 、 $-OC(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-OC(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-OC(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)R^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)R^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})OR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(O)SR^{1-4}$ 、 $-C(O)-R^{1-6}-C(S)SR^{1-4}$ および $-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})SR^{1-4}$ からなる群から選択される；

あるいは R^7 は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^{1-3}-OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-S(O)_tR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-CN$ 、 $-R^{1-3}-C(O)R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(S)R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(O)SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(S)SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(NR^{1-4})S$ 、 R^{1-4} 、 $-R^{1-3}-S(O)_tOR^{1-4}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})N(R^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})N=C(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(NR^{1-4})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)OR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)SR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})SR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-N(R^{1-4})C(S)SR^{1-5}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{1-3}-O(C(O)R^{1-5})$ 、 $-R^{1-3}-O(C(NR^{1-4})R^{1-5})$ 、 $-R^{1-3}-O(C(S)R^{1-5})$

R^1 、 $-R^{1-3}-OC(O)OR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-OC(NR^{1-4})OR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}$
 $-OC(S)OR^{1-5}$ 、 $-R^{1-3}-OC(O)SR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-OC(O)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-OC(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-OC(S)N(R^{1-4})_2$ 、
 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(O)R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})R^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}C(O)$
 $-R^{1-6}-C(O)OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(S)OR^{1-4}$ 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(O)$
 $N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(S)N(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(O)$
 SR^{1-4} 、 $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(S)SR^{1-4}$ および $-R^{1-3}-C(O)-R^{1-6}-C(NR^{1-4})SR^{1-4}$ からなる群から選択される；

ここで、各 R^8 および R^{1-3} は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各 R^9 は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個の R^9 は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各 R^{1-4} は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個の R^{1-4} は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各 R^{1-0} および R^{1-5} は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；そして

ここで、各 R^{1-1} および R^{1-6} は、それぞれ別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

但し、式(XII)は、以下を除外する：

$N-(3-\text{クロロフェニル})-5-\text{メチル}-1,3-\text{ジフェニル}-1H-\text{ピラゾール}-4-\text{カルボキサミド}$ および

$5-\text{メチル}-N-[4-[[(2-\text{メチルフェニル})\text{アミノ}] \text{スルホニル}]\text{フェニル}]-1,3-\text{ジフェニル}-1H-\text{ピラゾール}-4-\text{カルボキサミド}.$

【請求項13】

单一異性体、異性体混合物として、あるいは異性体のラセミ混合物として；あるいは溶媒和物または多形物として；あるいはプロドラッグまたは代謝物として；あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩としての、請求項12に記載の化合物であって、ここで：

R^4 は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に

応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)_2$ 、 $-R^8-CN$ 、 $-R^8-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)S$ R^9 、 $-R^8-C(S)SR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tOR^9$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(R^9)_2$ 、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(O)R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(O)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)C(O)R^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-OC(O)R^{10}$ 、 $-R^8-OC(NR^9)R^{10}$ 、 $-R^8-OC(S)R^{10}$ 、 $-R^8-OC(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-OC(NR^9)OR^{10}$ 、 $-R^8-OC(S)OR^{10}$ 、 $-R^8-OC(O)SR^9$ 、 $-R^8-OC(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OC(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OC(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)SR^9$ および $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)SR^9$ からなる群から選択される；そして

R^7 は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、 $-R^{13}-OR^{14}$ 、 $-R^{13}-SR^{14}$ 、 $-R^{13}-S(O)_tR^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-CN$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})O$ R^{14} 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)SR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)SR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})SR^{14}$ 、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{14}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})_2$ （ここで、 t は、

1または2である)、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)N(R¹⁴)₂(ここで、tは、1または2である)、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)N=C(R¹⁴)₂、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)C(O)R¹⁵(ここで、tは、1または2である)、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)C(O)N(R¹⁴)₂(ここで、tは、1または2である)、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)C(NR¹⁴)N(R¹⁴)₂(ここで、tは、1または2である)および-R¹³-N(R¹⁴)S(O)_tR¹⁵(ここで、tは、1または2である)からなる群から選択される;

