

【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29年11月9日(2017.11.9)

【公表番号】特表2016-533397(P2016-533397A)

【公表日】平成28年10月27日(2016.10.27)

【年通号数】公開・登録公報2016-061

【出願番号】特願2016-549208(P2016-549208)

【国際特許分類】

C 0 7 D	213/64	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
C 0 7 D	217/24	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
C 0 7 D	413/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/538	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)
C 0 7 D	405/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
C 0 7 D	213/73	(2006.01)
A 6 1 K	31/4412	(2006.01)
C 0 7 D	213/74	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4985	(2006.01)
C 0 7 D	237/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/50	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
C 0 7 D	417/14	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)
C 0 7 D	409/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
C 0 7 D	498/04	(2006.01)
C 0 7 D	405/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/4427	(2006.01)
C 0 7 D	413/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
C 0 7 D	491/048	(2006.01)
C 0 7 D	495/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/4365	(2006.01)
C 0 7 D	213/69	(2006.01)
A 6 1 K	31/5383	(2006.01)
C 0 7 D	213/70	(2006.01)
A 6 1 K	31/4433	(2006.01)
A 6 1 K	31/4436	(2006.01)
A 6 1 K	31/443	(2006.01)
C 0 7 D	241/20	(2006.01)

C 0 7 D 221/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/435 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/64

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 217/24 C S P

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 413/04

A 6 1 K 31/538

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4725

C 0 7 D 471/04 1 1 4 A

A 6 1 K 31/4375

C 0 7 D 405/04

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 213/73

A 6 1 K 31/4412

C 0 7 D 213/74

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 K 31/4985

C 0 7 D 237/14

A 6 1 K 31/50

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 487/04 1 4 6

C 0 7 D 498/04 1 0 5

C 0 7 D 405/06

A 6 1 K 31/4427

C 0 7 D 413/06

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 491/048

C 0 7 D 495/04 1 0 5

A 6 1 K 31/4365

C 0 7 D 213/69

C 0 7 D 498/04 1 1 2 T

A 6 1 K 31/5383

C 0 7 D 213/70

A 6 1 K 31/4433

A 6 1 K 31/4436

A 6 1 K 31/443

C 0 7 D 241/20

C 0 7 D 221/04

A 6 1 K 31/435

【手続補正書】

【提出日】平成29年9月28日(2017.9.28)

【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

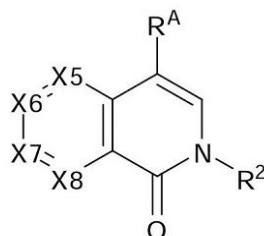
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 1】



式 (I)

式中、

R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2D 、 CHD_2 、または CD_3 から選択され、

$X5$ は $C-R^5$ または N であり、

$X6$ は $C-R^6$ または N であり、

$X7$ は $C-R^7$ または N であり、

$X8$ は $C-R^8$ または N であり、ここで、 $X5$ 、 $X6$ 、 $X7$ 、または $X8$ の 2 つだけが N であってもよく、

R^5 は、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{61}$ 、 $-NHR^{61}$ 、 $-N(R^{61})_2$ 、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、 R^{61} はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

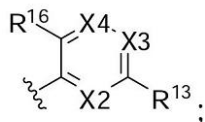
R^6 は、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{61}$ 、 $-NHR^{61}$ 、 $-N(R^{61})_2$ 、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、 R^{61} はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

R^7 は、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-OR^{61}$ 、 $-NHR^{61}$ 、 $-N(R^{61})_2$ 、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、 R^{61} はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

