

【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22年4月15日(2010.4.15)

【公表番号】特表2009-534310(P2009-534310A)

【公表日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2009-038

【出願番号】特願2009-503181(P2009-503181)

【国際特許分類】

| | |
|----------------|-----------|
| C 07 D 241/04 | (2006.01) |
| A 61 K 31/495 | (2006.01) |
| C 07 D 405/06 | (2006.01) |
| A 61 K 31/496 | (2006.01) |
| C 07 D 401/12 | (2006.01) |
| C 07 D 403/06 | (2006.01) |
| C 07 D 413/06 | (2006.01) |
| A 61 K 31/5377 | (2006.01) |
| C 07 D 403/12 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P 9/10 | (2006.01) |
| A 61 P 9/12 | (2006.01) |
| A 61 P 13/12 | (2006.01) |
| A 61 P 29/00 | (2006.01) |
| A 61 P 25/00 | (2006.01) |
| A 61 P 35/00 | (2006.01) |
| A 61 P 5/42 | (2006.01) |
| C 12 N 15/09 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|----------------|-------|
| C 07 D 241/04 | C S P |
| A 61 K 31/495 | Z N A |
| C 07 D 405/06 | |
| A 61 K 31/496 | |
| C 07 D 401/12 | |
| C 07 D 403/06 | |
| C 07 D 413/06 | |
| A 61 K 31/5377 | |
| C 07 D 403/12 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 1 |
| A 61 P 9/10 | |
| A 61 P 9/12 | |
| A 61 P 13/12 | |
| A 61 P 29/00 | |
| A 61 P 25/00 | |
| A 61 P 35/00 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 6 |
| A 61 P 5/42 | |
| C 12 N 15/00 | A |

【手続補正書】

【提出日】平成22年2月26日(2010.2.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

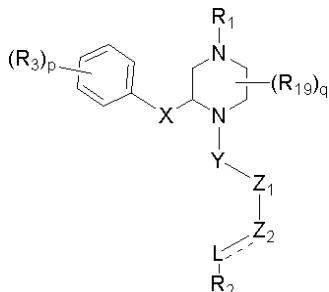
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】



[式中：

pは、0、1、2、3、4及び5からなる群より選ばれ；

qは、0、1、2及び3からなる群より選ばれ；

Lは、存在しないか、又はZ₂とR₂との間で1、2又は3原子の分離をもたらすリンカ（式中、当該分離をもたらすリンカの原子は、炭素、酸素、窒素、及び硫黄からなる群より選ばれる）であり；Xは、-(CR₄R₅)_n-（式中、nは1及び2からなる群より選ばれる）であり；Yは、-CO-及び-SO₂-からなる群より選ばれ；Z₁は、CR₆R₇、NR₈、O及びSからなる群より選ばれ；Z₂は、CR₉R₁₀、NR₁₁、O及びSからなる群より選ばれるか、又はZ₂及び分離をもたらすLの1つ以上の原子が一緒になって3、4、5、6又は7員環を形成し；R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；R₂は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₄-₇)アリール及びヘテロ(C₁-₆)アリールからなる群より選ばれ；R₃は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-₁₀)アルキル、ハロ(C₁-₁₀)アルキル、カルボニル(C₁-₃)アルキル、チオカルボニル(C₁-₃)アルキル、スルホニル(C₁-₃)アルキル、スルフィニル(C₁-₃)アルキル、アミノ(C₁-₁₀)アルキル、イミノ(C₁-₃)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、アリール(C₁-₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₈-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリール、アミノカルボニルオキシ及びカルボニルアルコキシからなる群より選ばれ、R₄及びR₅は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁-₁₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄及びR₅が一緒になって環を形成し；

R_6 及び R_7 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル及びイミノ(C₁₋₃)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる(但し、 R_7 は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない)か、又は、 R_6 及び R_7 が一緒になって環を形成し;

R_8 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれ;

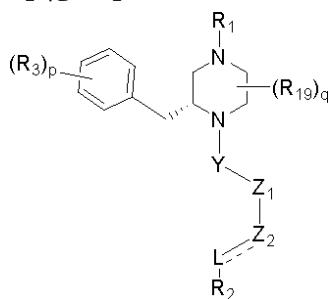
R_9 及び R_{10} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_9 及び R_{10} が一緒になって環を形成し(但し、 R_{10} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない);

R_{11} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれ(但し、 R_{11} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない);且つ

R_{19} は、水素、メチル及びフルオロメチルからなる群より選ばれる、
但し、Yが-CO-で、R₁が水素で、Xが-CH₂-で、R₂がフェニルで、Z₂が-CH₂-の場合、Z₁は-O-ではない]
を含む：化合物。

【請求項 2】

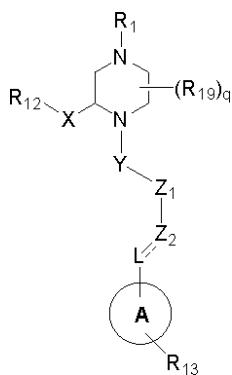
【化 2】



を含む：請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

【化 3】



[式中：

q は、0、1、2 及び 3 からなる群より選ばれ；

環 A は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

L は、存在しないか、又は Z₂ と R₂ との間で 1、2 又は 3 原子の分離をもたらすリンカー（式中、当該分離をもたらすリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素、及び硫黄からなる群より選ばれる）であり；

X は、-(CR₄R₅)_n-（式中、n は 1 及び 2 からなる群より選ばれる）であり；

Y は、-CO- 及び -SO₂- からなる群より選ばれ；

Z₁ は、CR₆R₇、NR₈、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z₂ は、CR₉R₁₀、NR₁₁、O 及び S からなる群より選ばれるか、又は Z₂ 及び分離をもたらす L の 1 つ以上の原子が一緒になって 3、4、5、6 又は 7 員環を形成し；

R₁ は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₄ 及び R₅ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁-₁₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄ 及び R₅ が一緒になって環を形成し；

R₆ 及び R₇ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁-₁₀)アルキル、ハロ(C₁-₁₀)アルキル、スルホニル(C₁-₃)アルキル、スルフィニル(C₁-₃)アルキル、アミノ(C₁-₁₀)アルキル及びイミノ(C₁-₃)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる（但し、R₇ は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）か、又は、R₆ 及び R₇ が一緒になって環を

形成し；

R_8 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{4-7})アリール、及びヘテロ(C_{1-10})アリールからなる群より選ばれ；

R_9 及び R_{10} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})ビシクロアルキル、(C_{4-7})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_9 及び R_{10} が一緒になって環を形成し（但し、 R_{10} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R_{11} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{4-7})アリール及びヘテロ(C_{1-10})アリールからなる群より選ばれ（但し、 R_{11} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R_{12} は、置換されているか又は置換されていない、(C_{4-7})アリールであり；

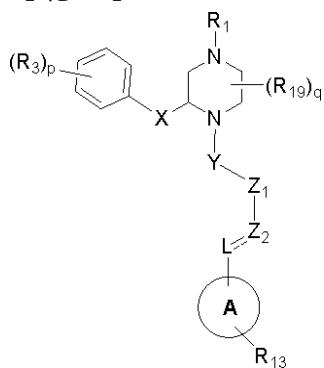
R_{13} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、

アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つR₁₉は、水素、メチル及びフルオロメチルからなる群より選ばれる、

但し、Yが-CO-で、R₁が水素で、Xが-CH₂-で、R₁₂がフェニルで、Z₂が-CH₂-で、環Aがフェニルで、且つR₁₃が水素の場合、Z₁は-O-ではない]を含む：化合物。

【請求項4】

【化4】



[式中：

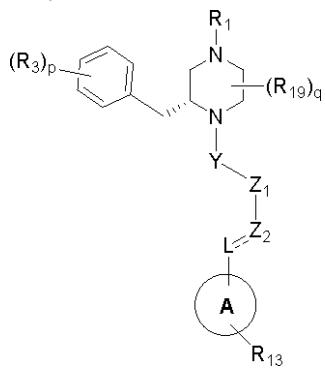
pは、0、1、2、3、4及び5からなる群より選ばれ；且つ

R₃は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-1₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-1₀)アルキル、ハロ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-1₀)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリール、アミノカルボニルオキシ及びカルボニルアルコキシからなる群より選ばれる]

