

【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 18 年 1 月 19 日 (2006.1.19)

【公表番号】 特表 2005-536448 (P2005-536448A)

【公表日】 平成 17 年 12 月 2 日 (2005.12.2)

【年通号数】 公開・登録公報 2005-047

【出願番号】 特願 2003-545613 (P2003-545613)

【国際特許分類】

C 0 7 C 233/73 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C 0 7 C 233/78 (2006.01)

C 0 7 D 207/08 (2006.01)

C 0 7 D 207/12 (2006.01)

C 0 7 D 209/08 (2006.01)

C 0 7 D 211/22 (2006.01)

C 0 7 D 307/12 (2006.01)

C 0 7 D 309/06 (2006.01)

C 0 7 D 309/10 (2006.01)

C 0 7 D 333/16 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 233/73

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/445

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

C 0 7 C 233/78

C 0 7 D 207/08

C 0 7 D 207/12

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 211/22

C 0 7 D 307/12

C 0 7 D 309/06

C 0 7 D 309/10

C 0 7 D 333/16

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】 平成 17 年 11 月 18 日 (2005.11.18)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

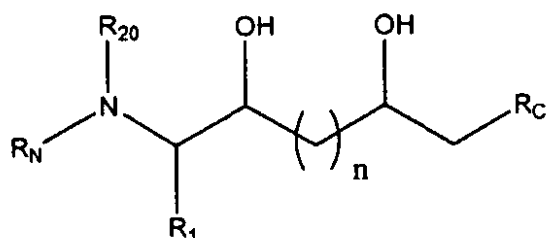
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式 I の化合物、又は薬剤として許容されるその塩であって、

【化 1】



(I)

[式中、 R_N が、

(I) $R_{N-1} - X_N$ であり、前式で X_N が以下のものからなる群から選択され：

(A) $-CO-$ 、

(B) $-SO_2-$ 、

(C) R'' 及び R''' が出現するごとに、同じであるか異なってもよく、 $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CR''R''')$ $_1 \sim 6$ 、

(D) X_{N-1} が $-O-$ 、 $-S-$ 、及び $-NR''$ からなる群から選択される、 $-CO-(CR''R''')$ $_1 \sim 6 - X_{N-1}$ 、

(E) 単結合、及び

(F) $-CO-(CR''R''')$ $_1 \sim 6$ であって、

R_{N-1} が以下のものからなる群から選択され：

(A) R_N -アリールであって、 R_N -アリールが、出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、テトラニル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又は 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプチルであり、これらはそれぞれ、同じであるか異なってもよい 1 個、2 個、又は 3 個の以下の置換基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

前式で R_{1-a} 及び R_{1-b} が、出現するごとに、独立に H 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO_2H$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なっており、以下のものからなる群から選択され：

(a) $-H$ 、

(b) 以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_8$ アルキル、

(i) $-OH$ 、

(ii) $-NH_2$ 、

(iii) フェニル、

(c) 独立に $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ である、1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_8$ アルキル、

(d) $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

(e) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(f) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(g) $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(h) $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(i) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖

(j) $-R_1$ - アリール であって、 R_1 - アリール が出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又はテトラリニルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換され：

(i) $C_1 \sim C_6$ アルキル であって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(ii) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニル であって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(iii) $C_2 \sim C_6$ アルキニル であって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(iv) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(v) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(vi) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(vii) $-OH$ 、

(viii) $-C \equiv N$ 、

(ix) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル であって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(x) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(xi) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(xii) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(xiii) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(k) $-R_1$ - ヘテロアリール であって、 R_1 - ヘテロアリール が出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾ

リル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノオキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_1 -ヘテロアリール基が、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換され：

(i) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-NR_{1-a}R_{1-b}、-C $\equiv$ N、-CF₃、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(ii) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C $\equiv$ N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(iii) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C $\equiv$ N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(iv) -F、Cl、-Br及び-I、

(v) 1個、2個、又は3個の-Fで場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(vi) -(CH₂)_{0~4}-NR_{N-2}R_{N-3}、

(vii) -OH、

(viii) -C $\equiv$ N、

(ix) (CH₂)_{0~4}-C₃~C₇ シクロアルキルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C $\equiv$ N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された(CH₂)_{0~4}-C₃~C₇ シクロアルキル、

(x) (CH₂)_{0~4}-CO-(C₁~C₆ アルキル)、

(xi) (CH₂)_{0~4}-SO₂-NR_{N-2}R_{N-3}、

(xii) (CH₂)_{0~4}-CO-NR_{N-2}NR_{N-3}、

(xiii) (CH₂)_{0~4}-SO₂-(C₁~C₆ アルキル)、

(xiv) $(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{R}_{\text{N}-2}) - \text{SO}_2 -$ 、及び

(xv) $(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{R}_{\text{N}-2}) - \text{C}(\text{O}) -$ 、

(1) $-\text{R}_1$ - 複素環であって、 R_1 - 複素環が出現するごとに、モルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S - オキシド、チオモルホリニル S 、 S - ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S 、 S - ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S - オキシド、テトラヒドロチエニル S 、 S - ジオキシド及びホモチオモルホリニル S - オキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_1 - 複素環基が、水素で置換された親 R_1 - 複素環基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_1 - 複素環基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(a) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(b) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(c) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(d) ハロゲン、

(e) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

(f) 1 個、2 個、又は 3 個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

(g) $-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{R}_{\text{N}-3}$ 、

(h) $-\text{OH}$ 、

(i) $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、

(j) $(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ であって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(k) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(l) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(m) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(n) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、及び

(o) $= \text{O}$ 、

(p) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{R}_{\text{N}-2}) - \text{SO}_2 -$ 、

(q) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{R}_{\text{N}-2}) - \text{C}(\text{O}) -$ 、

(8) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_2 \sim \text{C}_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_2 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{R}_{1-アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - 複素環、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} がフェニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S, S-ジオキシド、ピロリニル、チエニル、ピラゾリル、ピリジル N-オキシド、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、独立に $C_1 \sim C_6$ アルキルである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$:

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1-アリール)$ 、

(c) $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1-ヘテロアリール)$ 、及び

(g) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1-複素環)$ 、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$

、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) R_{100} が出現するごとに独立に $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(35) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

(36) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(39) $-(CH_2)_{1 \sim 4}-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(B) $-R_N$ - ヘテロアリール であって、 R_N - ヘテロアリール がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピ

ラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサニル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピリジニル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、ベンゾチオピラニル-S, S-ジオキシド、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリジニル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミジノニル、及びジヒドロベンズフラノニルからなる群から選択され、

上式で R_N -ヘテロアリール基が、水素で置換された親 R_N -ヘテロアリール基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_N -ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C $\equiv$ N、-CF $_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び-NR $_1$ -a R $_1$ -b からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) -OH、

(3) -NO $_2$ 、

(4) -F、Cl、-Br、-I、

(5) -CO $_2$ H、

(6) -C $\equiv$ N、

(7) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-NR $_N$ - $_2$ R $_N$ - $_3$ 、

(8) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-(C $_1 \sim C_{12}$ アルキル)、

(9) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-(C $_2 \sim C_{12}$ アルケニル)、

(10) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-(C $_2 \sim C_{12}$ アルキニル)、

(11) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-(C $_3 \sim C_8$ シクロアルキル)、

(12) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-R $_1$ -アリール、

(13) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-R $_1$ -ヘテロアリール、

(14) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-R $_1$ -複素環、

(15) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-R $_N$ - $_4$ 、

(16) -(CH $_2$) $_0 \sim 4$ -CO-O-R $_N$ - $_5$

- (17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、
 (19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、
 (22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$

- (23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、
 (25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、
 (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})$ 、
 (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})-COOH$ 、
 (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})$ 、
 (34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F$

で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、

- (35) $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、

(36) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

- (38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

- (39) $-(CH_2)_1 \sim 4-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(C) R_N -アリール-W- R_N -アリール、

(D) R_N -アリール-W- R_N -ヘテロアリール、

(E) R_N -アリール-W- R_1 -複素環、

(F) R_N -ヘテロアリール-W- R_N -アリール、

(G) R_N -ヘテロアリール-W- R_N -ヘテロアリール、

(H) R_N -ヘテロアリール-W- R_{N-1} -複素環、

(I) R_N -複素環-W- R_N -アリール、

(J) R_N -複素環-W- R_N -ヘテロアリール、

(K) R_N -複素環-W- R_{N-1} -複素環、

上式でWは以下のものであり、

(15) $-(CH_2)_{1-4}-$ 、

(16) $-O-$ 、

(17) $-S(O)_{0-2}-$ 、

(18) $-N(R_{N-5})-$ 、

(19) $-CO-$; or

(20) a bond;

(II) $-CO-(C_1 \sim C_{10} \text{ アルキル})$ であって、アルキルが以下の群からなるも

のから独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された-C
O-(C₁ ~ C₁₀ アルキル) :

- (A) -OH、
- (B) -C₁ ~ C₆ アルコキシ、
- (C) -C₁ ~ C₆ チオアルコキシ、
- (D) R_{N-8} が、出現するごとに、独立に-H、C₁ ~ C₆ アルキル又は-フェニ
ルである、-CO-O-R_{N-8}、
- (E) -CO-NR_{N-2} R_{N-3}、
- (F) -CO-R_{N-4}、
- (G) -SO₂-(C₁ ~ C₈ アルキル)、
- (H) -SO₂-NR_{N-2} R_{N-3}、
- (I) -NH-CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (J) -NH-CO-O-R_{N-8}、
- (K) -NR_{N-2} R_{N-3}、
- (L) -R_{N-4}、
- (M) -O-CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (N) -O-CO-NR_{N-8} R_{N-8}、
- (O) -O-(C₁ ~ C₅ アルキル)-COOH、
- (P) -O-(1個、2個、又は3個の-F、-Cl、-Br、-Iで場合によって
は置換されたC₁ ~ C₆ アルキル)、

- (Q) -NH-SO₂-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (R) ハロゲン、
- (S) -N(H又はR_{N-5})-SO₂-R_{N-2}、
- (T) -N(H又はR_{N-5})-CO-(R_{N-2})、及び
- (U) -SO₂-R_{N-2}、

(III) -CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)-O-(C₁ ~ C₆ アルキル)であって、
それぞれのアルキルが非置換であるか、あるいは以下のものからなる群から選択される1
個、2個、又は3個の置換基で独立に置換されている-CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)-
O-(C₁ ~ C₆ アルキル) :

- (A) -OH、
- (B) -C₁ ~ C₆ アルコキシ、
- (C) -C₁ ~ C₆ チオアルコキシ、
- (D) -CO-O-R_{N-8}、
- (E) -CO-NR_{N-2} R_{N-3}、
- (F) -CO-R_{N-4}、
- (G) -SO₂-(C₁ ~ C₈ アルキル)、
- (H) -SO₂-NR_{N-2} R_{N-3}、
- (I) -NH-CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (J) -NH-CO-O-R_{N-8}、
- (K) -NR_{N-2} R_{N-3}、
- (L) -R_{N-4}、
- (M) -O-CO-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (N) -O-CO-NR_{N-8} R_{N-8}、
- (O) -O-(C₁ ~ C₅ アルキル)-CO₂H、
- (P) -O-(独立に-F、-Cl、-Br、又は-Iである1個、2個、又は3個
の基で場合によっては置換されたC₁ ~ C₆ アルキル)、
- (Q) -NH-SO₂-(C₁ ~ C₆ アルキル)、
- (R) ハロゲン、
- (S) -N(H又はR_{N-5})-SO₂-R_{N-2}、
- (T) -N(H又はR_{N-5})-CO-(R_{N-2})、及び

(U) $-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ 、

(IV) $-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{S}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ であって、それぞれのアルキルが非置換であるか、あるいは以下のものからなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で独立に置換されている $-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{S}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$:

(A) $-\text{OH}$ 、

(B) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルコキシ}$ 、

(C) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ チオアルコキシ}$ 、

(D) $-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-8}$ 、

(E) $-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{ R}_{\text{N}-3}$ 、

(F) $-\text{CO}-\text{R}_{\text{N}-4}$ 、

(G) $-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ アルキル})$ 、

(H) $-\text{SO}_2-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{ R}_{\text{N}-3}$ 、

(I) $-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(J) $-\text{NH}-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-8}$ 、

(K) $-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{ R}_{\text{N}-3}$ 、

(L) $-\text{R}_{\text{N}-4}$ 、

(M) $-\text{O}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(N) $-\text{O}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-8} \text{ R}_{\text{N}-8}$ 、

(O) $-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_5 \text{ アルキル})-\text{COOH}$ 、

(P) $-\text{O}-(\text{独立に}-\text{F}、-\text{Cl}、-\text{Br}、\text{又は}-\text{I} \text{ である 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された } \text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(Q) $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(R) ハロゲン、

(S) $-\text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{\text{N}-5})-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ 、

(T) $-\text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{\text{N}-5})-\text{CO}-(\text{R}_{\text{N}-2})$ 、及び

(U) $-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ 、

(V) $-\text{CO}-\text{CH}(-(\text{CH}_2)_{0 \sim 2}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-10})-(\text{CH}_2)_{0 \sim 2}-\text{R}_{\text{N}-\text{アリーール}} / \text{R}_{\text{N}-\text{ヘテロアリーール}}$ 、

上式で $\text{R}_{\text{N}-10}$ が以下のものからなる群から選択される：

(A) $-\text{H}$ 、

(B) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ 、

(C) $\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル}$ 、

(D) 1 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6 \text{ アルケニル}$ 、

(E) 1 つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6 \text{ アルキニル}$ 、

(F) $\text{R}_1-\text{アリーール}$ 、

(G) $\text{R}_{\text{N}}-\text{ヘテロアリーール}$ 、

(H) $\text{R}_{\text{N}}-\text{複素環}$ 、

(VI) $-\text{CO}-(\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ であって、シクロアルキル基が、以下のものからなる群から独立に選択される 1 個又は 2 個の置換基で場合によっては置換された $\text{CO}-(\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$:

(A) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{OH}$ 、

(B) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルコキシ}$ 、

(C) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ チオアルコキシ}$ 、

(D) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-8}$ 、

(E) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{ R}_{\text{N}-3}$ 、

(F) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{CO}-\text{R}_{\text{N}-4}$ 、

(G) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{SO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ アルキル})$ 、

(H) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{SO}_2-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{ R}_{\text{N}-3}$ 、

(I) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4}-\text{NH}-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(J) $\text{NH}-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-8}$ 、

(K) $-(\text{CH}_2)_{0\sim4}-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$ 、

(L) $-(\text{CH}_2)_{0\sim4}-\text{R}_{\text{N}-4}$ 、

(M) $-\text{O}-\text{CO}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(N) $-\text{O}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-8}\text{R}_{\text{N}-8}$ 、

(O) $-\text{O}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{CO}_2\text{H}$ 、

(P) $-\text{O}-(\text{-F、-Cl、-Br、及び-I から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された } \text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(Q) $-\text{NH}-\text{SO}_2-(\text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(R) ハロゲン、

(S) $-\text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{\text{N}-5})-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ 、及び

(T) $-\text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{\text{N}-5})-\text{CO}-(\text{R}_{\text{N}-2})$ 、及び

(U) $-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{N}-2}$ ；

上式で R_1 が H、アリール、ヘテロアリールであり、又は

(I) $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_7$ アルキル ($\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル及び $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシで場合によっては置換されたもの)、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が独立に $-\text{H}$ 又は $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルである $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、及び $-\text{OC}=\text{ONR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、

(II) $-\text{CH}_2-\text{S}(\text{O})_{0\sim2}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(III) $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{S}(\text{O})_{0\sim2}-(\text{C}_1\sim\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(IV) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、

(V) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、

(VI) $-(\text{CH}_2)_{n_1}-(\text{R}_1\text{-アリール})$ であって、 n_1 が 0 又は 1 であり、 $\text{R}_1\text{-アリール}$ が、アリール環上で 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下の置換基で場合によっては置換された、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル及びインダニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、又はテトラリニルである $-(\text{CH}_2)_{n_1}-(\text{R}_1\text{-アリール})$ ；

(A) $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、

(C) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、

(D) $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 又は $-\text{I}$ 、

(F) 1 個、2 個、又は 3 個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、

(G) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(H) $-OH$ 、

(I) $-C \equiv N$ 、

(J) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(K) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(L) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(N) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(VII) $-(CH_2)_{n-1}-(R_1-\text{ヘテロアリール})$ であって、 $R_1-\text{ヘテロアリール}$ がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から選択され、

上式で $R_1-\text{ヘテロアリール}$ 基が、水素で置換された親 $R_N-\text{ヘテロアリール}$ 基の任意の環原子によって $-(CH_2)_{n-1}$ に結合されており、その結果 $R_1-\text{ヘテロアリール}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(6) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(7) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-OH$ 、

(9) $-C \equiv N$ 、

(10) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(11) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(12) $-SO_2-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(13) $-CO-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、又は

(14) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、但し n_1 が0であるとき、 R_{1-} ヘテロアリールは窒素によって炭素鎖に結合されておらず、あるいは

(VII) $-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-} \text{ 複素環})$ であって、 $R_{1-} \text{ 複素環}$ がモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S -オキシド、チオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ペラジニル、ホモペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ペリリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモペリリジニル、ホモモルホリニル、ホモモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S -オキシド、テトラヒドロチエニル S 、 S -ジオキシド、ホモチオモルホリニル S -オキシドからなる群から選択され、

上式で $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基が、水素で置換された親 $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基の任意の原子によって結合されており、その結果 $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(5) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(6) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(7) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$

、

(8) $-\text{OH}$ 、(9) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(10) $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(11) $-\text{CO}- (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、(12) $-\text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、(13) $-\text{CO}-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、(14) $-\text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(15) $=\text{O}$ 、但し n_1 が0であるとき、 $\text{R}_{1-\text{複素環}}$ は窒素により炭素鎖に結合されておらず；

R_{20} が H 、 CH_3 、又は $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキル若しくはアルケニルであり、これらはいずれも $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{CON}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されてもよく；

上式で n が0又は1であり；

上式で R_C が $-\text{R}_A$ 、 $-\text{O}-\text{R}_A$ 、 $-\text{X}-\text{R}_A$ 、 $-\text{NH}-\text{NHR}_A$ 、 $-\text{NR}_{20}-\text{NHR}_A$ 、 $-\text{NH}-\text{NR}_{20}\text{R}_A$ 又は $-\text{NR}_{20}-\text{NR}_{20}\text{R}_A$ であり、前式で X が $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}(\text{R}_A)-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{20})-$ 、 $-\text{N}(\text{R}_A)-$ 、 $-\text{NH}-\text{N}(\text{R}_A)-$ 、又は $-\text{NR}_{20}-\text{N}(\text{R}_A)-$ であり；

上式で R_A が、

(I) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-\text{O}-$ フェニル、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{OC}=\text{ONR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_{0\sim 2}\text{R}_{1-a}$ 、 $-\text{NR}_{1-a}\text{C}=\text{ONR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{C}=\text{ONR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、及び $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキルであり、

上式で R_{1-a} 及び R_{1-b} が、出現するごとに、独立に H 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり、

(II) $-(\text{CH}_2)_{0\sim 3}-(\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ であって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $-\text{O}-$ フェニル、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $-(\text{CH}_2)_{0\sim 3}-(\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(III) $-(\text{CR}_C-\text{X}\text{R}_C-\text{Y})_{0\sim 4}-\text{R}_C-\text{アリール}$ であって、 R_C-X 及び R_C-Y が以下のものからなる群から独立に選択され、

$-\text{H}$ 、

1個又は2個の $-\text{OH}$ で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、

1個、2個、又は3個のハロゲンで場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ

、

$-(\text{CH}_2)_{0\sim 4}-\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル}$ 、

1つ又は2つの二重結合を含む $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

1つ又は2つの三重結合を含む $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、及び

フェニル

又は

R_C-X 及び R_C-Y が、それらが結合する炭素と一緒に、炭素原子が3個、4個、5個、6個又は7個の炭素環を形成し、1つの炭素原子が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}_N-2-$ 、及び $\text{R}_C-\text{アリール}$ から選択される基で場合によっては置換されて

おり、かつ

R_C -アリールが、出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、テトラニリル、インダニル、ジヒドロナフチル、又は6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプチルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) ハロゲン、

(5) $-CO_2H$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下のものからなる群から独立に選択される、 $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - NR_{N-2}R_{N-3}$ 、：

