

【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 0 7 D 241/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/42 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 241/04 C S P

A 6 1 K 31/495 Z N A

C 0 7 D 405/06

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 413/06

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 403/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 6

A 6 1 P 5/42

C 1 2 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

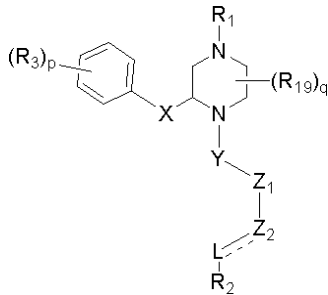
【補正方法】変更

【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、- (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；Y は、- CO - 及び - SO₂ - からなる群より選ばれ；Z₁ は、C R₆ R₇、N R₈、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z₂ は、C R₉ R₁₀、N R₁₁、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；

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；

R₈ 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)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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；

R₉ 及び R₁₀ 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)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)ビスシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-10)アリール、(C₉-12)ビスシクロアリール及びヘテロ(C₄-12)ビス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、R₉ 及び R₁₀ が一緒になって環を形成し(但し、R₁₀ 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)；

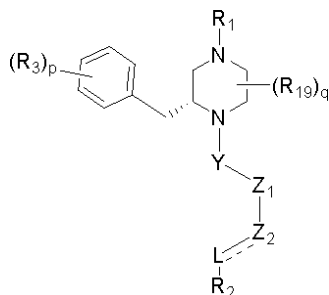
R₁₁ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、スルホニル、スルフィニル、(C₁-10)アルキル、ハロ(C₁-10)アルキル、カルボニル(C₁-3)アルキル、チオカルボニル(C₁-3)アルキル、スルホニル(C₁-3)アルキル、スルフィニル(C₁-3)アルキル、アミノ(C₁-10)アルキル、イミノ(C₁-3)アルキル、(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₃-7)シクロアルキル(C₁-5)アルキル、アリール(C₁-10)アルキル、ヘテロアリール(C₁-5)アルキル、(C₉-12)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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、R₁₁ 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

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、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】

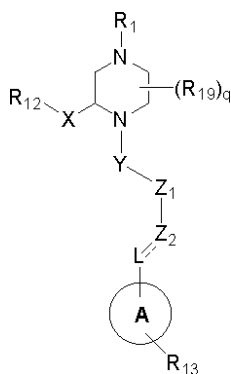
【化 2】



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、-(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；

Y は、-CO- 及び -SO₂- からなる群より選ばれ；

Z₁ は、C R₆ R₇、N R₈、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z₂ は、C R₉ R₁₀、N R₁₁、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；

R₈ 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、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、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、アリーール(C₁ - 10) アルキル、ヘテロアリーール(C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 12) ビシクロアリーール(C₁ - 5) アルキル、ヘテロ(C₈ - 12) ビシクロアリーール(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) アリーール、及びヘテロ(C₁ - 10) アリーールからなる群より選ばれ；

R₉ 及び R₁₀ 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、アリーール(C₁ - 10) アルキル、ヘテロアリーール(C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 12) ビシクロアリーール(C₁ - 5) アルキル、ヘテロ(C₈ - 12) ビシクロアリーール(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) アリーール、ヘテロ(C₁ - 10) アリーール、(C₉ - 12) ビシクロアリーール及びヘテロ(C₄ - 12) ビシクロアリーールからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、R₉ 及び R₁₀ が一緒になって環を形成し(但し、R₁₀ 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)；

R₁₁ 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、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、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、アリーール(C₁ - 10) アルキル、ヘテロアリーール(C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 12) ビシクロアリーール(C₁ - 5) アルキル、ヘテロ(C₈ - 12) ビシクロアリーール(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) アリーール及びヘテロ(C₁ - 10) アリーールからなる群より選ばれ(但し、R₁₁ 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)；

R₁₂ は、置換されているか又は置換されていない、(C₄ - 7) アリーールであり；

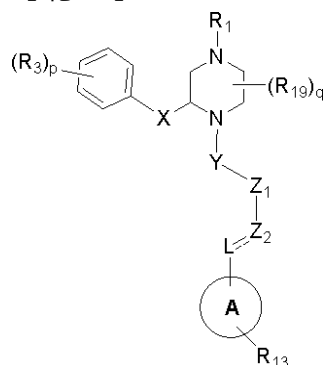
R₁₃ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁ - 10) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁ - 10) アルキル、ハロ(C₁ - 10) アルキル、カルボニル(C₁ - 3) アルキル、チオカルボニル(C₁ - 3) アルキル、スルホニル(C₁ - 3) アルキル、スルフィニル(C₁ - 3) アルキル、アミノ(C₁ - 10) アルキル、イミノ(C₁ -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

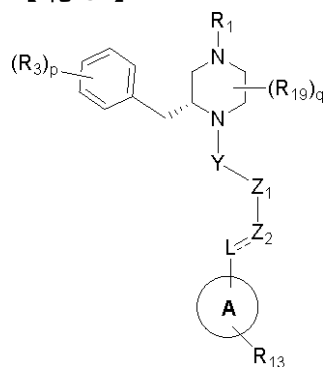
p は、0、1、2、3、4 及び 5 からなる群より選ばれ；且つ

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】

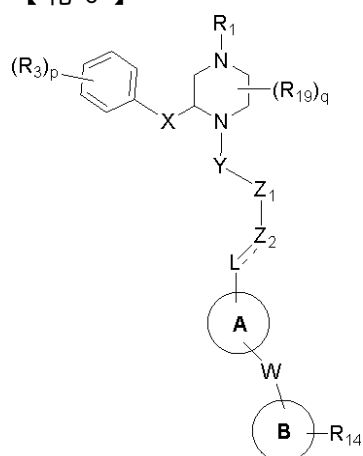
【化 5】



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、C R₁₅ R₁₆、N R₁₇、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、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリアル、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；