を含む：請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

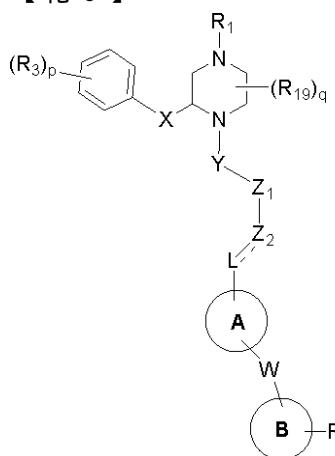
【化5】



を含む：請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

【化6】



[式中：

pは、0、1、2、3、4及び5からなる群より選ばれ；

環Bは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

Wは、存在しないか、又は、CR₁₅R₁₆、NR₁₇、O及びSからなる群より選ばれ；

R₃は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-₁₀)アルキル、ハロ(C₁-₁₀)アルキル、カルボニル(C₁-₃)アルキル、チオカルボニル(C₁-₃)アルキル、スルホニル(C₁-₃)アルキル、スルフィニル(C₁-₃)アルキル、アミノ(C₁-₁₀)アルキル、イミノ(C₁-₃)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、アリール(C₁-₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₈-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール

ール、ヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリール、アミノカルボニルオキシ及びカルボニルアルコキシからなる群より選ばれ；

R₁₋₄は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリール、アミドアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれ；

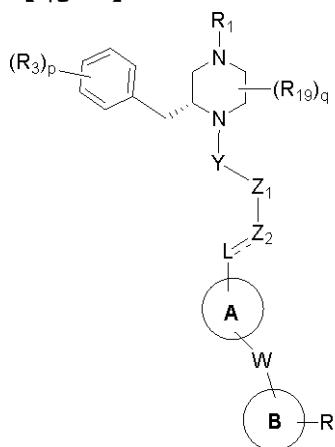
R₁₋₅及びR₁₋₆は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₁₋₅及びR₁₋₆が一緒にになってオキソを形成し（但し、R₁₋₆は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；且つ

R₁₋₇は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₇)アリール及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれる（但し、R₁₋₇は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）】

を含む：請求項3に記載の化合物。

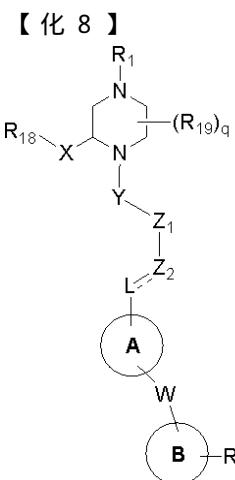
【請求項7】

【化7】



を含む：請求項6に記載の化合物。

【請求項8】



[式中：

qは、0、1、2及び3からなる群より選ばれ；

環Aは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

環Bは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

Lは、存在しないか、又はZ₂と環Aとの間で1、2又は3原子の分離をもたらすリンカ-（式中、当該分離をもたらすリンカ-の原子は、炭素、酸素、窒素、及び硫黄からなる群より選ばれる）であり；

Wは、存在しないか、又は、CR₁₅R₁₆、NR₁₇、O及びSからなる群より選ばれ；

Xは、-(CR₄R₅)_n-（式中、nは1及び2からなる群より選ばれる）であり；

Yは、-CO-及び-SO₂-からなる群より選ばれ；

Z₁は、CR₆R₇、NR₈、O及びSからなる群より選ばれ；

Z_2 は、 $C R_9 R_{10}$ 、 $N R_{11}$ 、 O 及び S からなる群より選ばれるか、又は Z_2 及び分離をもたらす L の 1 つ以上の原子が一緒になって 3、4、5、6 又は 7 員環を形成し；

R_1 は、水素及びインビポで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R_4 及び R_5 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C_{1-10})アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_4 及び R_5 が一緒になって環を形成し；

R_6 及び R_7 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル及びイミノ(C_{1-3})アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる（但し、 R_7 は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）か、又は、 R_6 及び R_7 が一緒になって環を形成し；

R_8 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{4-7})アリール、及びヘテロ(C_{1-10})アリールからなる群より選ばれ；

R_9 及び R_{10} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})ビシクロアルキル、(C_{4-7})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_9 及び R_{10} が一緒になって環を形成し（但し、 R_{10} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R_{11} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-7})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7})シクロアルキル、(C_{4-7})アリール及びヘテロ(C_{1-10})アリールからなる群より選ばれる；

らなる群より選ばれ（但し、R₁₋₁は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R₁₋₄は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリール、アミドアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれ；

R₁₋₅及びR₁₋₆は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₁₋₅及びR₁₋₆が一緒にになってオキソを形成し（但し、R₁₋₆は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R₁₋₇は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれ（但し、R₁₋₇は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；

R₁₋₈は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、

チオカルボニル (C₁~₃) アルキル、スルホニル (C₁~₃) アルキル、スルフィニル (C₁~₃) アルキル、アミノ (C₁~₁₀) アルキル、イミノ (C₁~₃) アルキル、(C₃~₇) シクロアルキル (C₁~₅) アルキル、ヘテロ (C₃~₇) シクロアルキル (C₁~₅) アルキル、アリール (C₁~₁₀) アルキル、ヘテロアリール (C₁~₅) アルキル、(C₉~₁₂) ビシクロアリール (C₁~₅) アルキル、ヘテロ (C₈~₁₂) ビシクロアリール (C₁~₅) アルキル、(C₃~₇) シクロアルキル、ヘテロ (C₃~₇) シクロアルキル、(C₉~₁₂) ビシクロアルキル、(C₄~₇) アリール、ヘテロ (C₁~₁₀) アリール、(C₉~₁₂) ビシクロアリール及びヘテロ (C₄~₁₂) ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つ R₁₉ は、水素、メチル及びフルオロメチルからなる群より選ばれる] を含む：化合物。

【請求項 9】

X が、-CH₂- 及び -CH₂CH₂- からなる群より選ばれる、請求項 1、3、4、6 及び 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

R₄ が、水素及びハロからなる群より選ばれる、請求項 1、3、4、6、8 及び 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

R₅ が、水素及びハロからなる群より選ばれる、請求項 1、3、4、6 及び 8~10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

Z₁ が CR₆R₇ である、請求項 1~11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 13】

Z₂ が CR₉R₁₀ である、請求項 1~12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

R₆ が水素である、請求項 1~13 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 15】

R₇ が水素である、請求項 1~14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

R₈ が、水素及び置換されているか又は置換されていない、(C₁~₃) アルキルからなる群より選ばれる、請求項 1~15 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】

R₉ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ヒドロキシカルボニル (C₁~₁₀) アルキル、アルキル (C₁~₃) アミノカルボニルアルキル (C₁~₁₀) アルキル、アルコキシ (C₁~₃) カルボニルアルキル (C₁~₁₀) アルキル及びシクロアルコキシ (C₃~₆) カルボニルアルキル (C₁~₁₀) アルキルからなる群より選ばれる、請求項 1~16 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

R₁₀ が水素である、請求項 1~17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 19】

R₁₁ が、水素及び置換されているか又は置換されていない、(C₁~₃) アルキルからなる群より選ばれる、請求項 1~18 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 20】

R₁ が水素である、請求項 1~19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

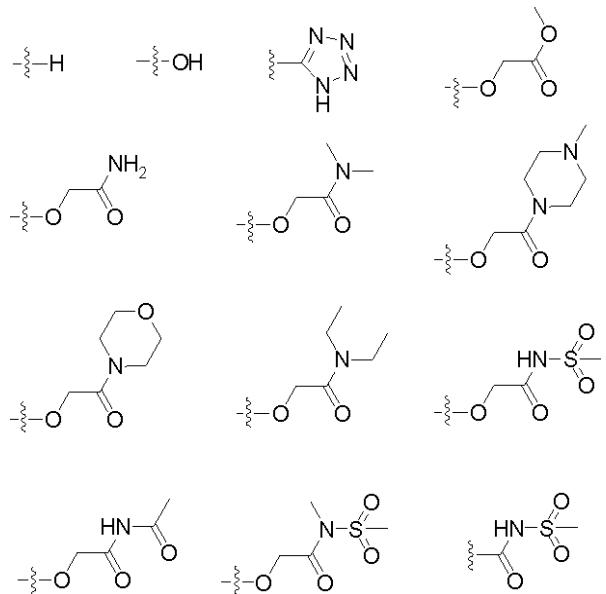
【請求項 21】

R₁₂ が、置換されているか又は置換されていないフェニルである、請求項 3 及び 9~20 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 22】