(a) $-H$ 、

(b) $-C_1 \sim C_6$ アルキルであって、以下のものからなる群から選択される1個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(i) $-OH$ 、及び

(ii) $-NH_2$ 、

(c) 独立に $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 又は OH である、1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(d) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(e) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル}) - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(f) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - (C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(g) $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(h) $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(i) 1つの二重結合及び1つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖

、

(j) $-R_{1-a}$ アリールであって、 R_{1-a} アリールが出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又はテトラリニルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(i) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(ii) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(iii) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(iv) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(v) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(vi) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(v i i) -OH、

(v i i i) -C≡N、

(i x) C₃ ~ C₇ シクロアルキルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ及び-NR_{1-a} R_{1-b} からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換されたC₃ ~ C₇ シクロアルキル、

(x) -CO- (C₁ ~ C₄ アルキル)、

(x i) -SO₂ -NR_{1-a} R_{1-b}、

(x i i) -CO-NR_{1-a} R_{1-b}、又は

(x i i i) -SO₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、

(k) -R₁ - ヘテロアリールであって、R₁ - ヘテロアリールが出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリニル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、β-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式でR₁ - ヘテロアリール基が、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(i) C₁ ~ C₆ アルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-NR_{1-a} R_{1-b}、-C≡N、-CF₃、及びC₁ ~ C₃ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₁ ~ C₆ アルキル、

(i i) C₂ ~ C₆ アルケニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ及び-NR_{1-a} R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂ ~ C₆ アルケニル、

(i i i) C₂ ~ C₆ アルキニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ及び-NR_{1-a} R_{1-b} からなる群

から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(i v) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(v) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(v i) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(v i i) $-OH$ 、

(v i i i) $-C \equiv N$ 、

(i x) $(CH_2)_{0 \sim 4} - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a} R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(CH_2)_{0 \sim 4} - C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(x) $(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(x i) $(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(x i i) $(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(x i i i) $(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(x i v) $(CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - SO_2 -$ 、及び

(x v) $(CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - C(O) -$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (CH_2)_{0 \sim 4} (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{複素環}$ 、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ は、出現するごとにモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S -オキシド、チオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S -オキシド、テトラヒドロチエニル S 、 S -ジオキシド及びホモチオモルホリニル S -オキシドからなる群から独立に選択され、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ 基が、水素で置換された親 $R_1 - \text{複素環}$ 基の任意の原子によって結合されており、その結果 $R_1 - \text{複素環}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a} R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a} R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(c) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a} R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によ

っては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(d) ハロゲン、

(e) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(f) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(g) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(h) $-OH$ 、

(i) $-C \equiv N$ 、

(j) $(CH_2)_{0 \sim 4} - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ であって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(CH_2)_{0 \sim 4} - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(k) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(l) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(m) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(n) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、及び

(o) $=O$ 、

(p) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - SO_2 -$ 、

(q) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - C(O) -$ 、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} が出現するごとに、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジノニル、ピロリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジル N -オキシド、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、独立に $C_1 \sim C_6$ アルキルである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が出現するごとに、以下のものからなる群から独立に選択される $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - O - R_{N-5}$ ：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2} - (R_{1-a} \text{ アリール})$ 、

(c) $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - (R_{1-a} \text{ ヘテロアリール})$ 、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}$ 、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})_2$

、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N - CS - N(R_{N-5})_2$ 、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - R_{N-2}$ 、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) R_{100} が独立に H 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - P(O) - (OR_{100})_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CO - N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - O - CS - N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ であって、アルキル基が、F、Cl、Br、及びIからなる群から独立に選択される、1個、2個、3個、4個、又は5個の置換基で場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(35) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(36) $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、

(37) $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(IV) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0 \sim 4}-R_C$ - ヘテロアリール であって、

上式中で R_C - ヘテロアリール が出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリジニル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミジノニル、ジヒドロベンゾフラノニル、ピリジニルN-オキシド、ピロリルN-オキシド、ピリミジニルN-オキシド、ピリダジニルN-オキシド、ピラジニルN-オキシド、キノリニルN-オキシド、インドリルN-オキシド、インドリニルN-オキシド、イソキノリルN-オキシド、キナゾリニルN-オキシド、キノキサリニルN-オキシド、フタラジニルN-オキシド、イミダゾリルN-オキシド、イソオキサゾリルN-オキシド、オキサゾリルN-オキシド、チアゾリルN-オキシド、インドリジニルN-オキシド、インダゾリルN-オキシド、ベンゾチアゾリルN-オキシド、ベンズイミダゾリルN-オキシド、ピロリルN-オキシド、オキサジアゾリルN-オキシド、チアジアゾリルN-オキシド、トリアゾリルN-オキシド、テトラゾリルN-オキシド、ベンゾチオピラニルS-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_C - ヘテロアリール 基が、水素で置換された親 R_C - ヘテロアリール 基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_C - ヘテロアリール 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-B$

r 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C\equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの二重結合を有する}$

$C_2 \sim C_{12}$ アルケニル)、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの三重結合を有する}$
 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル)、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-複素環}$ 、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$

、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) R_{100} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F$
 で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C\equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

$(V) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{アリール} - R_{101} - R_C - \text{アリール}$
 、
 $(VI) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{アリール} - R_{101} - R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、
 $(VII) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{ヘテロアリール} - R_{101} - R_C - \text{アリール}$ 、
 $(VIII) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{ヘテロアリール} - R_{101} - R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、
 $(IX) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{アリール} - R_{101} - R_1 - \text{複素環}$ 、
 $(X) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_C - \text{ヘテロアリール} - R_{101} - R_1 - \text{複素環}$ 、
 $(XI) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_1 - \text{複素環} - R_{101} - R_C - \text{アリール}$ 、
 $(XII) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_1 - \text{複素環} - R_{101} - R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、
 $(XIII) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_1 - \text{複素環} - R_{101} - R_1 - \text{複素環}$ 、
 上式で R_{101} が単結合、 $(CH_2)_{0-4}$ 、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、又は $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ であり、
 $(XIV) - (CR_C - X R_C - Y)_{0-4} - R_1 - \text{複素環}$ 、
 $(XV) - [C(R_{C-1})(R_{C-2})]_{1-3} - CO - N(R_{C-3})_2$ であって、
 前式で R_{C-1} 及び R_{C-2} が同じであるか異なってもよく、以下のものからなる群から選択され：

(A) $-H$ 、
 (B) $-C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ}$ 、 $-O-$ フェニル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ 、
 (C) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ}$ 、 $-O-$ フェニル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (D) $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ}$ 、 $-O-$ フェニル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (E) $-(CH_2)_{1-2} - S(O)_{0-2} - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (F) $-(CH_2)_{0-4} - C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ}$ 、 $-O-$ フェニル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $-(CH_2)_{0-4} - C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル}$ 、
 (G) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_1 - \text{アリール}$ 、
 (H) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、
 (I) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_1 - \text{複素環}$ 、
 (J) $-R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、
 (K) $-R_1 - \text{複素環}$ 、
 (M) R_{C-4} が $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-NR(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ である、 $-($

CH_2)_{1~4} - $\text{R}_\text{C} - 4$ - (CH_2)_{0~4} - R_1 - アリール、
 (N) - (CH_2)_{1~4} - $\text{R}_\text{C} - 4$ - (CH_2)_{0~4} - R_C - ヘテロアリール、
 (O) - R_1 - アリール、

かつ $\text{R}_\text{C} - 3$ が出現するごとに独立に以下のものである：

(A) - H、

(B) - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、
 -I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、-O-フェニル、
 及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(C) 1つ又は2つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、
 -O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、
 又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(D) 1つ又は2つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、
 -F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、
 -O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、
 又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(E) - (CH_2)_{0~4} - $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、
 -F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、
 -O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、
 又は3個の基で場合によっては置換された - (CH_2)_{0~4} - $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(F) - R_1 - アリール、

(G) - R_C - ヘテロアリール、

(H) - R_1 - 複素環、

(I) - ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) - R_1 - アリール、

(J) - ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) - R_C - ヘテロアリール、

(K) - ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) - R_1 - 複素環、

(XVI) - CH (R_C - アリール)₂、

(XVII) - CH (R_C - ヘテロアリール)₂、

(XVIII) - CH (R_C - アリール) (R_C - ヘテロアリール)、

(XIX) R_C - アリール 又は R_C - ヘテロアリール 又は R_1 - 複素環 と縮合した - シクロペンチル、
 - シクロヘキシル、又はシクロヘプチル環であって、シクロペンチル、
 シクロヘキシル、又は - シクロヘプチルの1個の炭素が、NH、NR_{N-5}、O、S (=O)
)_{0~2} で場合によっては置換されており、シクロペンチル、シクロヘキシル、又は - シクロヘプチルが1個又は2個の - $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、
 -F、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、=O、又は -NR_{1-a}R_{1-b} で場合によっては置換されている、
 - シクロペンチル、- シクロヘキシル、又はシクロヘプチル環、

(XX) $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、
 -I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、-O-フェニル、
 及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、

(XXI) $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、
 -I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、-O-フェニル、
 及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、

(XXII) $\text{R}_\text{C} - 6$ が - (CH_2)_{0~6} - OH である、- (CH_2)_{0~1} - CHR
 $\text{C} - 6$ - (CH_2)_{0~1} - R_C - アリール、

(XXIII) - (CH_2)_{0~1} - CHR $\text{C} - 6$ - (CH_2)_{0~1} - R_C - ヘテロア

リール、

(XXIII) $-\text{CH}(-\text{R}_C - \text{アリール 又は } \text{R}_C - \text{ヘテロアリール}) - \text{CO}-\text{O}(\text{C}_{1 \sim 4} \text{ アルキル})$ 、

(XXIV) $-\text{CH}(-\text{CH}_2 - \text{OH}) - \text{CH}(-\text{OH}) - \text{アルキル}-\text{NO}_2$ 、

(XXV) $-(\text{C}_{1 \sim 6} \text{ アルキル}) - \text{O} - (\text{C}_{1 \sim 6} \text{ アルキル}) - \text{OH}$ 、

(XXVI) $-\text{CH}_2 - \text{NH} - \text{CH}_2 - \text{CH}(-\text{O} - \text{CH}_2 - \text{CH}_3)_2$ 、

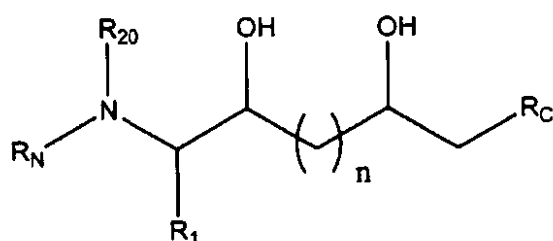
(XXVII) $-\text{H}$ 、及び

(XXVIII) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 6 - \text{C}(=\text{NR}_{1-a})(\text{NR}_{1-a} \text{ R}_{1-b})$ である
] 化合物、又は薬剤として許容されるその塩。

【請求項 2】

以下の式 I の化合物、又は薬剤として許容されるその塩であって、

【化 2】



(I)

[式中 R_1 が、

(I) $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキルであって、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルキル、 $\text{C}_{1 \sim 7}$ アルキル ($\text{C}_{1 \sim 3}$ アルキル及び $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルコキシで場合によっては置換されたもの)、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルコキシ、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が独立に $-\text{H}$ 又は $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキルである $-\text{NR}_{1-a} \text{ R}_{1-b}$ 、 $-\text{OC}=\text{ONR}_{1-a} \text{ R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、

(II) $-\text{CH}_2 - \text{S}(\text{O})_{0 \sim 2} - (\text{C}_{1 \sim 6} \text{ アルキル})$ 、

(III) $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{S}(\text{O})_{0 \sim 2} - (\text{C}_{1 \sim 6} \text{ アルキル})$ 、

(IV) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a} \text{ R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(V) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a} \text{ R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(VI) $-(\text{CH}_2)_{n_1} - (\text{R}_1 - \text{アリール})$ であって、 n_1 が 0 又は 1 であり、 $\text{R}_1 - \text{アリール}$ が、アリール環上で 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下の独立に選択された置換基で場合によっては置換された、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル及びインデニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、テトラリニルである $-(\text{CH}_2)_{n_1} - (\text{R}_1 - \text{アリール})$ ：

(A) $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキルであって、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{1-a} \text{ R}_{1-b}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_{1 \sim 3}$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$

1、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(C) 1つ又は2つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(D) $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 及び $-\text{I}$ 、

(E) 1個、2個、又は3個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

(F) $-\text{NR}_N - \text{R}_{N-2} - \text{R}_{N-3}$ 、

(G) $-\text{OH}$ 、

(H) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(I) $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(J) $-\text{CO}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(K) $-\text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、

(L) $-\text{CO} - \text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、

(M) $-\text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(VII) $-(\text{CH}_2)_{n-1}-(\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール})$ であって、 $\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$ がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピラジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から選択され、

上式で $\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$ 基が、水素で置換された親 $\text{R}_N - \text{ヘテロアリール}$ 基の任意の環原子によって $-(\text{CH}_2)_{n-1}-$ に結合されており、その結果 $\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$

ル基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリアルが1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(5) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(6) $-NR_N - 2 R_N - 3$ 、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C \equiv N$ 、

(9) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(10) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(11) $-SO_2 - NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(12) $-CO - NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(13) $-SO_2 - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、但し n_1 が0であるとき、 R_{1-} ヘテロアリアルは窒素によって炭素鎖に結合されておらず、

(VII) $-(CH_2)_{n_1} - (R_{1-} \text{ 複素環})$ であって、 $R_{1-} \text{ 複素環}$ がモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニルS-オキシド、チオモルホリニルS、S-ジオキシド、ペラジニル、ホモペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニルS、S-ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニルS-オキシド、テトラヒドロチエニルS、S-ジオキシド、ホモチオモルホリニルS-オキシドからなる群から選択され、

上式で $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基が、水素で置換された親 $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基の任意の原子によって結合されており、その結果 $R_{1-} \text{ 複素環}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(5) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(6) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C \equiv N$ 、

(9) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(10) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(11) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(12) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(13) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(14) $=O$ 、但し n_1 が0であるとき、 $R_{1-\text{複素環}}$ は窒素により炭素鎖に結合されておらず；

R_N は、以下のものであり：

(I) $R_{N-1}-X_N$ であって、 X_N は以下からなる群から選択され：

(A) $-CO-$ 、

(B) $-SO_2-$

ここで、 R_{N-1} は以下からなる群から選択され：

(A) R_N -アリールであって、 R_N -アリールは、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、テトラリニル、インダニル、ジヒドロナフチル又は6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプテニルであり、同じであるか異なってもよい1個、2個、又は3個の以下の置換基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ であって、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は、同じであるか異なり、以下からなる群から選択される $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ ：

(a) $-H$ 、

(b) $-C_1 \sim C_6$ アルキルであって、

(i) $-OH$ 、

(ii) $-NH_2$

からなる群から選択される1個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(c) $-C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、及び $-I$ から独立に選択される1個から3個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(d) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

- (e) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル}) - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (f) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - (C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、
 (g) 1つ又は2つの二重結合を有する $-C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (h) 1つ又は2つの三重結合を有する $-C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (i) 1つの二重結合及び1つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6 \text{ ヒドロカル}$

ビル鎖、

- (j) $-R_1 - \text{アリール}$ 、
 (k) $-R_1 - \text{ヘテロアリール}$
 (8) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (9) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (1\text{つ、}2\text{つ又は}3\text{つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、
 (10) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (1\text{つ、}2\text{つ又は}3\text{つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、
 (11) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (12) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{アリール}$ 、
 (13) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、
 (14) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{複素環}$ 、
 (15) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{N-4}$ であって、 R_{N-4} が、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1個、2個、3個、又は4個の $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ で場合によっては置換された $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{N-4}$ 、
 (16) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - O - R_{N-5}$ であって、 R_{N-5} が以下からなる群から選択され：

- (a) $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ 、
 (b) $-(CH_2)_0 \sim 2 - (R_1 - \text{アリール})$ 、
 (c) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (d) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (e) $C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル}$ 、
 (f) $-(CH_2)_0 \sim 2 - (R_1 - \text{ヘテロアリール})$ 、
 (17) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、
 (18) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、
 (19) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (20) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (21) R_{N-5} が同じであるか異なってもよい $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}$ 、
 (22) R_{N-5} が同じであるか異なってもよい $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})_2$ 、
 (23) R_{N-5} が同じであるか異なってもよい $-(CH_2)_0 \sim 4 - N - CS - N(R_{N-5})_2$ 、
 (24) $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(-H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - R_{N-2}$ 、
 (25) $-(CH_2)_0 \sim 4 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、
 (26) $-(CH_2)_0 \sim 4 - R_{N-4}$ 、
 (27) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) R_{N-1} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ である $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - P(O) - (OR_{N-1})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - CO - N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - CS - N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - (R_{N-5})_2$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-$ (1個、2個、3個、4個、又は5個の $-F$ で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、又は

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(B) R_N -ヘテロアリールであって、 R_N -ヘテロアリールが R_1 -ヘテロアリールと同じ定義を有し、 R_N -ヘテロアリール基が水素で置換された親 R_N -ヘテロアリール基の任意の原子によって結合しており、その結果 R_N -ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが以下から独立に選択された1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(C) R_N -アリール- $W-R_N$ -アリール、

(D) R_N -アリール- $W-R_N$ -ヘテロアリール、

(E) R_N -複素環が R_1 -複素環と同じである R_N -アリール- $W-R_N$ -複素環

(F) R_N -ヘテロアリール- $W-R_N$ -アリール、

(G) R_N -ヘテロアリール- $W-R_N$ -ヘテロアリール、

(H) R_N -ヘテロアリール- $W-R_N$ -複素環、

(I) R_N -複素環- $W-R_N$ -アリール、

(J) R_N -複素環- $W-R_N$ -ヘテロアリール、

(K) R_N -複素環- $W-R_N$ -複素環、

W は、以下のものであり、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-$ 、

(22) $-O-$ 、

(23) $-S(O)_{0 \sim 2}-$ 、

(24) $-N(R_{N-5})-$ 、又は

(5) $-CO-$ ；

R_{20} が H 、 CH_3 、又は $C_2 \sim C_6$ アルキル若しくはアルケニルであり、これらはいずれも $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CON$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択され

る 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換されてもよく；

n が 0 又は 1 であり；

R_C が $-R_A$ 、 $-O-R_A$ 、 $-X-R_A$ 、 $-NH-NHR_A$ 、 $-NR_{20}-NHR_A$ 、 $-NH-NR_{20}R_A$ 又は $-NR_{20}-NR_{20}R_A$ であり、前式で X が $-CH_2-$ 、 $-CH(R_A)$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(R_{20})-$ 、 $-N(R_A)-$ 、 $-NH-N(R_A)-$ 、又は $-NR_{20}-N(R_A)-$ であり；

上式で R_A が、

(I) $-C_1 \sim C_{10}$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O-$ フェニル、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-OC=ONR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-S(=O)_{0 \sim 2}R_{1-a}$ 、 $-NR_{1-a}C=ONR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C=ONR_{1-a}R_{1-b}$ 、及び $-S(=O)_2NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_{10}$ アルキルであり、

上式で R_{1-a} 及び R_{1-b} が、出現するごとに、独立に H 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

(II) $-(CH_2)_{0 \sim 3}-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ であって、シクロアルキルが、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O-$ フェニル、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換されていてもよい $-(CH_2)_{0 \sim 3}-(C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(III) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0 \sim 4}-R_{C-アリール}$ であって、 R_{C-X} 及び R_{C-Y} が以下のものからなる群から独立に選択され、

$-H$ 、

1 個又は 2 個の $-OH$ で場合によっては置換された $C_1 \sim C_4$ アルキル、

1 個、2 個、又は 3 個のハロゲンで場合によっては置換された $C_1 \sim C_4$ アルコキシ

、

$-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル}$ 、

1 つ又は 2 つの二重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

1 つ又は 2 つの三重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルキニル、及び

フェニル

又は

R_{C-X} 及び R_{C-Y} が、それらが結合する炭素と一緒に、炭素原子が 3 個、4 個、5 個、6 個又は 7 個の炭素環を形成し、1 つの炭素原子が、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR_{N-2}-$ 、及び $R_{C-アリール}$ から選択される基で場合によっては置換されており、かつ

