

【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24年10月25日(2012.10.25)

【公表番号】特表2012-502927(P2012-502927A)

【公表日】平成24年2月2日(2012.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2012-005

【出願番号】特願2011-527166(P2011-527166)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 11/02	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 7/02	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	1 0 4 A
C 07 D 471/04	C S P
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 11/02	
A 61 P 37/08	
A 61 P 11/06	
A 61 P 11/00	
A 61 P 25/20	
A 61 P 15/00	
A 61 P 7/02	
A 61 P 27/06	
A 61 P 27/02	
A 61 P 9/04	
A 61 P 29/00	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/06	
A 61 P 19/08	
A 61 P 19/10	

A 6 1 P 37/02
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/444
 C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月7日(2012.9.7)

【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

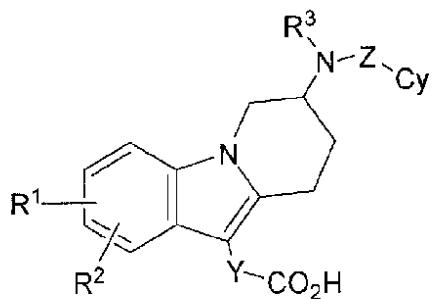
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化1】



I

およびその医薬的に許容される塩(式中：

Yは、-C(R^a)(R^b)-、-C(R^a)(R^b)-C(R^a)(R^b)-、-C(R^a)(R^a)=C(R^b)-、-OCH₂-、-OCH(C₁-₃アルキル)-、-OC(C₁-₃アルキル)₂-、-OC(CH₂)₂-₅-、-SCH₂-、-SCH(C₁-₃アルキル)₂-、-SC(C₁-₃アルキル)₂-および-SC(CH₂)₂-₅-から選択され；

Zは、-C(O)-C(R^d)(R^e)_n-または-C(O)-C(R^f)(R^g)-O-であり、nは、0、1または2であり；

C_yは、アリール、ヘテロアリールまたは場合によりベンゼンに縮合されたC₃-₆シクロアルキルであり、それらのそれぞれは、R^cから独立して選択される1~4個の基によって場合により置換され；

R¹は、H、ハロゲン、-OC₁-₆アルキル、および-C₁-₆アルキルから選択され；

R²は、H、ハロゲン、-C₁-₆アルキル、-OC₁-₆アルキル、-SC₁-₆アルキル、-S(O)C₁-₆アルキル、-S(O)₂C₁-₆アルキル、-CN、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

R³は、H、C₁-₆アルキルおよびそのフェニル部分で1~3個のハロゲンによって場合により置換されたベンジルから選択され；

R^aおよびR^bは独立して、H、アリール、ヘテロアリール、C₁-₆アルキルもしくはハロC₁-₆アルキルであり；または

R^aおよびR^bは、それらの両方が結合する炭素原子と共にC₃-₆シクロアルキル環を形成し；または

R^a および R^b は、それらが結合する隣接する炭素原子と共に C₃ - C₆ シクロアルキル環を形成し；

R^c は、ハロゲン、NR^fR^g、SO₂NR^fR^g、CN、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルキル、ハロC₁ - C₆ アルコキシ、およびハロC₁ - C₆ アルキルから選択され；

R^d および R^e は独立して、水素、C₁ - C₆ アルキル、-C₁ - C₆ アルキル-C₃ - C₆ シクロアルキル、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、R^c から独立して選択される 1 ~ 3 個の基によって場合により置換されたアリール、および NR^fR^g から選択され；または

R^d、R^e は、それらの両方が結合する炭素原子と共に、-O-、-S-、-N(C(O)R^f) - および -N(R^f) - から選択される環ヘテロ原子を場合により有し、1 ~ 3 個の C₁ - C₃ アルキル基によって場合により置換された C₃ - C₆ シクロアルキルを形成し

; または

隣接する炭素原子に結合する R^d、R^e は、それらの両方が結合する炭素原子と共に、-O-、-S-、-N(C(O)R^f) - および -N(R^f) - から選択される環ヘテロ原子を場合により有し、1 ~ 3 個の C₁ - C₃ アルキル基によって場合により置換された C₃ - C₆ シクロアルキルを形成し；および