ここで、各R⁸およびR¹³は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である;

ここで、各R⁹は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される;あるいは

ここで、2個のR⁹は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する;

ここで、各R¹⁴は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される;あるいは

ここで、2個のR¹⁴は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する;

ここで、各R¹⁰およびR¹⁵は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される;そして

ここで、各R¹¹は、別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である。

化合物。

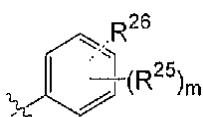
【請求項14】

R⁷が、必要に応じて置換したアリールである、請求項12または13に記載の化合物。

【請求項15】

R⁷が、以下である、請求項12～14のいずれか1項に記載の化合物:

【化5】



ここで:

mは、0または1である;

R²⁵は、八口、必要に応じて置換したアルキル、-R¹³-N(R¹⁴)₂または-R¹³-OR¹⁴である;

R²⁶は、-R¹³-C(O)R¹⁴、-R¹³-S(O)_tR¹⁵(ここで、tは、1または2である)、-R¹³-S(O)_tN(R¹⁴)₂(ここで、tは、1または2

である)、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})N(R^{1-4})_2$ (ここで、 t は、1または2である)、 $-R^8-S(O)_tN(R^{1-4})N=C(R^{1-4})_2$ 、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(O)R^{1-5}$ (ここで、 t は、1または2である)、 $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ (ここで、 t は、1または2である)または $-R^{1-3}-S(O)_tN(R^{1-4})C(NR^{1-4})N(R^{1-4})_2$ (ここで、 t は、1または2である)である;

ここで、各 R^{1-3} は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である;

ここで、各 R^{1-4} は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される; あるいは

ここで、2個の R^{1-4} は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する; そして

ここで、各 R^{1-5} は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される。

化合物。

【請求項16】

R^{2-6} が、 $-C(O)R^{1-4}$ 、 $-S(O)_tR^{1-5}$ (ここで、 t は、1または2である)または $-S(O)_tN(R^{1-4})_2$ (ここで、 t は、1または2である)である、請求項15に記載の化合物であって;

ここで、各 R^{1-4} は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される; あるいは

ここで、2個の R^{1-4} は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する; そして

ここで、各 R^{1-5} は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される。

化合物。

【請求項17】

R^1 および R^5 が、両方共に、必要に応じて置換したアルキルであるか、あるいは R^1 および R^5 の一方が、必要に応じて置換したアルキルであり、そして R^1 および R^5 の他方が、フェニルである、請求項12～16のいずれか1項に記載の化合物。

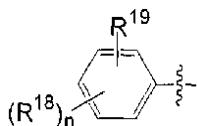
【請求項18】

R^4 が、必要に応じて置換したアリールである、請求項12～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

R^4 が、請求項 12 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 6】



ここで：

n は、0 ~ 4 である；

各 R^1 ~ R^8 は、別個に、ハロ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリールまたは必要に応じて置換したアラルケニルである；

R^1 ~ R^9 は、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリール、 $-R^8-O-R^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ または $-R^8-C(O)N(R^9)_2$ である；

ここで、各 R^8 は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；そして

ここで、各 R^9 は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2 個の R^9 は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する、

化合物。

【請求項 20】

R^1 ~ R^9 が、オルト位置にあり、そして n が、0 ~ 1 である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^2 ~ R^6 が、パラ位置で、 $-S(O)_2R^{1~5}$ または $-S(O)_2N(R^{1~4})_2$ であり、ここで、 $R^{1~4}$ および $R^{1~5}$ が、必要に応じて置換したアルキルである、請求項 20 に記載の化合物。

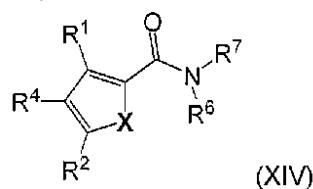
【請求項 22】

前記化合物が、1,4-ジメチル-5-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸(4-メタンスルホニル-フェニル)-アミドである、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