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、アリアルオキシ、ヘテロアリアルオキシ、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、アリアル (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリアル (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリアル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリアル (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_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-7}) アリアル、ヘテロ (C_{1-10}) アリアル、(C_{9-12}) ビシクロアリアル、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリアル、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；

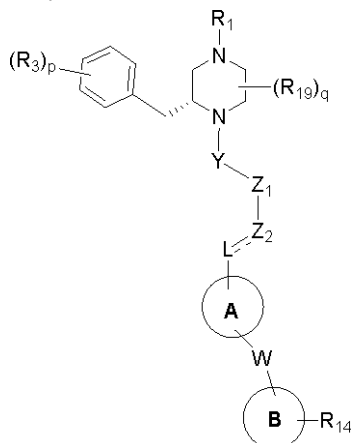
R_{15} 及び R_{16} は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、(C_{3-7}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-7}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリアル (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリアル (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリアル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリアル (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}) アリアル、ヘテロ (C_{1-10}) アリアル、(C_{9-12}) ビシクロアリアル及びヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリアルからなる群よりそれぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_{15} 及び R_{16} が一緒になってオキシを形成し (但し、 R_{16} 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_{17} 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、アリアルオキシ、ヘテロアリアルオキシ、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、アリアル (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリアル (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリアル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリアル (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}) アリアル及びヘテロ (C_{1-10}) アリアルからなる群より選ばれる (但し、 R_{17} 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】

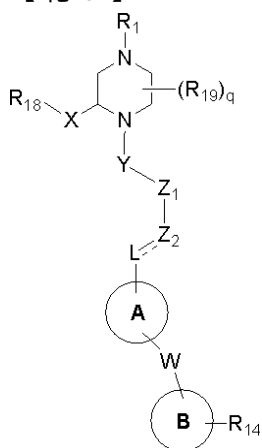
【化 7】



を含む：請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

【化 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、C R₁₅ R₁₆、N R₁₇、O 及び S からなる群より選ばれ；

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；

Y は、- C O - 及び - S O₂ - からなる群より選ばれ；

Z₁ は、C R₆ R₇、N R₈、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z_2 は、 CR_9R_{10} 、 NR_{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、水素及びインビボ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、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、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（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_{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、(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、(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、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_{15} 及び R_{16} 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、(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_{15} 及び R_{16} が一緒になってオキソを形成し（但し、 R_{16} 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_{17} 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（但し、 R_{17} 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_{18} 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、(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；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]

を含む：化合物。

【請求項 9】

X が、 $-CH_2-$ 及び $-CH_2CH_2-$ 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】

R_4 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】

R_5 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】

Z_1 が CR_6R_7 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】

Z_2 が CR_9R_{10} 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】

R_6 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】

R_7 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】

R_8 が、水素及び置換されているか又は置換されていない、(C_{1-3}) 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】

R_9 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_{1-10}) 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、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

R_{10} 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】

R_{11} が、水素及び置換されているか又は置換されていない、(C_{1-3}) 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】

R_1 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。

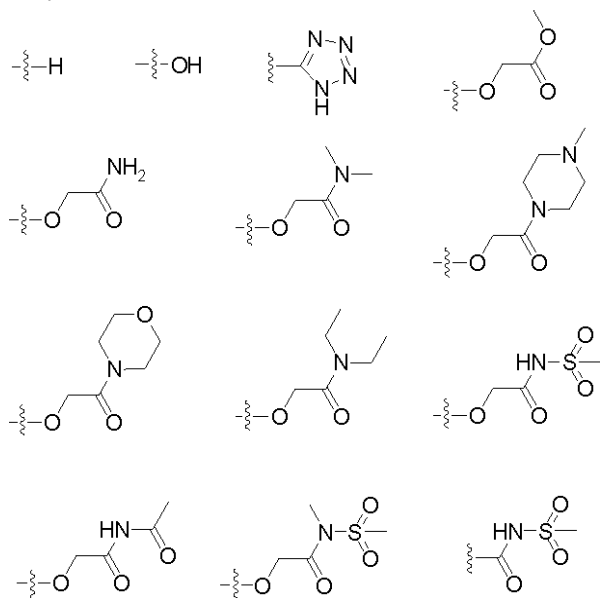
【請求項 21】

R_{12} 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】

R_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 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。