$R_{C-アリール}$ が、出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、テトラニリル、インダニル、ジヒドロナフチル、又は 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプチルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) ハロゲン、

(5) $-CO_2H$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下のものからなる群から独立に選択される、—

$(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{NR}_{\text{N}-2} \text{R}_{\text{N}-3}$ 、：

(a) $-\text{H}$ 、

(b) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル：

(i) $-\text{OH}$ 、及び

(ii) $-\text{NH}_2$ 、

(c) 独立に $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 又は $-\text{OH}$ である、1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(d) $-\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(e) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{ アルキル}) - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(f) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{ アルキル})$ 、

(g) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(h) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(i) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル鎖

、
(j) $-\text{R}_1 - \text{アリール}$ であって、 $\text{R}_1 - \text{アリール}$ が出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又はテトラリニルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(i) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(ii) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(iii) $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(iv) $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 及び $-\text{I}$ 、

(v) 1 個、2 個、又は 3 個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

(vi) $-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{R}_{\text{N}-3}$ 、

(vii) $-\text{OH}$ 、

(viii) $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、

(ix) $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C} \equiv \text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(x) $-\text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(xi) $-\text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(xii) $-\text{CO} - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、又は

(xiii) $-\text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(k) $-\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$ であって、 $\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$ が出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピラジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾ

リル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノオキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_1 -ヘテロアリール基が、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(i) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-NR_{1-a}R_{1-b}、-C≡N、-CF₃、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(ii) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(iii) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(iv) -F、Cl、-Br及び-I、

(v) 1個、2個、又は3個の-Fで場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(vi) $-(CH_2)_0 \sim 4 - NR_N - 2 R_N - 3$ 、

(vii) -OH、

(viii) -C≡N、

(ix) $(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、-F、-Cl、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(x) $(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(xi) $(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - NR_N - 2 R_N - 3$ 、

(xii) $(CH_2)_0 \sim 4 - CO - NR_N - 2 R_N - 3$ 、

- $(x\ i\ i\ i) (CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 $(x\ i\ v) (CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - SO_2 -$ 、及び
 $(x\ v) (CH_2)_{0 \sim 4} - N(R_{N-2}) - C(O) -$ 、
 $(8) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 $(9) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、
 $(10) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、
 $(11) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (CH_2)_{0 \sim 4} (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアル$

キル)、

- $(12) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{アリール}$ 、
 $(13) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、
 $(14) - (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{複素環}$ 、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ は、出現するごとにモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S -オキシド、チオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S -オキシド、テトラヒドロチエニル S 、 S -ジオキシド及びホモチオモルホリニル S -オキシドからなる群から独立に選択され、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ 基が、水素で置換された親 $R_1 - \text{複素環}$ 基の任意の原子によって結合されており、その結果 $R_1 - \text{複素環}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(c) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(d) ハロゲン、

(e) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(f) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(g) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(h) $-OH$ 、

(i) $-C \equiv N$ 、

(j) $(CH_2)_{0 \sim 4} - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ であって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(CH_2)_{0 \sim 4} - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(k) $- (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(l) $- (CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(m) $- (CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(n) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - (C₁ ~ C₆ アルキル)、及び

(o) = O、

(p) - (CH₂)_{0~4} - N(R_{N-2}) - SO₂ -

(q) - (CH₂)_{0~4} - N(R_{N-2}) - C(O) -

(15) - (CH₂)_{0~4} - CO - R_{N-4} であって、前式で R_{N-4} が出現するごとに、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジルN-オキシド、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニルS-オキシド、ホモチオモルホリニルS、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、独立に C₁ ~ C₆ アルキルである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換された - (CH₂)_{0~4} - CO - R_{N-4}、

(16) R_{N-5} が出現するごとに、以下のものからなる群から独立に選択される - (CH₂)_{0~4} - CO - O - R_{N-5} :

(a) C₁ ~ C₆ アルキル、

(b) - (CH₂)_{0~2} - (R₁ - アリール)、

(c) C₂ ~ C₆ アルケニル、

(d) C₂ ~ C₆ アルキニル、

(e) C₃ ~ C₇ シクロアルキル、及び

(f) - (CH₂)_{0~4} - (R₁ - ヘテロアリール)、

(17) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - NR_{N-2} R_{N-3}、

(18) - (CH₂)_{0~4} - SO - (C₁ ~ C₈ アルキル)、

(19) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - (C₁ ~ C₁₂ アルキル)、

(20) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - (C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、

(21) - (CH₂)_{0~4} - N(H又はR_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}、

(22) - (CH₂)_{0~4} - N(H又はR_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})₂

(23) - (CH₂)_{0~4} - N - CS - N(R_{N-5})₂、

(24) - (CH₂)_{0~4} - N(H又はR_{N-5}) - CO - R_{N-2}、

(25) - (CH₂)_{0~4} - NR_{N-2} R_{N-3}、

(26) - (CH₂)_{0~4} - R_{N-4}、

(27) - (CH₂)_{0~4} - O - CO - (C₁ ~ C₆ アルキル)、

(28) R₁₀₀ が独立に H 又は C₁ ~ C₄ アルキルである、 - (CH₂)_{0~4} - O - P(O) - (OR₁₀₀)₂、

(29) - (CH₂)_{0~4} - O - CO - N(R_{N-5})₂、

(30) - (CH₂)_{0~4} - O - CS - N(R_{N-5})₂、

(31) - (CH₂)_{0~4} - O - (R_{N-5})、

(32) - (CH₂)_{0~4} - O - (R_{N-5}) - COOH、

(33) - (CH₂)_{0~4} - S - (R_{N-5})、

(34) - (CH₂)_{0~4} - O - (C₁ ~ C₆ アルキル) であって、アルキル基が、F、Cl、Br、及びIからなる群から独立に選択される、1個、2個、3個、4個、又は5個の置換基で場合によっては置換された - (CH₂)_{0~4} - O - (C₁ ~ C₆ アルキル)、

(35) - (CH₂)_{0~4} - (C₃ ~ C₈ シクロアルキル)、

(36) C₂ ~ C₆ アルケニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ又は -NR_{1-a} R_{1-b} で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルケニル、

(37) C₂ ~ C₆ アルキニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ、又は -NR_{1-a} R_{1-b} で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルキニル、

(38) - (CH₂)_{0~4} - N(-H又はR_{N-5}) - SO₂ - R_{N-2}、

(IV) — (C R_C — X R_C — Y)_{0 ~ 4} — R_C — ヘテロアリアルであって、

上式中で R_C — ヘテロアリアル が出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、β-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリジニル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミジノニル、ジヒドロベンゾフラノニル、ピリジニルN-オキシド、ピロリルN-オキシド、ピリミジニルN-オキシド、ピリダジニルN-オキシド、ピラジニルN-オキシド、キノリニルN-オキシド、インドリルN-オキシド、インドリニルN-オキシド、イソキノリルN-オキシド、キナゾリニルN-オキシド、キノキサリニルN-オキシド、フタラジニルN-オキシド、イミダゾリルN-オキシド、イソオキサゾリルN-オキシド、オキサゾリルN-オキシド、チアゾリルN-オキシド、インドリジニルN-オキシド、インダゾリルN-オキシド、ベンゾチアゾリルN-オキシド、ベンズイミダゾリルN-オキシド、ピロリルN-オキシド、オキサジアゾリルN-オキシド、チアジアゾリルN-オキシド、トリアゾリルN-オキシド、テトラゾリルN-オキシド、ベンゾチオピラニルS-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_C — ヘテロアリアル 基が、水素で置換された親 R_C — ヘテロアリアル 基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_C — ヘテロアリアル 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリアルが、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(1) C₁ ~ C₆ アルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、—F、—Cl、—Br、—I、—OH、—SH、—C≡N、—CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ、及び—NR₁—_a R₁—_b からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された C₁ ~ C₆ アルキル、

(2) —OH、

(3) —NO₂、

(4) —F、—Cl、—Br、—I、

(5) —CO—OH、

(6) —C≡N、

(7) —(CH₂)_{0 ~ 4}—CO—NR_{N-2}R_{N-3}、

(8) —(CH₂)_{0 ~ 4}—CO—(C₁ ~ C₁₂ アルキル)、

(9) —(CH₂)_{0 ~ 4}—CO—(1つ、2つ、又は3つの二重結合を有する C₂ ~ C₁₂ アルケニル)、

(10) —(CH₂)_{0 ~ 4}—CO—(1つ、2つ、又は3つの三重結合を有する C₂ ~ C₁₂ アルキニル)、

(11) —(CH₂)_{0 ~ 4}—CO—(C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、

- (12) - (CH₂)_{0~4} - CO - R₁ - アリール、
 (13) - (CH₂)_{0~4} - CO - R₁ - ヘテロアリール、
 (14) - (CH₂)_{0~4} - CO - R₁ - 複素環、
 (15) - (CH₂)_{0~4} - CO - R_{N-4}、
 (16) - (CH₂)_{0~4} - CO - O - R_{N-5}、
 (17) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - NR_{N-2} R_{N-3}、
 (18) - (CH₂)_{0~4} - SO - (C₁ ~ C₈ アルキル)、
 (19) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - (C₁ ~ C₁₂ アルキル)、
 (20) - (CH₂)_{0~4} - SO₂ - (C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、
 (21) - (CH₂)_{0~4} - N(H又はR_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}、
 (22) - (CH₂)_{0~4} - N(H又はR_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})₂

- 、
 (23) - (CH₂)_{0~4} - N - CS - N(R_{N-5})₂、
 (24) - (CH₂)_{0~4} - N(-H又はR_{N-5}) - CO - R_{N-2}、
 (25) - (CH₂)_{0~4} - NR_{N-2} R_{N-3}、
 (26) - (CH₂)_{0~4} - R_{N-4}、
 (27) - (CH₂)_{0~4} - O - CO - (C₁ ~ C₆ アルキル)、
 (28) R₁₀₀ が -H 又は C₁ ~ C₄ アルキルである、 - (CH₂)_{0~4} -
 O - P(O) - (OR₁₀₀)₂、
 (29) - (CH₂)_{0~4} - O - CO - N(R_{N-5})₂、
 (30) - (CH₂)_{0~4} - O - CS - N(R_{N-5})₂、
 (31) - (CH₂)_{0~4} - O - (R_{N-5})、
 (32) - (CH₂)_{0~4} - O - (R_{N-5}) - COOH、
 (33) - (CH₂)_{0~4} - S - (R_{N-5})、
 (34) - (CH₂)_{0~4} - O - (1個、2個、3個、4個、又は5個の - F
 で場合によっては置換された C₁ ~ C₆ アルキル)、
 (35) C₃ ~ C₇ シクロアルキル、
 (36) C₂ ~ C₆ アルケニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、
 -Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ、又は -N
 R_{1-a} R_{1-b} で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルケニル、
 (37) C₂ ~ C₆ アルキニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、
 -Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ、又は -N
 R_{1-a} R_{1-b} で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルキニル、
 (38) - (CH₂)_{0~4} - N(-H又はR_{N-5}) - SO₂ - R_{N-2}、
 (39) - (CH₂)_{0~4} - (C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、
 (V) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - アリール - R₁₀₁ - R_C - アリール
 、
 (VI) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - アリール - R₁₀₁ - R_C - ヘテロ
 アリール、
 (VII) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - ヘテロアリール - R₁₀₁ - R_C
 - アリール、
 (VIII) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - ヘテロアリール - R₁₀₁ - R_C
 - ヘテロアリール、
 (IX) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - アリール - R₁₀₁ - R₁ - 複素環
 、
 (X) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R_C - ヘテロアリール - R₁₀₁ - R₁ - 複
 素環、
 (XI) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R₁ - 複素環 - R₁₀₁ - R_C - アリール
 、
 (XII) - (CR_{C-X} R_{C-Y})₀₋₄ - R₁ - 複素環 - R₁₀₁ - R_C - ヘテロ

アリール、

(X I I I) - (C R_C - X R_C - Y)₀₋₄ - R₁ - 複素環 - R₁₀₁ - R₁ - 複素環、

上式で R₁₀₁ が単結合、(CH₂)_{0~4}、-O-、-NH-、又は -N(C₁ ~ C₆ アルキル) であり、

(X I V) - (C R_C - X R_C - Y)₀₋₄ - R₁ - 複素環、

(X V) - [C(R_{C-1})(R_{C-2})]_{1~3} - CO - N(R_{C-3})₂ であって、前式で R_{C-1} 及び R_{C-2} が同じであるか異なってもよく、以下のものからなる群から選択され：

(A) -H、

(B) -C₁ ~ C₆ アルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された -C₁ ~ C₆ アルキル、

(C) 1つ又は2つの二重結合を有する C₂ ~ C₆ アルケニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルケニル、

(D) C₂ ~ C₆ アルキニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルキニル、

(E) - (CH₂)_{1~2} - S(O)_{0~2} - (C₁ ~ C₆ アルキル)、

(F) - (CH₂)_{0~4} - C₃ ~ C₇ シクロアルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された - (CH₂)_{0~4} - C₃ ~ C₇ シクロアルキル、

(G) - (C₁ ~ C₄ アルキル) - R₁ - アリール、

(H) - (C₁ ~ C₄ アルキル) - R_C - ヘテロアリール、

(I) - (C₁ ~ C₄ アルキル) - R₁ - 複素環、

(J) - R_C - ヘテロアリール、

(K) - R₁ - 複素環、

(M) R_{C-4} が -O-、-S- 又は -NR(C₁ ~ C₆ アルキル)- である、- (CH₂)_{1~4} - R_{C-4} - (CH₂)_{0~4} - R₁ - アリール、

(N) - (CH₂)_{1~4} - R_{C-4} - (CH₂)_{0~4} - R_C - ヘテロアリール、

(O) - R₁ - アリール、

かつ R_{C-3} が出現するごとに独立に以下のものである：

(A) -H、

(B) -C₁ ~ C₆ アルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された -C₁ ~ C₆ アルキル、

(C) 1つ又は2つの二重結合を有する C₂ ~ C₆ アルケニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~ C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルケニル、

(D) 1つ又は2つの三重結合を有する C₂ ~ C₆ アルキニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁ ~

C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂~C₆ アルキニル、

(E) -(CH₂)_{0~4}-C₃~C₇ シクロアルキルであって、C₁~C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された-(CH₂)_{0~4}-C₃~C₇ シクロアルキル、

(F) -R₁-アリール、

(G) -R_C-ヘテロアリール、

(H) -R₁-複素環、

(I) -(C₁~C₄ アルキル)-R₁-アリール、

(J) -(C₁~C₄ アルキル)-R_C-ヘテロアリール、

(K) -(C₁~C₄ アルキル)-R₁-複素環、

(XVI) -CH(R_C-アリール)₂、

(XVII) -CH(R_C-ヘテロアリール)₂、

(XVIII) -CH(R_C-アリール)(R_C-ヘテロアリール)、

(XIX) R_C-アリール又はR_C-ヘテロアリール又はR₁-複素環と縮合した-シクロペンチル、-シクロヘキシル、又はシクロヘプチル環であって、シクロペンチル、シクロヘキシル、又は-シクロヘプチルの1個の炭素が、NH、NR_{N-5}、O、S(=O)_{0~2} で場合によっては置換されており、シクロペンチル、シクロヘキシル、又は-シクロヘプチルが1個又は2個の-C₁~C₃ アルキル、-F、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆ アルコキシ、=O、又は-NR_{1-a}R_{1-b} で場合によっては置換されている、-シクロペンチル、-シクロヘキシル、又はシクロヘプチル環、

(XX) C₂~C₁₀ アルケニルであって、C₁~C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂~C₁₀ アルケニル、

(XXI) C₂~C₁₀ アルキニルであって、C₁~C₃ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆ アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂~C₁₀ アルキニル、

(XXII) R_{C-6} が-(CH₂)_{0~6}-OHである、-(CH₂)_{0~1}-CHR_{C-6}-(CH₂)_{0~1}-R_C-アリール、

(XXIII) -(CH₂)_{0~1}-CHR_{C-6}-(CH₂)_{0~1}-R_C-ヘテロアリール、

(XXIV) -CH(-R_C-アリール又はR_C-ヘテロアリール)-CO-O(C₁~C₄ アルキル)、

(XXV) -CH(-CH₂-OH)-CH(-OH)-(C₁~C₄ アルキル)-NO₂、

(XXVI) -(C₁~C₆ アルキル)-O-(C₁~C₆ アルキル)-OH、

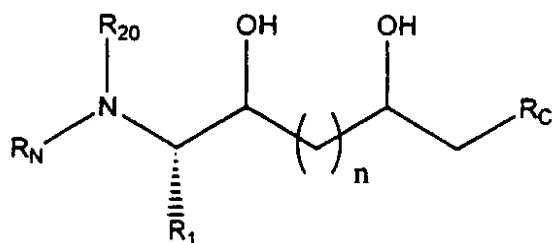
(XXVII) -CH₂-NH-CH₂-CH(-O-CH₂-CH₃)₂、

(XXVIII) -H、及び

(XXIX) -(CH₂)_{0~6}-C(=NR_{1-a})(NR_{1-a}R_{1-b})である
] 化合物、又は薬剤として許容されるその塩。

【請求項3】

【化 3】

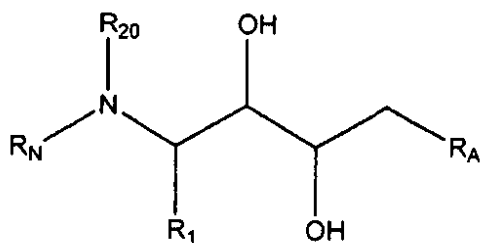


の配置の立体化学構造である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

式 I I の化合物であって、

【化 4】

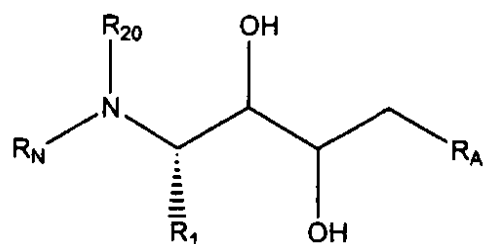


(II)

上式で R_N 、 R_{20} 、 R_1 、及び R_A が請求項 1 又は 2 で定義するものである化合物、並びに薬剤として許容されるその塩及びエステル。

【請求項 5】

【化 5】

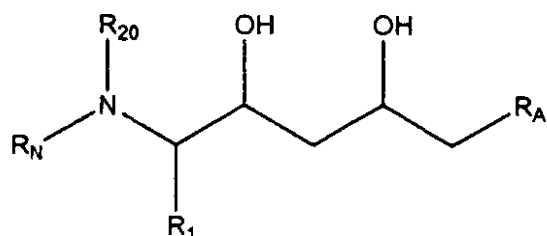


の配置の立体化学構造である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

式 I I I の化合物であって、

【化 6】

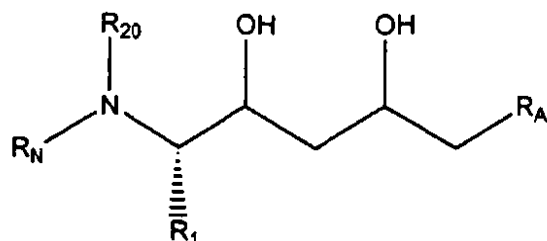


(III)

上式で R_N 、 R_{20} 、 R_1 、及び R_A が請求項 1 又は 2 で定義するものである化合物、並びに薬剤として許容されるその塩及びエステル。

【請求項 7】

【化 7】

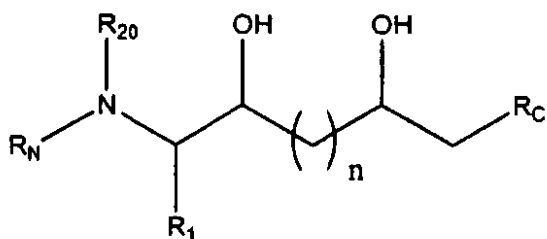


の配置の立体化学構造である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

式 I V の化合物、又は薬剤として許容されるその塩。

【化 8】



(IV)

[式中、 R_N 、 R_{20} 、 R_1 、及び n が請求項 1 又は 2 で定義するものであり、 n が 0 のとき、 R_C が $-O-R_A$ 、 $-NH-NHR_A$ 、 $-NR_{20}-NHR_A$ 、 $-NH-NR_{20}R_A$ 、又は $-NR_{20}-NR_{20}R_A$ であり、

n が 1 のとき、 R_C が $-X-R_A$ であり、かつ X が O 、 CH_2 、 CHR_A 、 S 、 SO 、 SO_2 、 NH 、 NR_{20} 、 NR_A 、 $NH-NR_A$ 、又は $NR_{20}-NR_A$ であり、