R₃ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化9】



からなる群より選ばれる、請求項1、2、4～7及び9～21のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

R_2 が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C_{1-5})アリールからなる群より選ばれる、請求項1、2及び9～22のいずれか1項に記載の化合物。

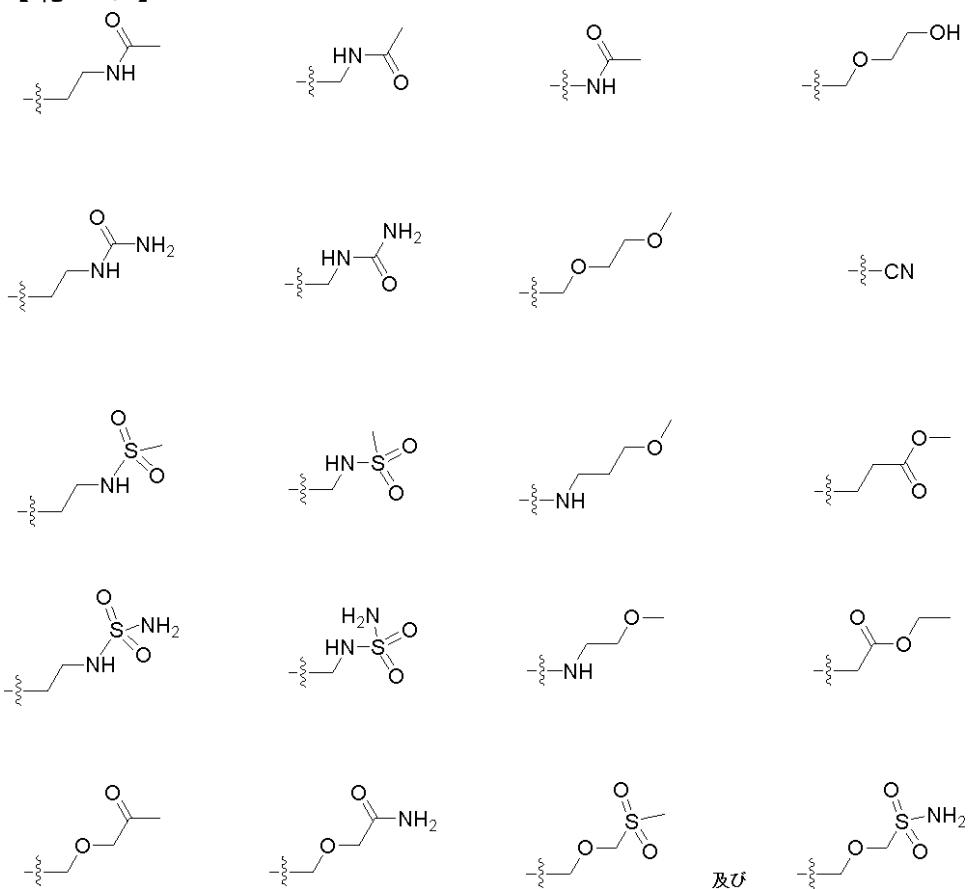
【請求項24】

R_2 が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、ハロ、(C_{1-3})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-3})アルキル、ヒドロキシカルボニル(C_{1-10})アルキル、アルキル(C_{1-3})アミノカルボニルアルキル(C_{1-10})アルキル、アルコキシ(C_{1-3})カルボニルアルキル(C_{1-10})アルキル、シクロアルコキシ(C_{3-6})カルボニルアルキル(C_{1-10})アルキル；ヒドロキシカルボニル(C_{1-10})アルキル、アルキル(C_{1-3})アミノカルボニルアルキル(C_{1-10})アルキル、アルコキシ(C_{1-3})カルボニルアルキル(C_{1-10})アルキル及びシクロアルコキシ(C_{3-6})カルボニルアルキル(C_{1-10})アルキルからなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項23に記載の化合物。

【請求項25】

R_2 が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化10】



からなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項23に記載の化合物。

【請求項26】

環Aが、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C₁-₅)アリールからなる群より選ばれる、請求項3~25のいずれか1項に記載の化合物。

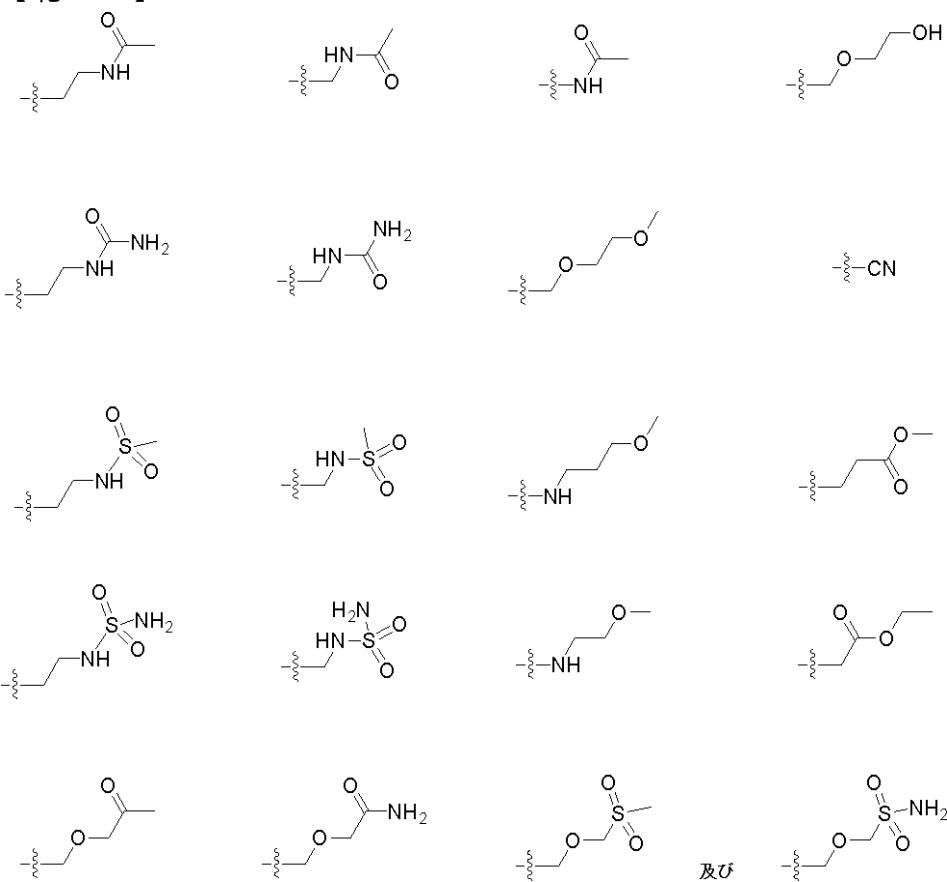
【請求項27】

R_{1~3}が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、ハロ、(C₁-₃)アルキル、ヒドロキシ(C₁-₃)アルキル、ヒドロキシカルボニル(C₁-₁₀)アルキル、アルキル(C₁-₃)アミノカルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキル、アルコキシ(C₁-₃)カルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキル、シクロアルコキシ(C₃-₆)カルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキル；ヒドロキシカルボニル(C₁-₁₀)アルキル、アルキル(C₁-₃)アミノカルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキル、アルコキシ(C₁-₃)カルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキル及びシクロアルコキシ(C₃-₆)カルボニルアルキル(C₁-₁₀)アルキルからなる群より選ばれる、請求項3~5及び9~26のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項28】

R_{1~3}が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化11】



からなる群より選ばれる、請求項3～5及び9～26のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項29】

Wが、CR₁₋₅R₁₋₆（式中、R₁₋₅及びR₁₋₆は、水素、ハロ、ヒドロキシル及び置換されているか又は置換されていない、(C₁₋₃)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる）、N H及びOからなる群より選ばれる、請求項6～28のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項30】

