

【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21年9月24日(2009.9.24)

【公表番号】特表2009-505962(P2009-505962A)

【公表日】平成21年2月12日(2009.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-006

【出願番号】特願2008-524274(P2008-524274)

【国際特許分類】

C 0 7 C 275/42	(2006.01)
C 0 7 C 237/42	(2006.01)
C 0 7 C 311/46	(2006.01)
A 6 1 K 45/00	(2006.01)
A 6 1 K 45/06	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 1/06	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/00	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
C 0 7 D 211/60	(2006.01)
A 6 1 K 31/445	(2006.01)
A 6 1 K 31/17	(2006.01)
A 6 1 K 31/167	(2006.01)
C 0 7 D 207/16	(2006.01)
A 6 1 K 31/401	(2006.01)
C 0 7 D 209/08	(2006.01)
A 6 1 K 31/404	(2006.01)
C 0 7 D 209/42	(2006.01)
C 0 7 D 307/85	(2006.01)
A 6 1 K 31/343	(2006.01)
A 6 1 K 31/18	(2006.01)

【F I】

C 0 7 C 275/42	C S P
C 0 7 C 237/42	
C 0 7 C 311/46	
A 6 1 K 45/00	
A 6 1 K 45/06	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 1/06	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 3/00	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 3/10	

A	6	1	P	9/10
A	6	1	P	9/12
C	0	7	D	211/60
A	6	1	K	31/445
A	6	1	K	31/17
A	6	1	K	31/167
C	0	7	D	207/16
A	6	1	K	31/401
C	0	7	D	209/08
A	6	1	K	31/404
C	0	7	D	209/42
C	0	7	D	307/85
A	6	1	K	31/343
A	6	1	K	31/18

【手續補正書】

【提出日】平成21年8月4日(2009.8.4)

【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

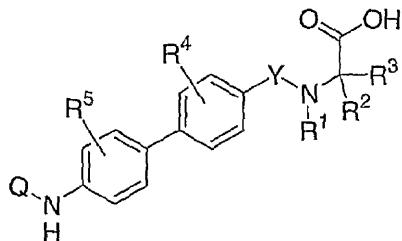
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ⅰ)がN-[4'-(2-メトキシ-アセチルアミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]-カルボニル]-L-フェニルアラニンではないことを条件として、式(Ⅰ)

【化 1】



(1)

{式中、

Y は、 C = 0 または S (= 0) , であり ;

R^1 が水素または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^2 が $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヒドロキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキルまたはビス [$(C_1 - C_6)$ アルキル] アミノ- $(C_1 - C_6)$ アルキルであり：

R^3 が水素であるか；或は

R^1 が水素または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^2 が $R^6 (CH_3)_m$

「ここで、

これは、0 から 3 であり、

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい。

エニルであるか、或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

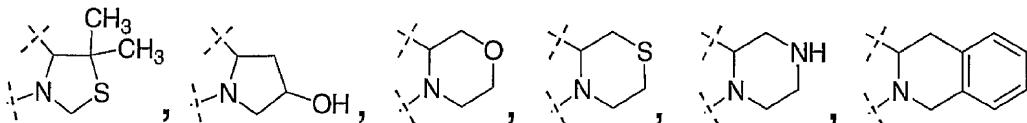
R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²およびR³が同じで、各々が(C₁ - C₆)アルキルから選択されるか；或はR²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか、或は

【化2】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵は、独立して、水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Qは、R⁷ - C(=O) -

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルであるか、或は

R⁷は、R⁸(CH₂)_n

[ここで、

nは、0から3であり、

R⁸は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R⁸は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R⁷は、R¹⁰C(R⁹)₂

[ここで、

R⁹は、メチルまたはエチルであるか、或は

C(R⁹)₂が1,1-シクロプロピル、1,1-シクロブチル、1,1-シクロペンチルまたは1,1-シクロヘキシリル環であり、

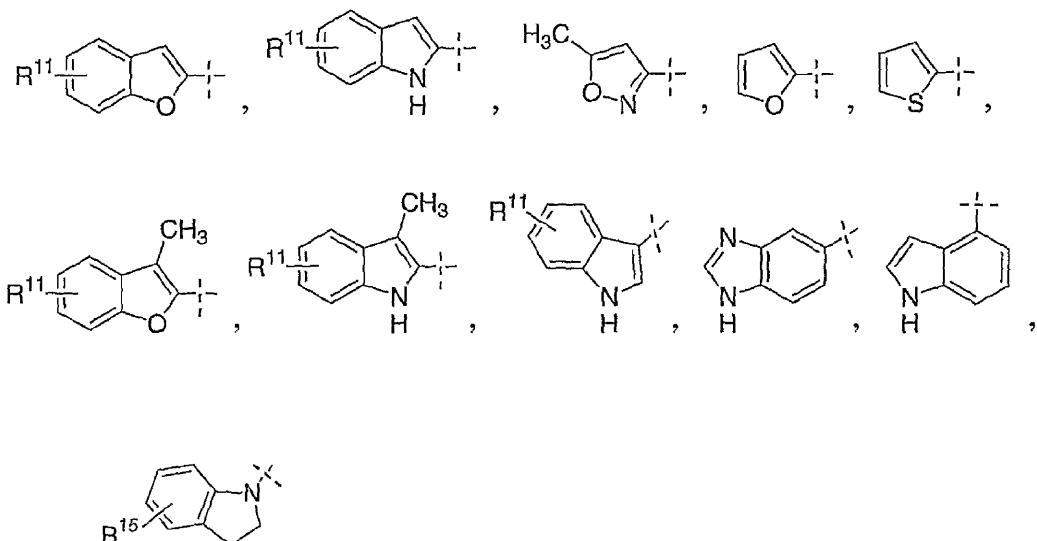
R¹⁰は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁰は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R⁷は、下記

【化3】



(ここで、

R¹¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択されるフラグメント基である]

であるか；或は

Qは、R¹³ - N (R¹²) - C (= O) - ,

[ここで、

R¹²は、水素または(C₁ - C₆)アルキルであり、

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R¹³は、R¹⁷ (C H₂)_p

(ここで、

pは、0から3であり、

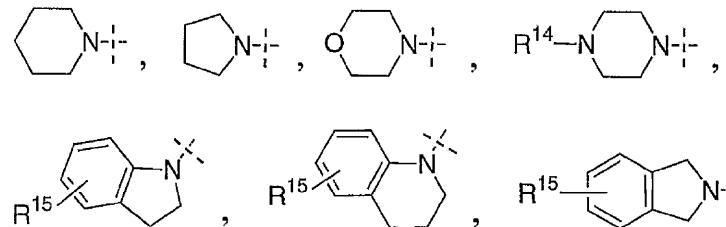
R¹⁷は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁷は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R¹²とR¹³これらが結合している窒素原子が下記

【化4】



(ここで、

R¹⁴は、(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R¹⁴は、R¹⁶ (C H₂)_qであり、ここで、

qは0または1であり、

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり、

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択される環フラグメントを形成している]

である}

で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項2】

YがC=Oであり；

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²が(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキル、アミノ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ-(C₁ - C₆)アルキルまたはビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノ-(C₁ - C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²がR⁶(CH₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり，

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり、

R³が水素であるか；或は

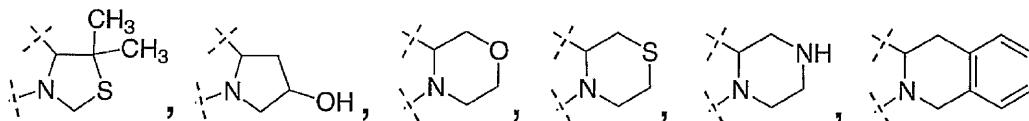
R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²とR³が同じで、各々が(C₁ - C₆)アルキルから選択されるか；或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化5】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり、

