

【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

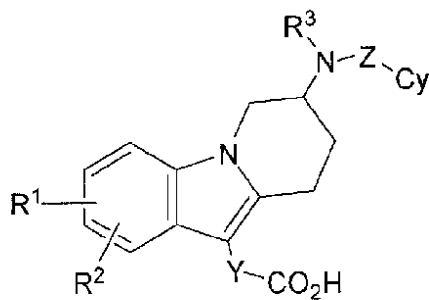
【補正の内容】

【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、 $-C(R^a)(R^b)-$ 、 $-C(R^a)(R^b)-C(R^a)(R^b)-$ 、 $-C(R^a)=C(R^b)-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-OCH(C_{1-3}\text{アルキル})-$ 、 $-OC(C_{1-3}\text{アルキル})_2-$ 、 $-OC(CH_2)_2-5-$ 、 $-SCH_2-$ 、 $-SCH(C_{1-3}\text{アルキル})-$ 、 $-SC(C_{1-3}\text{アルキル})_2-$ および $-SC(CH_2)_2-5-$ 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 C_{3-6} 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；

R^1 は、H、ハロゲン、 $-OC_{1-6}\text{アルキル}$ 、および $-C_{1-6}\text{アルキル}$ から選択され；

R^2 は、H、ハロゲン、 $-C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-OC_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-SC_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-S(O)C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-S(O)_2C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-CN$ 、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

R^3 は、H、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 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、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ もしくは $HOC_{1-6}\text{アルキル}$ 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 C_{3-6} 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 $C_3 - 6$ シクロアルキル環を形成し；

R^c は、ハロゲン、 $NR^f R^g$ 、 $SO_2 NR^f R^g$ 、 CN 、 $C_1 - 6$ アルコキシ、 $C_1 - 6$ アルキル、ハロ $C_1 - 6$ アルコキシ、およびハロ $C_1 - 6$ アルキルから選択され；

R^d および R^e は独立して、水素、 $C_1 - 6$ アルキル、 $-C_1 - 6$ アルキル- $C_3 - 6$ シクロアルキル、ヒドロキシ、 $C_1 - 6$ 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 $NR^f R^g$ 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 $C_1 - 3$ 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；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、 $C_1 - 6$ アルキル、ハロ $C_1 - 6$ アルキルおよび $C_1 - 6$ 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。

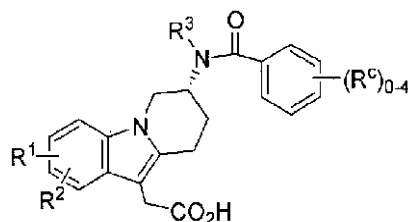
【請求項 5】

$-NR^3-Z-C_y$ 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 I a を有する請求項 1 に記載の化合物：

【化 2】



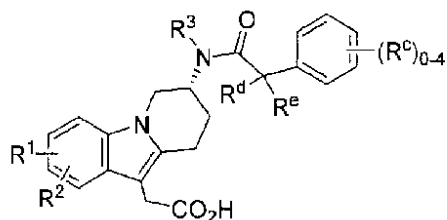
Ia

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、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 I b を有する請求項 1 に記載の化合物：

【化 3】



Ib

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 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 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} 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；

{ (7R) - 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；

{ (7R) - 7 - [[(2 - (2 - ブロモ - 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；

{ (7R) - 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；

{ (7R) - 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；

{ (7R) - 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；

((7R) - 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；

((7R) - 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} - 酢酸；

{ (7R) - 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；

{ (7R) - 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} - 酢酸；

{ (7R) - 7 - [メチル (フェノキシアセチル) 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；

{ (7R) - 7 - [メチル (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 - [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；

{ (7R) - 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} 酢酸；

{ (7R) - 7 - [(2, 2 - ジメチル - 3 - 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 - (メチル { [4 - (トリフルオロメチル) 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 - [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} 酢酸；

{ (7R) - 7 - [メチル (3 - 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；

((7R) - 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；

{ (7R) - 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} 酢酸；

{ (7R) - 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 - ブロモ - 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) - 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;

[(7R) - 7 - { [(2R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - 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 - { [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 2 - 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 - { 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

ル}酢酸；

[(7S)-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-(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；

{(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[(2Rまたは2S)-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；

{(7R)-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；

((7R)-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；

{(7R)-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；

((7R)-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；

{(7R)-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

((7R)-4-フルオロ-7-{[(2Rまたは2S)-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】

{(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](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-[[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；

((7R)-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；

{(7R)-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 ;

{ (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} 酢酸 ; および

{ (7 R) - 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】0009

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0009】

およびその医薬的に許容される塩を含み、式中：

Y は、 $-C(R^a)(R^b)-$ 、 $-C(R^a)(R^b)-C(R^a)(R^b)-$ 、 $-C(R^a)(R^b)=C(R^b)-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-OCH(C_{1-3} \text{ アルキル})-$ 、 $-OC(C_{1-3} \text{ アルキル})_2-$ 、 $-OC(CH_2)_2-$ 、 $-SCH_2-$ 、 $-SCH(C_{1-3} \text{ アルキル})-$ 、 $-SC(C_{1-3} \text{ アルキル})_2-$ および $-SC(CH_2)_2-$ 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 C_{3-6} 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；

R^1 は、H、ハロゲン、 $-OC_{1-6} \text{ アルキル}$ 、および $-C_{1-6} \text{ アルキル}$ から選択され；

R^2 は、H、ハロゲン、 $-C_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-OC_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-SC_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-S(O)C_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-S(O)_2C_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-CN$ 、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

R^3 は、H、 $C_{1-6} \text{ アルキル}$ 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、 $C_{1-6} \text{ アルキル}$ もしくはハロ $C_{1-6} \text{ アルキル}$ 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 C_{3-6} 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 C_{3-6} シクロアルキル環を形成し；

R^c は、ハロゲン、 NR^fR^g 、 $SO_2NR^fR^g$ 、 CN 、 $C_{1-6} \text{ アルコキシ}$ 、 $C_{1-6} \text{ アルキル}$ 、ハロ $C_{1-6} \text{ アルコキシ}$ 、およびハロ $C_{1-6} \text{ アルキル}$ から選択され；

R^d および R^e は、水素、 $C_{1-6} \text{ アルキル}$ 、 $-C_{1-6} \text{ アルキル}-C_{3-6} \text{ シクロアルキル}$ 、ヒドロキシ、 $C_{1-6} \text{ アルコキシ}$ 、 NR^fR^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。