かつ R_A が以下のものであり、

(I) $-C_1 \sim C_8$ アルキルであって、以下のものからなる群から独立に選択される 1 ～ 3 個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_8$ アルキル：

- m) アリール
- n) ヘテロアリール
- o) 複素環
- p) CN
- q) O-R_{1-a}
- r) NR_{1-a}R_{1-b}
- s) C(O) NR_{1-a}R_{1-b}
- t) NR_{1-a}C(O)R_{1-b}
- u) NR_{1-a}C(O)NR_{1-a}R_{1-b}
- v) S(O)₂R_{1-a}
- w) S(O)₂ NR_{1-a}R_{1-b}
- x) NR_{1-a}S(O)₂R_{1-b};

(I I) アリール、ヘテロアリール、又は複素環であって、X-R_A が-NH-NR_AR_A 又は-NR_AR_A であるとき、基R_AR_A が場合によっては結合して5～7員環を形成することができ、その環中に場合によってはO又はN原子を含み、このような環は以下のもので場合によっては置換されており：

- b) OH
- b) O-R_{1-a}
- f) アリール
- g) ヘテロアリール
- h) (CH₂)₀₋₄-NR_{N-2}-C(O)-R_{N-2}
- f) (CH₂)₀₋₄-NR_{N-2}-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}
- h) (CH₂)₀₋₄-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}
- h) C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}
- i) NR_{N-2}R_{N-3};

この実施形態中で使用するとき、R_{1-a}及びR_{1-b}は以下のものからなる群から独立に選択され：

- j) H
- k) C_1-C_7 アルキル
- l) $(CH_2)_{1-4}-NR_{N-2}-C(O)-R_{N-2}$
- m) $(CH_2)_{1-4}-NR_{N-2}-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}$
- n) $(CH_2)_{1-4}-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}$
- o) $(CH_2)_{1-4}-O-R_{N-2}$
- p) アリール
- q) ヘテロアリール
- r) 複素環;

この実施形態中で使用するとき、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は以下のものからなる群から独立に選択され：

- i) H
- ii) $C_1 \sim C_7$ アルキルであって、以下のものからなる群から独立に選択される 1 個又は 2 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_7$ アルキル：

- 1. OH
- 2. アリール
- 3. ヘテロアリール

iii) $(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$

iv) $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル

- v) アリール
- vi) ヘテロアリール
- vii) 複素環

R_{N-2} 及び R_{N-3} は、以下の例において一緒に出現する場合：

- $(CH_2)_{1-4}-NR_{N-2}-C(O)-R_{N-2}$
- $(CH_2)_{1-4}-NR_{N-2}-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}$
- $(CH_2)_{1-4}-C(O)-NR_{N-2}R_{N-3}$

5～7 員環を場合によっては形成することができ、この場合環の $R_{N-2}-R_{N-3}$ 部分の 0～1 個の原子は、窒素又は酸素を場合によっては含むことができ；

R_{1-a} 及び R_{1-b} は、以下の例において一緒に出現する場合：

- $NR_{1-a}R_{1-b}$
- $C(O)NR_{1-a}R_{1-b}$
- $NR_{1-a}C(O)R_{1-b}$
- $NR_{1-a}C(O)NR_{1-a}R_{1-b}$
- $S(O)_2NR_{1-a}R_{1-b}$
- $NR_{1-a}S(O)_2R_{1-b}$;

5～7 員環を場合によっては形成することができ、この場合環の $R_{1-a}-R_{1-b}$ 部分の 0～1 個の原子は、窒素又は酸素を場合によっては含むことができ；

この実施形態中で使用するとき、アルキルは直鎖、分岐鎖、シクロアルキル、及びシクロアルキルメチルを含むと定義され、1個若しくは2個のアルケン結合、又は1個のアルキン結合を場合によっては含むことができ、このようなアルキル基は以下のものからなる群から独立に選択される1～3個の基で場合によっては置換することができる：

- a) OH,
- b) $\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- c) $\text{C}(\text{O})\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- d) $\text{NC}(\text{O})\text{R}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- e) $\text{NC}(\text{O})\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- f) $\text{NS}(\text{O})_2\text{R}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- g) NR_{1-c} -アリール
- h) NR_{1-c} -ヘテロアリール
- i) アリール
- j) ヘテロアリール
- k) 複素環；

この実施形態中では、アルキルがシクロアルキル又はシクロアルキルメチルであるとき、1個又は2個の環の炭素を、以下のものからなる群から独立に選択される基で場合によっては置換することができる：

- i) -O-
- ii) - NR_{1-a}
- iii) - $\text{NC}(\text{O})\text{R}_{1-c}$
- iv) - $\text{NC}(\text{O})\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- v) - $\text{NS}(\text{O})_2\text{R}_{1-c}$
- vi) -N-アリール
- vii) -N-ヘテロアリール；

さらにこの実施形態中では、シクロアルキルは、追加の芳香族又は非芳香族で、炭素環又は複素環の、3～7個の環原子を含む環と場合によっては縮合することができる、この場合、この追加の縮合環は、以下のものからなる群から独立に選択される1～3個の基で場合によっては置換することができる：

- 1. OH
- 2. -O- ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)
- 3. - NR_{1-c} 及び R_{1-d}
- 4. - $\text{C}(\text{O})\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- 5. - $\text{NC}(\text{O})\text{R}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- 6. - $\text{NC}(\text{O})\text{NR}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- 7. - $\text{NC}(\text{O})_2\text{R}_{1-c}\text{R}_{1-d}$
- 9. 芳香環上のハロゲン、縮合環が芳香族であるハロゲン；

さらにこの実施形態中では、シクロアルキル又はシクロアルキルメチルは、追加の芳香環と縮合しない場合、1個又は2個のアルケン結合を場合によっては含むことができる；

この実施形態中で使用するとき、ヘテロアリールはピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニルであってよく；

この実施形態中で使用するとき、アリールはフェニル及び二環式環から選択することができ、フェニルは3～4員を含む他の非芳香環と縮合し、その環員は炭素と、場合によっては、窒素及び酸素からなる群から独立に選択される1個又は2個の非炭素原子から構成され；

さらにこの実施形態中で使用するとき、ヘテロアリール及びアリールが第2の非芳香環を有する場合、前記非芳香環は、炭素環員と直接結合したカルボニル基を含むことができ；

さらにこの実施形態中で使用するとき、アリール及びヘテロアリールは、以下のものからなる群から独立に選択される1個又は2個の基で場合によっては置換することができ：

- a) OR_1-C
- b) NR_1-CR_1-d
- c) $C(O)NR_1-CR_1-d$
- d) $NC(O)R_1-CR_1-d$
- e) $NC(O)NR_1-CR_1-d$
- f) $NS(O)_2R_1-CR_1-d$
- g) NR_1-C チアゾリル
- h) NR_1-C イミダゾリル
- i) NR_1-C オキサゾリル；

さらにこの実施形態中で使用するとき、複素環はアゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、アゼピニル、ピペラジニル、モルホリニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、インドリニル、又はイソクロマニルからなる群から選択することができ、かつ複素環は、以下のものからなる群から独立に選択される1個又は2個の基で場合によっては置換することができ：

- j) =O
- b) -OH-NR_{1-c}R_{1-d}
- k) -C(O)NR_{1-c}R_{1-d}
- l) -NC(O)R_{1-c}R_{1-d}
- m) -NC(O)NR_{1-c}R_{1-d}
- n) -NS(O)₂R_{1-c}R_{1-d}
- o) -NR_{1-a}アリール
- p) -NR_{1-a}ヘテロアリール
- q) -アリール
- r) -ヘテロアリール;

この実施形態中使用するとき、R_{1-c} 及び R_{1-d} は出現するごとに、以下のものからなる群から独立に選択することができ：

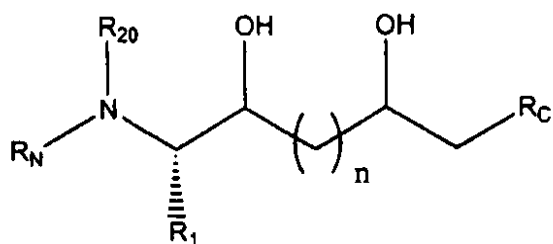
- a) -H
- b) -C₁-C₆ アルキル
- c) -(CH₂)₀₋₂-NR_{1-e}R_{1-f}
- d) -(CH₂)₀₋₂-C(O)NR_{1-e}R_{1-f}
- e) -(CH₂)₀₋₂-NR_{1-e}-C(O)R_{1-f}
- f) -(CH₂)₀₋₂-NR_{1-e}-C(O)NR_{1-e}R_{1-f}
- g) -(CH₂)₀₋₂-O-C(O)NR_{1-e}R_{1-f}
- h) -(CH₂)₀₋₂-O-R_{1-e};

この実施形態中使用するとき、R_{1-e} 及び R_{1-f} は出現するごとに、

- i) H
 - ii) C₁ ~ C₆ アルキル
- からなる群から独立に選択される]

【請求項 9】

【化 9】

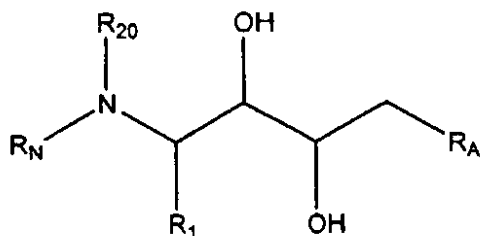


の配置の立体化学構造である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

式 V の化合物であって、

【化 1 0】

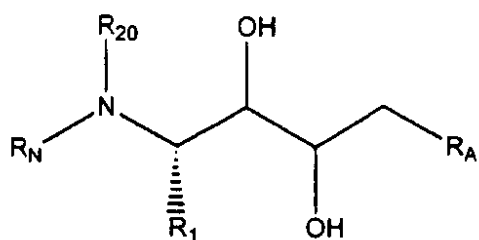


(V)

上式で R_N 、 R_{20} 、及び R_1 が請求項 1 又は請求項 2 で定義するものであり、 R_A が請求項 8 で定義するものである化合物、並びに薬剤として許容されるその塩及びエステル。

【請求項 1 1】

【化 1 1】

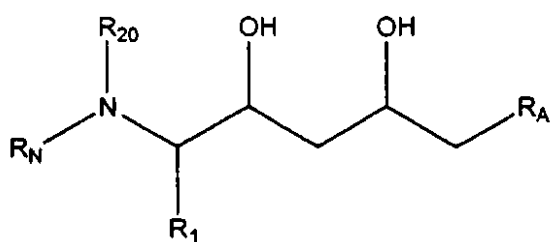


の配置の立体化学構造である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

式 V I の化合物であって、

【化 1 2】

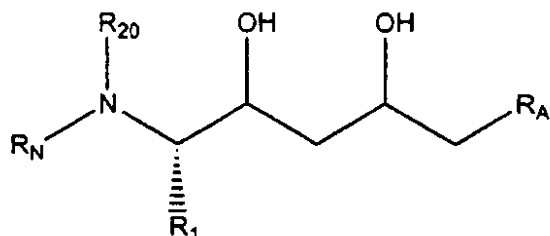


(VI)

上式で R_N 、 R_{20} 、及び R_1 が請求項 1 又は請求項 2 で定義するものであり、 R_A が請求項 8 で定義するものである化合物、並びに薬剤として許容されるその塩及びエステル。

【請求項 1 3】

【化 1 3】



の配置の立体化学構造である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ であり、

R_1 が

(I) $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-アリール)$ であって、 n_1 が 0 又は 1 であり、 $R_1-アリール$ が、アリール環上で 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下の置換基で場合によっては置換された、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、又はテトラリニルである $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-アリール)$ ：

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(C) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(D) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(F) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(G) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下のものからなる群から選択される：

(1) $-H$ 、

(2) 以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(a) $-OH$ 、及び

(b) $-NH_2$ 、

(3) 1 個から 3 個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(4) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(5) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(6) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(7) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(8) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(9) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、

(10) $-R_1$ - アリール、及び

(11) $-R_1$ - ヘテロアリール、

(H) $-OH$ 、

(I) $-C \equiv N$ 、

(J) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(K) $-CO-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、

(L) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(N) $-SO_2-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、又は

(II) $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-\text{ヘテロアリール})$ であって、 n_1 は0又は1であり、 $R_1-\text{ヘテロアリール}$ がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニルからなる群から選択され、

上式で $R_1-\text{ヘテロアリール}$ 基が、水素で置換された親 $R_N-\text{ヘテロアリール}$ 基の任意の環原子によって $-(CH_2)_{n_1}-$ に結合されており、その結果 $R_1-\text{ヘテロアリール}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(6) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(7) $-NR_N-R_{N-3}$ 、

(8) $-OH$ 、

(9) $-C \equiv N$ 、

(10) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(11) $-CO-$ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、

(12) $-SO_2-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(13) $-CO-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、又は

(14) $-\text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、但し n_1 が 0 であるとき、 $\text{R}_1 -$ ヘテロアリールは窒素によって炭素鎖に結合されていない
である請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 16】

R_N が $\text{R}_{N-1} \text{C}(\text{O}) -$ であり、

R_{N-1} が以下のものからなる群から選択され：

フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、テトラリニル、インダニル、ジヒドロナフチル、又は 6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプチルであって、これらのそれぞれが同じであるか異なってもよい、以下の 1 個、2 個又は 3 個の置換基で場合によっては置換されている：

(1) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_1 - \text{a} \text{R}_1 - \text{b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(2) $-\text{OH}$ 、

(3) $-\text{NO}_2$ 、

(4) $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、又は $-\text{I}$ 、

(5) $-\text{CO}-\text{OH}$ 、

(6) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(7) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{NR}_{N-2} \text{R}_{N-3}$ 、

(8) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} -$ (1 つ、2 つ、又は 3 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_{12}$ アルケニル)、

(10) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} -$ (1 つ、2 つ、又は 3 つの三重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_{12}$ アルキニル)、

(11) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{R}_1 - \text{アリール}$ 、

(13) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{R}_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{R}_1 - \text{複素環}$ 、

(15) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{R}_{N-4}$ 、前式で R_{N-4} がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル及びピロリジニルからなる群から選択され、各基が 1 個、2 個、3 個又は 4 個の $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルで場合によっては置換されており、

(16) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{CO} - \text{O} - \text{R}_{N-5}$ 、前式で、 R_{N-5} が以下のものからなる群から選択され：

(a) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(b) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 2} - (\text{R}_1 - \text{アリール})$ 、

(c) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(d) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(e) $-\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 2} - (\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール})$ 、

(17) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO}_2 - \text{NR}_{N-2} \text{R}_{N-3}$ 、

(18) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{SO}_2 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{N-5}) - \text{CO} - \text{O} - \text{R}_{N-5}$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(22) $-(\text{CH}_2)_{0 \sim 4} - \text{N}(\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{N-5}) - \text{CO} - \text{N}(\text{R}_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なってもよく、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) $R_{N-アリアル-1}$ が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-アリアル-1})_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は } 5 \text{ 個の } -F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、又は、

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項17】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ であり、

R_{N-1} が R_N -ヘテロアリアルであり、前式で R_N -ヘテロアリアルが以下のものからなる群から選択される：

ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、ブリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル

前式で R_N -ヘテロアリアル基が、水素で置換された親 R_N -ヘテロアリアル基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_N -ヘテロアリアル基との新しい結合が、

水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが、以下のものである1個、2個、3個、又は4個の置換基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 Cl 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの二重結合を有する}$

$C_2 \sim C_{12}$ アルケニル)、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの三重結合を有する}$
 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル)、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ アリール、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ 複素環、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なってもよく、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) R_{N-} アリール -1 が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-}$ アリール $-1)_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F$
で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 C_1

$\sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、前式で、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項18】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ であり、

R_{N-1} がフェニル、1-ナフチル、又は2-ナフチルであり、これらはそれぞれ、同じであるか異なってもよい1個、2個、又は3個の以下の置換基で場合によっては置換されている：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12})$ アルキル)、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ アリール、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ 複素環、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} が、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1個、2個、3個、又は4個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$ ：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_{1-}$ アリール)、

(c) 1つ又は2つの二重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1つ又は2つの三重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_{1-}$ ヘテロアリール)、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

- (18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、
 (19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、
 (25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なってもよく、
 (26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、
 (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) $R_{N-アリール-1}$ が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ である、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-アリール-1})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、
 (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、
 (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、
 (34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (35) $C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル}$ 、
 (36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、又は
 (39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル}$ 、

請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 19】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ を表し、

R_{N-1} が同じであるか異なってもよい、以下の 1 個、2 個又は 3 個の置換基で場合によっては置換されているフェニルである：

- (1) $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}$ であり、
 (2) $-OH$ 、
 (3) $-NO_2$ 、
 (4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、
 (5) $-CO-OH$ 、
 (6) $-C \equiv N$ 、

- (7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、
 (10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、
 (11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - アリール、
 (13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - ヘテロアリール、
 (14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - 複素環、
 (15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1 個、2 個、3 個、又は 4 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、
 (16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$ ：
 (a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、
 (b) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_1$ - アリール、
 (c) 1 つ又は 2 つの二重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルケニル、
 (d) 1 つ又は 2 つの三重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルキニル、
 (e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び
 (f) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_1$ - ヘテロアリール、
 (17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、
 (19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、
 (24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、
 (25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なってもよく、
 (26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、
 (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) R_{N-1} - アリールが $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-1} \text{ - アリール})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、
 (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、
 (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、
 (34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_1 - a R_1 - b$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_1 - a R_1 - b$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(-H \text{ 又は } R_{N-5}) - SO_2 - R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、又は

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 20】

R_N が $R_{N-1} C(O)-$ を表し、

R_{N-1} が同じであるか異なってもよい、以下の 1 個、2 個又は 3 個の置換基で場合によっては置換されているフェニルである：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (1 \text{ つ、2 つ又は 3 つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (1 \text{ つ、2 つ又は 3 つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{1-アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{1-ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{1-複素環}$ 、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1 個、2 個、3 個、又は 4 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - O - R_{N-5}$ ：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2} - (R_{1-アリール})$ 、

(c) 1つ又は2つの二重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1つ又は2つの三重結合を含む $C_2 \sim C_6$ アルキニル、及び

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、前式で R_{N-5} が同じであるか異なってもよく、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が同じであるか異なってもよく、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(28) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、前式で R_{N-5} 及び R_{N-2} が同じであるか異なってもよく、又は

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_8 \text{ シクロアルキル}$ 、

請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 21】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ であり、

R_1 が $-(CH_2)_{n_1}-$ フェニルを表し、 n_1 が 0 又は 1 であり、フェニルが同じであるか異なる、以下の 1 個、2 個又は 3 個の置換基で場合によっては置換されている：

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(C) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(D) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(F) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(G) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が独立に、以下のものからなる群から選択される：

(1) $-H$ 、

(2) 以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(a) $-OH$ 、及び

(b) $-NH_2$ 、

(3) 1 個から 3 個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(4) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(5) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

- (6) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、
 (7) 1つ又は2つの二重結合を有する $-C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (8) 1つ又は2つの三重結合を有する $-C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (9) 1つの二重結合及び1つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6 \text{ アルキル鎖}$ 、
 (10) $-R_1 - \text{アリール}$ 、及び
 (11) $-R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、

(H) $-OH$ 、

(I) $-C \equiv N$ 、

(J) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(K) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(L) $-SO_2 - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-CO - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(N) $-SO_2 - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項22】

R_1 がフェニル ($C_1 \sim C_6$) アルキル基からなる群から選択され、フェニルが以下のものから独立に選択される1個又は2個の基で場合によって置換されている：

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(C) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(D) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が独立に、以下のものからなる群から選択される：

(1) $-H$ 、

(2) 以下のものからなる群から選択される1個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(a) $-OH$ 、及び

(b) $-NH_2$ 、

(3) 1個から3個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(4) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(5) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(6) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(9) 1つの二重結合及び1つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、

(E) $-OH$ 、

(F) $-C \equiv N$ 、

(G) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(H) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(I) $-SO_2 - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(J) $-CO - NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