R^f および R^g は独立して、水素および C₁ - C₃ アルキルから独立して選択され；または

R^f、R^g は、それらの両方が結合する原子と共に、3 ~ 6 員環を形成する)。

【請求項 2】

C_y が R^c から独立して選択される 1 ~ 3 個の基によって場合により置換されたフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Y が -C(R^a)(R^b) - である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

部分 -Z-C_y が -C(O)-C(R^d)(R^e) - フェニルを表し、フェニルがハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、ハロC₁ - C₆ アルキルおよび C₁ - C₆ アルコキシから独立して選択される 1 ~ 2 個の基によって場合により置換された、請求項 1 に記載の化合物。

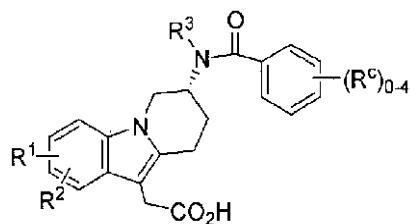
【請求項 5】

-NR³-Z-C_y が結合しているキラル炭素が (R) 立体配置を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

式 Ia を有する請求項 1 に記載の化合物：

【化 2】



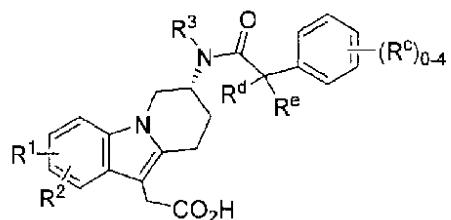
Ia

(式中、R¹、R²、R³、および R^c は、請求項 1 で定義した通りである)。

【請求項 7】

式 Ib を有する請求項 1 に記載の化合物：

【化3】



Ib

(式中、R¹、R²、R³、R^c、R^dおよびR^eは、請求項1で定義した通りである)。

【請求項8】

R^d、R^eおよびそれらの両方が結合する炭素が共に、1または2個のC₁~₃アルキル基によって場合により置換されたC₃~₆炭素環を形成する、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

{(7R)-7-[[(2-(4-フルオロフェニル)プロパノイル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(4-フルオロフェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(4-フルオロベンジル)[(4-フルオロフェニル)アセチル]アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 [(7R)-7-({[1-(4-フルオロフェニル)シクロペンチル]カルボニル} アミノ)-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル]酢酸；
 {(7R)-7-[({[1-(4-フルオロフェニル)シクロペンチル]カルボニル} (メチル)アミノ)-6,7,8,9-テトラヒドロ-ピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(2-(4-フルオロフェニル)-2-メチルプロパノイル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(2,4-ジフルオロフェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(2-クロロ-4-フルオロフェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(3-クロロ-4-フルオロフェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(4-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロ-ピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル)アセチル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロ-ピリド[1,2-]インドール-10-イル}酢酸；
 {(7R)-7-[(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルカルボニル](メチル)アミノ]-6,7,8,9-テトラヒドロピリド[1,2-]インドール-1

0 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [[4 - (ジフルオロメチル) - 3 - ヨードベンゾイル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] - インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [[(2 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) プロパノイル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [(4 - フルオロベンゾイル) (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [(シクロペンチルカルボニル) (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [(シクロプロピルカルボニル) (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

((7 R) - 7 - { メチル [(5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル) カルボニル] アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

(7 R) - 7 - [[(4 - クロロフェニル) アセチル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - クロロフェニル) シクロペンチル] カルボニル } (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [(4 - メトキシフェニル) アセチル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [メチル (フエノキシアセチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [メチル (フエニルアセチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [メチル (2 - ナフトイル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;

{ (7 R) - 7 - [[(3 , 4 - ジフルオロフェニル) アセチル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [(2 , 2 - ジメチル - 3 - フエニルプロパノイル) (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

[(7 R) - 7 - (メチル { [4 - (トリフルオロメチル) フエニル] アセチル } アミノ) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル] 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [メチル (1 - ナフチルアセチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [メチル (3 - フエニルプロパノイル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

((7 R) - 7 - { メチル [2 - フエニルプロパノイル] アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) シクロプロピル] カルボニル } (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) シクロブチル] カルボニル } (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 醋酸 ;