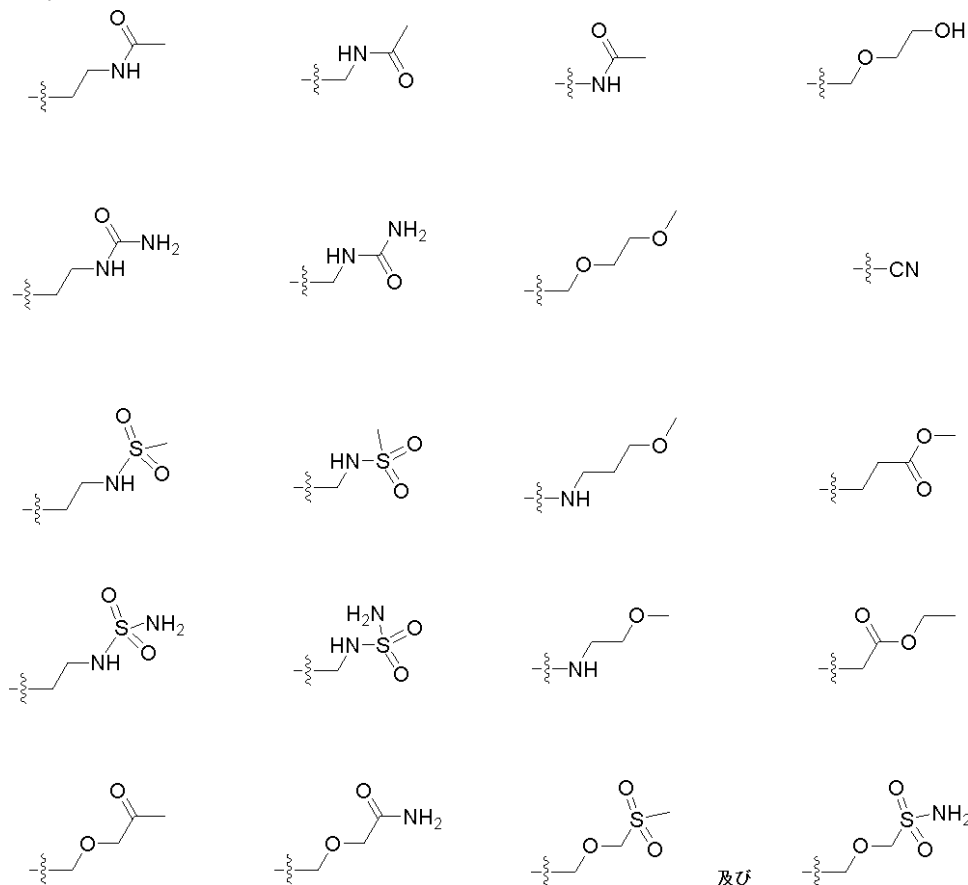
【請求項 24】

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 1 0】



からなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

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 3 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

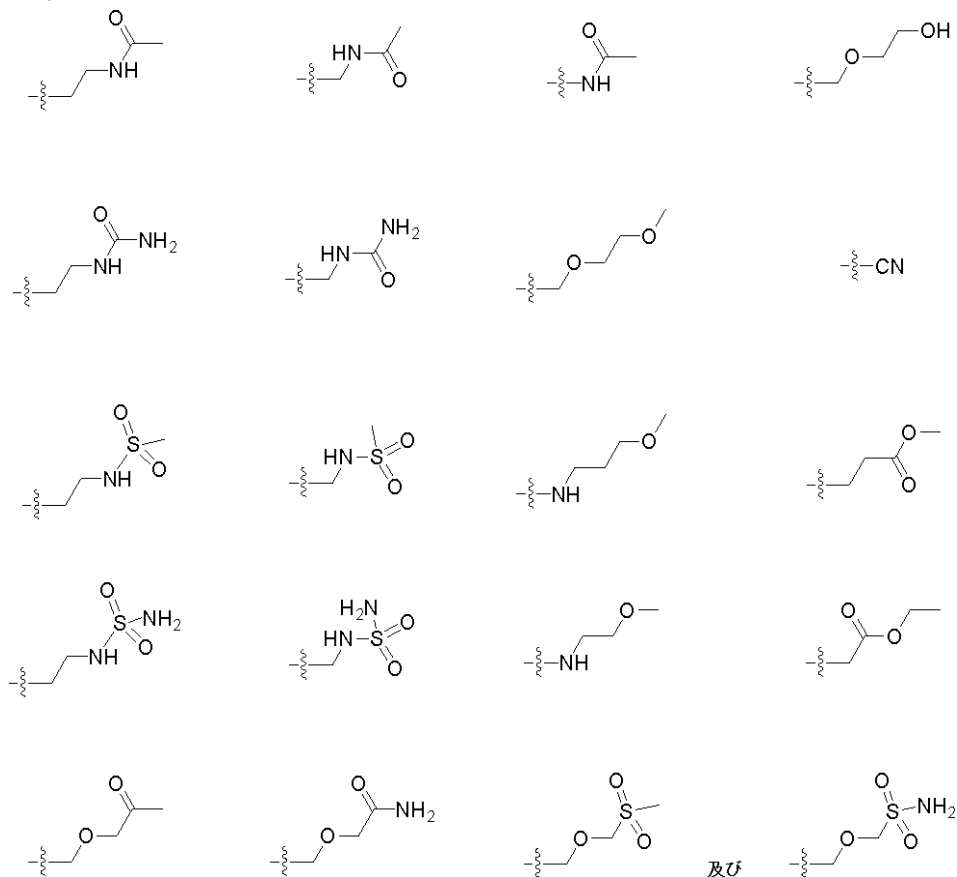
【請求項 2 7】

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、(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、請求項 3 ~ 5 及び 9 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 8】

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 1 1】



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、 $CR_{15}R_{16}$ （式中、 R_{15} 及び R_{16} 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_{1-3}) 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 6 ～ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

R_{15} 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、 (C_{1-3}) 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。