R₁₋₅が、水素、ヒドロキシル、ハロ及び置換されているか又は置換されていない、(C₁₋₃)アルキルからなる群より選ばれる、請求項6～29のいずれか1項に記載の化合物。

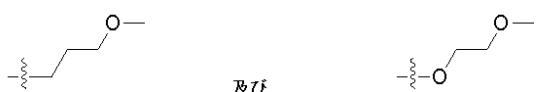
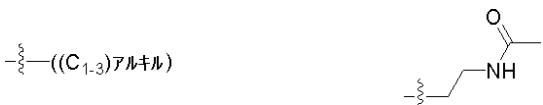
【請求項31】

R₁₋₆が、水素、ヒドロキシル、ハロ及び置換されているか又は置換されていない、(C₁₋₃)アルキルからなる群より選ばれる、請求項6～30のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項32】

R₁₋₇が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化12】



からなる群より選ばれる、請求項 6～31 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 33】

R₁₋₈ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール及びヘテロ(C₁₋₅)アリールからなる群より選ばれる、請求項 8～32 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 34】

環 B が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれる、請求項 6～33 のいずれか 1 項に記載の化合物。

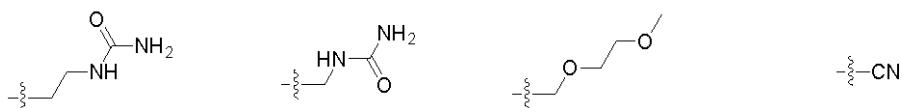
【請求項 35】

R₁₋₄ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、ハロ、(C₁₋₃)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₃)アルキル、ヒドロキシカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、アルキル(C₁₋₃)アミノカルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アルコキシ(C₁₋₃)カルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、シクロアルコキシ(C₃₋₆)カルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル；ヒドロキシカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、アルキル(C₁₋₃)アミノカルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アルコキシ(C₁₋₃)カルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、シクロアルコキシ(C₃₋₆)カルボニルアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アミド(C₁₋₁₀)アルキル、アルコキシアルコキシ(C₁₋₁₀)アルキル、アルコキシ(C₁₋₁₀)アルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれる、請求項 6～34 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 36】

R₁₋₄ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化 13】



及び

からなる群より選ばれる、請求項 6～34 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 37】

Lが存在しない、請求項1～36のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 38】

Yが-CO-である、請求項1～37のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 39】

(R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3,3-ジフェニルプロパン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(4'-フルオロビフェニル-2-イル)エタノン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2-プロモフェノキシ)エタノン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-4-フェニルブタン-1,4-ジオン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-フェニルプロパン-1-オン；
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2,3-ジフェニルプロパン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-フェノキシフェニル)プロパン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2-フェノキシフェニル)エタノン；
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2'-メトキシビフェニル-2-イル)エタノン；
 (R)-N-ベンズヒドリル-2-ベンジルピペラジン-1-カルボキサミド；
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2'-クロロビフェニル-2-イル)エタノン；
 (R)-2-ベンジル-1-(フェネチルスルホニル)ピペラジン；
 2-(3-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ-1-p-トリルプロピル)イソインドリン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(ナフタレン-1-イルオキシ)エタノン；
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(フラン-2-イル)-4-フェニルブタン-1-オン；
 (R)-2-ベンジル-1-(2,2-ジフェニルエチルスルホニル)ピペラジン；
 (R)-1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-フェニルブタン-1-オン；
 (S)-1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-フェニルブタン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-4-フェニルブタン-1-オン；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(4-クロロフェノキシ)フェニル)プロパン-1-オン；
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2,2-ジメチル-4-フェニルテトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)エタノン；
 (R)-2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)フェニルベンゾエート；
 (R)-2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)フェノキシ)ベンゾニトリル；
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(m-トリルオキシ)フェニル)プロパン-1-オン；

オキソプロピル)フェノキシ)フェニル)プロピル)アセトアミド;
 (R)-N-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)フェノキシ)-5-メチルフェネチル)アセトアミド;
 2-(3-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)-2-フェニルシクロヘキサン;
 (R)-3-(2-ベンジルフェニル)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)
プロパン-1-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(4-(4-クロロフェニル)-2-メチルオキサゾール-5-イル)プロパン-1-オン;
 (R)-3-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)-
2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-2-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(4-クロロベンジル)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-(2-メトキシフェノキシ)
エタノン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(ジフェニルアミノ)プロ
パン-1-オン;
 (R)-4-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)-
2-メトキシフェニル アセテート;
 (R)-4-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-4-オキソ-N,N-ジフェニ
ルブタンアミド;
 1-(R)-2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2,2-ジメチルテトラ
ヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-3-フェニルプロパン-1-オン;
 (R)-2-(3-ベンジルフェノキシ)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)
エタノン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(4,5-ジフェニルオキ
サゾール-2-イル)プロパン-1-オン;
 (R)-N-(1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル)
シクロヘキシリル)ベンズアミド;
 (R)-2-(ベンズヒドリルチオ-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)エタ
ノン;
 (R)-3-(2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
プロピル)フェノキシ)フェニル)プロパンニトリル;
 (R)-メチル 3-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
プロピル)フェノキシ)フェニル)プロパノエート;
 (R)-1-(2-(4-ヒドロキシベンジル)ピペラジン-1-イル)-3-(2-
フェノキシフェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-メチル 2-(4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)
ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセテート;
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)ピペラ
ジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセトアミド;
 (R)-N,N-ジメチル-2-(4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロ
パノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセトアミド;
 (R)-4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)ピペラジン-
2-イル)メチル)フェニル 4-メチルピペラジン-1-カルボキシレート;
 (R)-4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)ピペラジン-
2-イル)メチル)フェニル モルホリン-4-カルボキシレート;
 (R)-4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)ピペラジン-
2-イル)メチル)フェニル ジエチルカルバメート;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(3-ヒドロキシブ

ロボキシ)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(3-メトキシプロ
 ポキシ)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(3-(2-メトキ
 シエトキシ)プロボキシ)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(3-(ヒドロキシ
 メチル)フェノキシ)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-3-(2-(3-アセチルフェノキシ)フェニル)-1-(2-ベンジルピペ
 ラジン-1-イル)プロパン-1-オン;
 (R)-3-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピ
 ル)フェノキシ)ベンズアミド;
 (R)-N-(2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
 プロピル)フェノキシ)フェネチル)プロピオンアミド;
 (R)-N-(2-(2-(3-(2-(4-ヒドロキシベンジル)ピペラジン-1-
 イル)-3-オキソプロピル)フェノキシ)フェネチル)アセトアミド;
 (R)-4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)フェノキシ)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェニル モルホリン-4-カル
 ボキシレート;
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)フェノキシ)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセトアミ
 ド;
 (R)-3-(2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
 プロピル)フェノキシ)フェニル)プロパン酸;
 (R)-N-(2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
 プロピル)ベンジル)フェネチル)アセトアミド;
 (R)-3-(2-(2-(3-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-オキソ
 プロピル)フェノキシ)フェニル)プロパンアミド;
 (R)-1-(2-(4-((1H-テトラゾール-5-イル)メトキシ)ベンジル)ピペラ
 ジン-1-イル)-3-(2-フェノキシフェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)ベンジル)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセトアミド;
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)ベンジル)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)酢酸;
 (R)-1-(2-ベンジルピペラジン-1-イル)-3-(2-(2-(ヒドロキシ
 メチル)フェノキシ)フェニル)プロパン-1-オン;
 (R)-N-(2-(2-(3-(2-(4-ヒドロキシベンジル)ピペラジン-1-
 イル)-3-オキソプロピル)ベンジル)フェネチル)アセトアミド; 及び
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-フェノキシフェニル)プロパノイル)ピペラ
 ジン-2-イル)メチル)フェノキシ)酢酸;
 (R)-2-(4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)ベンジル)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)-N-(メチ
 ルスルホニル)アセトアミド
 (R)-メチル 2-(4-((1-(3-(2-(2-アセトアミドエチル)ベンジル)フェ
 ニル)プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)フェノキシ)アセ
 テート
 (R)-4-((1-(3-(2-(2-(2-アセトアミドエチル)ベンジル)フェニル)
 プロパノイル)ピペラジン-2-イル)メチル)-N-(メチルスルホニル)ベン
 ズアミド
 (R)-N-(2-(2-(3-(2-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)ベン