R⁴とR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR⁷-C(=O)-

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルで

あるか、或は

R^7 は、 $R^8 (C_2H_2)_n$

[ここで、

n は、0から3であり、

R^8 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、 $R^{10}C(R^9)_2$ 、

[ここで、

R^9 は、メチルまたはエチルであるか、或は

$C(R^9)_2$ が1,1-シクロプロピル、1,1-シクロブチル、1,1-シクロペンチルまたは1,1-シクロヘキシル環であり、

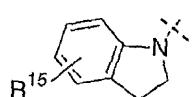
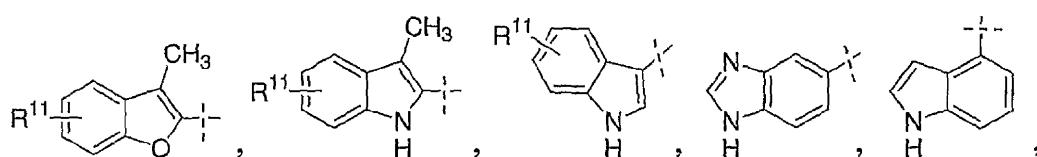
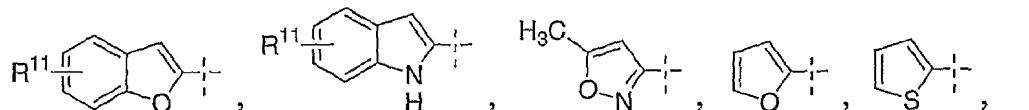
R^{10} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^{10} は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、下記

【化6】



[ここで、

R^{11} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択されるフラグメント基である]

であるか、或は

Q が $R^{13}-N(R^{12})-C(=O)-$

[ここで、

R^{12} は、水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり、

R^{13} は、場合により、1個以上のヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルコキシ、ビス[$(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい($C_1 - C_6$)アルキル

であるか；或は

R^{13} は、 $R^{17} (C_2H_2)_p$

[ここで、

p は、0から3であり、

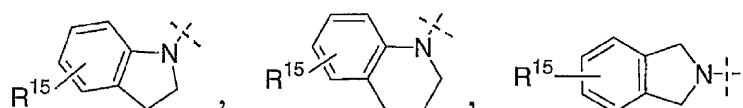
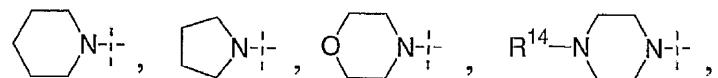
R^{17} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^{17} は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^{12} と R^{13} とこれらが結合している窒素原子が下記

【化7】



[ここで、

R^{14} は、($C_1 - C_6$)アルキルであるか；或は

R^{14} は、 $R^{16} (C_2H_2)_q$ であり、ここで、

q は、0または1であり、

R^{16} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^{16} は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり、

R^{15} は、ハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項3】

Y が $S(=O)_2$ であり、

R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 が($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ- ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ- ($C_1 - C_6$)アルキル、アミノ- ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルキルアミノ- ($C_1 - C_6$)アルキルまたはビス[($C_1 - C_6$)アルキル]アミノ- ($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^3 が水素であるか；或は

R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 が $R^6 (C_2H_2)_m$ 、

[ここで、

m は、0から3であり、

R^6 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^6 は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ

、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである】

であり、

R³が水素であるか；或は

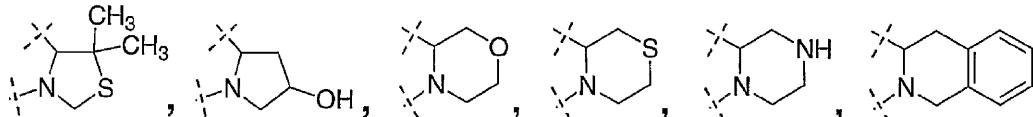
R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²とR³が同じで、各々が(C₁-C₆)アルキルから選択されるか；或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか、或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化8】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR⁷-C(=O)-

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか、或は

R⁷は、R⁸(CH₂)_n

[ここで、

nは、0から3であり、

R⁸は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R⁸は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか、或は

R⁷は、R¹⁰C(R⁹)₂

[ここで、

R⁹は、メチルまたはエチルであるか、或は

C(R⁹)₂が1,1-シクロプロピル、1,1-シクロブチル、1,1-シクロペンチルまたは1,1-シクロヘキシル環であり、

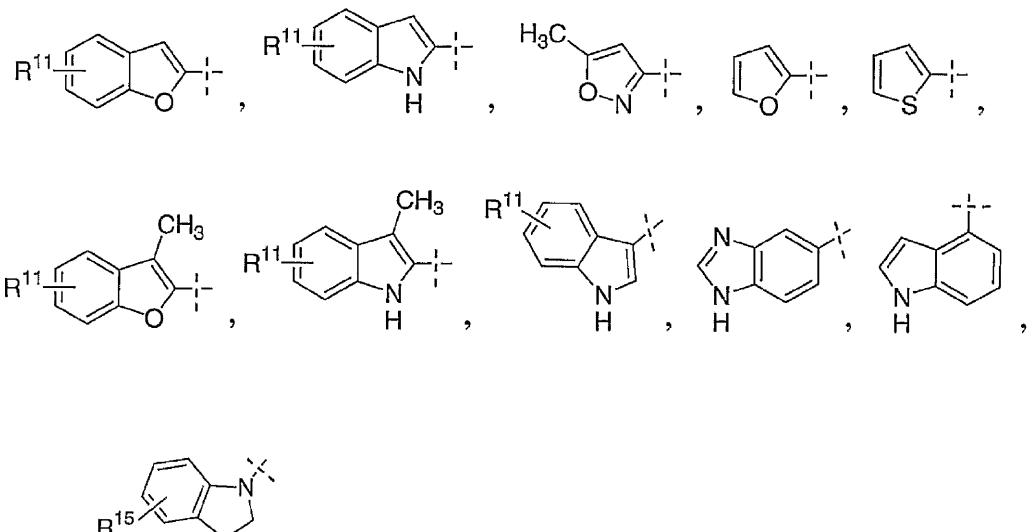
R¹⁰は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁰は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか、或は

R⁷は、下記

【化 9】



(ここで、

R¹¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択されるフラグメント基である]

であるか、或は

$$O \in \mathbb{R}^{13} = N(\mathbb{R}^{12}) = C(=O) = \dots$$

「 で で で

B^{12} は、水素または($C_1 - C_2$)アルキルであり

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R^{13} は、 $R^{17}(CH_3)_n$

(て て)

これは 0 から 3 であり

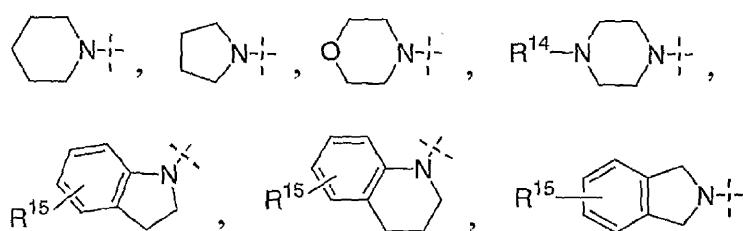
R^{17} は、場合により、1 個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてよいフェニルであるか、或は

R^{17} は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい 2 - ピリジニル、3 - ピリジニルまたは 4 - ピリジニルである)

であるか・或は

B^{12} と B^{13} とこれらが結合している窒素原子が下記

【化 10】



(ここで、

R¹⁴は、(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R^{14} は、 $R^{16}(CH_2)_n$ であり、ここで、

q は、0 または 1 である。

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり、

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項4】

YがC=OまたはS(=O)₂であり、

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり、

R²が(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキル、アミノ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ-(C₁ - C₆)アルキルまたはビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノ-(C₁ - C₆)アルキルであり、

R³が水素であるか、或は

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり、

R²がR⁶(CH₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり、

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり、

R³が水素であるか、或は

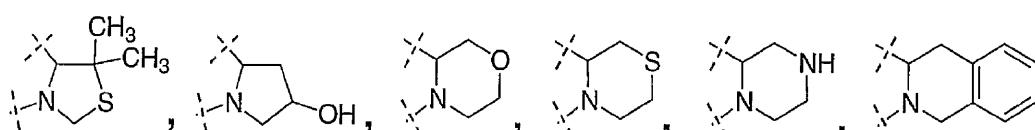
R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり、

R²およびR³が同じで、各々が(C₁ - C₆)アルキルから選択されるか、或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか、或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか、或は下記

【化11】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり、

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され、

QがR⁷-C(=O)-

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルで

あるか、或は

R⁷ は、R⁸(CH₂)_n

(ここで、

n は、0 から 3 であり、

R⁸は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、 $R^{10}C(R^9)_2$

(ここで、

R⁹は、メチルまたはエチルであるか、或は

$C_2(R^9)$ が $1,1$ -シクロプロピル, $1,1$ -シクロブチル, $1,1$ -シクロペンチルまたは $1,1$ -シクロヘキシル環であり,