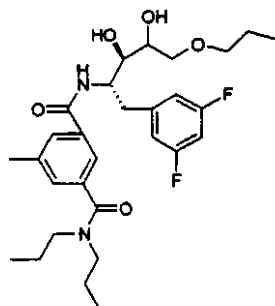
請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項23】

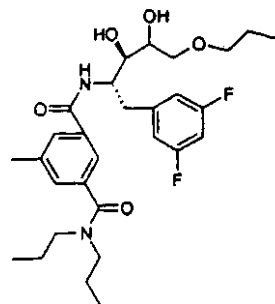
R₁ がベンジル、4-ヒドロキシベンジル、2-フルオロ-4-プロピルベンジル、3-アミノ-4-ブロモベンジル、3-クロロ-5-メチルフェネチル、3,5-ジフルオロベンジル、2-メチルフェニルプロピル、4-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルフェネチル、2,3-ジクロロベンジル、及び2-クロロ-4-シアノベンジルからなる群から選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項24】

【化14-1】

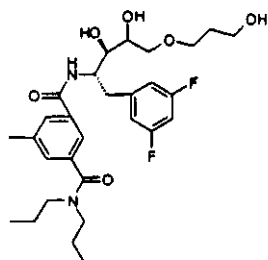


1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-O-プロピル-L-
スレオ-ペンチトール

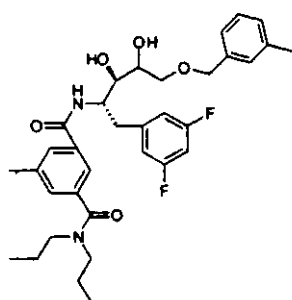


1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-O-プロピル-L-
スレオ-ペンチトール

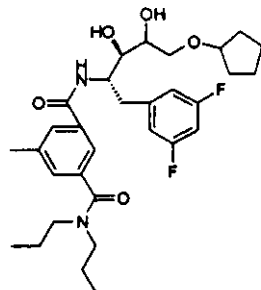
1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-(3-[3-(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル)アミノ-5-O-(3-ヒドロキシプロピル)-L-スレオ-ペンチオール



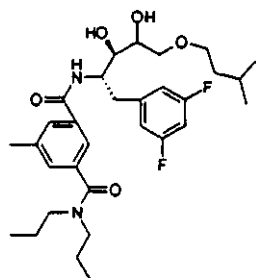
1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-($\{3-[(シブロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル\}$ アミノ)-5-O-(3-メチルベンジル)-L-スレオ-ペンチオール



5-*O*-シクロペンチル-1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-($\{3-[(\text{シプロピルアミノ})カルボニル]-5\text{-メチルベンゾイル}\}$ アミノ)-*L*-スレオ-ペンチトール



1,2-ジ^テオキシ-1-(3,5-ジ^{フル}オロ^{フェニル})-2-(³-[^シプロピル^{アミノ}]カルボ^{ニル}]-5-メチルベンゾ^{イル}アミノ)-5-^{イソ}ベンチル-^{スレオ}-ベンチオール



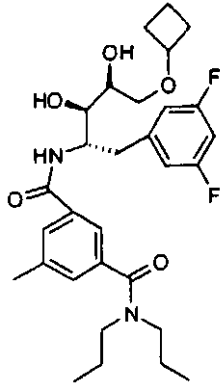
CCCCN(CCC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@@H](Cc2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)COCCOCCN(CC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@H](C2=CC=C(C=C2)F)C[C@@H](O)[C@H](O)COCC(C)C

1,2,5-トリテ オキシ-1-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-2-
(3-[3-(シ'プロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾ'イル)アミノ)-5-[メチル(3-
メチルフェニル)アミノ]-D-リボトール

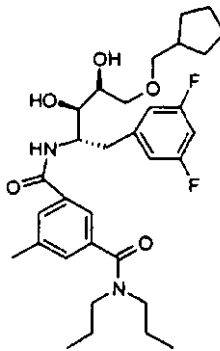
CCN(CC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@@H](c2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)CO

1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル}アミノ)-5-O-イソブチル-L-スレオ-ペンチオール

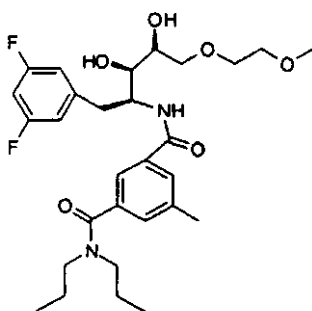
【化 1 4 - 5】



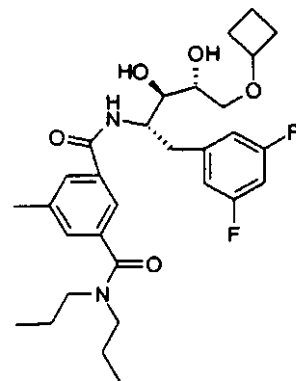
5-O-シクロプロチル-1,2-シテオキシ-1-(3,5-
シフルオロフェニル)-2-({3-[(シプロピルアミノ)
カルボニル]-5-メチルベンゾイル} アミノ)-D-
キシリトール



5-O-(シクロペンチルメチル)-1,2-シテオキシ-
1-(3,5-シフルオロフェニル)-2-({3-[(シプロ
ピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル}
アミノ)-D-キシリトール

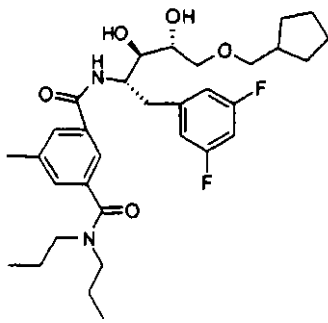


1,2-シテオキシ-1-(3,5-シフルオロフェニル)-
2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル} アミノ)-5-O-(2-メトキシエチル)-
D-キシリトール

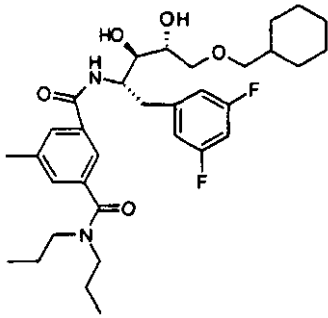


5-O-シクロプロチル-1,2-シテオキシ-1-(3,5-
シフルオロフェニル)-2-({3-[(シプロピルアミノ)
カルボニル]-5-メチルベンゾイル} アミノ)-D-
キシリトール

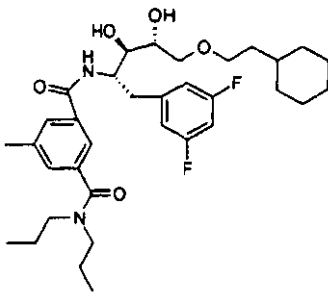
【化 1 4 - 6】



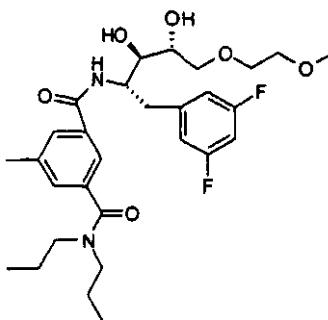
5-O-(シクロペンチルメチル)-1,2-ジイソプロキシー
1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-
[(イソプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-D-キシリトール



5-O-(シクロヘキシルメチル)-1,2-ジイソプロキシー
1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-
[(イソプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-D-キシリトール

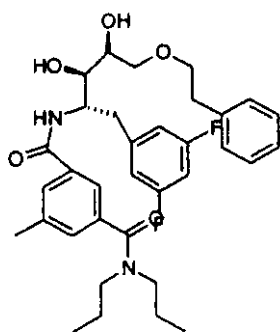


5-O-(2-シクロヘキシルエチル)-1,2-ジイソプロキシー
1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-
[(イソプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-D-キシリトール

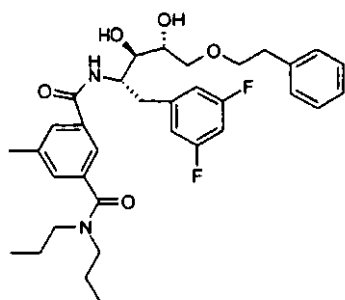


1,2-ジイソプロキシー-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-({3-[(イソプロピルアミノ)カルボニル]-
5-メチルベンゾイル}アミノ)-5-O-(2-
メトキシシクロヘキシル)-D-キシリトール

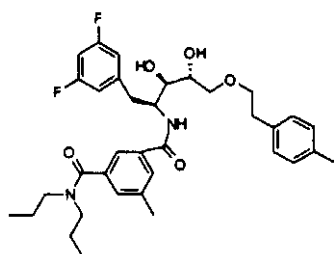
【化 1 4 - 7】



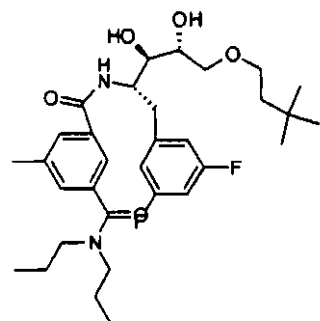
1,2-ジイソプロピリデン-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルペンソイル}アミノ)-5-O-(2-フェニルエチル)-
D-キシリトール



1,2-ジイソプロピリデン-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルペンソイル}アミノ)-5-O-(2-フェニルエチル)-
D-キシリトール

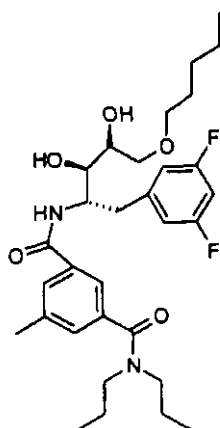
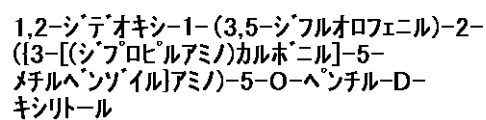
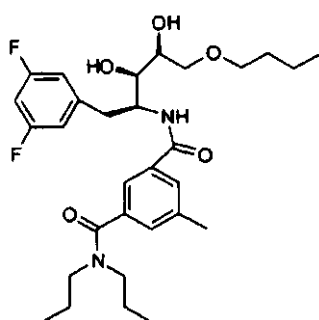
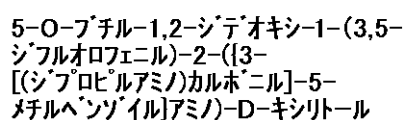
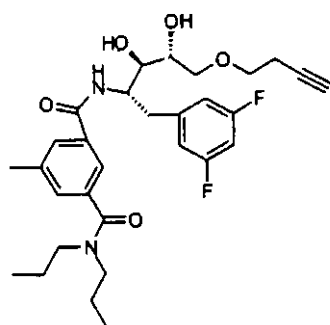
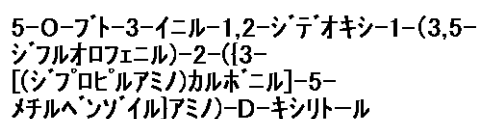
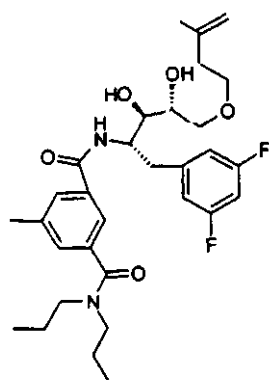


1,2-ジイソプロピリデン-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルペンソイル}アミノ)-5-O-[2-(4-メチル
フェニル)エチル]-D-キシリトール



1,2-ジイソプロピリデン-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
5-O-(3,3-ジメチルブチル)-2-({3-[(
シプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチル
ペンソイル}アミノ)-D-キシリトール

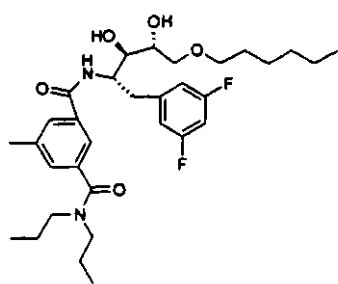
1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
 ([3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
 メチルベンゾイル]アミノ)-5-O-(3-
 メチルブト-3-イニル)-D-キシリトール



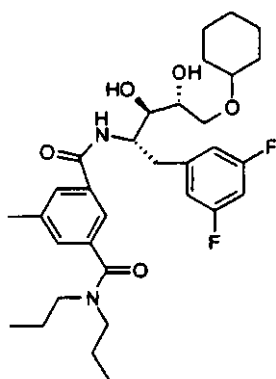
CCCCN(CC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@H](C(=O)O)[C@@H](O)COCCCCCCCCCN(CCCC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)NC[C@H](O)[C@H](O)COCc2ccccc2CCCCOC[C@H](O)[C@@H](c1ccc(F)c(F)c1)NC(=O)c2ccc(C)cc2C(=O)N(CCC)CCCCCCCN(CCCC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@@H](Cc2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)COCCCC

1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
([3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル]アミノ)-5-O-ペンチル-D-
キシリトール

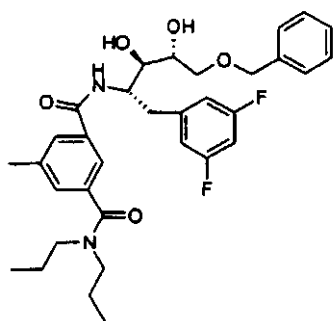
【化 14-10】



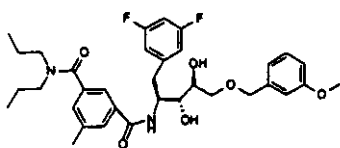
1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
-((3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-ヘキシル-D-
キシリトール



5-O-シクロヘキシル-1,2-ジデオキシ-1-(3,5-
ジフルオロフェニル)-2-((3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-D-
キシリトール



5-O-ベンジル-1,2-ジデオキシ-1-(3,5-
ジフルオロフェニル)-2-((3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-D-
キシリトール

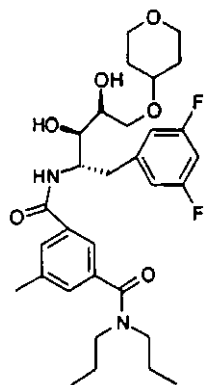


1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-((3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-(3-
メトキシベンジル)-D-キシリトール

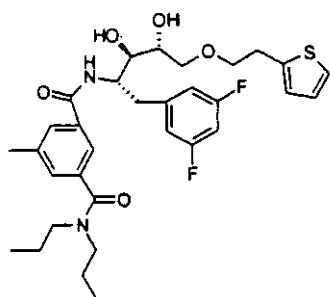
CCN(CC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@@H](Cc2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)COCC3OCCO3CCc1ccc(cc1C(=O)N(CC)CC)C(=O)N[C@@H](C[C@H](O)[C@H](O)COCc2ccsc2)c3cc(F)c(F)cc3CCCCN(CCC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@@H](Cc2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)COCC3OCCOCC3

1,2-ジ・テオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
 ([3-[(ジ・プロピルアミノ)カルボニル]-5-
 メチルベンゾイル]アミノ)-5-O-
 (テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルメチル)-D-
 キシリトール

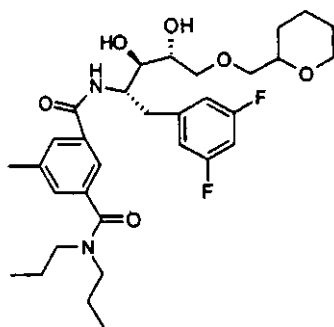
【化 1 4 - 1 2】



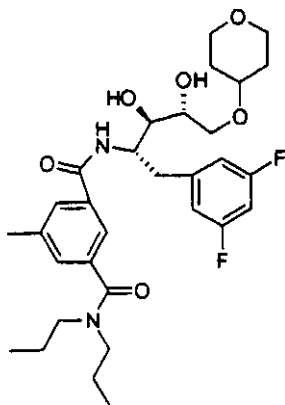
1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
(3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-
テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル-D-キシリトール



1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
(3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-(2-チエン-2-
イルメチル)-D-キシリトール

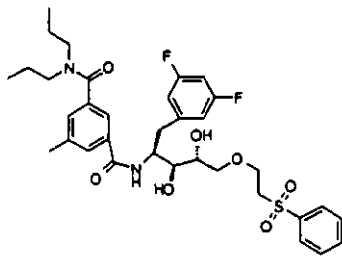


1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
(3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-
(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルメチル)-D-
キシリトール

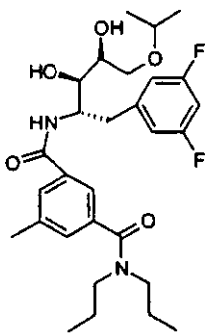


1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-
(3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-
テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル-D-
キシリトール

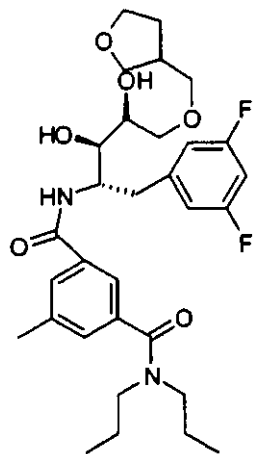
【化 1 4 - 1 3】



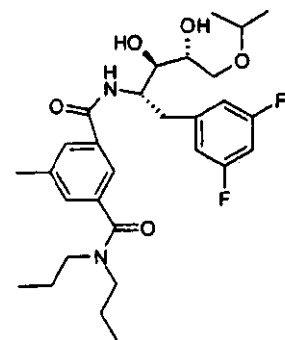
1,2-ジ*デオキシ-1-(3,5-ジ*フルオロフェニル)-
2-({3-[(シ*プロピルアミノ)カルボ*ニル]-5-
メチルベンゾ*イル}アミノ)-5-O-[2-(フェニル
スルホニル)エチル]-D-リビ*トール



1,2-ジ*デオキシ-1-(3,5-ジ*フルオロフェニル)-
2-({3-[(シ*プロピルアミノ)カルボ*ニル]-5-
メチルベンゾ*イル}アミノ)-5-O-イソ*プロピル-
D-キシリ*トール

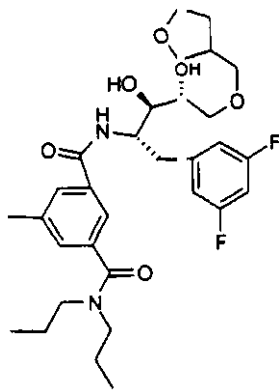


1,2-ジ*デオキシ-1-(3,5-ジ*フルオロフェニル)-
2-({3-[(シ*プロピルアミノ)カルボ*ニル]-5-
メチルベンゾ*イル}アミノ)-5-O-(テトラヒ*トロファン
-3-イルメチル)-D-キシリ*トール

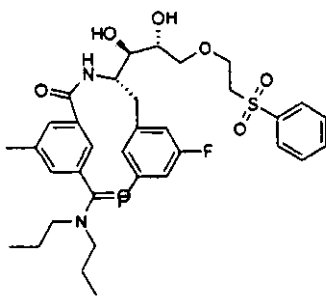


1,2-ジ*デオキシ-1-(3,5-ジ*フルオロフェニル)-
2-({3-[(シ*プロピルアミノ)カルボ*ニル]-5-
メチルベンゾ*イル}アミノ)-5-O-イソ*プロピル-
D-キシリ*トール

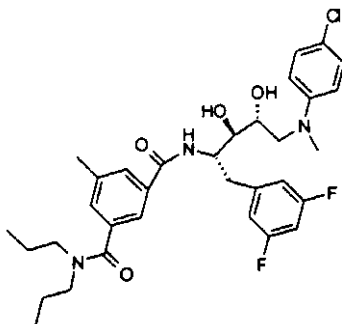
【化 1 4 - 1 4】



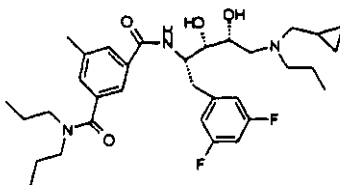
1,2-シデ`オキシ-1-(3,5-シフルオロフェニル)
-2-({3-[(シ`プロピルアミノ)カルボ`ニル]-5
-メチルベンゾ`イル} アミノ)-5-O-(テトラヒド`ロ
ファン-3-イルメチル)-D-キシリトール



1,2-シデ`オキシ-1-(3,5-シフルオロフェニル)
-2-({3-[(シ`プロピルアミノ)カルボ`ニル]-5
-メチルベンゾ`イル} アミノ)-5-O-[2-
(フェニルスルホ`ニル)エチル]-D-キシリトール