ジル)ピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)ベンジル)フェネチル)アセトアミド

からなる群より選ばれる：化合物。

【請求項40】

化合物が、医薬上許容される塩の形態である、請求項1～39のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項41】

化合物が、立体異性体の混合物で存在する、請求項1～40のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項42】

該化合物が、単一の立体異性体を含む、請求項1～40のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項43】

請求項1～42のいずれか1項に記載の化合物を有効成分として含む、医薬組成物。

【請求項44】

組成物が、経口投与に適した固体製剤である、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項45】

組成物が、経口投与に適した液体製剤である、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項46】

組成物が錠剤である、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項47】

組成物が、非経口投与に適した液体製剤である、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項48】

組成物が、経口、非経口、腹腔内、静脈内、動脈内、経皮、舌下、筋肉内、直腸内、口腔内、鼻腔内、リポソーム、吸入経由、膣内、眼内、局所送達経由、皮下、脂肪内、関節内、及びくも膜下腔内からなる群より選ばれる経路による投与に適している、請求項1～42のいずれか1項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項49】

請求項1～42のいずれか1項の化合物；及び

該化合物が投与される疾患状態の表示、該化合物の保存情報、投薬情報及び該化合物の投与方法についての指示からなる群より選ばれる1つ以上の形態の情報を含む、説明書を含む：キット。

【請求項50】

複数回投与形態での該化合物を含む、請求項49のキット。

【請求項51】

請求項1～42のいずれか1項の化合物；及び

包装材料

を含む：製品。

【請求項52】

包装材料が、該化合物の収容のための容器を含む、請求項51の製品。

【請求項53】

容器が、該化合物が投与される疾患状態、保存情報、投薬情報及び／又は該化合物の投与方法についての指示からなる群の1つ以上の要素を示すラベルを含む、請求項52の製品。

【請求項54】

製品が、複数回投与形態で該化合物を含む、請求項51の製品。

【請求項55】

請求項1～42のいずれか1項の化合物を含有する、レニンの阻害剤。

【請求項56】

インビボで第二の化合物に変換される第一の化合物を含有し、該第二の化合物がレニン

をインビボで阻害する、レニンの阻害剤であって、該第二の化合物が、請求項1～42のいずれか1項に記載の化合物である、阻害剤。

【請求項57】

レニンが疾患状態の病理及び／又は総体症状に寄与する活性を有する疾患状態の治療剤であって、該治療剤が、請求項1～42のいずれか1項の化合物を該疾患状態に対する治療有効量で含有する、治療剤。

【請求項58】

レニンが疾患状態の病理及び／又は総体症状に寄与する活性を有する疾患状態の治療剤であって、該治療剤が、インビボで第二の化合物に変換される第一の化合物を含有し、該第二の化合物がレニンをインビボで阻害し、該第二の化合物が、請求項1～42のいずれか1項に記載の化合物である、治療剤。

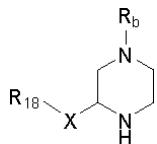
【請求項59】

疾患状態が、循環器疾患、高血圧症、うっ血性心不全、心筋梗塞症、腎臓保護、炎症、神経系の疾患及び癌からなる群より選ばれる、請求項57および58のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項60】

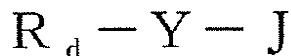
式

【化14】



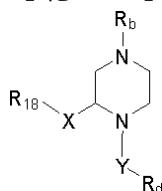
を有する化合物を、式

【化15】



の化合物に、式

【化16】



[式中

Jは、脱離基であり；

Xは、-(CR₄R₅)_n-（式中、nは1及び2からなる群より選ばれる）であり；

Yは、-C(O)-及び-S(O₂)-からなる群より選ばれ；

R_bは、R₁、ベンジル及びBocからなる群より選ばれ；

R_dは、置換されているアルキル又は置換されているヘテロアルキルであり；

R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₄及びR₅は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁₋₁₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄及びR₅が一緒になって環を形成し；且つ

R₁₈は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C

C_{1-10}) アルキル、ハロ(C_{1-10}) アルキル、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、アミノ(C_{1-10}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) ビシクロアルキル、(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群より選ばれる]を有する反応生成物を形成する条件下でカップリングさせることを含む、方法。

【請求項 6 1】

Yが- $C(O)$ -である、請求項6 0に記載の方法。

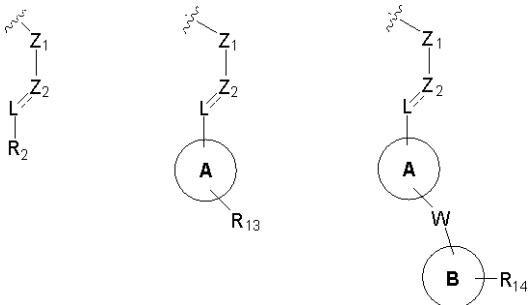
【請求項 6 2】

Yが- $S(O)_2$ -である、請求項6 0に記載の方法。

【請求項 6 3】

R_d が、

【化 1 7】



[式中

環Aは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

環Bは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

Lは、存在しないか、又は Z_2 と R_2 又は環Aとの間で1、2又は3原子の分離をもたらすリンカー(式中、当該分離をもたらすリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素、及び硫黄からなる群より選ばれる)であり；

Wは、存在しないか、又は、 $CR_{1-5}R_{1-6}$ 、 NR_{1-7} 、 O 及び S からなる群より選ばれ；

Z_1 は、 CR_6R_7 及び NR_8 、 O 及び S からなる群より選ばれ；

Z_2 は、 CR_9R_{1-10} 及び NR_{1-11} 、 O 及び S からなる群より選ばれるか、又は Z_2 及び分離をもたらすLの1つ以上の原子が一緒になって3、4、5、6又は7員環を形成し；

R_2 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{4-7}) アリール及びヘテロ(C_{1-6}) アリールからなる群より選ばれ；

R_6 及び R_7 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル及びイミノ(C₁₋₃)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる(但し、 R_7 は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない)か、又は、 R_6 及び R_7 が一緒になって環を形成し;

R_8 は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれ;

R_9 及び R_{10} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_9 及び R_{10} が一緒になって環を形成し(但し、 R_{10} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない);

R_{11} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₄₋₇)アリール及びヘテロ(C₁₋₁₀)アリールからなる群より選ばれ(但し、 R_{11} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない);

R_{13} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C

C_{1-10}) アルキル、ハロ(C_{1-10}) アルキル、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、アミノ(C_{1-10}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

R_{1-4} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ(C_{1-10}) アルキル、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、アミノ(C_{1-10}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリール、アミドアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれ；

R_{1-5} 及び R_{1-6} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C_{1-10}) アルキル、ハロ(C_{1-10}) アルキル、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、アミノ(C_{1-10}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{4-7}) アリール、ヘテロ(C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリール及びヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_{1-5} 及び R_{1-6} が一緒になってオキソを形成し（但し、 R_{1-6} は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない）；且つ

R_{1-7} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ(C_{1-10}) アルキル、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、アミノ(C_{1-10}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル(C_{1-5}) アルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-7}) シクロアルキル、

$C_{3\sim7}$) シクロアルキル、($C_{4\sim7}$) アリール及びヘテロ($C_{1\sim10}$)アリールからなる群より選ばれる(但し、 $R_{1\sim7}$ は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成するとき、存在しない)]

からなる群より選ばれる、請求項60～62のいずれか1項に記載の方法。

【請求項64】

Lが存在しない、請求項63に記載の方法。

【請求項65】

Wが、存在しないか、又は- $CR_{1\sim5}R_{1\sim6}$ -、及び-O-、(式中、 $R_{1\sim5}$ 及び $R_{1\sim6}$ は、水素、ハロ、ヒドロキシル及び置換されているか又は置換されていない、($C_{1\sim3}$)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる)、NH、及びOからなる群より選ばれる、請求項63～64のいずれか1項に記載の方法。