单一異性体、異性体混合物として、あるいは異性体のラセミ混合物として；あるいは溶媒和物または多形物として；あるいはプロドラッグまたは代謝物として；あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩としての、式(XIV)の化合物：

【化 7】



ここで：

X は、 $-O-$ または $-S-$ である；

R^1 および R^2 は、それぞれ別個に、シアノ、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換

したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換したヘテロアラルキルである；

R^4 は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)_2$ 、 $-R^8-CN$ 、 $-R^8-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(S)SR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_tOR^9$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)N=C(R^9)_2$ 、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(O)R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(O)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_tN(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)C(O)R^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-OOC(O)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)SR^9$ 、 $-R^8-OOC(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)SR^9$ および $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)SR^9$ からなる群から選択される；あるいは

R^4 は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル

ル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 $-R^8-OR^9$ 、 $-R^8-SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_{t}R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)_2$ 、 $-R^8-CN$ 、 $-R^8-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(S)SR^9$ 、 $-R^8-C(NR^9)SR^9$ 、 $-R^8-S(O)_{t}OR^9$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^9)C(O)R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^9)C(O)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-N(R^9)C(O)R^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)S(O)_{t}R^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-OOC(O)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)SR^9$ 、 $-R^8-OOC(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^1-C(S)SR^9$ および $-R^8-C(O)-R^1-C(NR^9)SR^9$ からなる群から選択される；

R^6 は、水素である；

R^7 は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、二トロ、ハロ、 $-OR^{14}$ 、 $-SR^{14}$ 、 $-S(O)_{t}R^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-N(R^{14})_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(S)R^{14}$ 、 $-C(NR^{14})R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{14}$ 、 $-C(S)OR^{14}$ 、 $-C(NR^{14})OR^{14}$ 、 $-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-C(NR^{14})N(R^{14})_2$ 、 $-C(O)S(R^{14})_2$ 、 $-C(S)SR^{14}$ 、 $-C(NR^{14})SR^{14}$ 、 $-S(O)_{t}OR^{14}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_{t}N(R^{14})N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_{t}N(R^{14})N=C(R^{14})_2$ 、 $-S(O)_{t}N(R^{14})C(O)R^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-S(O)_{t}N(R^{14})N=C(R^{14})_2$ 、 $-S(O)_{t}N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-S(O)_{t}N(R^{14})C(NR^{14})N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-N(R^{14})C(O)R^{15}$ 、 $-N(R^{14})C(O)OR^{15}$ 、 $-N(R^{14})C(O)SR^{15}$ 、 $-N(R^{14})C(NR^{14})SR^{15}$ 、 $-N(R^{14})C(S)SR^{15}$ 、 $-N(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(NR^{14})N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-N(R^{14})C(S)OR^{15}$ 、 $-OOC(O)R^{15}$ 、 $-OOC(NR^{14})R^{15}$ 、 $-OOC(S)R^{15}$ 、 $-OOC(O)OR^{15}$ 、 $-OOC(NR^{14})OR^{15}$ 、 $-OOC(S)OR^{15}$ 、 $-OOC(O)SR^{14}$ 、 $-OOC(O)N(R^{14})_2$ 、 $-OOC(NR^{14})N(R^{14})_2$ 、 $-OOC(S)N(R^{14})_2$ 、 $-C(O)-R^{16}-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)-R^{16}$

- C (S) R ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) R ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (O) OR ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) OR ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) OR ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (O) N (R ¹ ⁴) ₂、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) N (R ¹ ⁴) ₂、 - C (O) - R ¹ ⁶ C (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (O) S R ¹ ⁴、 - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) S R ¹ ⁴ および - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) S R ¹ ⁴ からなる群から選択される；