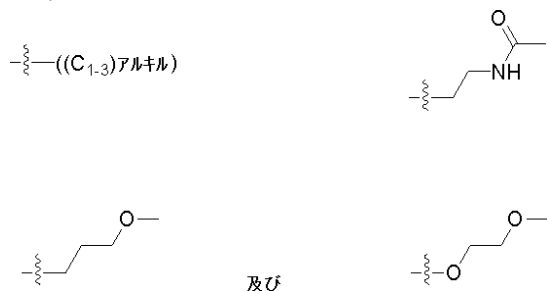
【請求項 31】

R_{16} 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、 (C_{1-3}) 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】

R_{17} が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化 1 2】



からなる群より選ばれる、請求項 6 ~ 3 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 3】

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 8 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 4】

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 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

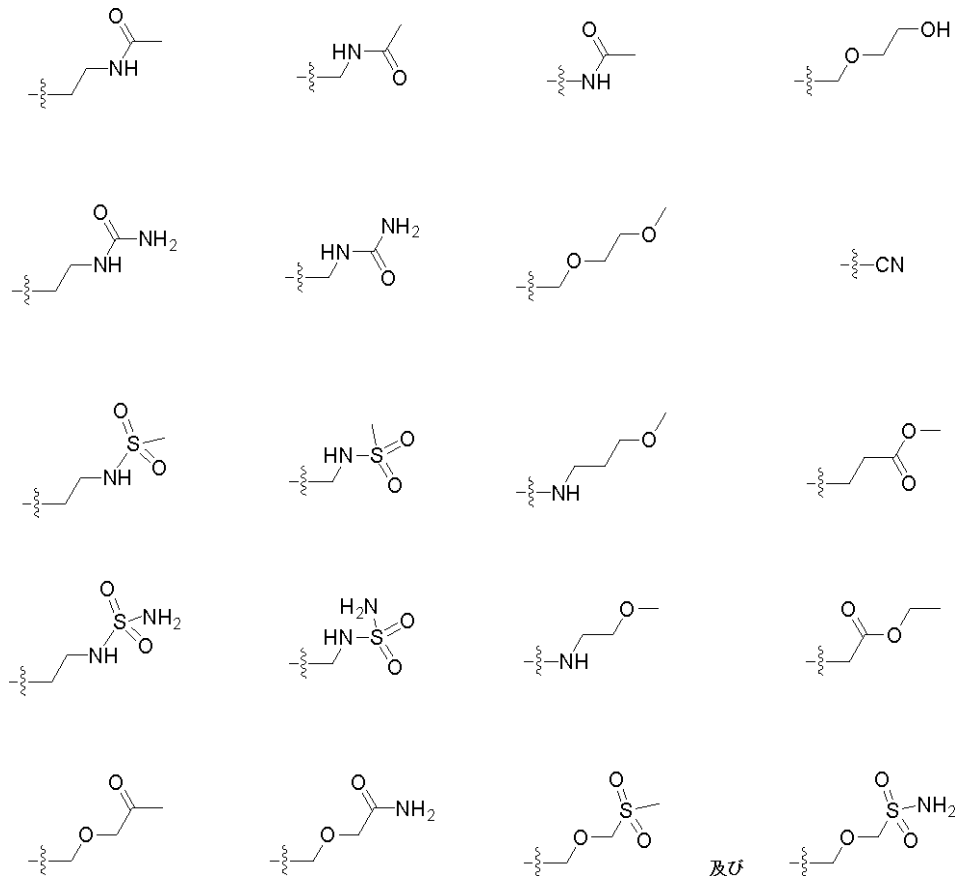
【請求項 3 5】

R₁₄ 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シアルコキシからなる群より選ばれる、請求項 6 ~ 3 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 6】

R₁₄ が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、

【化 1 3】



からなる群より選ばれる、請求項 6 ~ 3 4 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 - ブロモフェノキシ) 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 - 2 H - 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 ;

(R) - N - (3 - (2 - (2 - (3 - (2 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 3 -

オキシプロピル)フェノキシ)フェニル)プロピル)アセトアミド;

(R) - N - (2 - (2 - (3 - (2 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 3 - オキシプロピル)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 - オキシプロピル) - 2 - フェニルシクロヘキサノン;

(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 - オキシプロピル) - 2 H - 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 - オキシプロピル) - 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 - オキシ - 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 - 2 H - 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 - (2 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル)シクロヘキシル)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 - オキシプロピル)フェノキシ)フェニル)プロパンニトリル;

(R) - メチル 3 - (2 - (2 - (3 - (2 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 3 - オキシプロピル)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 - (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 - オキシプロピル)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 - オキシプロピル)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 - オキシプロピル)フェノキシ)フェネチル)アセトアミド ;

(R) - 4 - ((1 - (3 - (2 - (2 - (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 - (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 - オキシプロピル)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 - オキシプロピル)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 - オキシプロピル)フェノキシ)フェニル)プロパンアミド ;

(R) - 1 - (2 - (4 - ((1 H - 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 - (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 - (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 - オキシプロピル)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 - (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 - (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 - (1 H - 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、吸入経路、膈内、眼内、局所送達経路、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 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の化合物である、阻害剤。

【請求項 5 7】

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 ~ 4 2 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 5 8】

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 ~ 4 2 のいずれか 1 項に記載の化合物である、治療剤。

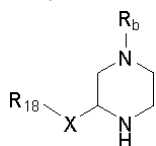
【請求項 5 9】

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 5 7 および 5 8 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 6 0】