R^8 は水素、ハロゲン、またはアルキルであり、

R^A は以下であり、

【化 2】



X 2 は N または C - R^{1 2} であり、R^{1 2} は水素、ハロゲン、アルキル、またはアルコキシであり、

R^{1 3} は - Y - Z であり、

Y は単結合、- CH₂ -、- CH (C₁ - C₄ アルキル) - から選択され、

Z は、- SO₂ R^{2 1}、- N (R^{2 2}) SO₂ R^{2 1}、- SO₂ N (R^{2 2})₂、- N (R^{2 2}) SO₂ N (R^{2 2})₂、- CON (R^{2 2})₂、- N (R^{2 2}) CO₂ R^{2 1}、- N (R^{2 2}) CON (R^{2 2})₂、- N (R^{2 2}) COR^{2 1}、- COR^{2 1}、- OC (O) N (R^{2 2})₂、- OSO₂ N (R^{2 2})₂、または - N (R^{2 2}) SO₃ R^{2 1} から選択され、

X 3 は N または C - R^{1 4} であり、R^{1 4} は、水素、ハロゲン、- CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

X 4 は N または C - R^{1 5} であり、R^{1 5} は、水素、ハロゲン、アルキル、- CN、またはアルコキシであり、

R^{1 6} は、水素、ハロゲン、N (H) COX、または - W - X であり、W は単結合、- O -、- S -、または - NH - であり、X は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキニル、シクロアルキルアルキニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから選択され、

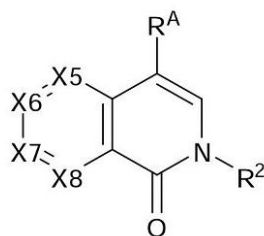
R^{2 1} はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、および、

R^{2 2} はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択される、化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

式 (I b) の構造を有し、

【化 3】



式 (Ib)

式中、

R² は CH₃ から選択され、

X 5 は C - H であり、

X 6 は C - R⁶ であり、

X 7 は C - R⁷ であり、

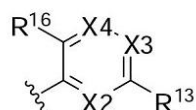
X 8 は C - H であり、

R⁶ は水素またはハロゲンであり、

R⁷ は水素またはハロゲンであり、

R^A は以下であり、

【化 4】



X_2 は C - H であり、

R^{13} は - Y - Z であり、

Y は単結合または - CH₂ - から選択され、

Z は、- SO₂ R²¹、- N (R²²) SO₂ R²¹、- SO₂ N (R²²)₂、- N (R²²) SO₂ N (R²²)₂、- CON (R²²)₂、- N (R²²) CO₂ R²¹、- N (R²²) CON (R²²)₂、- N (R²²) COR²¹、- OC (O) N (R²²)₂、- OSO₂ N (R²²)₂、または - N (R²²) SO₃ R²¹ から選択され、

X_3 は C - R¹⁴ であり、R¹⁴ は、水素、ハロゲン、C₁ - C₃ アルキル、または C₁ - C₃ アルコキシであり、

X_4 は C - R¹⁵ であり、R¹⁵ は水素またはハロゲンであり、

R¹⁶ は - W - X であり、W は単結合、- O -、- S -、または - NH - であり、X は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから選択され、

R²¹ はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、および、

R²² はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

R⁶ はハロゲンであり、R⁷ は水素である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

R⁶ は水素であり、R⁷ はハロゲンである、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

R⁶ は水素であり、R⁷ は水素である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

Y は - CH₂ - である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

Z は - SO₂ R²¹ または - N (R²²) SO₂ R²¹ である、請求項 6 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

Y は単結合である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

Z は - N (R²²) SO₂ R²¹ または - N (R²²) SO₂ N (R²²)₂ である、請求項 8 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

Z は - SO₂ R²¹ である、請求項 8 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

。

【請求項 1 1】

Z は $-SO_2N(R^{22})_2$ である、請求項 8 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 2】

R^{21} はヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルである、請求項 10 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

R^{22} は水素またはメチルである、請求項 9 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 4】

少なくとも 1 つの R^{22} はアルキル、シクロアルキル、またはアラルキルである、請求項 11 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

R^{21} はアルキル、シクロアルキル、またはシクロアルキルアルキルである、請求項 10 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 6】

アルキルは $C_1 - C_4$ アルキルである、請求項 15 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 7】

R^{14} は水素であり、 R^{15} は水素である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 8】