あるいは R ⁷ は、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキル、ここで、各々は、必要に応じて、1 個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルケニル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、 - R ¹ ³ - OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - SR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - S (O) _t R ¹ ⁵ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - CN、 - R ¹ ³ - C (O) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (S) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (N R ¹ ⁴) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (S) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (N R ¹ ⁴) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (S) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (O) S R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (S) S R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (N R ¹ ⁴) S R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - S (O) _t OR ¹ ⁴ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - S (O) _t N (R ¹ ⁴) ₂ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - S (O) _t N (R ¹ ⁴) N = C (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - S (O) _t N (R ¹ ⁴) C (O) R ¹ ⁵ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - S (O) _t N (R ¹ ⁴) C (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (O) R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (O) OR ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (O) S R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (N R ¹ ⁴) S R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (O) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (O) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) C (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - N (R ¹ ⁴) S (O) _t R ¹ ⁵ (ここで、t は、1 または 2 である)、 - R ¹ ³ - OC (O) R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (N R ¹ ⁴) R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (S) R ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (O) OR ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (N R ¹ ⁴) OR ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (S) OR ¹ ⁵、 - R ¹ ³ - OC (O) S R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - OC (O) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - OC (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - OC (S) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (O) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) (O) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) OR ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) N (R ¹ ⁴) ₂、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (O) S R ¹ ⁴、 - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (S) S R ¹ ⁴ および - R ¹ ³ - C (O) - R ¹ ⁶ - C (N R ¹ ⁴) S R ¹ ⁴ からなる群から選択される；

ここで、各 R ⁸ および R ¹ ³ は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各 R ⁹ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換

したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR⁹は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各R^{1~4}は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR^{1~4}は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各R^{1~0}およびR^{1~5}は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；そして

ここで、各R^{1~1}およびR^{1~6}は、それぞれ別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である、化合物。

【請求項2~4】

請求項2~3に記載の化合物であって、ここで：

Xは、-O-または-S-である；

R⁴は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したシクロアルケニル、必要に応じて置換したシクロアルケニルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、必要に応じて置換したヘテロアラルケニル、-R⁸-OR⁹、-R⁸-SR⁹、-R⁸-S(O)_tR^{1~0}（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)₂、-R⁸-CN、-R⁸-C(O)R⁹、-R⁸-C(S)R⁹、-R⁸-C(NR⁹)R⁹、-R⁸-C(O)OR⁹、-R⁸-C(S)OR⁹、-R⁸-C(NR⁹)OR⁹、-R⁸-C(O)N(R⁹)₂、-R⁸-C(S)N(R⁹)₂、-R⁸-C(NR⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-C(O)SR⁹、-R⁸-C(NR⁹)SR⁹、-R⁸-S(O)_tOR⁹（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)N(R⁹)₂、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)R^{1~0}（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(O)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R⁹)C(NR⁹)N(R⁹)₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-N(R⁹)C(O)R^{1~0}、-R⁸-N(R⁹)C(O)OR^{1~0}、-R⁸-N(R⁹)C(O)SR^{1~0}、-R⁸-N(R⁹)C(NR⁹)SR^{1~0}、-R⁸-N(R⁹)

$C(S)SR^{10}$ 、 $-R^8-N(R^9)C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)C(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-N(R^9)$
 $S(O)_tR^{10}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^8-OOC(O)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)R^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(S)OR^{10}$ 、 $-R^8-OOC(O)$
 SR^9 、 $-R^8-OOC(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-OOC(NR^9)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-O$
 $C(S)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)R^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)OR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)N(R^9)_2$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(O)SR^9$ 、 $-R^8-C(O)-R^{11}-C(S)SR^9$ および $-R^8-C(O)-R^{11}-C(NR^9)SR^9$ からなる群から選択される；そして