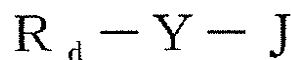
式

【化 1 4】



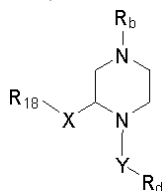
を有する化合物を、式

【化 1 5】



の化合物に、式

【化 1 6】



[式中

J は、脱離基であり；

X は、 $-(C R_4 R_5)_n-$ (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 $-S(O_2)-$ からなる群より選ばれ；

R_b は、R_1、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；

R_1 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；

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；且つ

R_18 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、アリアルオキシ、ヘテロアリアルオキシ、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 - 1 0) アルキル、ハロ (C₁ - 1 0) 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 - 1 0) 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 - 1 0) アルキル、ヘテロアリール (C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール (C₁ - 5) アルキル、ヘテロ (C₈ - 1 2) 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 - 1 2) ビシクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) ビシクロアルキル、(C₄ - 7) アリール、ヘテロ (C₁ - 1 0) アリール、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール及びヘテロ (C₄ - 1 2) 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。

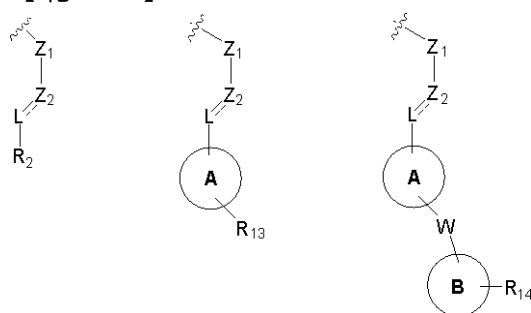
【請求項 6 2】

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、(C₃ - 7) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 7) シクロアルキル、(C₉ - 1 2) ビシクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) ビシクロアルキル、(C₄ - 7) アリール、ヘテロ (C₁ - 1 0) アリール、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール及びヘテロ (C₄ - 1 2) 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 - 1 2) ビシクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) ビシクロアルキル、(C₄ - 7) アリール、ヘテロ (C₁ - 1 0) アリール、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール及びヘテロ (C₄ - 1 2) 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 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、C R₁₅ R₁₆、N R₁₇、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z₁ は、C R₆ R₇ 及び N R₈、O 及び S からなる群より選ばれ；

Z₂ は、C R₉ R₁₀ 及び N R₁₁、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 つ以上の原子と一緒に 3、4、5、6 又は 7 員環を形成し；

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；

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；

R₈ 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)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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；

R₉ 及び R₁₀ 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)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃-7)ビスシクロアルキル、(C₄-7)アリール、ヘテロ(C₁-10)アリール、(C₉-12)ビスシクロアリール及びヘテロ(C₄-12)ビス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、R₉ 及び R₁₀ が一緒になって環を形成し(但し、R₁₀ 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)；

R₁₁ 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)ビスシクロアリール(C₁-5)アルキル、ヘテロ(C₈-12)ビスシクロアリール(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、R₁₁ 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)；

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、(C

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、 (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、 (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；

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、 (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、 (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、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_{15} 及び R_{16} 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、 (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_{15} 及び R_{16} が一緒になってオキソを形成し（但し、 R_{16} 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_{17} 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_{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それぞれ独立して選ばれるか、又は、 R_{17} が一緒になってオキソを形成し（但し、 R_{17} 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

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)

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-CR₁₅R₁₆-、及び-O-、(式中、R₁₅及びR₁₆は、水素、ハロ、ヒドロキシ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)、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(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(C₁₋₅)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。

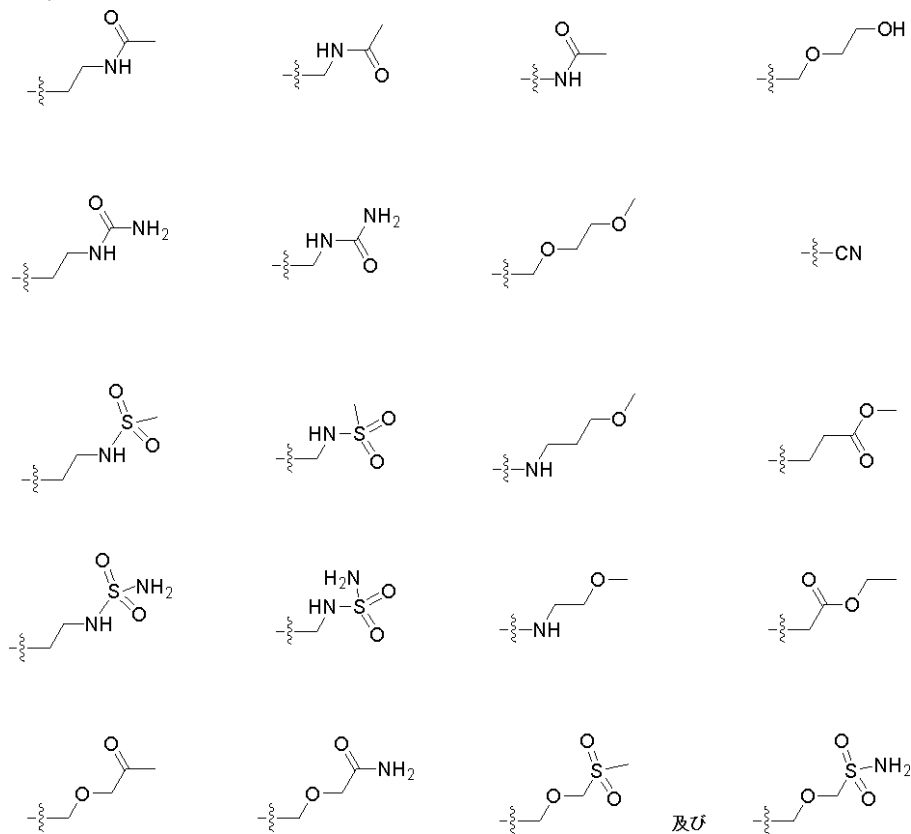
【請求項74】

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、(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 1 8】