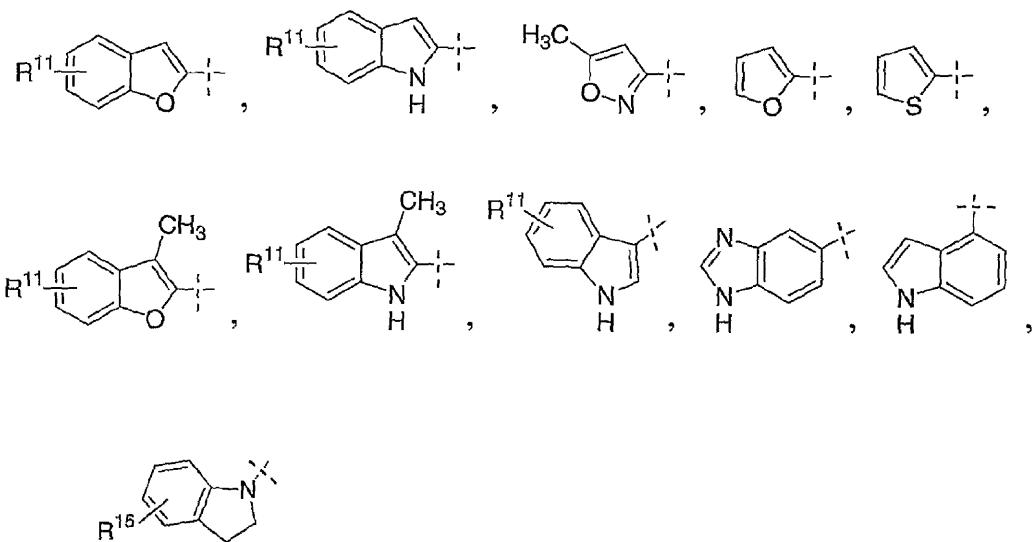
R^{10} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁰は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか：或は

R^7 は、下記

【化 1 2】



(ここで、

R^{11} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される 1 個以上の置換基である) から選択されるフラグメント基である]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項5】

Y が C = 0 または S (= 0) , であり ;

R' が水素または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^2 が (C₁ - C₆) アルキル, ヒドロキシ - (C₁ - C₆) アルキル, (C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキル, アミノ - (C₁ - C₆) アルキル, (C₁ - C₆) アルキルア

ミノ - (C₁ - C₆) アルキルまたはビス [(C₁ - C₆) アルキル] アミノ - (C₁ - C₆) アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または (C₁ - C₆) アルキルであり；

R²が R⁶ (C H₂)_m

【ここで、

mは、0から3であり，

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか，或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである】

であり、

R³が水素であるか；或は

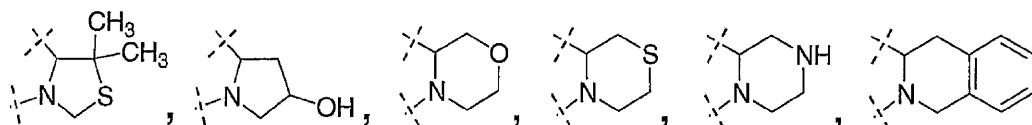
R¹が水素または (C₁ - C₆) アルキルであり；

R²およびR³が同じで、各々が (C₁ - C₆) アルキルから選択されるか；或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-，ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化13】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR¹³ - N (R¹²) - C (= O) -

【ここで、

R¹²は、水素または (C₁ - C₆) アルキルであり，

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ、ビス [(C₁ - C₆) アルキル] アミノまたはフルオロで置換されていてもよい (C₁ - C₆) アルキルであるか；或は

R¹³は、R¹⁷ (C H₂)_p

【ここで、

pは、0から3であり，

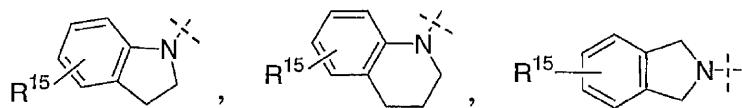
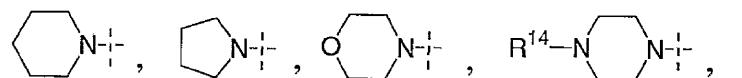
R¹⁷は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか，或は

R¹⁷は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである】

であるか；或は

R¹²とR¹³とこれらが結合している窒素原子が下記

【化14】



[ここで、

R¹⁴は、(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R¹⁴は、R¹⁶(C₁H₂)_qであり、ここで、

qは、0または1であり、

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり；

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項6】

YがC=Oであり；

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²が(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキル、アミノ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ-(C₁ - C₆)アルキルまたはビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノ-(C₁ - C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²がR⁶(C₁H₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり、

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

R³が水素であるか；或は

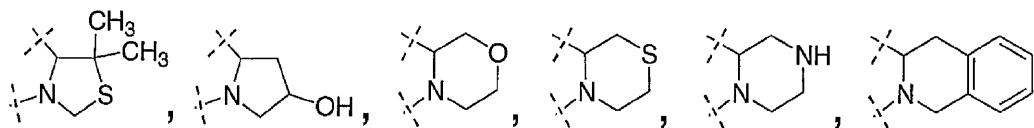
R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²およびR³が同じで、各々が(C₁ - C₆)アルキルから選択されるか；或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化15】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Q が $R^7 - C(=O) -$

[ここで、

R^7 は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルであるか、或は

R^7 は、 $R^8 (CH_2)_n$

[ここで、

n は、0から3であり、

R^8 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、 $R^{10}C(R^9)_2$

[ここで、

R^9 は、メチルまたはエチルであるか、或は

$C(R^9)_2$ が1,1-シクロプロピル、1,1-シクロブチル、1,1-シクロペンチルまたは1,1-シクロヘキシル環であり、

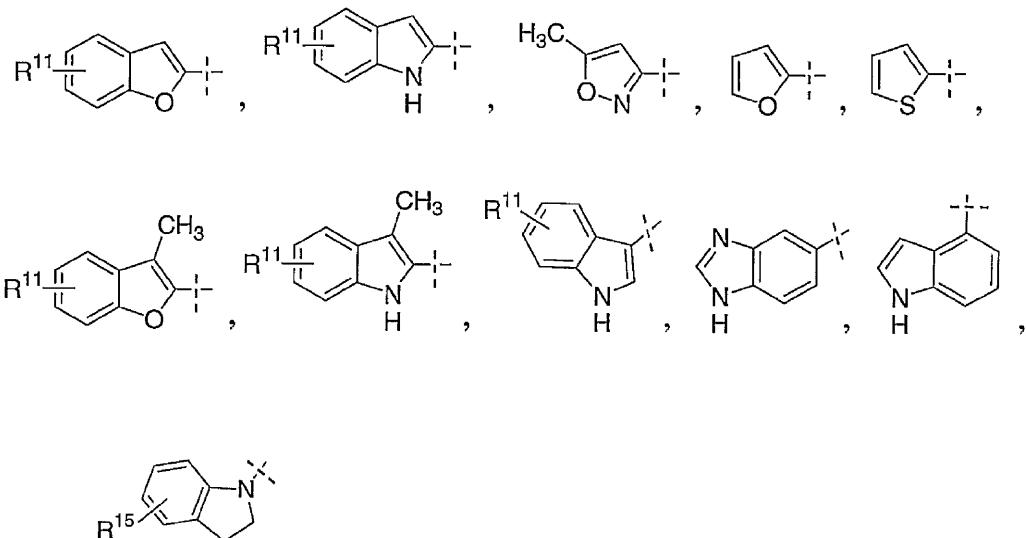
R^{10} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^{10} は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、下記

【化16】



[ここで、

R¹¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択されるフラグメント基である]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項7】

YがC = Oであり；

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²が(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ-(C₁ - C₆)アルキル、アミノ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ-(C₁ - C₆)アルキルまたはビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノ-(C₁ - C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²がR⁶(C₁H₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり；

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてよいフェニルであるか；或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

R³が水素であるか；或は

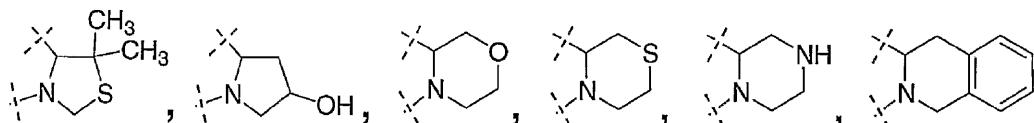
R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²およびR³が同じで、各々が(C₁ - C₆)アルキルから選択されるか；或は

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化17】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Qが R^{13} - N (R¹²) - C (= O) -

[ここで、

R^{12} は、水素または(C₁ - C₆)アルキルであり、

R^{13} は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R^{13} は、R¹⁷ (C H₂)_p