R^7 は、アリールまたはヘテロアリール、ここで、各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、ハロ、ニトロ、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したアラルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアラルキル、 $-R^{13}-OR^{14}$ 、 $-R^{13}-SR^{14}$ 、 $-R^{13}-S(O)_tR^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-CN$ 、 $-R^{13}-C(O)R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})R^{14}$ 、 $-R^{13}-C(O)OR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)OR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})O$
 R^{14} 、 $-R^{13}-C(O)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(S)N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})N(R^{14})_2$ 、 $-R^{13}-C(O)SR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(S)SR^{14}$ 、 $-R^{13}-C(NR^{14})SR^{14}$ 、 $-R^{13}-S(O)_tOR^{14}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})C(O)R^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})C(O)N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）、 $-R^{13}-S(O)_tN(R^{14})C(NR^{14})N(R^{14})_2$ （ここで、 t は、1または2である）および $-R^{13}-N(R^{14})S(O)_tR^{15}$ （ここで、 t は、1または2である）からなる群から選択される；

ここで、各 R^8 および R^{13} は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各 R^9 は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個の R^9 は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各 R^{14} は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアル

キル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR^{1~4}は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；

ここで、各R^{1~0}およびR^{1~5}は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；そして

ここで、各R^{1~1}は、別個に、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である、

化合物。

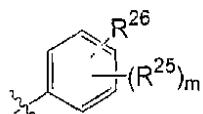
【請求項25】

R⁷が、必要に応じて置換したアリールである、請求項23または24に記載の化合物。

【請求項26】

R⁷が、請求項23～25のいずれか1項に記載の化合物：

【化8】



ここで、

mは、0または1である；

R^{2~5}は、ハロ、必要に応じて置換したアルキル、-R^{1~3}-N(R^{1~4})₂または-R^{1~3}-OR^{1~4}である；

R^{2~6}は、-R^{1~3}-C(O)R^{1~4}、-R^{1~3}-S(O)_tR^{1~5}（ここで、tは、1または2である）、-R^{1~3}-S(O)_tN(R^{1~4})₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R^{1~4})N(R^{1~4})₂（ここで、tは、1または2である）、-R⁸-S(O)_tN(R^{1~4})N=C(R^{1~4})₂、-R^{1~3}-S(O)_tN(R^{1~4})C(O)R^{1~5}（ここで、tは、1または2である）、-R^{1~3}-S(O)_tN(R^{1~4})C(O)N(R^{1~4})₂（ここで、tは、1または2である）または-R^{1~3}-S(O)_tN(R^{1~4})C(NR^{1~4})N(R^{1~4})₂（ここで、tは、1または2である）である；

ここで、各R^{1~3}は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルキレン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；

ここで、各R^{1~4}は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR^{1~4}は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；そして

ここで、各R^{1~5}は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換し

たヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される、

化合物。

【請求項 27】

$R^{2 \sim 6}$ が、 $-C(O)R^{1 \sim 4}$ 、 $-S(O)_t R^{1 \sim 5}$ （ここで、 t は、1 または 2 である）または $-S(O)_t N(R^{1 \sim 4})_2$ （ここで、 t は、1 または 2 である）である、請求項 26 に記載の化合物であって；

ここで、各 $R^{1 \sim 4}$ は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2 個の $R^{1 \sim 4}$ は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する；そして

ここで、各 $R^{1 \sim 5}$ は、別個に、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される、

化合物。

【請求項 28】

R^1 および R^2 が、両方共に、必要に応じて置換したアルキルであるか、あるいは R^1 および R^2 の一方が、必要に応じて置換したアルキルであり、そして R^1 および R^2 の他方が、フェニルである、請求項 23 ~ 27 のいずれか 1 項に記載の化合物。

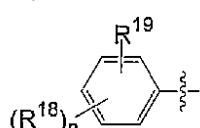
【請求項 29】

R^4 が、必要に応じて置換したアリールである、請求項 23 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

R^4 が、請求項 23 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 9】



ここで：

n は、0 ~ 4 である；

各 $R^{1 \sim 8}$ は、別個に、八口、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリールまたは必要に応じて置換したアラルケニルである；