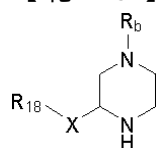


からなる群より選ばれる置換基で置換される、請求項 6 3 ~ 6 4、6 7 ~ 7 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 7 6】

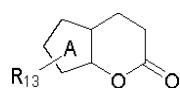
式

【化 1 9】



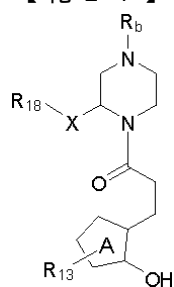
を有する化合物を、式

【化 2 0】



の化合物に、式

【化 2 1】



[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、- (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；

R_b は、R₁、ベンジル及び Boc からなる群より選ばれ；

R₁ は、水素及びインピ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

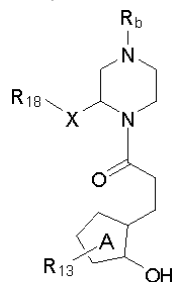
R₁₈ は、それぞれ置換されているか又は置換されていない、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁ - 10)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁ - 10)アルキル、ハロ(C₁ - 10)アルキル、カルボニル(C₁ - 3)アルキル、チオカルボニル(C₁ - 3)アルキル、スルホニル(C₁ - 3)アルキル、スルフィニル(C₁ - 3)アルキル、アミノ(C₁ - 10)アルキル、イミノ(C₁ - 3)アルキル、(C₃ - 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 - 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】

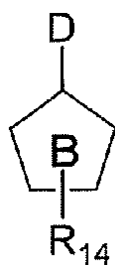
式

【化 2 2】



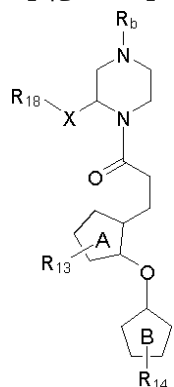
を有する化合物を、式

【化 2 3】



を有するジヒドロクマリン誘導体と、式

【化 2 4】



〔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)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃ - 12)ビスシクロアルキル、(C₄ - 7)アリール、ヘテロ(C₁ - 10)アリール、(C₉ - 12)ビスシクロアリール及びヘテロ(C₄ - 12)ビス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

R₁₄ 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)ビスシクロアリール(C₁ - 5)アルキル、ヘテロ(C₈ - 12

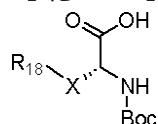
）ビスクロアリール（ C_{1-5} ）アルキル、（ C_{3-7} ）シクロアルキル、ヘテロ（ C_{3-7} ）シクロアルキル、（ C_{9-12} ）ビスクロアルキル、ヘテロ（ C_{3-12} ）ビスクロアルキル、（ C_{4-7} ）アリール、ヘテロ（ C_{1-10} ）アリール、（ C_{9-12} ）ビスクロアリール、ヘテロ（ C_{4-12} ）ビスクロアリール、アミドアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシアルコキシからなる群より選ばれる]

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】

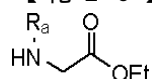
更に：式

【化 2_5】



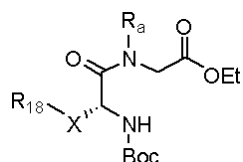
の化合物を、式

【化 2_6】



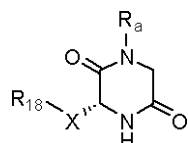
の別の化合物に、式

【化 2_7】



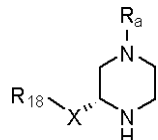
を有する化合物を形成する条件下でカップリングさせ、直上の化合物を環化して式

【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、 R_1 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。

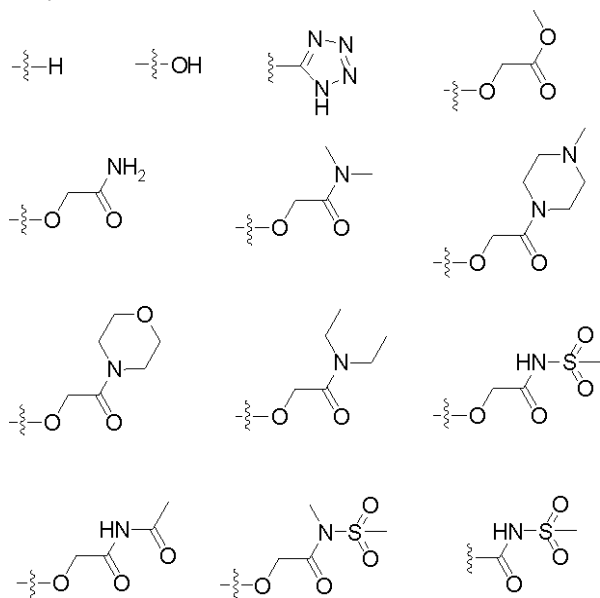
【請求項 7_9】

R_{18} が、それぞれ置換されているか又は置換されていない、（ C_{1-6} ）アルキル、（ C_{3-7} ）シクロアルキル、（ C_{4-7} ）アリール及びヘテロ（ C_{1-5} ）アリールからなる群より選ばれる、請求項 6_0 ~ 7_8 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 8_0】