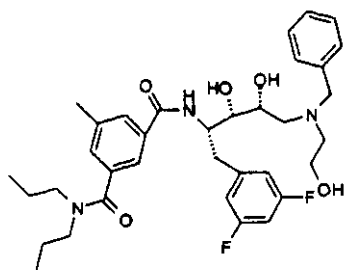


5-[(4-クロロフェニル)(メチル)アミノ]-1,2,5
-トリデ`オキシ-1-(3,5-シフルオロフェニル)
-2-({3-[(シ`プロピルアミノ)カルボ`ニル]
-5-メチルベンゾ`イル} アミノ)-D-キシリトール

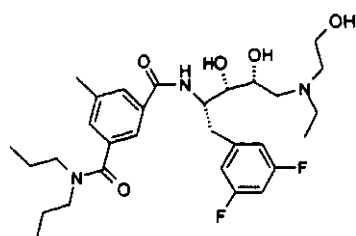


5-[(シクロ`プロピルメチル)(`プロピル)アミノ]
-1,2,5-トリデ`オキシ-1-(3,5-シフルオロ
フェニル)-2-({3-[(シ`プロピルアミノ)
カルボ`ニル]-5-メチルベンゾ`イル} アミノ)
-D-リビトール

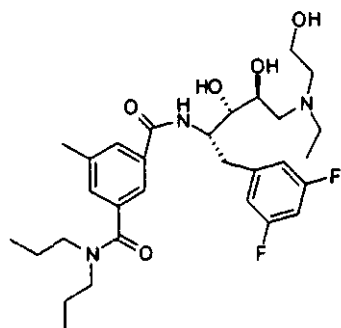
【化 1 4 - 1 5】



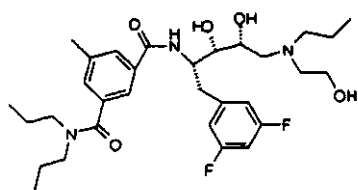
5-[ヘンシル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-
1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-
2-({ 3[(シクロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル } アミノ)-D-リビトール



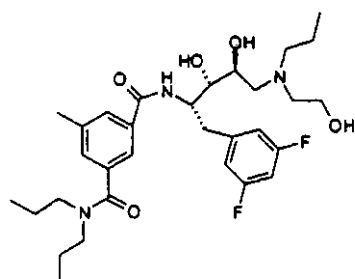
1,2,5-トリテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-([3-(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル)アミノ)-5-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-D-リヒトール



1,4,5-トリテオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)-4-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル}アミノ)-1-[エチル(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-L-アラビニトール

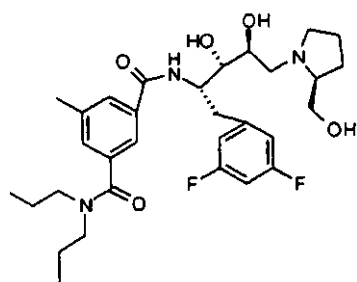


1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-(3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル)アミノ-5-[(2-ヒドロキシエチル)(プロピル)アミノ-D-リボitol

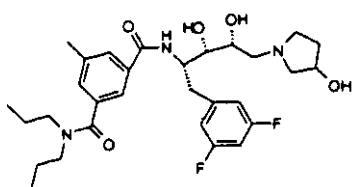


1,4,5-トリテオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)-4-({3-[(ジプロピルアミノ)カルボニル]-5-メチルベンゾイル}アミノ)-1-[(2-ヒドロキシエチル)(プロピル)アミノ]-L-アラビノール

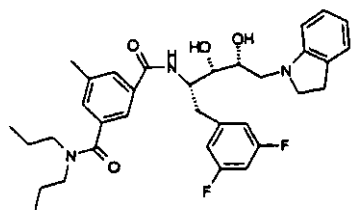
【化 1 4 - 1 6】



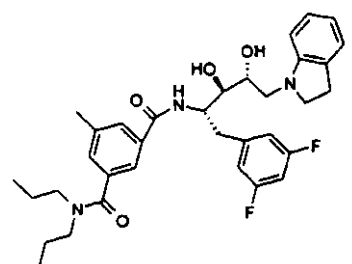
1,4,5-トリデ'オキシ-5-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-4-
({3-[(シ'プロピル'アミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ゾ'イル]アミノ)-1-[(2S)-2-
(ヒド'ロキシメチル)ピ'ロリシ'ン-1-イル]-L-
アラビ'ニトール



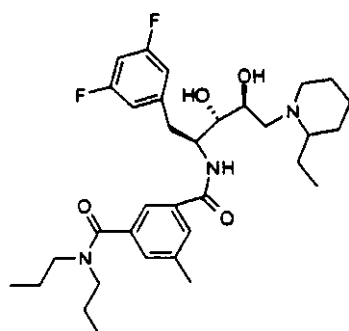
1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-2-
({3-[(シ'プロピル'アミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ゾ'イル]アミノ)-5-(3-
ヒド'ロキシピ'ロリシ'ン-1-イル)-D-リ'ヒトール



1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-5-
(2,3-ジ'ヒド'ロ-1H-イント'ール-1-イル)-2-({3-
[(シ'プロピル'アミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ゾ'イル]アミノ)-D-リ'ヒトール

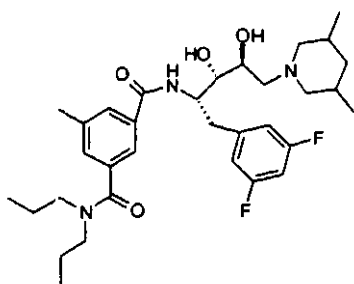


1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-5-
(2,3-ジ'ヒド'ロ-1H-イント'ール-1-イル)-2-({3-
[(シ'プロピル'アミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ゾ'イル]アミノ)-D-キシリ'トール

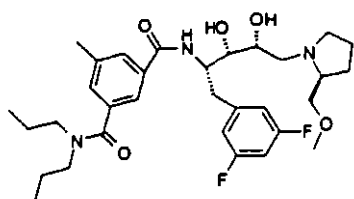


1,4,5-トリデ'オキシ-5-(3,5-ジ'フルオロフェニル)-4-
({3-[(シ'プロピル'アミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ゾ'イル]アミノ)-1-(2-
エチルピ'ロリシ'ン-1-イル)-L-アラビ'ニトール

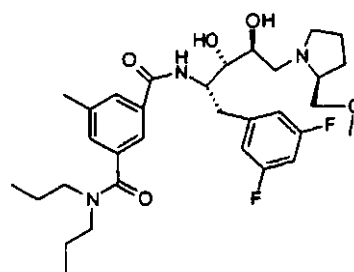
【化 1 4 - 1 7】



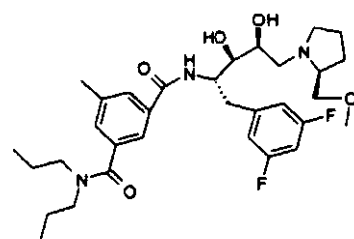
1,4,5-トリテオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)
-1-(3,5-ジメチルフェニル)-4-
({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル} アミノ)-L-アラビニトール



1,2,5-トリテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル} アミノ)-5-[(2S)-2-(メキシ
メチル)フェニル]-D-リビトール

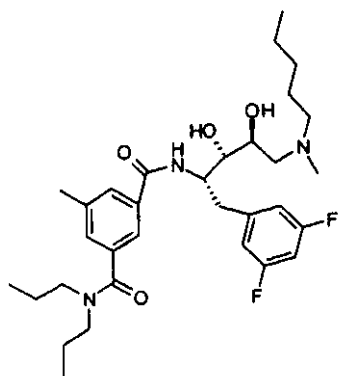


1,4,5-トリテオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)
-4-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル} アミノ)-1-[(2S)-2-(メキシ
メチル)フェニル]-L-アラビニトール

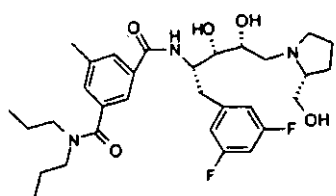


1,2,5-トリテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル} アミノ)-5-[(2S)-2-(メキシ
メチル)フェニル]-L-アラビニトール

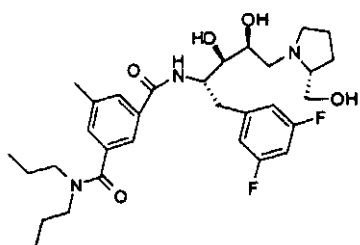
【化 1 4 - 1 8】



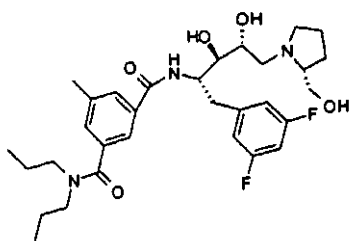
1,4,5-トリデ'オキシ-5-(3,5-シ'フルオロフェニル)-4-
({3-[(シ'プロピ'ルアミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ソ'イル]アミノ)-1-
[メチル(ベン'チル)アミノ]-L-アラビ'ニトール



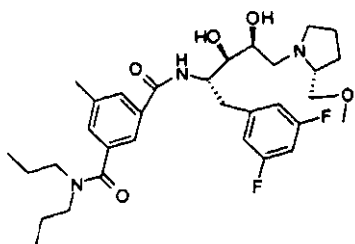
1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-シ'フルオロフェニル)-2-
({3-[(シ'プロピ'ルアミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ソ'イル]アミノ)-5-[(2R)-2-
(ヒド'ロキシメチル)ヒ'ロリジ'ン-1-イル]-D-
リヒトール



1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-シ'フルオロフェニル)-2-
({3-[(シ'プロピ'ルアミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ソ'イル]アミノ)-5-[(2R)-2-
(ヒド'ロキシメチル)ヒ'ロリジ'ン-1-イル]-L-
アラビ'ニトール

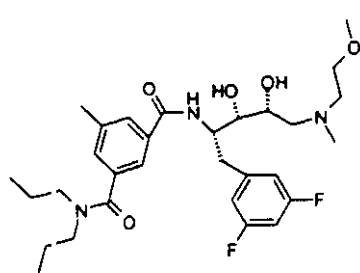


1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-シ'フルオロフェニル)-2-
({3-[(シ'プロピ'ルアミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ソ'イル]アミノ)-5-[(2R)-2-
(ヒド'ロキシメチル)ヒ'ロリジ'ン-1-イル]-D-
キシリトール

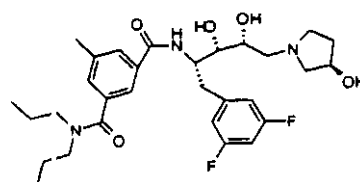


1,2,5-トリデ'オキシ-1-(3,5-シ'フルオロフェニル)-2-
({3-[(シ'プロピ'ルアミノ)カルボ'ニル]-5-
メチルベン'ソ'イル]アミノ)-5-[(2R)-2-
(メトキシメチル)ヒ'ロリジ'ン-1-イル]-L-
アラビ'ニトール

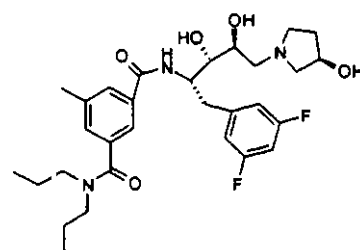
【化 1 4 - 1 9】



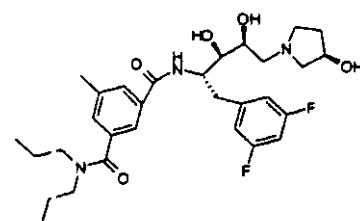
1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-[(2-メチルブチル)
(メチル)アミノ]-D-リキトール



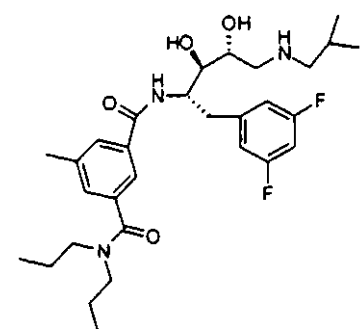
1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-[(3R)-3-ヒドロキシ
ピロリジン-1-イル]-D-リキトール



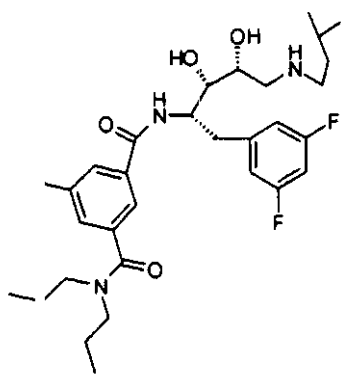
1,4,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-4-({3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-1-[(3R)-3-ヒドロキシ
ピロリジン-1-イル]-L-アラビノトール



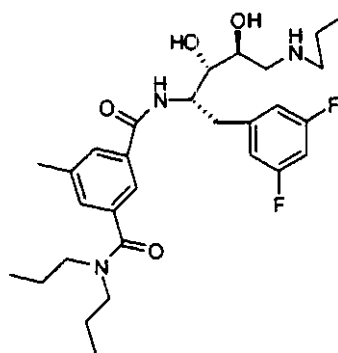
1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(3,5-ジフルオロフェニル)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-[(3R)-3-ヒドロキシ
ピロリジン-1-イル]-L-アラビノトール



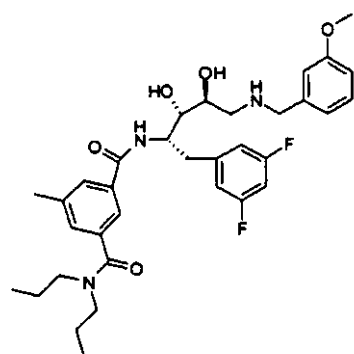
【化 1 4 - 2 0】



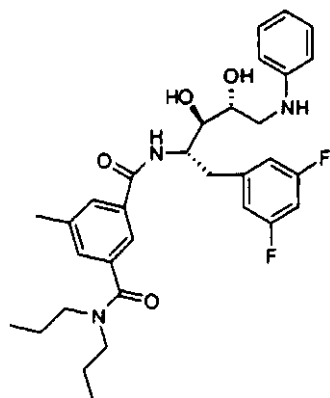
1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)
-2-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-5-(イソペンチルアミノ)
-D-リブトール



1,4,5-トリデオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)
-4-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-1-(プロピルアミノ)-
L-アラビニトール



1,4,5-トリデオキシ-5-(3,5-ジフルオロフェニル)
-4-({3-[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル}アミノ)-1-[(3-メトキシベンゾ
イル)アミノ]-L-アラビニトール

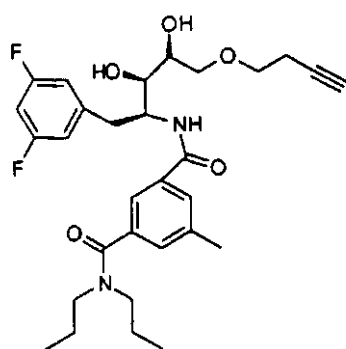


5-アミノ-1,2,5-トリデオキシ-1-(3,5-
ジフルオロフェニル)-2-({3-[(シプロピルアミノ)
カルボニル]-5-メチルベンゾイル}アミノ)-D-
キシリトール

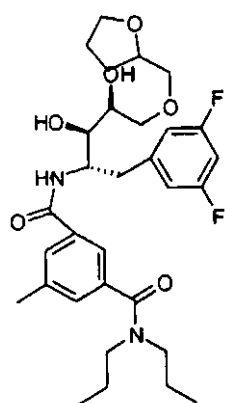
CCN(CC)C(=O)c1ccc(C)cc1C(=O)N[C@@H](c2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)[C@H](O)CNc3ccc(CC)cc3

1,2-ジテオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-5-
O-(3,3-ジメチルブチル)-2-([3-
[(シプロピルアミノ)カルボニル]-5-
メチルベンゾイル]アミノ)-D-キシリトール

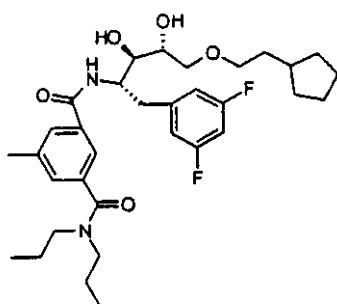
【化 1 4 - 2 2】



5-O-(3-allyloxy-1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-[(S)プロピルアミノ]カルボニル}-5-メチルベンゾイル)アミノ)-D-キシリトール



1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-[(S)プロピルアミノ]カルボニル}-5-メチルベンゾイル)アミノ)-5-O-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-D-キシリトール



5-O-(2-シクロペンチルエチル)-1,2-ジデオキシ-1-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-({3-[(S)プロピルアミノ]カルボニル}-5-メチルベンゾイル)アミノ)-D-キシリトール

からなる群から選択される化合物。

【請求項 2 5】

R_{20} 、 R_1 、 R_N 、 n 、及び R_C が請求項 1 又は請求項 2 で定義するものである式 (I) の化合物、又は薬剤として許容されるその塩若しくはエステルを有効成分として含有する医薬組成物。

【請求項 2 6】

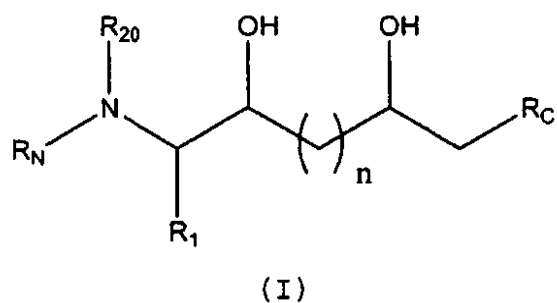
アルツハイマー病からなる群から選択される疾患又は状態を有する患者を治療するか、或いは患者が前記疾患又は状態になるのを予防するための医薬組成物であって、アルツハイマー病の発症の予防又は遅延を助長するため、軽度認知障害 (MCI) を有する患者を治療するため、MCI から AD へと進行する恐れのある患者のアルツハイマー病の発症を予防又は遅延するため、ダウン症候群を治療するため、オランダ型のアミロイドーシスを伴う遺伝性脳出血を治療するため、脳アミロイド血管障害を治療し、その予想される結果、すなわち単発性及び再発性皮質下出血を予防するため、血管性及び変性由来の混合型痴呆、パーキンソン病に付随する痴呆、進行性核上麻痺に付随する痴呆、皮質基底核変性症に付随する痴呆、びまん性レビー小体型のアルツハイマー病を含めた他の変性痴呆を治療

するためであり、かつ、このような治療を必要とする患者を治療するための医薬組成物である、請求項 25 記載の医薬組成物。

【請求項 27】

式 (I) の化合物、

【化 15】

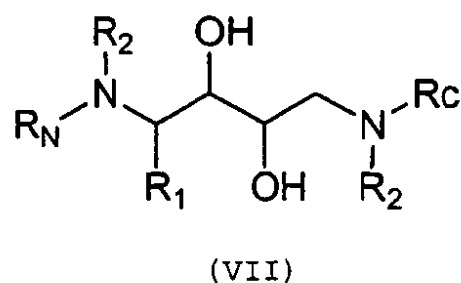


(上式で R_{20} 、 R_1 、 R_N 、 n 、及び R_C が請求項 1 又は請求項 2 で定義する通りである)、又は薬剤として許容されるその塩若しくはエステルを作製するための方法。

【請求項 28】

以下の式 VII の化合物、及び薬剤として許容されるその塩及びエステルであって、

【化 16】



式 (VII) 中で R_1 が

(I) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_7$ アルキル ($C_1 \sim C_3$ アルキル及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシで場合によっては置換されたもの)、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 R_{1-a} 及び R_{1-b} が独立に $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-OC=ONR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(II) $-CH_2-S(O)_{0 \sim 2}- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(III) $-CH_2-CH_2-S(O)_{0 \sim 2}- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(IV) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(V) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(VI) $-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-アリール})$ であって、 n_1 が 0 又は 1 であり、 $R_{1-アリール}$ が、アリール環上で 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下の独立に選択された置換基で場合によっては置換された、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル及びインダ

ニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、又はテトラリニルである $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-アリール)$:

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(C) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(D) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(E) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(F) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(G) $-OH$ 、

(H) $-C \equiv N$ 、

(I) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(J) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(K) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(L) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(V I I) $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-ヘテロアリール)$ であって、 n_1 は上記に定義されたものであり、 $R_1-ヘテロアリール$ がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-