$R^{1 \sim 9}$ は、八口、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリール、 $-R^8 - OR^9$ 、 $-R^8 - C(O)OR^9$ または $-R^8 - C(O)N(R^9)_2$ である；

ここで、各 R^8 は、別個に、直接結合、必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケン鎖、あるいは必要に応じて置換した直鎖または分枝アルケニレン鎖である；そして

ここで、各 R^9 は、別個に、水素、必要に応じて置換したアルキル、必要に応じて置換したアルケニル、必要に応じて置換したアルキニル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したアリール、必

要に応じて置換したアラルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリールおよび必要に応じて置換したヘテロアラルキルからなる群から選択される；あるいは

ここで、2個のR⁹は、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成する、

化合物。

【請求項31】

R^{1~9}が、オルト位置であり、そしてnが、0~1である、請求項30に記載の化合物。

【請求項32】

R^{2~6}が、パラ位置で、-S(=O)₂R^{1~5}または-S(=O)₂N(R^{1~4})₂であり、ここで、R^{1~4}およびR^{1~5}が、必要に応じて置換したアルキルである、請求項31に記載の化合物。

【請求項33】

前記化合物が、3,5-ジメチル-4-(2-トリフルオロメチル-フェニル)-チオフェン-2-カルボン酸(4-メタンスルホニル-フェニル)-アミドである、請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

1種以上の核内ステロイドレセプターが媒介するか、そうでなければ、それらに影響されるか、あるいは、核内ステロイドレセプター活性が関与している疾患または障害を治療する必要のある患者において、1種以上の核内ステロイドレセプターが媒介するか、そうでなければ、それらに影響されるか、あるいは、核内ステロイドレセプター活性が関与している疾患または障害を治療するための組成物であって、請求項1~33のいずれか1項に記載の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な誘導体を含む、組成物。

【請求項35】

前記疾患または障害が、前記患者において、過剰または欠乏ステロイドレセプター活性、あるいは該ステロイドレセプター活性の内在性調節因子と関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項36】

前記疾患または障害が、癌に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項37】

前記疾患または障害が、不妊症に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項38】

前記疾患または障害が、1種以上の代謝症候群である、請求項34に記載の組成物。

【請求項39】

前記疾患または障害が、骨または軟骨の機能障害に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項40】

前記疾患または障害が、免疫機能障害に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項41】

前記疾患または障害が、認知機能障害に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項42】

前記疾患または障害が、高血圧に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項43】

前記疾患または障害が、心疾患に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項44】

前記疾患または障害が、腎疾患に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項45】

前記疾患または障害が、線維症に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項46】

前記疾患または障害が、表皮機能障害に関連している、請求項34に記載の組成物。

【請求項 4 7】

前記疾患または障害が、筋肉消耗に関連している、請求項 3 4 に記載の組成物。

【請求項 4 8】

前記核内ステロイドレセプターが、鉱質コルチコイドレセプターである、請求項 3 4 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

請求項 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と、薬学的に受容可能な賦形剤とを含有する、薬学的組成物。

【請求項 5 0】

さらに、1種以上の追加活性成分を含有する、請求項 4 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 1】

前記 1 種以上の追加活性成分が、アンギオテンシン変換酵素インヒビター、アンギオテンシン I I 遮断薬、抗凝固薬、抗癌剤、抗不整脈薬、抗炎症薬、遮断薬、カルシウムチャネルアンタゴニスト、脂質調節剤、サイトカインアンタゴニスト、ジギタリス医薬、利尿薬、エンドセリン遮断薬、血管拡張薬、免疫抑制薬、およびグルコース低下剤からなる群から選択される、請求項 5 0 に記載の薬学的組成物。

【請求項 5 2】

細胞、組織または全生物体内における 1 種以上の核内ステロイドレセプターの活性を調節するための組成物であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 5 3】

前記 1 種以上のステロイドレセプターが、鉱質コルチコイドレセプターを含む、請求項 5 2 に記載の組成物。