[ここで、

pは、0から3であり、

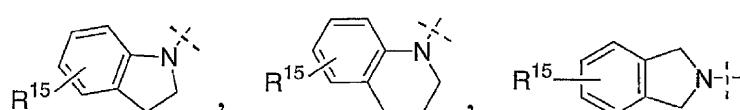
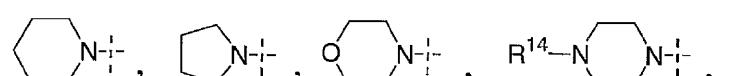
R^{17} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R^{17} は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^{12} と R^{13} とこれらが結合している窒素原子が下記

【化18】



[ここで、

R^{14} は、(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R^{14} は、R¹⁶ (C H₂)_qであり、ここで、

qは、0または1であり、

R^{16} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R^{16} は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり；

R^{15} は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項8】

YがS (= O)₂であり；

R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 が($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ- ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ- ($C_1 - C_6$)アルキル、アミノ- ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルキルアミノ- ($C_1 - C_6$)アルキルまたはビス[($C_1 - C_6$)アルキル]アミノ- ($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^3 が水素であるか；或は

R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 が $R^6(C H_2)_m$

[ここで、

m は、0から3であり；

R^6 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R^6 は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

R^3 が水素であるか；或は

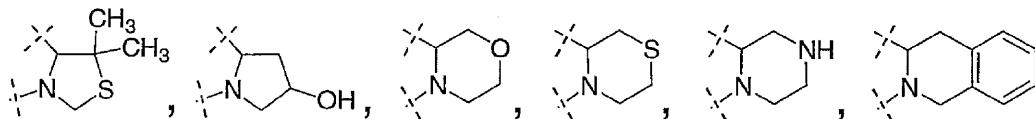
R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 および R^3 が同じで、各々が($C_1 - C_6$)アルキルから選択されるか；或は

R^2 と R^3 がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R^1 と R^2 が R^1 および R^2 が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化19】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Q が $R^7 - C(=O) -$

[ここで、

R^7 は、場合により、1個以上のヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルコキシ、ビス[($C_1 - C_6$)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい($C_1 - C_6$)アルキルであるか；或は

R^7 は、 $R^8(C H_2)_n$

(ここで、

n は、0から3であり；

R^8 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、 $R^{10}C(R^9)_2$

(ここで、

R^9 は、メチルまたはエチルであるか、或は
 $C(R^9)_2$ が1,1-シクロプロピル、1,1-シクロブチル、1,1-シクロペンチル
 または1,1-シクロヘキシル環であり、

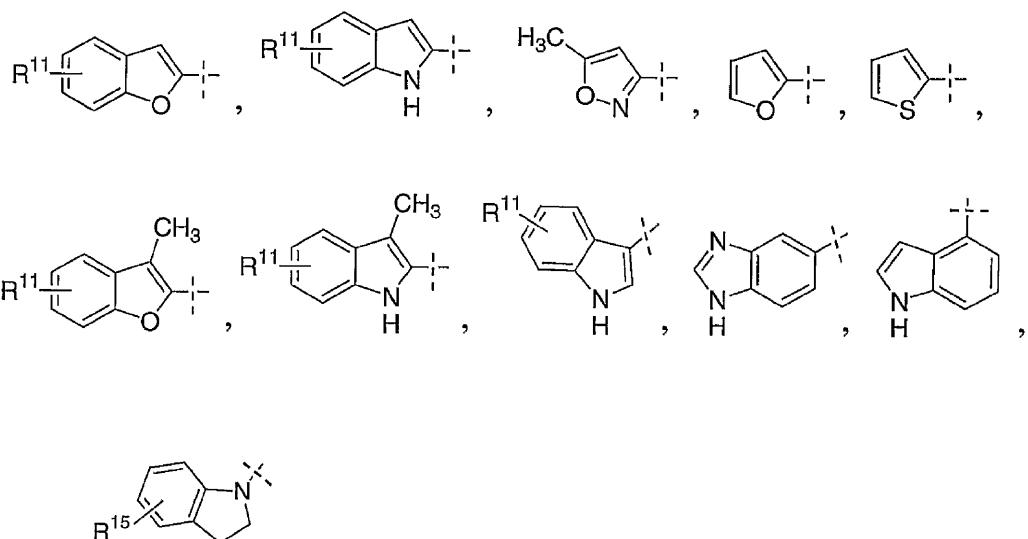
R^{10} は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^{10} は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、下記

【化20】



(ここで、

R^{11} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)
 から選択されるフラグメント基である]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項9】

Y がS(=O)₂であり；

R^1 が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R^2 が(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキルまたはビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルであり；

R^3 が水素であるか；或は

R^1 が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R^2 がR⁶(CH₂)_m

[ここで、

m は、0から3であり、

R^6 は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^6 は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

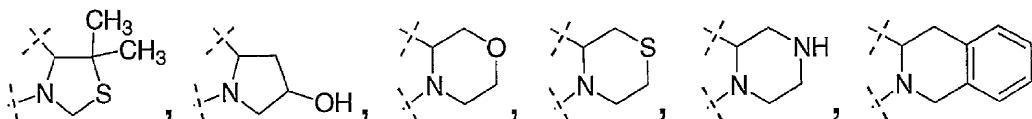
R^3 が水素であるか；或は

R^1 が水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり；

R^2 および R^3 が同じで、各々が($C_1 - C_6$)アルキルから選択されるか；或は
 R^2 と R^3 がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R^1 と R^2 が R^1 および R^2 が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-，ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化21】



から選択される環フラグメントを形成しており；

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素，ハロゲン，($C_1 - C_6$)アルキル，($C_1 - C_6$)アルコキシ，ヒドロキシ，トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Q が $R^{13} - N(R^{12}) - C(=O) -$

[ここで、

R^{12} は、水素または($C_1 - C_6$)アルキルであり，

R^{13} は、場合により、1個以上のヒドロキシ，($C_1 - C_6$)アルコキシ，ビス[$(C_1 - C_6)$ アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい($C_1 - C_6$)アルキルであるか；或は

R^{13} は、 $R^{17}(CH_2)_p$

[ここで、

p は、0から3であり，

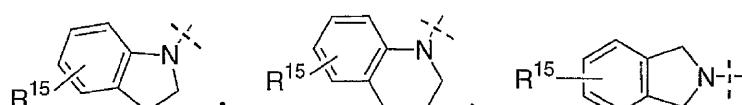
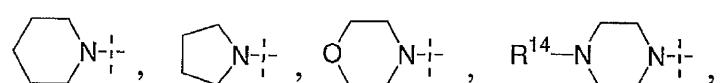
R^{17} は、場合により、1個以上のハロゲン，ヒドロキシ，($C_1 - C_6$)アルキル，($C_1 - C_6$)アルコキシ，トリフルオロメチル，トリフルオロメトキシ，シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか，或は

R^{17} は、各々が場合により、ハロゲン，($C_1 - C_6$)アルキル，($C_1 - C_6$)アルコキシ，トリフルオロメチル，シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル，3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^{12} と R^{13} とこれらが結合している窒素原子が下記

【化22】



[ここで、

R^{14} は、($C_1 - C_6$)アルキルであるか；或は

R^{14} は、 $R^{16}(CH_2)_q$ であり、ここで、

q は、0または1であり，

R^{16} は、場合により、1個以上のハロゲン，ヒドロキシ，($C_1 - C_6$)アルキル，($C_1 - C_6$)アルコキシ，トリフルオロメチル，トリフルオロメトキシ，シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか，或は

R^{16} は、各々が場合により、ハロゲン，($C_1 - C_6$)アルキル，($C_1 - C_6$)アルコキシ

、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり；

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項10】

YがC=Oであり；

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²が(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキルまたはビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²がR⁶(CH₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり、

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルである]