【請求項66】

Wが、CH₂又はOである、請求項63～64のいずれか1項に記載の方法。

【請求項67】

Z₁が、CR₆R₇である、請求項63～66のいずれか1項に記載の方法。

【請求項68】

R₆及びR₇が、共に水素である、請求項67に記載の方法。

【請求項69】

Z₂が、CR₉R₁₀又はOである、請求項63～68のいずれか1項に記載の方法。

【請求項70】

R₉が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ヒドロキシカルボニル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルキル($C_{1\sim3}$)アミノカルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルコキシ($C_{1\sim3}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル及びシクロアルコキシ($C_{3\sim6}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキルからなる群より選ばれる、請求項69に記載の方法。

【請求項71】

R₁₀が水素である、請求項69に記載の方法。

【請求項72】

Z₂がCH₂である、請求項63～68のいずれか1項に記載の方法。

【請求項73】

R₂が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ($C_{1\sim5}$)アリールからなる群より選ばれる、請求項63～64、67～72のいずれか1項に記載の方法。

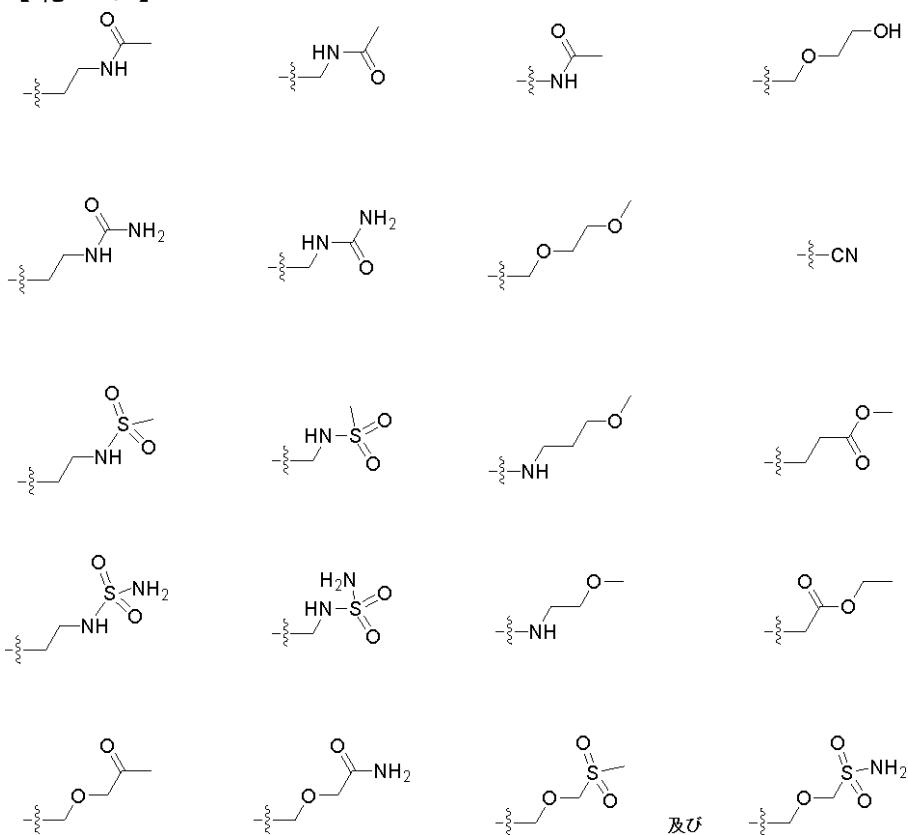
【請求項74】

R₂が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、ハロ、($C_{1\sim3}$)アルキル、ヒドロキシ($C_{1\sim3}$)アルキル、ヒドロキシカルボニル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルキル($C_{1\sim3}$)アミノカルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルコキシ($C_{1\sim3}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル、シクロアルコキシ($C_{3\sim6}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル；ヒドロキシカルボニル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルキル($C_{1\sim3}$)アミノカルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル、アルコキシ($C_{1\sim3}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキル及びシクロアルコキシ($C_{3\sim6}$)カルボニルアルキル($C_{1\sim10}$)アルキルからなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項63～64、67～73のいずれか1項に記載の方法。

【請求項75】

R₂が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化18】

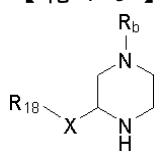


からなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項 6_3 ~ 6_4、6_7 ~ 7_3 のいずれか
1 項に記載の方法。

【請求項 7_6】

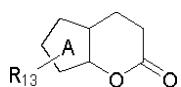
式

【化19】



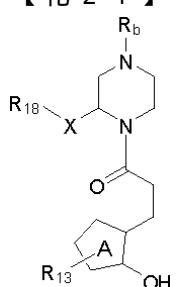
を有する化合物を、式

【化20】



の化合物に、式

【化21】



[式中

環 A は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

X は、-(CR₄R₅)_n-（式中、n は 1 及び 2 からなる群より選ばれる）であり；

R_b は、R₁、ベンジル及びBoc からなる群より選ばれ；

R₁ は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₄ 及び R₅ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁-₁₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄ 及び R₅ が一緒にになって環を形成し；

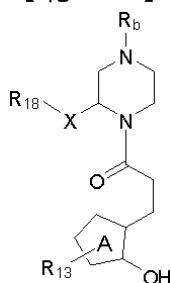
R₁₃ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-₁₀)アルキル、ハロ(C₁-₁₀)アルキル、カルボニル(C₁-₃)アルキル、チオカルボニル(C₁-₃)アルキル、スルホニル(C₁-₃)アルキル、スルフィニル(C₁-₃)アルキル、アミノ(C₁-₁₀)アルキル、イミノ(C₁-₃)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、アリール(C₁-₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₈-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つ

R₁₈ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-₁₀)アルキル、ハロ(C₁-₁₀)アルキル、カルボニル(C₁-₃)アルキル、チオカルボニル(C₁-₃)アルキル、スルホニル(C₁-₃)アルキル、スルフィニル(C₁-₃)アルキル、アミノ(C₁-₁₀)アルキル、イミノ(C₁-₃)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₃-₇)シクロアルキル(C₁-₅)アルキル、アリール(C₁-₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、ヘテロ(C₈-₁₂)ビシクロアリール(C₁-₅)アルキル、(C₃-₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₉-₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-₁₂)ビシクロアルキル、(C₄-₇)アリール、ヘテロ(C₁-₁₀)アリール、(C₉-₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれる】の化合物を形成する条件下でカップリングさせることを含む、方法。

【請求項 77】

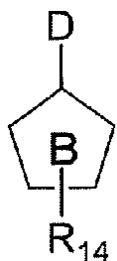
式

【化22】



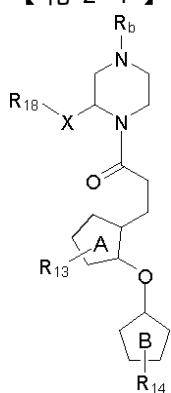
を有する化合物を、式

【化23】



を有するジヒドロクマリン誘導体と、式

【化24】



[式中

環Bは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃~7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃~7)シクロアルキル、(C₉~12)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃~12)ビシクロアルキル、(C₄~7)アリール、ヘテロ(C₁~10)アリール、(C₉~12)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄~12)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

Dは、-F、-Cl及び-Brからなる群より選ばれ；且つ

R_{14} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁~10)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁~10)アルキル、ハロ(C₁~10)アルキル、カルボニル(C₁~3)アルキル、チオカルボニル(C₁~3)アルキル、スルホニル(C₁~3)アルキル、スルフィニル(C₁~3)アルキル、アミノ(C₁~10)アルキル、イミノ(C₁~3)アルキル、(C₃~7)シクロアルキル(C₁~5)アルキル、ヘテロ(C₃~7)シクロアルキル(C₁~5)アルキル、アリール(C₁~10)アルキル、ヘテロアリール(C₁~5)アルキル、(C₉~12)ビシクロアリール(C₁~5)アルキル、ヘテロ(C₈~12)

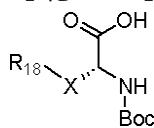
) ビシクロアリール(C₁ - 5)アルキル、(C₃ - 7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 1₂)ビシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 1₀)アリール、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄ - 1₂)ビシクロアリール、アミドアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれる]