W は単結合、または $-NH-$ である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 9】

W は $-O-$ である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 0】

X はアルキルである、請求項 18 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 1】

X はアルキルである、請求項 19 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 2】

X はシクロアルキルアルキルである、請求項 18 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 3】

X はシクロアルキルアルキルである、請求項 19 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 4】

X はアリールである、請求項 18 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 5】

X はアリールである、請求項 19 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 6】

$C_1 - C_4$ アルキルは C_1 アルキルである、請求項 16 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 7】

Y は単結合であり、Z は $-SO_2R^{21}$ であり、W は $-O-$ であり、X はアリールまたはシクロアルキルアルキルである、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 8】

N - [4 - メチル - 3 - (2 - メチル - 1 - オキシイソキノリン - 4 - イル) フェニル]

メタンスルホンアミド；

4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチル
イソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 6 - フルオ
ロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 7 - フルオ
ロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 -
メチルイソキノリン - 1 - オン；

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (2 - メチル - 1 - オキソイソキノ
リン - 4 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド；

4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 2 - メチル
イソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 6 - フルオ
ロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

2 - メチル - 4 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサラン - 3 - イルオキシ) フェニ
ル] イソキノリン - 1 - オン；

2 - メチル - 4 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサン - 4 - イルオキシ) フェニ
ル] イソキノリン - 1 - オン；

4 - (2 - エトキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 2 - メチルイソキノリン - 1 -
オン；

2 - メチル - 4 - (5 - メチルスルホニル - 2 - プロボキシフェニル) イソキノリン - 1
- オン；

2 - メチル - 4 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサン - 3 - イルオキシ) フェニ
ル] イソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニル
フェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [5 - エチルスルホニル - 2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ
フェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (トランス - 4 - アミノシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェ
ニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - (シス - 4 - アミノシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェニ
ル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - (2 - ブト - 2 - イノキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 2 - メチルイソキノ
リン - 1 - オン；

4 - (2 - ブト - 2 - イノキシ - 5 - エチルスルホニルフェニル) - 2 - メチルイソキノ
リン - 1 - オン；

6 - フルオロ - 4 - [2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ - 5 - メ
チルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

7 - フルオロ - 4 - [2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ - 5 - メ
チルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [5 - エチルスルホニル - 2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ
フェニル] - 6 - フルオロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

4 - [5 - エチルスルホニル - 2 - (トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ
フェニル] - 7 - フルオロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；

2 - メチル - 4 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサラン - 3 - イルアミノ) フェニ
ル] イソキノリン - 1 - オン；

2 - メチル - 4 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサン - 4 - イルアミノ) フェニ
ル] イソキノリン - 1 - オン；

4 - [2 - [(トランス - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) アミノ] - 5 - メチルスルホ

ニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 7 - フルオロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 7 - フルオロ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 6 - メトキシ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 [4 - (シクロプロピルメトキシ) - 3 - (2 - メチル - 1 - オキシイソキノリン - 4 - イル)フェニル] スルファミン酸塩 ;
 N - [2 - (2 - メチル - 1 - オキシイソキノリン - 4 - イル) - 4 - メチルスルホニルフェニル] - シクロプロパンカルボキサミド ;
 N - [2 - (2 - メチル - 1 - オキシイソキノリン - 4 - イル) - 4 - メチルスルホニルフェニル] プロパンアミド ;
 N - [2 - (2 - メチル - 1 - オキシイソキノリン - 4 - イル) - 4 - メチルスルホニルフェニル] アセトアミド ;
 2 - メチル - 4 - (5 - メチルスルホニル - 2 - プロピルフェニル)イソキノリン - 1 - オン ;
 4 - (2 - エチル - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - (2 - ブチル - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (2 - シクロプロピルエチル) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - プロパン - 2 - イルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - プロパン - 2 - イルスルホニルフェニル] - 6 - メトキシ - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;
 4 - [5 - (エチルスルホニルメチル) - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ; および、
 2 - メチル - 4 - [5 - (メチルスルホニルメチル) - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル]イソキノリン - 1 - オン ; から選択される、化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 29】