であり、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR⁷-C(=O)-

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R⁷は、R⁸(CH₂)_n

(ここで、

nは、0から3であり、

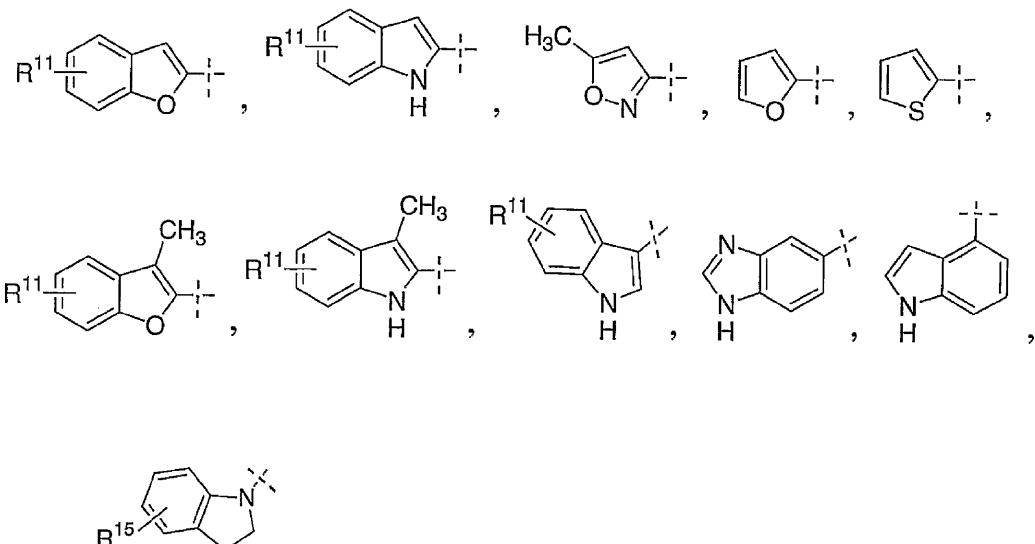
R⁸は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R⁸は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R⁷は、下記

【化23】



[ここで、

R¹¹は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択されるフラグメント基である]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項11】

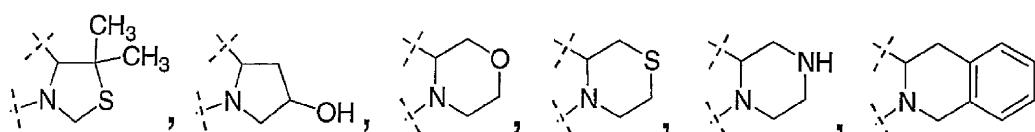
YがC = Oであり；

R¹が水素または(C₁ - C₆)アルキルであり；

R²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化24】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR⁷ - C(=O) -

[ここで、

R⁷は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ、ビス[(C₁ - C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R⁷は、R⁸(CH₂)_n

[ここで、

nは、0から3であり、

R⁸は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

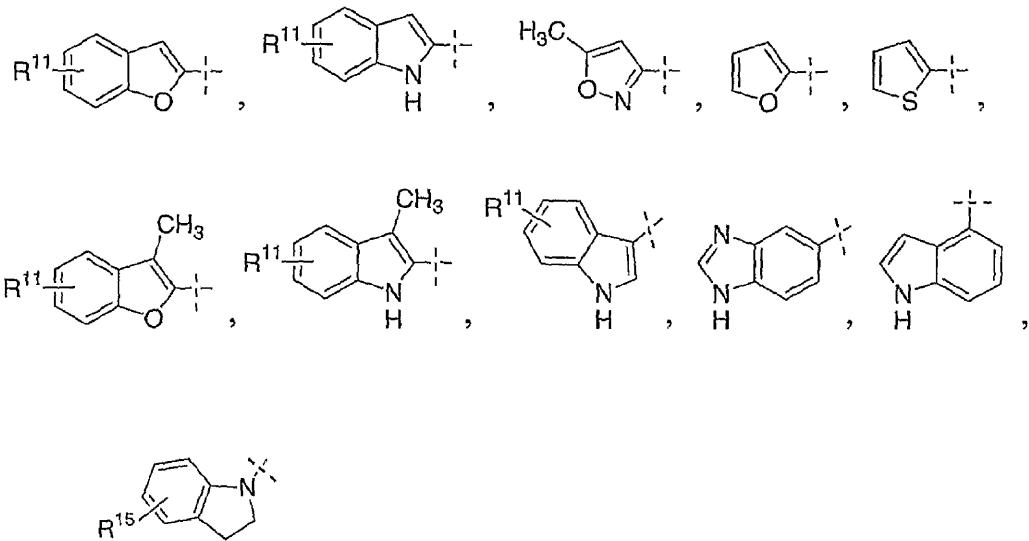
R⁸は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3

- ピリジニルまたは 4 - ピリジニルである)

であるか ; 或は

R⁷ は、下記

【化 25】



(ここで、

R¹¹ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される 1 個以上の置換基である) ; から選択されるフラグメント基である]

である請求項 1 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項 12】

Y が C = O であり ;

R¹ が水素または (C₁ - C₆) アルキルであり ;

R² が (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ - (C₁ - C₆) アルキル、アミノ - (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ - (C₁ - C₆) アルキルまたはビス [(C₁ - C₆) アルキル] アミノ - (C₁ - C₆) アルキルであり ;

R³ が水素であるか ; 或は

R¹ が水素または (C₁ - C₆) アルキルであり ;

R² が R⁶ (C H₂)_m

[ここで、

m は、0 から 3 であり ,

R⁶ は、場合により、1 個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてよいフェニルであるか , 或は

R⁶ は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてよい 2 - ピリジニル、3 - ピリジニルまたは 4 - ピリジニルである]

であり ;

R³ が水素であり ;

R⁴ および R⁵ が独立して水素、ハロゲン、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され ;

Q が R¹³ - N (R¹²) - C (= O) -

[ここで、

R¹² は、水素または (C₁ - C₆) アルキルであり ,

R¹³ は、場合により、1 個以上のヒドロキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ、ビス [(C₁ -

C_6) アルキル)] アミノまたはフルオロで置換されていてもよい (C_1 - C_6) アルキルであるか ; 或は

R^{13} は、 $R^{17} (C_2H_2)_p$

(ここで、

p は、 0 から 3 であり、

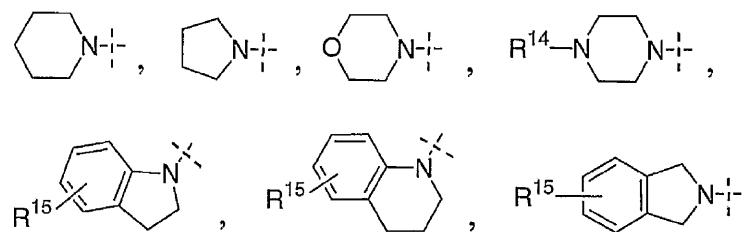
R^{17} は、 場合により、 1 個以上のハロゲン、 ヒドロキシ、 (C_1 - C_6) アルキル、 (C_1 - C_6) アルコキシ、 トリフルオロメチル、 トリフルオロメトキシ、 シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、 或は

R^{17} は、 各々が場合により、 ハロゲン、 (C_1 - C_6) アルキル、 (C_1 - C_6) アルコキシ、 トリフルオロメチル、 シアノまたはニトロで置換されていてもよい 2 - ピリジニル、 3 - ピリジニルまたは 4 - ピリジニルである)

であるか ; 或は

R^{12} と R^{13} とこれらが結合している窒素原子が下記

【化 2 6】



(ここで、

R^{14} は、 (C_1 - C_6) アルキルであるか ; 或は

R^{14} は、 $R^{16} (C_2H_2)_q$ であり、 ここで、

q は、 0 または 1 であり、

R^{16} は、 場合により、 1 個以上のハロゲン、 ヒドロキシ、 (C_1 - C_6) アルキル、 (C_1 - C_6) アルコキシ、 トリフルオロメチル、 トリフルオロメトキシ、 シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、 或は

R^{16} は、 各々が場合により、 ハロゲン、 (C_1 - C_6) アルキル、 (C_1 - C_6) アルコキシ、 トリフルオロメチル、 シアノまたはニトロで置換されていてもよい 2 - ピリジニル、 3 - ピリジニルまたは 4 - ピリジニルであり、

R^{15} は、 ハロゲン、 ヒドロキシ、 (C_1 - C_6) アルキル、 (C_1 - C_6) アルコキシ、 トリフルオロメチル、 シアノおよびニトロから選択される 1 個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項 1 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項 1 3】

Y が $C = O$ であり、

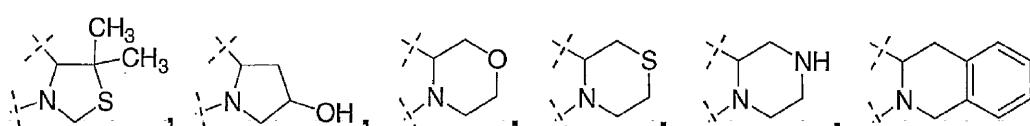
R^1 が水素または (C_1 - C_6) アルキルであり、

R^2 および R^3 が同じで、 各々が (C_1 - C_6) アルキルから選択されるか ; 或は

R^2 と R^3 がこれらが結合している炭素と一緒にになって 3 から 6 員の炭素環式環を形成しているか ; 或は

R^1 と R^2 が R^1 および R^2 が結合している原子と一緒にになって 5 から 7 員のピロリジニル - ピペリジニル - またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化 2 7】