オキシド、チアゾリルN-オキシド、インドリジニルN-オキシド、インダゾリルN-オキシド、ベンゾチアゾリルN-オキシド、ベンズイミダゾリルN-オキシド、ピロリルN-オキシド、オキサジアゾリルN-オキシド、チアジアゾリルN-オキシド、トリアゾリルN-オキシド、テトラゾリルN-オキシド、ベンゾチオピラニルS-オキシド、及びベンゾチオピラニルS, S-ジオキシドからなる群から選択され、

上式で R_1 -ヘテロアリール基が、水素で置換された親 R_1 -ヘテロアリール基の任意の環原子によって $-(CH_2)_{n_1}-$ に結合されており、その結果 R_1 -ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(5) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(6) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C \equiv N$ 、

(9) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(10) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(11) $-SO_2-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(12) $-CO-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(13) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、但し n_1 が0であるとき、 R_1 -ヘテロアリールは窒素によって炭素鎖に結合されておらず、

(VII) $-(CH_2)_{n_1}-(R_1-\text{複素環})$ であって、 n_1 は上記に定義したものであり、 R_1 -複素環がモルホリル、チオモルホリル、チオモルホリルS-オキシド、チオモルホリルS, S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリル、ホモチオモルホリル、ホモチオモルホリルS, S-ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニルS-オキシド、テトラヒドロチエニルS, S-ジオキシド、ホモチオモルホリルS-オキシドからなる群から選択され、

上式で R_1 -複素環基が、水素で置換された親 R_1 -複素環基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_1 -複素環基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置

換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 及び $-I$ 、

(5) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(6) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下に定義するものである $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(7) $-OH$ 、

(8) $-C \equiv N$ 、

(9) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(10) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(11) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(12) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(13) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(14) $=O$ 、但し n_1 が0であるとき、 $R_{1-\text{複素環}}$ は窒素により炭素鎖に結合されておらず；

ここで、 R_2 は、

(I) $-H$ 、又は

(II) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CON$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

ここで、 R_N は、

(I) $R_{N-1}-X_N$ であって、 X_N は、

(A) $-CO-$ 、

(B) $-SO_2-$

からなる群から選択され、 R_{N-1} は、以下からなる群から選択され：

(A) $R_{N-\text{アリール}}$ であって、 $R_{N-\text{アリール}}$ は、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、テトラリニル、インダニル、ジヒドロナフチル、又は6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプテニルであり、同じであるか異なってもよい1個、2個、又は3個の以下の置換基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ であって、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は、同じであるか異なり、以下からなる群から選択される $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$:

(a) $-H$ 、

(b) $-C_1 \sim C_6$ アルキルであって、

(i) $-OH$ 、

(ii) $-NH_2$

からなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(c) $-C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、及び $-I$ から独立に選択される 1 個から 3 個の基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(d) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(e) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(f) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(g) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(h) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(i) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ ヒドロカル

ビル鎖、

(j) $-R_1$ - アリール、

(k) $-R_1$ - ヘテロアリール

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ又は} 3 \text{ つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - アリール、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - 複素環、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、 R_{N-4} が、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1 個、2 個、3 個、又は 4 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$ であって、 R_{N-5} が以下からなる群から選択され:

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1 \text{ - アリール})$ 、

(c) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1 \text{ - ヘテロアリール})$ 、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

- (20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
- (21) R_{N-5} が同じであるか異なってもよい $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N$ (H 又は R_{N-5}) $-CO-O-R_{N-5}$ 、
- (22) R_{N-5} が同じであるか異なってもよい $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N$ (H 又は R_{N-5}) $-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
- (23) 各 R_{N-5} が独立に上記で定義したものである $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-C-S-N(R_{N-5})_2$ 、
- (24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N$ (H 又は R_{N-5}) $-CO-R_{N-2}$ 、
- (25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
- (26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、
- (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
- (28) R_{N-1} が H 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-1})_2$ 、
- (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
- (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
- (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、
- (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、
- (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、
- (34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O$ (1 個、2 個、3 個、4 個、又は 5 個の $-F$ で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、
- (35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、
- (36) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、
- (37) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、
- (38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N$ (H 又は R_{N-5}) $-SO_2-R_{N-2}$ 、又は
- (39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、
- (B) R_{N-} ヘテロアリールであって、 R_{N-} ヘテロアリールが R_{1-} ヘテロアリールと同じ定義を有し、 R_{N-} ヘテロアリール基が水素で置換された親 R_{N-} ヘテロアリール基の任意の原子によって結合しており、その結果 R_{N-} ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが以下から独立に選択された 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：
- (1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、
- (2) $-OH$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、
- (5) $-CO-OH$ 、
- (6) $-C \equiv N$ 、
- (7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
- (C) R_{N-} アリール $-W-R_{N-}$ アリール、
- (D) R_{N-} アリール $-W-R_{N-}$ ヘテロアリール、
- (E) R_{N-} 複素環が R_{1-} 複素環と同じである R_{N-} アリール $-W-R_{N-}$ 複素環

- 、
- (F) R_N - ヘテロアリール - W - R_N - アリール、
 - (G) R_N - ヘテロアリール - W - R_N - ヘテロアリール、
 - (H) R_N - ヘテロアリール - W - R_N - 複素環、
 - (I) R_N - 複素環 - W - R_N - アリール、
 - (J) R_N - 複素環 - W - R_N - ヘテロアリール、
 - (K) R_N - 複素環 - W - R_N - 複素環、

Wは、以下のものであり、

- (25) - (CH₂)_{0 ~ 4} -、
- (26) - O -、
- (27) - S(O)_{0 ~ 2} -、
- (28) R_N - ₅ が上記で定義したものである - N(R_N - ₅) -、又は
- (5) - CO -；

R_C は、以下からなる群から選択され：

(I) - C_{1 ~ 10} アルキルであって、C_{1 ~ 3} アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C_{1 ~ 6} アルコキシ、-O-フェニル、-NR_{1-a}R_{1-b}、-OC=ONR_{1-a}R_{1-b}、-S(=O)_{0 ~ 2}R_{1-a}、-NR_{1-a}C=ONR_{1-a}R_{1-b}、-C=ONR_{1-a}R_{1-b}、及び-S(=O)₂NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された-C_{1 ~ 10} アルキルであり、

上式でR_{1-a}及びR_{1-b}が、出現するごとに、独立にH又はC_{1 ~ 6} アルキルであり、

(II) - (CH₂)_{0 ~ 3} - (C_{3 ~ 8} シクロアルキル)であって、シクロアルキルは、C_{1 ~ 3} アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C_{1 ~ 6} アルコキシ、-O-フェニル、-CO₂H、-CO₂ - (C_{1 ~ 4} アルキル)、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換することができる - (CH₂)_{0 ~ 3} - (C_{3 ~ 8} シクロアルキル) 、

(III) - (CR_{C-X}R_{C-Y})_{0 ~ 4} - R_C - アリールであって、R_{C-X}及びR_{C-Y}が以下のものからなる群から独立に選択され、

-H、

1個又は2個の-OHで場合によっては置換されたC_{1 ~ 4} アルキル、

1個、2個、又は3個のハロゲン場合によっては置換されたC_{1 ~ 4} アルコキシ

、

- (CH₂)_{0 ~ 4} - C_{3 ~ 8} シクロアルキル、

1つ又は2つの二重結合を含むC_{2 ~ 6} アルケニル、

1つ又は2つの三重結合を含むC_{2 ~ 6} アルキニル、及び

フェニル

又は

R_{C-X}及びR_{C-Y}が、それらが結合する炭素と一緒に、炭素原子が3個、4個、5個、6個又は7個の炭素環を形成し、1つの炭素原子が、-O-、-S-、-SO₂-、-NR_{N-2}-、及びR_C - アリールから選択される基で場合によっては置換されており、かつ

R_C - アリールが、出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、テトラニリル、インダニル、ジヒドロナフチル、又は6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[a]シクロヘプチルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換されており：

(1) C_{1 ~ 6} アルキルであって、C_{1 ~ 3} アルキル、ハロゲン、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C_{1 ~ 3} アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC_{1 ~ C}

$_6$ アルキル、

(2) $-\text{OH}$ 、

(3) $-\text{NO}_2$ 、

(4) ハロゲン、

(5) $-\text{CO}_2\text{H}$ 、

(6) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(7) $\text{R}_{\text{N}-2}$ 及び $\text{R}_{\text{N}-3}$ が以下のものからなる群から独立に選択される、
 $(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{NR}_{\text{N}-2} \text{R}_{\text{N}-3}$ 、

(a) $-\text{H}$ 、

(b) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル：

(i) $-\text{OH}$ 、及び

(ii) $-\text{NH}_2$ 、

(c) 独立に $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 又は OH である、1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(d) $-\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(e) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_2 \text{ アルキル}) - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(f) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{ アルキル})$ 、

(g) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(h) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(i) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル鎖

(j) $-\text{R}_1$ - アリールであって、 R_1 - アリールが出現するごとに独立に、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又はテトラリニルであり、これらはそれぞれ、独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(i) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、及び $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(ii) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(iii) $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(iv) $-\text{F}$ 、 Cl 、 $-\text{Br}$ 及び $-\text{I}$ 、

(v) 1 個、2 個、又は 3 個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、

(vi) $-\text{NR}_{\text{N}-2} \text{R}_{\text{N}-3}$ 、

(vii) $-\text{OH}$ 、

(viii) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(ix) $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、

(x) $-\text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(xi) $-\text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(x i i) $-\text{CO}-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、又は

(x i i i) $-\text{SO}_2-(\text{C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル})$ 、

(k) $-\text{R}_1$ - ヘテロアリールであって、 R_1 - ヘテロアリールが出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリニル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニルS、S-ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_1 - ヘテロアリール基が、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(i) $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキルであって、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、及び $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、

(i i) $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルケニル、

(i i i) $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニルであって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ アルキニル、

(i v) $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 及び $-\text{I}$ 、

(v) 1個、2個、又は3個の $-\text{F}$ で場合によっては置換された $-\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルコキシ、

(v i) $-(\text{CH}_2)_0\sim 4-\text{NR}_N\text{R}_{N-2}\text{R}_{N-3}$ 、

(v i i) $-\text{OH}$ 、

(v i i i) $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、

(ix) $(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(x) $(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(xi) $(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(xii) $(CH_2)_0 \sim 4 - CO - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(xiii) $(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(xiv) $(CH_2)_0 \sim 4 - N(R_{N-2}) - SO_2 -$ 、及び

(xv) $(CH_2)_0 \sim 4 - N(R_{N-2}) - C(O) -$ 、

(8) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (CH_2)_0 \sim 4 (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアル$

キル)、

(12) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_1 - \text{複素環}$ 、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ は、出現するごとにモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S -オキシド、チオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、オキサゾリジノリル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S -オキシド、テトラヒドロチエニル S 、 S -ジオキシド及びホモチオモルホリニル S -オキシドからなる群から独立に選択され、

上式で $R_1 - \text{複素環}$ 基が、水素で置換された親 $R_1 - \text{複素環}$ 基の任意の原子によって結合されており、その結果 $R_1 - \text{複素環}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつ複素環が独立に以下のものである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換されており：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NR_1 - a R_1 - b$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、及び $C_1 \sim C_3$ アルコキシからなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) 1 個又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(c) 1 個又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(d) ハロゲン、

(e) $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(f) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(g) $-NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(h) $-OH$ 、

(i) $-C \equiv N$ 、

(j) $(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ であって、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(k) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、

(l) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(m) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{NR}_{1-a} \text{R}_{1-b}$ 、

(n) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、及び

(o) $=\text{O}$ 、

(p) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{R}_{N-2}) - \text{SO}_2 -$ 、

(q) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{R}_{N-2}) - \text{C}(\text{O}) -$ 、

(15) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{R}_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} が出現するごとに、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジル N-オキシド、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、独立に $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の基で場合によっては置換された $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{R}_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が出現するごとに、以下のものからなる群から独立に選択される $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{CO} - \text{O} - \text{R}_{N-5}$ ：

(a) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、

(b) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 2 - (\text{R}_1 - \text{アリール})$ 、

(c) $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、

(d) $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、

(e) $\text{C}_3 \sim \text{C}_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - (\text{R}_1 - \text{ヘテロアリール})$ 、

(17) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - \text{NR}_{N-2} \text{R}_{N-3}$ 、

(18) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - (\text{C}_1 \sim \text{C}_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{SO}_2 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{N-5}) - \text{CO} - \text{O} - \text{R}_{N-5}$ 、

(22) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{N-5}) - \text{CO} - \text{N}(\text{R}_{N-5})_2$

(23) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N} - \text{CS} - \text{N}(\text{R}_{N-5})_2$ 、

(24) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{N}(\text{H 又は } \text{R}_{N-5}) - \text{CO} - \text{R}_{N-2}$ 、

(25) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{NR}_{N-2} \text{R}_{N-3}$ 、

(26) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{R}_{N-4}$ 、

(27) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - \text{CO} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) R_{100} が独立に H 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである、 $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - \text{P}(\text{O}) - (\text{OR}_{100})_2$ 、

(29) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - \text{CO} - \text{N}(\text{R}_{N-5})_2$ 、

(30) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - \text{CS} - \text{N}(\text{R}_{N-5})_2$ 、

(31) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{R}_{N-5})$ 、

(32) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{R}_{N-5}) - \text{COOH}$ 、

(33) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{S} - (\text{R}_{N-5})$ 、

(34) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ であって、アルキル基が、F、Cl、Br、及び I からなる群から独立に選択される、1 個、2 個、3 個、4 個、又は 5 個の置換基で場合によっては置換された $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、

(35) $-(\text{CH}_2)_0 \sim 4 - (\text{C}_3 \sim \text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(36) $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-O$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ である場合には置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ である場合には置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(IV) $-(CR_C-XR_{C-Y})_{0 \sim 4}-R_C$ -ヘテロアリールであって、

上式中で R_C -ヘテロアリールが出現するごとに、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリジニル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミジノニル、ジヒドロベンゾフラノニル、ピリジニル N -オキシド、ピロリル N -オキシド、ピリミジニル N -オキシド、ピリダジニル N -オキシド、ピラジニル N -オキシド、キノリニル N -オキシド、インドリル N -オキシド、インドリニル N -オキシド、イソキノリル N -オキシド、キナゾリニル N -オキシド、キノキサリニル N -オキシド、フタラジニル N -オキシド、イミダゾリル N -オキシド、イソオキサゾリル N -オキシド、オキサゾリル N -オキシド、チアゾリル N -オキシド、インドリジニル N -オキシド、インダゾリル N -オキシド、ベンゾチアゾリル N -オキシド、ベンズイミダゾリル N -オキシド、ピロリル N -オキシド、オキサジアゾリル N -オキシド、チアジアゾリル N -オキシド、トリアゾリル N -オキシド、テトラゾリル N -オキシド、ベンゾチオピラニル S -オキシド、及びベンゾチオピラニル S 、 S -ジオキシドからなる群から独立に選択され、

上式で R_C -ヘテロアリール基が、水素で置換された親 R_C -ヘテロアリール基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_C -ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが、独立に以下のものである1個、2個、3個、又は4個の基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

- (7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (9) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの二重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、
 (10) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(1 \text{ つ、} 2 \text{ つ、又は} 3 \text{ つの三重結合を有する } C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、
 (11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - アリール、但し R_1 - アリール は上記に定義したものであり
 (13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - ヘテロアリール、
 (14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_1$ - 複素環、
 (15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、
 (16) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$
 (17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、
 (19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、
 (22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、
 (25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、
 (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) R_{100} が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ である、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})$ 、
 (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})-COOH$ 、
 (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})$ 、
 (34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、} 2 \text{ 個、} 3 \text{ 個、} 4 \text{ 個、又は} 5 \text{ 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (35) $C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル}$ 、
 (36) $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルケニル}$ 、
 (37) $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ であって、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルキル}$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3 \text{ アルコキシ}$ 、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6 \text{ アルキニル}$ 、
 (38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、
 (39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (V) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0-4}-R_C$ - アリール - R_{101} - R_C - アリール、
 (VI) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0-4}-R_C$ - アリール - R_{101} - R_C - ヘテロアリール、
 (VII) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0-4}-R_C$ - ヘテロアリール - R_{101} - R_C - アリール、
 (VIII) $-(CR_{C-X}R_{C-Y})_{0-4}-R_C$ - ヘテロアリール - R_{101} - R

C-ヘテロアリール、

(IX) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R_C-アリール - R₁₀₁ - R₁-複素環

、

(X) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R_C-ヘテロアリール - R₁₀₁ - R₁-複

素環、

(XI) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R₁-複素環 - R₁₀₁ - R_C-アリール

、

(XII) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R₁-複素環 - R₁₀₁ - R_C-ヘテロ

アリール、

(XIII) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R₁-複素環 - R₁₀₁ - R₁-複素

環、

上式でR₁₀₁が単結合、(CH₂)₀₋₄、-O-、-NH-、又は-N(C₁~C₆アルキル)であり、

(XIV) - (CR_C-X R_C-Y)₀₋₄ - R₁-複素環、

(XV) - [C(R_{C-1})(R_{C-2})]₁₋₃ - CO-N(R_{C-3})₂であって、前式でR_{C-1}及びR_{C-2}が同じであるか異なってもよく、以下のものからなる群から選択され：

(A) - H、

(B) - C₁~C₆アルキルであって、C₁~C₃アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₁~C₆アルキル、

(C) 1つ又は2つの二重結合を有するC₂~C₆アルケニルであって、C₁~C₃アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂~C₆アルケニル

(D) C₂~C₆アルキニルであって、C₁~C₃アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換されたC₂~C₆アルキニル、

(E) - (CH₂)₁₋₂ - S(O)₀₋₂ - (C₁~C₆アルキル)、

(F) - (CH₂)₀₋₄ - C₃~C₇シクロアルキルであって、C₁~C₃アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆アルコキシ、-O-フェニル、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された-(CH₂)₀₋₄ - C₃~C₇シクロアルキル、

(G) - (C₁~C₄アルキル) - R₁-アリール、

(H) - (C₁~C₄アルキル) - R_C-ヘテロアリール、

(I) - (C₁~C₄アルキル) - R₁-複素環、

(J) - R_C-ヘテロアリール、

(K) - R₁-複素環、

(M) R_{C-4}が-O-、-S-又は-NR(C₁~C₆アルキル)-である、-(CH₂)₁₋₄ - R_{C-4} - (CH₂)₀₋₄ - R₁-アリール、

(N) - (CH₂)₁₋₄ - R_{C-4} - (CH₂)₀₋₄ - R_C-ヘテロアリール、

(O) - R₁-アリール、

かつR_{C-3}が出現するごとに独立に以下のものである：

(A) - H、

(B) - C₁~C₆アルキルであって、C₁~C₃アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、C₁~C₆アルコキシ、-O-フェニル

、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(C) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O$ -フェニル、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(D) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O$ -フェニル、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(E) $-(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O$ -フェニル、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $-(CH_2)_0 \sim 4 - C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(F) $-R_1$ - アリール、

(G) $-R_C$ - ヘテロアリール、

(H) $-R_1$ - 複素環、

(I) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_1$ - アリール、

(J) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_C$ - ヘテロアリール、

(K) $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - R_1$ - 複素環、

(XVI) $-CH(R_C - \text{アリール})_2$ 、

(XVII) $-CH(R_C - \text{ヘテロアリール})_2$ 、

(XVIII) $-CH(R_C - \text{アリール})(R_C - \text{ヘテロアリール})$ 、

(XIX) R_C - アリール 又は R_C - ヘテロアリール 又は R_1 - 複素環 と縮合した $-シクロペンチル$ 、 $-シクロヘキシル$ 、又は $-シクロヘプチル$ 環であって、 R_C - アリール 又は R_C - ヘテロアリール 又は R_1 - 複素環 は上記に定義したものであり、 $-シクロペンチル$ 、 $-シクロヘキシル$ 、又は $-シクロヘプチル$ の1個の炭素が、 NH 、 $NR_N - 5$ 、 O 、 $S(=O)_0 \sim 2$ で場合によっては置換されており、 $-シクロペンチル$ 、 $-シクロヘキシル$ 、又は $-シクロヘプチル$ が1個又は2個の $-C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $=O$ 、又は $-NR_1 - a R_1 - b$ で場合によっては置換することができる、 $-シクロペンチル$ 、 $-シクロヘキシル$ 、又は $-シクロヘプチル$ 環、