R_{18} 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。

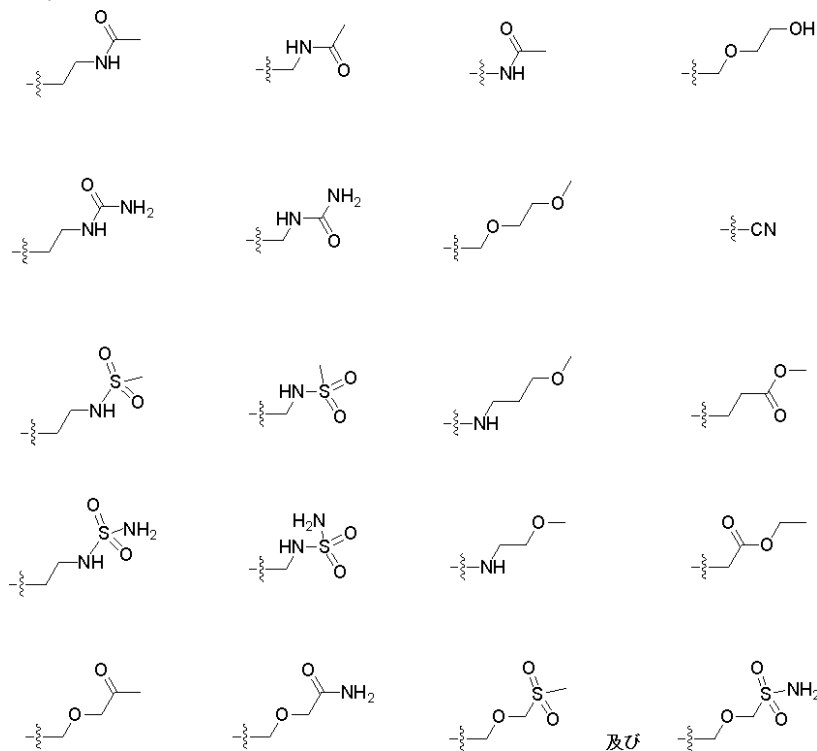
【請求項 8 3】

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 ~ C_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_{1-3} 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 1】



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。

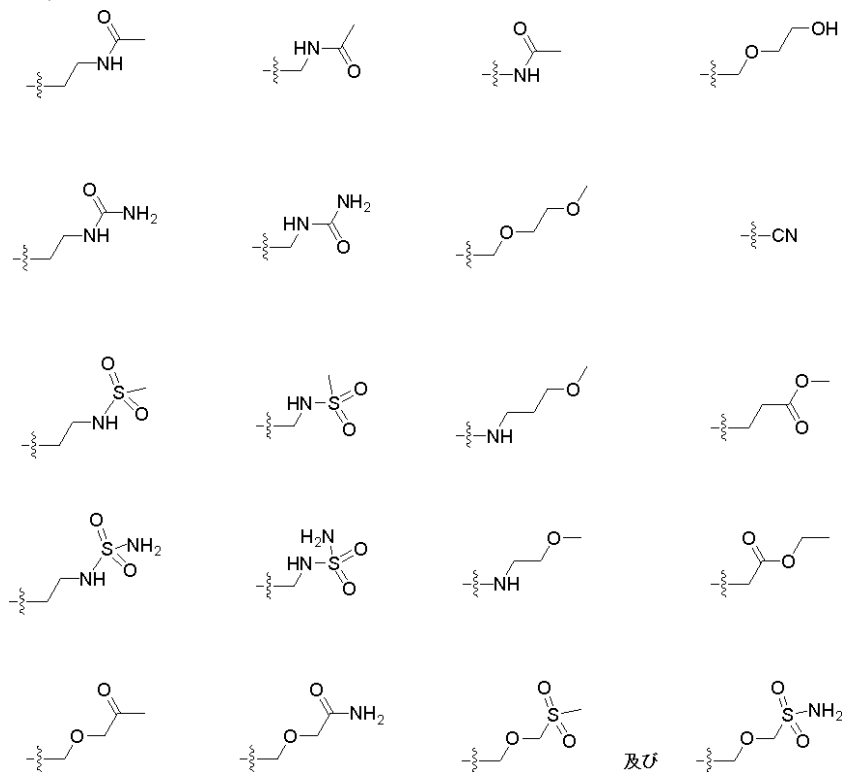
【請求項 8 5】

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 8 6】

R_{1 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 3 2】

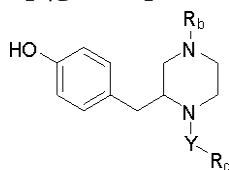


からなる群より選ばれる、請求項 6 3 ~ 8 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 8 7】

式

【化 3 3】



[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 B o c 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

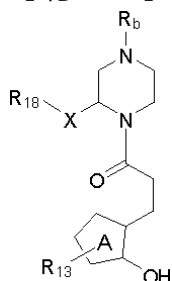
R₁ は、水素及びインビボで水素へと変換可能な置換基からなる群より選ばれる]