から選択される環フラグメントを形成しあり、

R^3 が水素であり、

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR¹³-N(R¹²)-C(=O)-

[ここで、

R¹²は、水素または(C₁-C₆)アルキルであり、

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R¹³は、R¹⁷(CH₂)_p

[ここで、

pは、0から3であり、

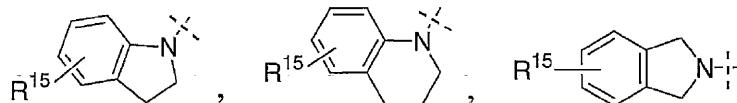
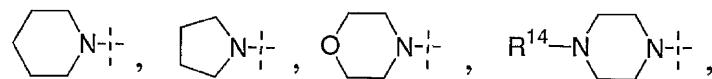
R¹⁷は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁷は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R¹²とR¹³とこれらが結合している窒素原子が下記

【化28】



[ここで、

R¹⁴は、(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R¹⁴は、R¹⁶(CH₂)_qであり、ここで、

qは、0または1であり、

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり；

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項14】

YがS(=O)₂であり；

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²が(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキルまたはビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R^2 が $R^6 (C_6H_5)_m$

[ここで、

m は、0 から 3 であり、

R^6 は、場合により、1 個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルである]

であり、

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素、ハロゲン、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Q が $R^7 - C(=O) -$ ，

[ここで、

R^7 は、場合により、1 個以上のヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシ、ビス[($C_1 - C_6$) アルキル] アミノまたはフルオロで置換されていてもよい ($C_1 - C_6$) アルキルであるか、或は

R^7 は、 $R^8 (C_6H_5)_n$

[ここで、

n は、0 から 3 であり、

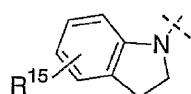
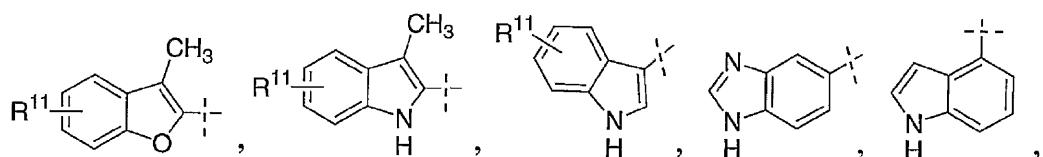
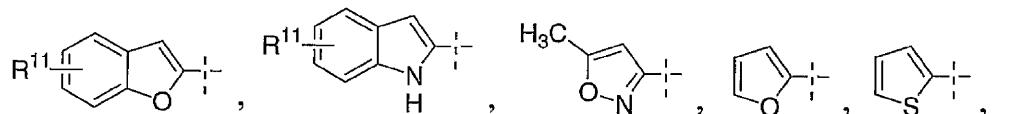
R^8 は、場合により、1 個以上のハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい 2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは 4-ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、下記

【化 2 9】



[ここで、

R^{11} は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される 1 個以上の置換基である) から選択されるフラグメント基である]

である請求項 1 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項 1 5】

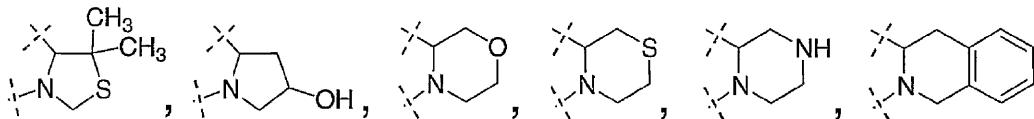
Y が $S(=O)_2$ であり；

R^1 が水素または ($C_1 - C_6$) アルキルであり；

R^2 と R^3 がこれらが結合している炭素と一緒にになって 3 から 6 員の炭素環式環を形成しているか；或は

R^1 と R^2 が R^1 および R^2 が結合している原子と一緒にになって 5 から 7 員のピロリジニル - , ピペリジニル - またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化 3 0】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R^3 が水素であり；

R^4 および R^5 が独立して水素，ハロゲン，(C_1 - C_6) アルキル，(C_1 - C_6) アルコキシ，ヒドロキシ，トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

Q が R^7 - C (= O) -

[ここで、

R^7 は、場合により、1 個以上のヒドロキシ，(C_1 - C_6) アルコキシ，ビス [(C_1 - C_6) アルキル] アミノまたはフルオロで置換されていてもよい (C_1 - C_6) アルキルであるか，或は

R^7 は、 R^8 ($C H_2$) n

[ここで、

n は、0 から 3 であり，

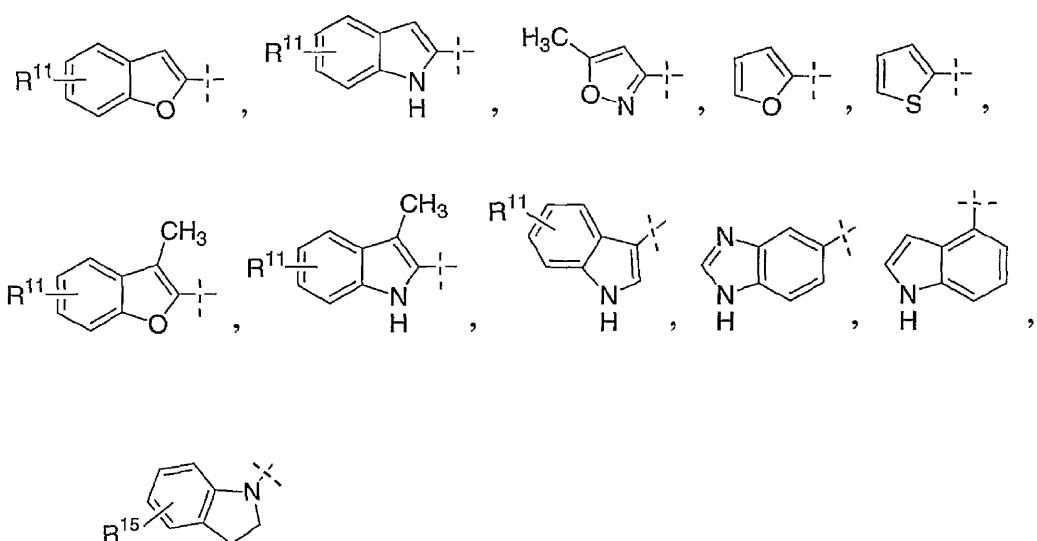
R^8 は、場合により、1 個以上のハロゲン，ヒドロキシ，(C_1 - C_6) アルキル，(C_1 - C_6) アルコキシ，トリフルオロメチル，シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか，或は

R^8 は、各々が場合により、ハロゲン，(C_1 - C_6) アルキル，(C_1 - C_6) アルコキシ，トリフルオロメチル，シアノまたはニトロで置換されていてもよい 2 - ピリジニル，3 - ピリジニルまたは 4 - ピリジニルである)

であるか；或は

R^7 は、下記

【化 3 1】



[ここで、

R^{11} は、水素，ハロゲン，ヒドロキシ，(C_1 - C_6) アルキル，(C_1 - C_6) アルコキシ，トリフルオロメチル，シアノおよびニトロから選択される 1 個以上の置換基である；から選択されるフラグメント基である]

である請求項 1 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項 1 6】

YがS(=O)₂であり；

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²が(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ-(C₁-C₆)アルキル、アミノ-(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ-(C₁-C₆)アルキルまたはビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノ-(C₁-C₆)アルキルであり；

R³が水素であるか；或は

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²がR⁶(CH₂)_m

[ここで、

mは、0から3であり；

R⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである]

であり；

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR¹³-N(R¹²)-C(=O)-

[ここで、

R¹²は、水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R¹³は、R¹⁷(CH₂)_p

(ここで、

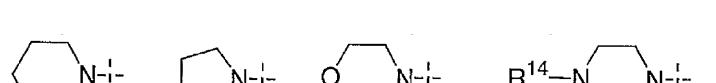
pは、0から3であり；

R¹⁷は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁷は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであるか；或は