請求項 1 に記載されるような式 (I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

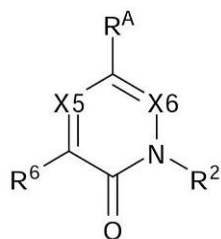
【請求項 30】

請求 28 の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 31】

式 (II) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 5】



式 (II)

式中、

R^2 は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、アラルキル、またはヘテロアリールアルキルであり、

X_6 は C - H または N であり、

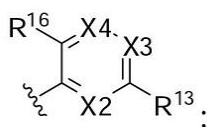
X_5 は C - R^5 または N であり、ただし、 X_6 が N である場合、 X_5 は C - R^5 であり、 X_5 が N である場合、 X_6 は CH であるとし、

R^5 は、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-OR^{6 1}、-NHR^{6 1}、-N($R^{6 1}$)₂、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、 $R^{6 1}$ はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

R^6 は、水素、ハロゲン、-OH、-CN、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノ、アルコキシ、-S-アルキル、シクロアルキルアルコキシ、ヘテロシクリル、アラルコキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールオキシ、アルキニルオキシ、または-N(H)COアルキルであり、

R^A は以下であり、

【化 6】



X_2 は N または C - $R^{1 2}$ であり、 $R^{1 2}$ は水素、ハロゲン、アルキル、またはアルコキシであり、

$R^{1 3}$ は -Y-Z であり、

Y は単結合、-CH₂-、または-CH(C₁-C₄アルキル)-から選択され、

Z は、-SO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})SO₂R^{2 1}、-SO₂N(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})SO₂N(R^{2 2})₂、-CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})CO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})COR^{2 1}、-COR^{2 1}、-OC(O)N(R^{2 2})₂、-OSO₂N(R^{2 2})₂、または-N(R^{2 2})SO₃R^{2 1}から選択され、

X_3 は N または C - $R^{1 4}$ であり、 $R^{1 4}$ は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

X_4 は N または C - $R^{1 5}$ であり、 $R^{1 5}$ は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラルキルオキシ、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロアリールアルキルオキシ、またはアルキニルオキシであり、

$R^{1 6}$ は、水素、ハロゲン、-N(H)COX、または-W-X であり、W は単結合、-O-、-S-、または-NH-であり、X は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキニル、シクロアルキルアルキニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキル

から選択され、

$R^{2\ 1}$ はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、および、

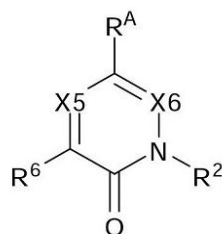
$R^{2\ 2}$ はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

ただし、 X^6 がNである場合、 R^5 と R^6 は水素ではないと仮定する、化合物。

【請求項 3 2】

式 (II a) によって表され、

【化 7】



式 (IIa)

式中、

R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 、 CH_2D 、 CHD_2 、または CD_3 であり、

X^6 はC - HまたはNであり、

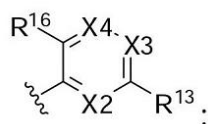
X^5 はC - R^5 またはNであり、ただし、 X^6 がNである場合、 X^5 はC - R^5 であり、 X^5 がNである場合、 X^6 はCHであるとす、

R^5 は、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-OR^{6 1}、-NHR^{6 1}、-N(R^{6 1})₂、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、 $R^{6\ 1}$ はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

R^6 は、水素、ハロゲン、-OH、-CN、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノ、アルコキシ、またはシクロアルキルアルコキシであり、

R^A は以下であり、

【化 8】



X^2 はNまたはC - $R^{1\ 2}$ であり、 $R^{1\ 2}$ は水素、ハロゲン、アルキル、またはアルコキシであり、

$R^{1\ 3}$ は -Y - Z であり、

Y は単結合または -CH₂- から選択され、

Z は、-SO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})SO₂R^{2 1}、-SO₂N(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})SO₂N(R^{2 2})₂、-CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})CO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})COR^{2 1}、-OC(O)N(R^{2 2})₂、-OSO₂N(R^{2 2})₂、または -N(R^{2 2})SO₃R^{2 1} から選択され、