{ (7 R) - 7 - [[2 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - ピペリジン - 1 - イルアセ

チル] (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [[(2 - プロモ-4 - フルオロフェニル)アセチル] (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロピル] カルボニル} (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [[-2 - メトキシ-2 - フェニルアセチル] (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [メチル- (2 - チオフェン-2 - イル-アセチル) - アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} - 酢酸;

{ (7R) - 7 - [メチル- (2 - チオフェン-3 - イル-アセチル) - アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} - 酢酸;

((7R) - 7 - { [2, 2 - ビス- (4 - フルオロ-フェニル) - アセチル] - メチル-アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] - インドール-10-イル) - 酢酸;

{ (7R) - 7 - [(ジフェニルアセチル) (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [(ジフェニルアセチル) (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

((7R) - 7 - { メチル- [2 - (2 - メチル-チアゾール-4 - イル) - アセチル] - アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル) - 酢酸;

((7R) - 7 - { [2 - (3, 5 - ジメチル-イソオキサゾール-4 - イル) - アセチル] - メチル-アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル) - 酢酸;

((7R) - 7 - { [2 - エチル-2 - (4 - フルオロ-フェニル) - ブチリル] - メチル-アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル) - 酢酸;

{ { 7R) - 7 - { [3 - シクロプロピル-2 - (4 - フルオロ-フェニル) - ブロピオニル] - メチル-アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} - 酢酸;

[(7R) - 7 - { [(2R) - 2 - ヒドロキシ-2 - フェニルプロパンイル] (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] - インドール-10-イル] 酢酸;

[(7R) - 7 - { [(2S) - 2 - ヒドロキシ-2 - フェニルプロパンイル] (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] - インドール-10-イル] 酢酸;

((7R) - 7 - { エチル- [1 - (4 - フルオロ-フェニル) - シクロプロパンカルボニル] - アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル) - 酢酸;

[(7R) - 7 - (メチル { [2 - (ピリジン-4 - イル)シクロプロピル] カルボニル} アミノ) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] - インドール-10-イル] 酢酸;

{ (7R) - 7 - [(ビシクロ[4.2.0]オクタ-1, 3, 5 - トリエン-7 - イルカルボニル) (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ-ピリド[1, 2 -] インドール-10-イル} 酢酸;

{ (7R) - 7 - [(イミダゾ[1, 2 -]ピリジン-3 - イルアセチル) (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[1, 2 -] インドール-10 - イ

ル } 酢酸 ;

[(7 S) - 7 - { [(4 - フルオロフェニル) アセチル] (メチル) アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル] 酢酸 ;
 ((7 R) - 7 - { [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - カルボニル] - メチル - アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) - 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [(2 - メトキシ - 2 - フェニル - アセチル) - メチル - アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 酢酸 ;
 [(7 R) - 7 - { メチル [(2 R または 2 S) - 2 - フェニルプロパノイル] アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル] 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [メチル - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - カルボニル) - アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 酢酸 ;
 ((7 R) - 7 - { [2 - (4 - ジメチルアミノ - フェニル) - アセチル] - メチル - アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) - 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [(2 - シクロペンチル - アセチル) - メチル - アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 酢酸 ;
 ((7 R) - 7 - { メチル - [3 - (ピペリジン - 1 - スルホニル) - ベンゾイル] - アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) - 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [メチル - (2 - ピリジン - 2 - イル - プロピオニル) - アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } - 酢酸 ; および
 ((7 R) - 4 - フルオロ - 7 - { [(2 R または 2 S) - 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオニル] - メチル - アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) - 酢酸 ;

からなる群より選択される請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 10】

{ (7 R) - 7 - [[2 - (4 - フルオロフェニル) プロパノイル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;
 ((7 R) - 7 - { (4 - フルオロベンジル) [(4 - フルオロフェニル) アセチル] アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) シクロペンチル] カルボニル } (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [[2 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチルプロパノイル] (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - クロロフェニル) シクロペンチル] カルボニル } (メチル) アミノ] - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - ピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル } 酢酸 ;
 ((7 R) - 7 - { メチル [2 - フェニルプロパノイル] アミノ } - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロピリド [1 , 2 -] インドール - 10 - イル) 酢酸 ;
 { (7 R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) シクロプロピル] カルボニル }

(メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ - ピリド [1, 2 -] インドール - 10 - イル} 酢酸；

{ (7R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) シクロプロチル] カルボニル} (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド [1, 2 -] インドール - 10 - イル} 酢酸；および

{ (7R) - 7 - [{ [1 - (4 - フルオロフェニル) - 2, 2 - ジメチルシクロプロピル] カルボニル} (メチル)アミノ] - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド [1, 2 -] インドール - 10 - イル} 酢酸；

からなる群より選択される請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 11】

請求項 1 の化合物の治療的有効量および医薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 12】

C R T H 2 介在疾患の治療または予防のための医薬品の製造における請求項 1 の化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 9】

およびその医薬的に許容される塩を含み、式中：

Y は、 - C (R^a) (R^b) - 、 - C (R^a) (R^b) - C (R^a) (R^b) - 、 - C (R^a) = C (R^b) - 、 - OCH₂ - 、 - OCH (C₁ - 3 アルキル) - 、 - OC (C₁ - 3 アルキル) - 、 - OC (C₁ - 3 アルキル) - 、 - SC (C₁ - 5) - 、 - SCH₂ - 、 - SCH (C₁ - 3 アルキル) - 、 - SC (C₁ - 3 アルキル) - および - SC (C₁ - 5) - から選択され；

Z は、 - C (O) - (C (R^d) (R^e))_n - または - C (O) - C (R^f) (R^g) - O - であり、n は、0、1 または 2 であり；

C_y は、アリール、ヘテロアリールまたは場合によりベンゼンに縮合された C₃ - 6 シクロアルキルであり、それらのそれぞれは、R^c から独立して選択される 1 ~ 4 個の基によって場合により置換され；

R¹ は、H、ハロゲン、-OC₁ - 6 アルキル、および - C₁ - 6 アルキルから選択され；

R² は、H、ハロゲン、-C₁ - 6 アルキル、-OC₁ - 6 アルキル、-SC₁ - 6 アルキル、-S (O) C₁ - 6 アルキル、-S (O) ₂ C₁ - 6 アルキル、-CN、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

R³ は、H、C₁ - 6 アルキルおよびフェニル部で 1 ~ 3 個のハロゲンによって場合により置換されたベンジルから選択され；

R^a および R^b は独立して、H、アリール、ヘテロアリール、C₁ - 6 アルキルもしくはハロ C₁ - 6 アルキルであり；または

R^a および R^b は、それらの両方が結合する炭素原子と共に C₃ - 6 シクロアルキル環を形成し；または

R^a および R^b は、それらが結合する隣接する炭素原子と共に C₃ - 6 シクロアルキル環を形成し；

R^c は、ハロゲン、NR^f R^g、SO₂ NR^f R^g、CN、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキル、ハロ C₁ - 6 アルコキシ、およびハロ C₁ - 6 アルキルから選択され；

R^d および R^e は、水素、C₁ - 6 アルキル、-C₁ - 6 アルキル - C₃ - 6 シクロアルキル、ヒドロキシ、C₁ - 6 アルコキシ、NR^f R^g、および場合により置換された 1 ~ 3 個の基によって独立して場合により置換されたアリールから選択され；または

R^d 、 R^e は、それらの両方が結合する炭素原子と共に、-O-、-S-、-N(C(O)R^f)-および-N(R^f)-から選択される環ヘテロ原子を場合により有し、1~3個のC_{1~3}アルキル基によって場合により置換されたC_{3~6}シクロアルキルを形成し；または

隣接する炭素原子に結合する R^d 、 R^e は、それらが結合する炭素原子と共に、-O-、-S-、-N(C(O)R^f)-および-N(R^f)-から選択される環ヘテロ原子を場合により有し、1~3個のC_{1~3}アルキル基によって場合により置換されたC_{3~6}シクロアルキルを形成し；および

R^f および R^g は独立して、水素およびC_{1~3}アルキルから選択され；または R^f 、 R^g は、それらの両方が結合する原子と共に、3~6員環を形成する。