を有する化合物を形成する条件下で反応させることを含む、請求項7_6に記載の方法。

【請求項 7_8】

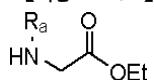
更に：式

【化 2_5】



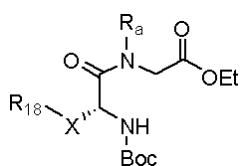
の化合物を、式

【化 2_6】



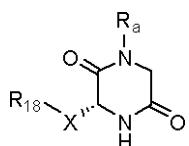
の別の化合物に、式

【化 2_7】



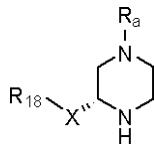
を有する化合物を形成する条件下でカップリングさせ、直上の化合物を環化して式

【化 2_8】



を有する化合物を形成し、直上の化合物を、式

【化 2_9】



[式中

R_a は、R₁ 又はベンジルである]

を有する生成物に還元することを含む、請求項6_0 ~ 7_7 のいずれか 1 項に記載の方法。

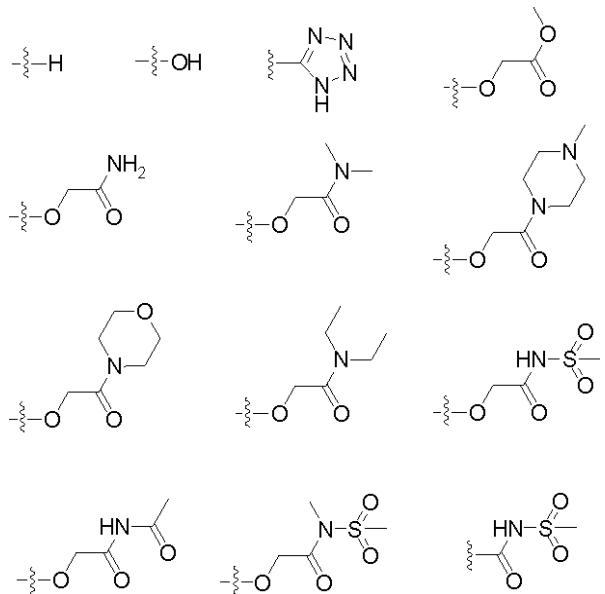
【請求項 7_9】

R₁₈ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₁ - 6)アルキル、(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₄ - 7)アリール及びヘテロ(C₁ - 5)アリールからなる群より選ばれる、請求項6_0 ~ 7_8 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 8_0】

R₁₈ が置換されたフェニルであり、置換基が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化 3 0】



からなる群より選ばれる、請求項6 0～7 8のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 8 1】

R_4 及び R_5 が、水素及びハロからなる群よりそれぞれ独立して選ばれる、請求項6 0～8 0のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 8 2】

X が、 $-CH_2-$ 及び $-CH_2CH_2-$ からなる群より選ばれる、請求項6 0～8 0のいずれか1項に記載の方法。

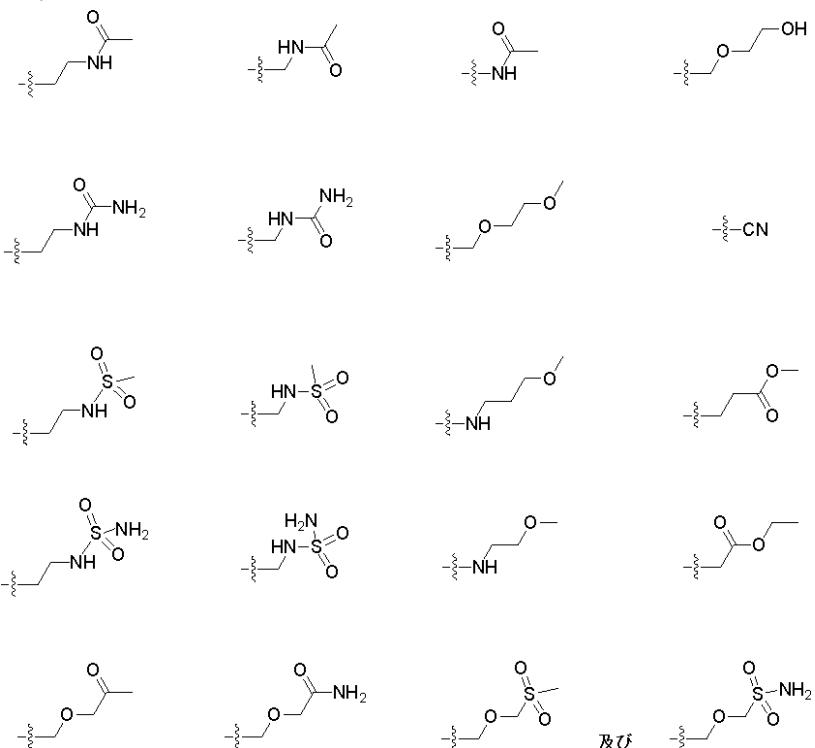
【請求項 8 3】

環 A が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C_1 ～ 5)アリールからなる群より選ばれる、請求項6 3～8 2のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 8 4】

$R_{1\sim 3}$ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化31】



からなる群より選ばれる、請求項6_3～8_3のいずれか1項に記載の方法。

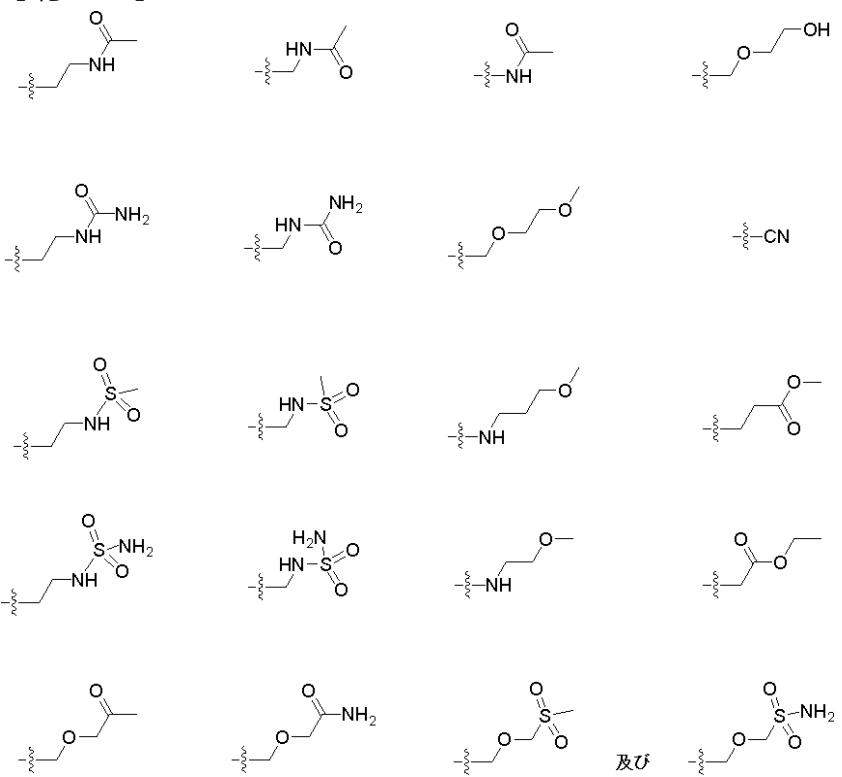
【請求項85】

環Bが、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C₁-C₁₀)アリールからなる群より選ばれる、請求項6_3～8_4のいずれか1項に記載の方法。

【請求項86】

R₁₋₄が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化32】

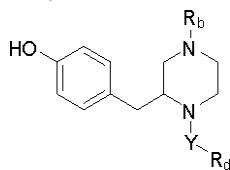


からなる群より選ばれる、請求項6_3～8_5のいずれか1項に記載の方法。

【請求項87】

式

【化33】



[式中

Yは、-C(=O)-及び-S(=O)₂-からなる群より選ばれ；

R_bは、R₁、ベンジル及びBocからなる群より選ばれ；

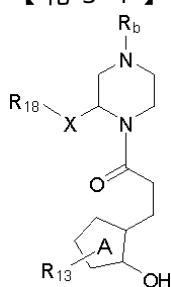
R_dは、置換されているアルキル又は置換されているヘテロアルキルであり；且つ

R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれる]の化合物。

【請求項88】

式

【化34】



[式中

環Aは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃～₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃～₇)シクロアルキル、(C₉～₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃～₁₂)ビシクロアルキル、(C₄～₇)アリール、ヘテロ(C₁～₁₀)アリール、(C₉～₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄～₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