(XX) $C_2 \sim C_{10}$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O$ -フェニル、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、

(XXI) $C_2 \sim C_{10}$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $-O$ -フェニル、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、

(XXII) $R_C - 6$ が $-(CH_2)_0 \sim 6 - OH$ である、 $-(CH_2)_0 \sim 1 - CHR_C - 6 - (CH_2)_0 \sim 1 - R_C - \text{アリール}$ 、

(XXIII) $-(CH_2)_0 \sim 1 - CHR_C - 6 - (CH_2)_0 \sim 1 - R_C - \text{ヘテロアリール}$ 、

(XXIV) $-CH(-R_C - \text{アリール 又は } R_C - \text{ヘテロアリール}) - CO - O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(XXV) $-CH(-CH_2 - OH) - CH(-OH) - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - NO_2$ 、

(XXV) — (C₁ ~ C₆ アルキル) — O — (C₁ ~ C₆ アルキル) — OH、

(XXVII) — CH₂ — NH — CH₂ — CH (— O — CH₂ — CH₃)₂、

(XXVIII) — H、及び

(XXIX) — (CH₂)_{0 ~ 6} — C (=NR_{1-a}) (NR_{1-a}R_{1-b}) である化合物、及び薬剤として許容されるその塩。

【請求項 29】

R_N が R_{N-1} C (O) — である請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R_N が R_{N-1} C (O) — を表し、

R₁ が以下のものを表し、

(I) — (CH₂)_{n1} — (R_{1-アリール}) であって、n₁ が 0 又は 1 であり、R_{1-アリール} が、アリール環上で 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下の置換基で場合によっては置換された、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、又はテトラリニルである — (CH₂)_{n1} — (R_{1-アリール}) :

(A) C₁ ~ C₆ アルキルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、— F、— Cl、— Br、— I、— OH、— SH、— C≡N、— CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ、及び — NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、C₁ ~ C₆ アルキル、

(B) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する C₂ ~ C₆ アルケニルであって、— F、— Cl、— OH、— SH、— C≡N、— CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ及び — NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルケニル、

(C) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する C₂ ~ C₆ アルキニルであって、— F、— Cl、— OH、— SH、— C≡N、— CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ及び — NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された C₂ ~ C₆ アルキニル、

(D) — F、— Cl、— Br 又は — I、

(F) 1 個、2 個、又は 3 個の — F で場合によっては置換された — C₁ ~ C₆ アルコキシ、

(G) R_{N-2} 及び R_{N-3} が以下のものからなる群から独立に選択されたものである — NR_{N-2}R_{N-3}、

(1) — H、

(2) — C₁ ~ C₆ アルキルであって、

(a) — OH、及び

(b) — NH₂

からなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された — C₁ ~ C₆ アルキル、

(3) — C₁ ~ C₆ アルキルであって、1 個から 3 個の — F、— Cl、— Br 又は — I で場合によっては置換された — C₁ ~ C₆ アルキル、

(4) — C₃ ~ C₇ シクロアルキル、

(5) — (C₁ ~ C₂ アルキル) — (C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、

(6) — (C₁ ~ C₆ アルキル) — O — (C₁ ~ C₃ アルキル)、

(7) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する — C₂ ~ C₆ アルケニル、

(8) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する — C₂ ~ C₆ アルキニル、

(9) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する — C₁ ~ C₆ アルキル鎖、

(10) — R_{1-アリール}、及び

(11) — R_{1-ヘテロアリール}

(H) — OH、

(I) — C≡N、

(J) C₃ ~ C₇ シクロアルキルであって、— F、— Cl、— OH、— SH、— C≡

N、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(K) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(L) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(N) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、又は

(II) $-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-\text{ヘテロアリール}})$ であって、 n_1 は 0 又は 1 であり、 $R_{1-\text{ヘテロアリール}}$ がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンズオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンズオキサゾリノニル、ピロリル-N-オキシド、ピリミジニル-N-オキシド、ピリダジニル-N-オキシド、ピラジニル-N-オキシド、キノリニル-N-オキシド、インドリル-N-オキシド、インドリニル-N-オキシド、イソキノリル-N-オキシド、キナゾリニル-N-オキシド、キノキサリニル-N-オキシド、フタラジニル-N-オキシド、イミダゾリル-N-オキシド、イソオキサゾリル-N-オキシド、オキサゾリル-N-オキシド、チアゾリル-N-オキシド、インドリジニル-N-オキシド、インダゾリル-N-オキシド、ベンゾチアゾリル-N-オキシド、ベンズイミダゾリル-N-オキシド、ピロリル-N-オキシド、オキサジアゾリル-N-オキシド、チアジアゾリル-N-オキシド、トリアゾリル-N-オキシド、テトラゾリル-N-オキシド、ベンゾチオピラニル-S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S、S-ジオキシドからなる群から選択され、

上式で $R_{1-\text{ヘテロアリール}}$ 基が、水素で置換された親 $R_{1-\text{ヘテロアリール}}$ 基の任意の環原子によって $-(CH_2)_{n_1}-$ に結合されており、その結果 $R_{1-\text{ヘテロアリール}}$ 基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが 1 個、2 個、3 個、又は 4 個の以下のもので場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} は $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(3) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換

され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} は $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(6) 1個、2個、又は3個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(7) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-OH$ 、

(9) $-C \equiv N$ 、

(10) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換され、 R_{1-a} 及び R_{1-b} は $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(11) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(12) $-SO_2-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、

(13) $-CO-NR_{1-a}NR_{1-b}$ 、又は

(14) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、但し n_1 が0であるとき、 R_{1-} ヘテロアリールは窒素によって炭素鎖に結合されていない、請求項28に記載の化合物。

【請求項31】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ を表し、

R_{N-1} が以下のものからなる群から選択される：

フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、テトラニル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、又は6, 7, 8, 9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ [a] シクロヘプチルであり、これらはそれぞれ、同じであるか異なってもよい1個、2個、又は3個の以下の置換基で場合によっては置換されており：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) 1つ、2つ又は3つの二重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) 1つ、2つ又は3つの三重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ アリール、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-}$ 複素環、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1個、2個、3個、又は4個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}$

—CO—O—R_{N-5} :

(a) C₁ ~ C₆ アルキル、

(b) —(CH₂)_{0~2}—(R₁-アリール)、

(c) 1つ又は2つの二重結合を有するC₂ ~ C₆ アルケニル、

(d) 1つ又は2つの三重結合を有するC₂ ~ C₆ アルキニル、

(e) C₃ ~ C₇ シクロアルキル、及び

(f) —(CH₂)_{0~2}—(R₁-ヘテロアリール)、

(17) —(CH₂)_{0~4}—SO₂—NR_{N-2}R_{N-3}、

(18) —(CH₂)_{0~4}—SO—(C₁ ~ C₈ アルキル)、

(19) —(CH₂)_{0~4}—SO₂—(C₁ ~ C₁₂ アルキル)、

(20) —(CH₂)_{0~4}—SO₂—(C₃ ~ C₇ シクロアルキル)、

(21) —(CH₂)_{0~4}—N(H又はR_{N-5})—CO—O—R_{N-5}、但し、R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(22) —(CH₂)_{0~4}—N(H又はR_{N-5})—CO—N(R_{N-5})₂、但し、R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(23) —(CH₂)_{0~4}—N—CS—N(R_{N-5})₂、但し、R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(24) —(CH₂)_{0~4}—N(—H又はR_{N-5})—CO—R_{N-2}、但し、R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(25) —(CH₂)_{0~4}—NR_{N-2}R_{N-3}、但し、R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じ又は異なってよく、

(26) —(CH₂)_{0~4}—R_{N-4}、

(27) —(CH₂)_{0~4}—O—CO—(C₁ ~ C₆ アルキル)、

(28) —(CH₂)_{0~4}—O—P(O)—(OR_{N-アリール-1})₂、但し、R_{N-アリール-1} は—H又はC₁ ~ C₄ アルキルであり、

(29) —(CH₂)_{0~4}—O—CO—N(R_{N-5})₂、

(30) —(CH₂)_{0~4}—O—CS—N(R_{N-5})₂、

(31) —(CH₂)_{0~4}—O—(R_{N-5})₂、

(32) —(CH₂)_{0~4}—O—(R_{N-5})₂—COOH、

(33) —(CH₂)_{0~4}—S—(R_{N-5})₂、

(34) —(CH₂)_{0~4}—O—(1個、2個、3個、4個、又は5個の—Fで場合によっては置換されたC₁ ~ C₆ アルキル)、

(35) C₃ ~ C₇ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有するC₂ ~ C₆ アルケニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、—F、—Cl、—Br、—I、—OH、—SH、—C≡N、—CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ又は—NR_{1-a}R_{1-b}で場合によっては置換されたC₂ ~ C₆ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有するC₂ ~ C₆ アルキニルであって、C₁ ~ C₃ アルキル、—F、—Cl、—Br、—I、—OH、—SH、—C≡N、—CF₃、C₁ ~ C₃ アルコキシ又は—NR_{1-a}R_{1-b}で場合によっては置換されたC₂ ~ C₆ アルキニル、

(38) —(CH₂)_{0~4}—N(—H又はR_{N-5})—SO₂—R_{N-2}、但し、R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、又は上記に定義したものであり、

(39) —(CH₂)_{0~4}—C₃ ~ C₇ シクロアルキル、

請求項28に記載の化合物。

【請求項32】

R_N はR_{N-1} C(O)—を表し、

R_{N-1} は—R_{N-ヘテロアリール}であって、R_{N-ヘテロアリール}がピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジ

ニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、 β -カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンズオキサゾリル、ピリドピリジニルからなる群から選択され、

上式で R_N -ヘテロアリール基が、水素で置換された親 R_N -ヘテロアリール基の任意の原子によって結合されており、その結果 R_N -ヘテロアリール基との新しい結合が、水素原子及びその結合を置換しており、かつヘテロアリールが1個、2個、3個、又は4個の以下のもので場合によっては置換されている：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から独立に選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) 1つ、2つ又は3つの二重結合を有する $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) 1つ、2つ又は3つの三重結合を有する $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{1-}$ アリール、

(13) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{1-}$ ヘテロアリール、

(14) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{1-}$ 複素環、

(15) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - R_{N-4}$ 、

(16) $-(CH_2)_0 \sim 4 - CO - O - R_{N-5}$ 、

(17) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_0 \sim 4 - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}$ 、但し R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(22) $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})_2$ 、但し R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(23) $-(CH_2)_0 \sim 4 - N - CS - N(R_{N-5})_2$ 、但し R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(24) $-(CH_2)_0 \sim 4 - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - R_{N-2}$ 、但し R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、

(25) $-(CH_2)_0 \sim 4 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、但し R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じ又は異なってよく、

(26) $-(CH_2)_0 \sim 4 - R_{N-4}$ 、

(27) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - CO - (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) $-(CH_2)_0 \sim 4 - O - P(O) - (OR_{N-}$ アリール $-1)_2$ 、但

し R_N - アリール - 1 は -H 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

(29) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - O - CO - $N(R_N - 5)_2$ 、

(30) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - O - CS - $N(R_N - 5)_2$ 、

(31) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - O - $(R_N - 5)_2$ 、

(32) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - O - $(R_N - 5)_2$ - COOH、

(33) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - S - $(R_N - 5)_2$ 、

(34) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - O - (1個、2個、3個、4個、又は5個の - F

で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル)、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は -NR_{1-a}R_{1-b} で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は -NR_{1-a}R_{1-b} で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - N (-H 又は $R_N - 5$) - SO₂ - $R_N - 2$ 、但し、 $R_N - 5$ 及び $R_N - 2$ は同じ又は異なってよく、又は

(39) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 33】

R_N が $R_N - 1$ C(O)- を表し、

$R_N - 1$ がフェニル、1-ナフチル又は2-ナフチルであり、これらはそれぞれ、同じであるか異なってもよい1個、2個、又は3個の以下の置換基で場合によっては置換されている：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-C≡N、-CF₃、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び -NR_{1-a}R_{1-b} からなる群から選択される1個、2個、又は3個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、式で R_{1-a} 及び R_{1-b} が、上記に定義したものであり、

(2) -OH、

(3) -NO₂、

(4) -F、-Cl、-Br、又は -I、

(5) -CO-OH、

(6) -C≡N、

(7) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - NR_{N-2}R_{N-3}

(8) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - ($C_1 \sim C_{12}$ アルキル)、

(9) 1つ、2つ又は3つの二重結合を有する - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - ($C_2 \sim C_{12}$ アルケニル)、

(10) 1つ、2つ又は3つの三重結合を有する - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - ($C_2 \sim C_{12}$ アルキニル)、

(11) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - ($C_3 \sim C_7$ シクロアルキル)、

(12) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - R_{1-a} - アリール、

(13) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - R_{1-a} - ヘテロアリール、

(14) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - R_{1-a} - 複素環、

(15) - $(CH_2)_0 \sim 4$ - CO - $R_N - 4$ であって、前式で $R_N - 4$ がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S、S-ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1

個、2 個、3 個、又は 4 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$:

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1-アリール)$ 、

(c) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 2}-(R_1-ヘテロアリール)$ 、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-SO_2-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、但し、 R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、但し、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じ又は異なってよく、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、但し、 R_{N-4} であり、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(28) $R_{N-アリール-1}$ が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-アリール-1})_2$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、

(32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、

(34) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、2 個、3 個、4 個、又は 5 個の } -F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(36) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(37) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、但し R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 34】

R_N は $R_{N-1}C(O)-$ を表し、

R_{N-1} は、同じ又は異なってよい 1 つ、2 個、又は 3 個の以下の置換基で場合によっては置換されたフェニルである：

(1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_1 - a R_1 - b$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、

(5) $-CO-OH$ 、

(6) $-C \equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(8) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(9) 1 つ、2 つ又は 3 つの二重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、

(10) 1 つ、2 つ又は 3 つの三重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、

(11) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(12) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{アリール}$ 、

(13) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{ヘテロアリール}$ 、

(14) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_1 - \text{複素環}$ 、

(15) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} が、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピロリニル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1 個、2 個、3 個、又は 4 個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が、以下のものからなる群から独立に選択される $-(CH_2)_{0 \sim 4} - CO - O - R_{N-5}$ ：

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $-(CH_2)_{0 \sim 2} - (R_1 - \text{アリール})$ 、

(c) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、及び

(f) $-(CH_2)_{0 \sim 2} - (R_1 - \text{ヘテロアリール})$ 、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO - (C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - SO_2 - (C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - O - R_{N-5}$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N - CS - N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - N(H \text{ 又は } R_{N-5}) - CO - R_{N-2}$ 、但し、 R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - NR_{N-2} R_{N-3}$ 、但し、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じ又は異なってよく、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4} - R_{N-4}$ 、

- (27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (28) $R_{N-アリール-1}$ が $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルである、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-P(O)-(OR_{N-アリール-1})_2$ 、
 (29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、
 (30) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、
 (31) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、
 (32) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、
 (33) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-S-(R_{N-5})_2$ 、
 (34) 1 個、2 個、3 個、4 個、又は 5 個の $-F$ で場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、
 (35) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、
 (36) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、
 (37) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、又は $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、
 (38) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、但し R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、
 (39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、
- 請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 35】

R_N は $R_{N-1}C(O)-$ を表し、

R_{N-1} がフェニルであり、これは、同じであるか異なってもよい 1 個、2 個、又は 3 個の以下の置換基で場合によっては置換されている：

- (1) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 (2) $-OH$ 、
 (3) $-NO_2$ 、
 (4) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ 、
 (5) $-CO-OH$ 、
 (6) $-C \equiv N$ 、
 (7) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、
 (8) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_1 \sim C_{12} \text{ アルキル})$ 、
 (9) 1 つ、2 つ又は 3 つの二重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12} \text{ アルケニル})$ 、
 (10) 1 つ、2 つ又は 3 つの三重結合を有する $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_2 \sim C_{12} \text{ アルキニル})$ 、
 (11) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、
 (12) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-アリール}$ 、
 (13) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-ヘテロアリール}$ 、
 (14) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{1-複素環}$ 、
 (15) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ であって、前式で R_{N-4} がモルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S 、 S -ジオキシド、ピロリニル、チエニル、ピラゾリル、ピリジル N -オキシド、オキサゾリル、

チアゾリル、イミダゾリル、及びピロリジニルからなる群から選択され、それぞれの基が、1個、2個、3個、又は4個の $C_1 \sim C_6$ アルキルで場合によっては置換された $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-R_{N-4}$ 、

(16) R_{N-5} が以下のものからなる群から選択される、 $-(CH_2)_{0 \sim 4}-CO-O-R_{N-5}$:

(a) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(b) $R_{1-アリール}$ は上記に定義したものであり $-(CH_2)_{0 \sim 2}-R_{1-アリール}$ 、

(c) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(d) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(e) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(17) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、上記に定義したものであり、

(18) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(19) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$ 、但し、 R_{N-5} は同じ又は異なってよく、

(20) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$ 、但し、 R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、

(21) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、但し、 R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じ又は異なってよく、

(22) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-R_{N-4}$ 、

(23) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(24) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$ 、

(25) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$ 、

(26) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2$ 、

(27) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(R_{N-5})_2-COOH$ 、

(28) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-O-(1 \text{ 個、2 個、3 個、4 個、又は5 個の}-F \text{ で場合によっては置換された } C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、

(29) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、但し、 R_{N-5} 及び R_{N-2} は同じ又は異なってよく、又は、

(39) $-(CH_2)_{0 \sim 4}-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 36】

R_N が $R_{N-1}C(O)-$ であり、

R_1 が $-(CH_2)_{n_1}-$ フェニルを表し、 n_1 が 0 又は 1 であり、フェニルが同じであるか異なる、以下の 1 個、2 個又は 3 個の置換基で場合によっては置換されている：

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) 1つ又は2つの二重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルケニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(C) 1つ又は2つの三重結合を有する $C_2 \sim C_6$ アルキニルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(D) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(F) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(G) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が独立に、以下のものからなる群から選択される：

(1) $-H$ 、

(2) 以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(a) $-OH$ 、及び

(b) $-NH_2$ 、

(3) 1 個から 3 個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(4) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(5) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(6) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(7) 1 つ又は 2 つの二重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルケニル、

(8) 1 つ又は 2 つの三重結合を有する $-C_2 \sim C_6$ アルキニル、

(9) 1 つの二重結合及び 1 つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、

(10) $-R_1$ - アリール、及び

(11) $-R_1$ - ヘテロアリール、

(H) $-OH$ 、

(I) $-C \equiv N$ 、

(J) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(K) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(L) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

(M) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(N) $-SO_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 37】

R_1 がフェニル ($C_1 \sim C_6$) アルキル基であり、フェニルが以下のものから独立に選択される 1 個又は 2 個の基で場合によって置換されている：

(A) $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される 1 個、2 個、又は 3 個の置換基で場合によっては置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、

(B) $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 又は $-I$ 、

(C) 1 個、2 個、又は 3 個の $-F$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルコキシ、

(D) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、前式で R_{N-2} 及び R_{N-3} が独立に、以下のものからなる群から選択される：

(1) $-H$ 、

(2) 以下のものからなる群から選択される 1 個の置換基で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル：

(a) $-OH$ 、及び

(b) $-NH_2$ 、

(3) 1 個から 3 個の $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、又は $-I$ で場合によっては置換された $-C_1 \sim C_6$ アルキル、

(4) $-C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(5) $-(C_1 \sim C_2 \text{ アルキル})-(C_3 \sim C_7 \text{ シクロアルキル})$ 、

(6) $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_3 \text{ アルキル})$ 、

(9) 1つの二重結合及び1つの三重結合を有する $-C_1 \sim C_6$ アルキル鎖、

(E) $-OH$ 、

(F) $-C \equiv N$ 、

(G) $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルであって、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-C \equiv N$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択される1個、2個、又は3個の基で場合によっては置換された $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、

(H) $-CO-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、

(I) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、又は

(J) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、

請求項28に記載の化合物。

【請求項38】

R_1 がベンジル、4-ヒドロキシベンジル、2-フルオロ-4-プロピルベンジル、3-アミノ-4-ブロモベンジル、3-クロロ-5-メチルフェネチル、3,5-ジフルオロベンジル、2-メチルフェニルプロピル、4-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルフェネチル、2,3-ジクロロベンジル、及び2-クロロ-4-シアノベンジルである、請求項28に記載の化合物。