R¹²とR¹³これらが結合している窒素原子が下記

【化32】



(ここで、

R¹⁴は、(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R¹⁴は、R¹⁶(CH₂)_qであり、ここで、

qは、0または1であり；

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである；

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)から選択される環フラグメントを形成している】

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項17】

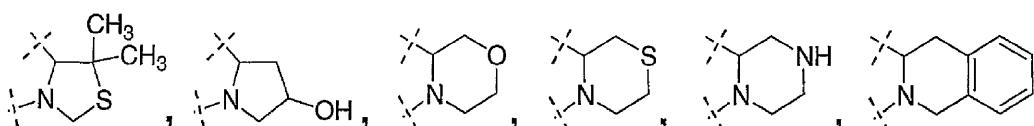
YがS(=O)₂であり；

R¹が水素または(C₁-C₆)アルキルであり；

R²およびR³が同じで、各々が(C₁-C₆)アルキルから選択されるか；或はR²とR³がこれらが結合している炭素と一緒にになって3から6員の炭素環式環を形成しているか；或は

R¹とR²がR¹およびR²が結合している原子と一緒にになって5から7員のピロリジニル-、ピペリジニル-またはホモピペリジニル環を形成しているか或は下記

【化33】



から選択される環フラグメントを形成しており、

R³が水素であり；

R⁴およびR⁵が独立して水素、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチルおよびシアノから選択され；

QがR¹³-N(R¹²)-C(=O)-

【ここで、

R¹²は、水素または(C₁-C₆)アルキルであり、

R¹³は、場合により、1個以上のヒドロキシ、(C₁-C₆)アルコキシ、ビス[(C₁-C₆)アルキル]アミノまたはフルオロで置換されていてもよい(C₁-C₆)アルキルであるか；或は

R¹³は、R¹⁷(CH₂)_p

【ここで、

pは、0から3であり、

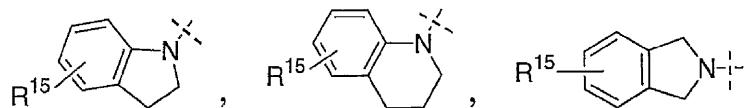
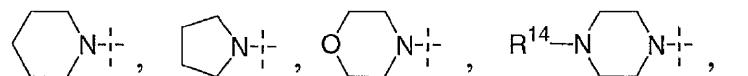
R¹⁷は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか、或は

R¹⁷は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルである)

であるか；或は

R¹²とR¹³とこれらが結合している窒素原子が下記

【化34】



(ここで、

R¹⁴は、(C₁ - C₆)アルキルであるか；或は

R¹⁴は、R¹⁶(CH₂)_qであり、ここで、

qは、0または1であり、

R¹⁶は、場合により、1個以上のハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノまたはニトロで置換されていてもよいフェニルであるか；或は

R¹⁶は、各々が場合により、ハロゲン、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノまたはニトロで置換されていてもよい2-ピリジニル、3-ピリジニルまたは4-ピリジニルであり；

R¹⁵は、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノおよびニトロから選択される1個以上の置換基である)

から選択される環フラグメントを形成している]

である請求項1記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩およびエステル。

【請求項18】

下記

(2S)-1-[{[4'-(2,3-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,3-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,4-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,4-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(4-ブチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,4-ジフルオロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,5-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,6-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-(2,6-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ]-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル]-2-ピペリジンカルボン酸

(2S)-1-[{[4'-({{[(2-トリフルオロメトキシフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(3,4-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(3,4-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(3,5-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(3,5-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(2-メトキシフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

(2S)-1-[{[4'-({{[(4-トリフルオロメトキシフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}-2-ピペリジンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(2,4-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(2,4-ジフルオロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(3,4-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

および

1-[{[4'-({{[(2,4-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸から成る群から選択される請求項1記載の化合物。

【請求項19】

下記

1-[{[4'-({{[(2-クロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(2-エトキシフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(3,4-ジクロロフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(3,4-ジメチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(4-ブチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(4-エチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-アミノ]カルボニル}アミノ)-1,1'-ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1-[{[4'-({{[(ペンタノイルアミノ)ビフェニル-4-イル]カルボニル}アミノ]シクロプロパンカルボン酸,

1 - [({ 4 ' - [((4 - クロロフェニル) - アセチル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アミノ] シクロプロパンカルボン酸 ,
 1 - [({ 4 ' - [(4 - ブチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アミノ] シクロプロパンカルボン酸 ,
 1 - [({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アミノ] シクロプロパンカルボン酸 ,
 N - { [4 ' - ({ [(4 - エチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,

1 - [(4 ' - { [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - プロリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 , 3 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,
 1 - [(4 ' - { [(3 , 5 - ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - プロリン ,
 1 - [(4 ' - { [(5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル) カルボニル] アミノ } ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 3 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 3 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 3 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン , および
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン
 から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 20】

下記

1 - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 5 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 5 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 5 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 6 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 , 6 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(3 , 5 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,

1 - { [4 ' - ({ [(4 - ブチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 - メトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - プロリン ,
 1 - { [4 ' - (ペンタノイルアミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル] カルボニル } - L - プロリン ,
 2 - メチル - N - ({ 4 ' - [({ [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] アミノ } カルボニル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アラニン ,
 2 - メチル - N - [(4 ' - { [(ピリジン - 3 - イルアミノ) カルボニル] アミノ } ビ
 フェニル - 4 - イル) カルボニル] アラニン ,
 N - ({ 4 ' - (ペンタノイルアミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル
) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [((2 , 4 - ジフルオロフェニ) アセチル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフ
 エニル - 4 - イル } カルボニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(2 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(2 - フルオロベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニ
 ル) - D - バリン , および
 N - ({ 4 ' - [(2 - フルオロベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニ
 ル) - N , 2 - ジメチルアラニン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 1】

下記

N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジクロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジクロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジクロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カル
 ボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カル
 ボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジメトキシベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -

4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジメトキシベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 - フルオロ - 4 - メチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 - メチルブタノイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - ブチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - D - バリン , N - ({ 4 ' - [(4 - ブチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン , および
 N - ({ 4 ' - [(4 - ブチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 22】

下記

N - ({ 4 ' - [(4 - ブチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - エチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - エチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - エチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - エチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N , 2 - ジメチルアラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - D - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - アラニン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル)

ル) - N, 2 -ジメチルアラニン,
 N - ({ 4 ' - [(4 -メチルペンタノイル) アミノ] - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - L - バリン, および
 N - ({ 4 ' - [(アニリノカルボニル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) - 2 - メチルアラニン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 3】

下記

N, 2 -ジメチル - N - ({ 4 ' - [(2 -メチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アラニン,
 N, 2 -ジメチル - N - ({ 4 ' - [(3 -メチルブタノイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アラニン,
 N, 2 -ジメチル - N - ({ 4 ' - [(4 -メチルベンゾイル) アミノ] ビフェニル - 4 - イル } カルボニル) アラニン,
 N, 2 -ジメチル - N - ({ 4 ' - [(4 -メチルペンタノイル) アミノ] ビフェニル - 4 - y 1 } カルボニル) アラニン,
 N, 2 -ジメチル - N - { [4 ' - (ペンタノイルアミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } アラニン,
 N - [(4 ' - { [(1 -ベンゾフラン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(2, 4 -ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - D - バリン,
 N - [(4 ' - { [(3, 4 -ジメトキシフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - D - バリン,
 N - [(4 ' - { [(3, 4 -ジメトキシフェニル) - アセチル] アミノ } ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - N, 2 -ジメチルアラニン,
 N - [(4 ' - { [(3, 5 -ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - D - バリン,
 N - [(4 ' - { [(3, 5 -ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(3, 5 -ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - N - メチル - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(3, 5 -ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - N - メチル - L - アラニン,
 N - [(4 ' - { [(3 -クロロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(4 -クロロフェニル) - アセチル] アミノ } ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - N, 2 -ジメチルアラニン,
 N - [(4 ' - { [(4 -エトキシフェニル) - アセチル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(5 -クロロ - 2, 3 -ジヒドロ - 1H - インドール - 1 - イル) カルボニル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(5 -メトキシ - 1H - インドール - 2 - イル) カルボニル] アミノ } ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン,
 N - [(4 ' - { [(7 -エトキシ - 1 -ベンゾフラン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン, および
 N - [(4 ' - { [(7 -メトキシ - 1 -ベンゾフラン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } - 1, 1 ' - ビフェニル - 4 - イル) カルボニル] - L - バリン
 から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 4】

下記

から成る群から

請求

下記
N - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビ
フェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
N - { [4 ' - ({ [(2 , 5 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビ
フェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
N - { [4 ' - ({ [(2 , 6 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビ
フェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,

N - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - フェニルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - フェニルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - メトキシ - 5 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - フェニルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - フルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - フルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - メトキシ - 5 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(4 - メトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン , および
 N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン
 から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 6】

下記

N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 , 3 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,

1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - エチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - エチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - エチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - フルオロベンジル) アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニ
 ル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - フルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - フルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン , および
 N - { [4' - ({ [(4 - フルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - L - バリン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 28】

下記

N - { [4' - ({ [(4 - イソプロピルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビ
 フェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } ア
 ミノ) - 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - D - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } ア
 ミノ) - 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - アラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } ア
 ミノ) ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル } - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4' - ({ [(4 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) ビフェニ
 ル - 4 - イル] カルボニル } - 2 - メチルアラニン ,
 N - { [4' - (ペンタノイルアミノ) - 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] カルボニル
 } - L - バリン , および
 N - メチル - N - { [4' - (ペンタノイルアミノ) - 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル
] カルボニル } - N - メチル - L - バリン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 29】

下記

1 - { [4' - ({ [(3 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -
 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4' - ({ [(2 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -
 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4' - ({ [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -
 1 , 1' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4' - ({ [(2 , 4 - ジメチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -

1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 ,
 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -
 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(3 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) -
 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(4 - プチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(4 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミ
 ノ) - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(4 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 1 - { [4 ' - ({ [(4 - エチルフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1
 ' - ビフェニル - 4 - イル] スルホニル } - L - プロリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(2 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジクロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(2 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 , 4 - ジメチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } スルホニル) - N - メチル - L - バリン , および
 N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジフルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4
 - イル } スルホニル) - L - バリン
 から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 30】

下記

N - ({ 4 ' - [(3 , 5 - ジメトキシベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル -
 4 - イル } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(3 - メチルブタノイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - プチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - エチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - プチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - クロロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イル
 } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ビフェ
 ニル - 4 - イル } スルホニル) - L - バリン ,

N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロ - 3 - メチルベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル) - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - フルオロベンゾイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル) - N - メチル - L - バリン ,
 N - ({ 4 ' - [(4 - メチルペンタノイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル) - L - バリン ,
 N - [(4 ' - { [(3 , 4 - ジメトキシフェニル) - アセチル] アミノ } - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - [(4 ' - { [(3 , 5 - ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - [(4 ' - { [(3 , 5 - ジフルオロフェニル) - アセチル] アミノ } - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - N - メチル - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジクロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - クロロフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - { [4 ' - ({ [(2 - エトキシフェニル) - アミノ] カルボニル } アミノ) - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン ,
 N - { [4 ' - (ペンタノイルアミノ) - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル] - L - バリン , および
 N - メチル - N - ({ 4 ' - [(4 - メチルペンタノイル) アミノ] - 1 , 1 ' - ピフェニル - 4 - イル } スルホニル) - L - バリン

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3 1】

治療的に有効な量の請求項 1 から 30 のいずれかに記載の化合物または製薬学的に受け入れられる塩またはエステルを製薬学的に受け入れられる担体と一緒に含有して成る製薬学的組成物。

【請求項 3 2】

治療的に有効な量の請求項 1 から 30 のいずれかに記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩またはエステルを製薬学的に受け入れられる担体および 1 種以上の薬剤と一緒に含有して成る製薬学的組成物。

【請求項 3 3】

前記薬剤が - 3 作動薬 , C B - 1 捩抗薬 , 神経ペプチド Y 5 阻害剤 , 食欲抑制剤およびリパーゼ阻害剤から成る群から選択される抗肥満薬である請求項 3 2 記載の製薬学的組成物。

【請求項 3 4】

前記薬剤がインスリン , インスリン誘導体 , P P A R リガンド , スルホニル尿素薬 , - グリコシダーゼ阻害剤 , ビグアニド , P T P - 1 B 阻害剤 , D P P - I V 阻害剤 , 1 1 - ベータ - H S D 阻害剤 , G L P - 1 および G L P - 1 誘導体 , G I P および G I P 誘導体 , P A C A P および P A C A P 誘導体およびセクレチンおよびセクレチン誘導体から成る群から選択される糖尿病治療薬である請求項 3 2 記載の製薬学的組成物。

【請求項 3 5】

前記薬剤が H M G - C o A 阻害剤 , ニコチン酸 , 脂肪酸低下用化合物 , 脂質低下薬 , A C A T 阻害剤 , 胆汁抑制薬 , 胆汁酸再取り込み阻害剤 , ミクロゾームトリグリセリド輸送阻害剤およびフィブリン酸誘導体から成る群から選択される脂質障害治療薬である請求項 3 2 記載の製薬学的組成物。

【請求項 3 6】

前記薬剤が - 遮断薬，カルシウムチャネル遮断薬，利尿薬，レニン阻害剤，ACE阻害剤，AT-1受容体拮抗薬，ET受容体拮抗薬および硝酸塩から成る群から選択される抗高血圧薬である請求項32記載の製薬学的組成物。

【請求項 3 7】

有効成分として請求項1から30のいずれか記載の化合物を含んで成る肥満の治療用製薬学的製剤。

【請求項 3 8】

有効成分として請求項1から30のいずれか記載の化合物を含んで成る減量の誘発用製薬学的製剤。

【請求項 3 9】

有効成分として請求項1から30のいずれか記載の化合物を含んで成る体重増加の防止用製薬学的製剤。

【請求項 4 0】

有効成分として請求項1から30のいずれか記載の化合物を含んで成る肥満関連疾患の治療用製薬学的製剤。

【請求項 4 1】

前記肥満関連疾患が脂質異常症，コレステロール結石，胆嚢疾患，通風，癌，月経異常，不妊症，多嚢胞性卵巣，変形性関節症，睡眠時無呼吸，高トリグリセリド血症，X症候群，2型糖尿病，アテローム性動脈硬化症，高脂血症，高コレステロール血症，低HDLレベル，高血圧，心疾患，冠状動脈性心臓病，冠動脈疾患，脳血管疾患，脳梗塞および抹消血管障害から成る群から選択される請求項40記載の製剤。

【請求項 4 2】

1種以上の薬剤と組み合わさった請求項1から30のいずれかに記載の化合物を含んでなる肥満の治療用製薬学的製剤。

【請求項 4 3】

前記薬剤が - 3作動薬，CB-1拮抗薬，神経ペプチドY5阻害剤，食欲抑制剤およびリバーゼ阻害剤から選択される抗肥満薬である請求項42記載の製剤。

【請求項 4 4】

前記薬剤がインスリン，インスリン誘導体，PPARリガンド，スルホニル尿素薬，-グリコシダーゼ阻害剤，ビグアニド，PTP-1B阻害剤，DPP-IV阻害剤，11-ベータ-HSD阻害剤，GLP-1およびGLP-1誘導体，GIPおよびGIP誘導体，PACAPおよびPACAP誘導体およびセクレチンおよびセクレチン誘導体から成る群から選択される糖尿病治療薬である請求項42記載の製剤。

【請求項 4 5】

前記薬剤がHMG-CoA阻害剤，ニコチン酸，脂肪酸低下用化合物，脂質低下薬，ACAT阻害剤，胆汁抑制薬，胆汁酸再取り込み阻害剤，ミクロゾームトリグリセリド輸送阻害剤およびフィブリリン酸誘導体から成る群から選択される脂質障害治療薬である請求項42記載の製剤。

【請求項 4 6】

前記薬剤が - 遮断薬，カルシウムチャネル遮断薬，利尿薬，レニン阻害剤，ACE阻害剤，AT-1受容体拮抗薬，ET受容体拮抗薬および硝酸塩から成る群から選択される抗高血圧薬である請求項42記載の製剤。

【請求項 4 7】

請求項1記載の化合物と1種以上の薬剤が单一の製薬学的投薬製剤として投与する請求項42記載の製剤。

【請求項 4 8】

肥満および肥満関連疾患を治療および/または予防するための請求項1から30のいずれか記載の化合物。

【請求項 4 9】

請求項 1 から 30 のいずれか記載の少なくとも 1 種の化合物を少なくとも 1 種の製薬学的に受け入れられて製薬学的に安全な担体または賦形剤と一緒に含有する製剤。

【請求項 50】

肥満および肥満関連疾患を治療および / または予防する製剤を製造するための請求項 1 から 30 のいずれか記載化合物の使用。

【請求項 51】

肥満を治療および / または予防するための請求項 49 記載製剤。