Xは、-(CR₄R₅)_n-（式中、nは1及び2からなる群より選ばれる）であり；

R_bは、R₁、ベンジル及びBoc基からなる群より選ばれ；

R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₄及びR₅は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁～₁₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄及びR₅が一緒になって環を形成し；

R₁₃は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁～₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁～₁₀)アルキル、ハロ(C₁～₁₀)アルキル、カルボニル(C₁～₃)アルキル、チオカルボニル(C₁～₃)アルキル、スルホニル(C₁～₃)アルキル、スルフィニル(C₁～₃)アルキル、アミノ(C₁～₁₀)アルキル、イミノ(C₁～₃)アルキル、(C₃～₇)シクロアルキル(C₁～₅)アルキル、ヘテロ(C₃～₇)シクロアルキル(C₁～₅)アルキル、アリール(C₁～₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁～₅)

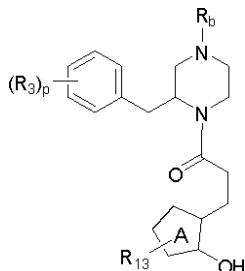
アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つ

R₁₈は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-1₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-1₀)アルキル、ハロ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-1₀)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれる]の化合物。

【請求項 8 9】

式

【化 3 5】



[式中

pは、0、1、2、3、4及び5からなる群より選ばれ；

環Aは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃-7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル、(C₉-1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃-1₂)ビシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-1₀)アリール、(C₉-1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄-1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

R_bは、R₁、ベンジル及びBocからなる群より選ばれ；

R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₃は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁-1₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁-1₀)アルキル、ハロ(C₁-1₀)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-1₀)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-1₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-1₂)ビシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-1₂)ビシクロ

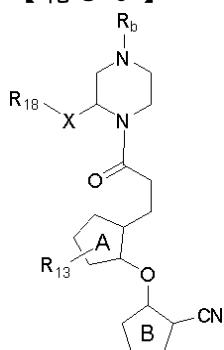
アリール(C₁ - 5)アルキル、(C₃ - 7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 1₂)ビシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 1₀)アリール、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール、ヘテロ(C₄ - 1₂)ビシクロアリール、アミノカルボニルオキシ及びカルボニルアルコキシからなる群より選ばれ、且つ

R₁₃ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁ - 1₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁ - 1₀)アルキル、ハロ(C₁ - 1₀)アルキル、カルボニル(C₁ - 3)アルキル、チオカルボニル(C₁ - 3)アルキル、スルホニル(C₁ - 3)アルキル、スルフィニル(C₁ - 3)アルキル、アミノ(C₁ - 1₀)アルキル、イミノ(C₁ - 3)アルキル、(C₃ - 7)シクロアルキル(C₁ - 5)アルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル(C₁ - 5)アルキル、アリール(C₁ - 1₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁ - 5)アルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール(C₁ - 5)アルキル、ヘテロ(C₈ - 1₂)ビシクロアリール(C₁ - 5)アルキル、(C₃ - 7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 1₂)ビシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 1₀)アリール、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄ - 1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれる]の化合物。

【請求項 90】

式

【化 36】



[式中

Xは、- (C R₄ R₅)_n - (式中、nは1及び2からなる群より選ばれる)であり；環Aは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃ - 7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 1₂)ビシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 1₀)アリール、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄ - 1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

環Bは、それぞれ置換されているか又は置換されていない、(C₃ - 7)シクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 7)シクロアルキル、(C₉ - 1₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 1₂)ビシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 1₀)アリール、(C₉ - 1₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄ - 1₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；

R_bは、R₁、ベンジル及びB o cからなる群より選ばれ；

R₁は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれ；

R₄及びR₅は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、チオ、オキシ、ヒドロキシ及び(C₁ - 1₀)アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₄及びR₅が一緒にになって環を形成し；

R₁₋₃ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つ

R₁₋₈ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₇)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール及びヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群より選ばれる]の化合物。

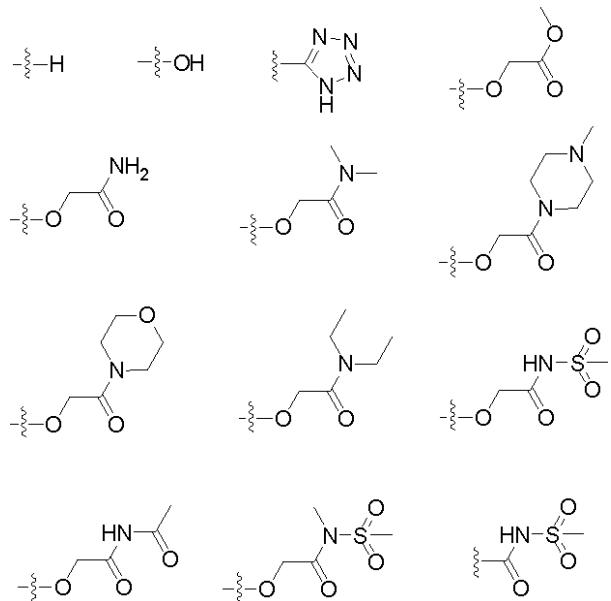
【請求項 9 1】

R₁₋₈ が、置換されているフェニルである、請求項8 8 及び9 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 2】

R₃ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化37】



からなる群より選ばれる、請求項8_9に記載の化合物。

【請求項93】

Yが、- C (O) - である、請求項8_7に記載の化合物。

【請求項94】

R₁が水素、メチル又はエチルである、請求項8_7～9_3のいずれか1項に記載の化合物。

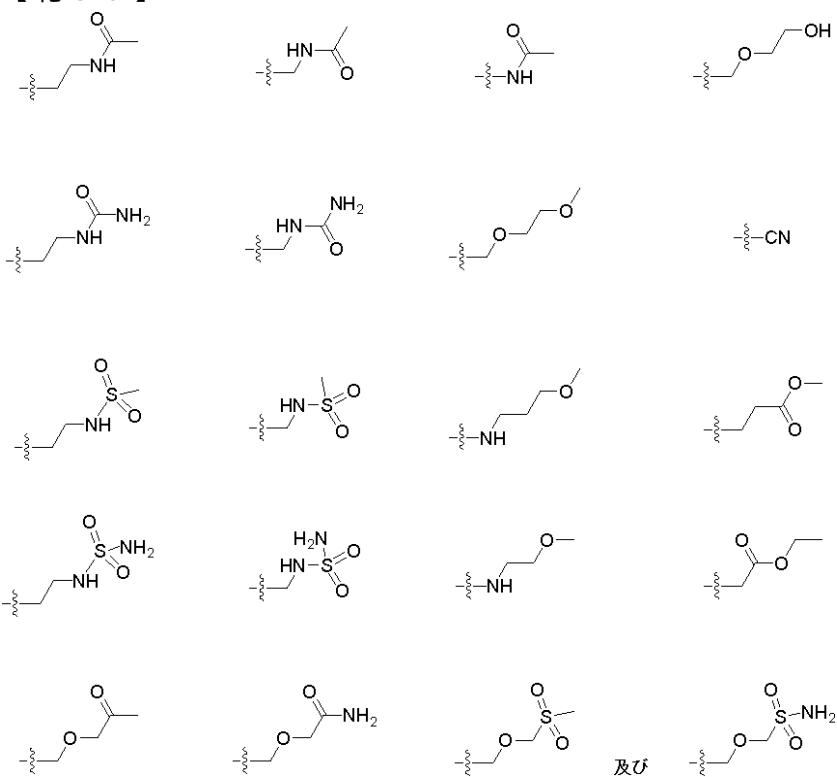
【請求項95】

環Aが、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ(C₁～₅)アリールからなる群より選ばれる、請求項8_9～9_2、及び9_4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項96】

R_{1_3}が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化 3 8】



からなる群より選ばれる、請求項8 8～9 2及び9 4～9 5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 9 7】

環Bが、それぞれ置換されているか又は置換されていない、フェニル及びヘテロ及び(
 C_{1-10})アリールからなる群より選ばれる、請求項9 0～9 2及び9 4～9 6のいずれか1項に記載の化合物。