の化合物。

【請求項 8 8】

式

【化 3 4】



[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、- (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；

R_b は、R₁、ベンジル及び B o c 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)

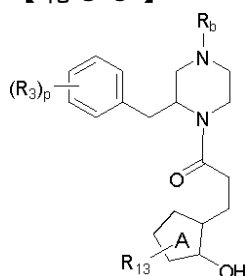
アルキル、(C₉ - 12) ビシクロアリール (C₁ - 5) アルキル、ヘテロ (C₈ - 12) ビシクロアリール (C₁ - 5) アルキル、(C₃ - 7) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 7) シクロアルキル、(C₉ - 12) ビシクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 12) ビシクロアルキル、(C₄ - 7) アリール、ヘテロ (C₁ - 10) アリール、(C₉ - 12) ビシクロアリール及びヘテロ (C₄ - 12) ビシクロアリールからなる群より選ばれ；且つ

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 89】

式

【化 35】



[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、水素及びインピ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

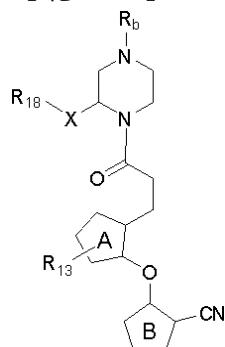
アリール (C₁ - 5) アルキル、(C₃ - 7) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 7) シクロアルキル、(C₉ - 12) ビシクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 12) ビシクロアルキル、(C₄ - 7) アリール、ヘテロ (C₁ - 10) アリール、(C₉ - 12) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄ - 12) ビシクロアリール、アミノカルボニルオキシ及びカルボニルアルコキシからなる群より選ばれ、且つ

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、- (C₄ 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(C₃₋₇)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。

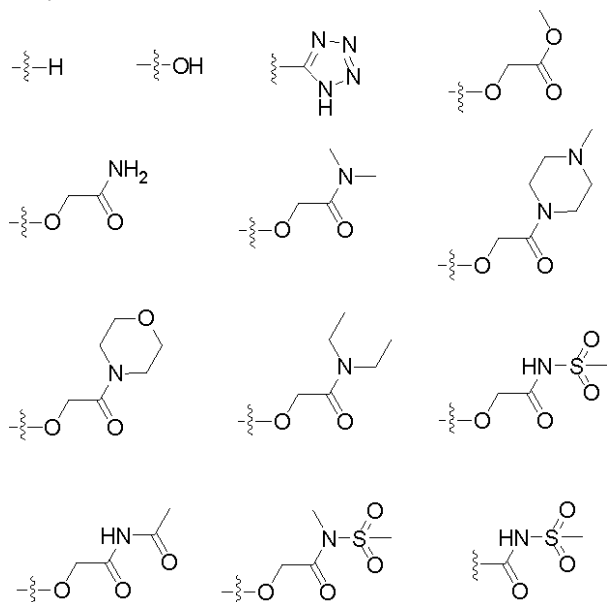
【請求項 9 1】

R₁₈ 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 3 7】



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 9 3】

Y が、 $-\text{C}(\text{O})-$ である、請求項 8 7 に記載の化合物。

【請求項 9 4】

R_1 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。

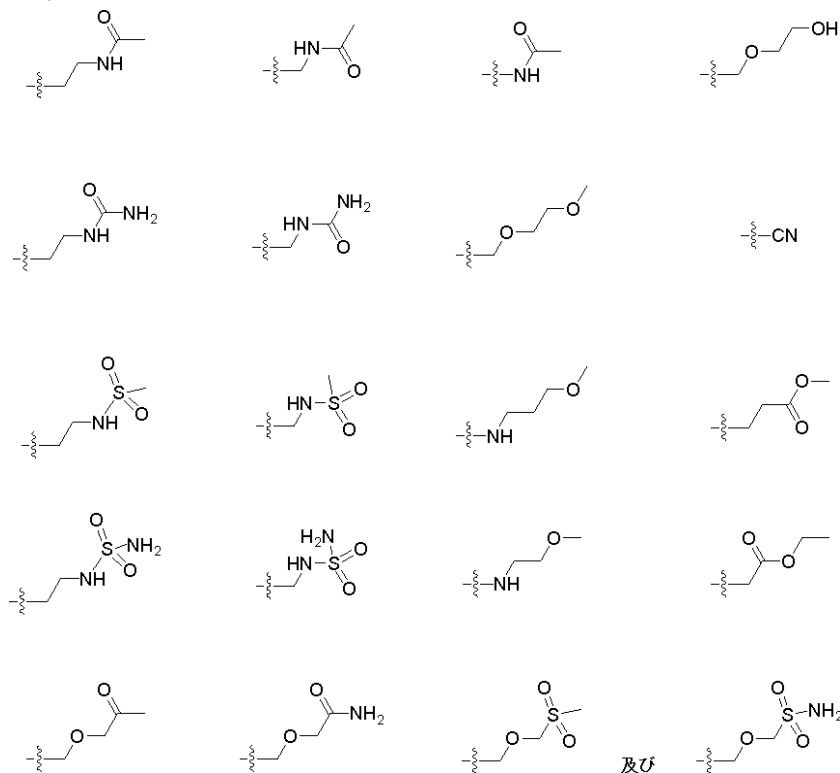
【請求項 9 5】

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 ($\text{C}_1 - 5$) 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 9 6】

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 (C₁ - C₁₀) 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。