X^3 はNまたはC - $R^{1\ 4}$ であり、 $R^{1\ 4}$ は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シ

クロアルキル、またはアルコキシであり、

X⁴ はNまたはC - R^{1 5}であり、R^{1 5}は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、またはアルコキシであり、

R^{1 6}は、水素、ハロゲン、または-W-Xであり、Wは単結合、-O-、-S-、または-NH-であり、Xは、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから選択され、

R^{2 1}はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、および、

R^{2 2}はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

ただし、X⁶がNである場合、R⁵とR⁶は水素ではないと仮定する、請求項31に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項33】

R²はCH₃である、請求項31または32に記載の化合物。

【請求項34】

X⁶はC-Hである、請求項31乃至33のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項35】

X⁶はNである、請求項31乃至33のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項36】

X⁵はC-R⁵である、請求項31乃至35のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項37】

X⁵はNである、請求項31乃至35のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項38】

R⁵は水素、ハロゲン、またはアルキルである、請求項31乃至36のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項39】

R⁶は水素、ハロゲン、アルキル、またはアルコキシである、請求項31乃至38のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項40】

Yは単結合である、請求項31乃至39のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項41】

Yは-CH₂-である、請求項31乃至39のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項42】

Zは-SO₂R^{2 1}である、請求項31乃至41のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項43】

Zは-N(R^{2 2})SO₂R^{2 1}である、請求項31乃至41のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項44】

Zは-SO₂N(R^{2 2})₂である、請求項31乃至41のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項45】

Zは-N(R^{2 2})SO₂N(R^{2 2})₂である、請求項31乃至41のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項46】

Zは-CON(R^{2 2})₂である、請求項31乃至41のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項47】

Z は $-N(R^{2,2})CO_2R^{2,1}$ である、請求項 3 1 乃至 4 1 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 4 8】

Z は $-N(R^{2,2})CON(R^{2,2})_2$ である、請求項 3 1 乃至 4 1 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 4 9】

$R^{2,1}$ はアルキル、シクロアルキル、またはシクロアルキルアルキルである、請求項 3 1 乃至 4 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 0】

$R^{2,1}$ はアルキルである、請求項 3 1 乃至 4 9 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 1】

$R^{1,4}$ は水素、ハロゲン、またはアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 2】

X 4 は $C-R^{1,5}$ である、請求項 3 1 乃至 5 1 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 3】

X 3 は N である、請求項 3 1 乃至 5 0、または 5 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 4】

X 2 は N である、請求項 3 1 乃至 5 3 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 5】

X 2 と X 3 は N であり、X 4 は $C-H$ である、請求項 3 1 乃至 5 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 6】

W は $-O-$ である、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 7】

W は $-NH-$ である、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 8】

W は単結合である、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5 9】

X はアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 0】

X はアリールである、請求項 3 1 乃至 5 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 1】

X はシクロアルキルアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 8 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 2】

W は $-(O)-$ であり、X はアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 3】

W は $-(O)-$ であり、X はアリールである、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 4】

W は $-(O)-$ であり、X はシクロアルキルアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 5】

W は単結合であり、X はアルキルである、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6 6】

W は単結合であり、X はアリールである、請求項 3 1 乃至 5 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 67】

Wは単結合であり、Xはシクロアルキルアルキルである、請求項31乃至55のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 68】

R⁶はCD₃である、請求項31乃至67のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 69】

N-[3-(1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[3-(1,4-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[3-(1,5-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[3-(1,4,5-トリメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

5-[2-(シクロプロピルメトキシ)-5-メチルスルホニルフェニル]-1-メチルピリジン-2-オン；

N-[4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-3-(1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]エタンスルホンアミド；

N-[4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-3-(1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-3-(1,4-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-3-(1,5-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-3-(1,4,5-トリメチル-6-オキソピリジン-3-イル)フェニル]メタンスルホンアミド；

3-アミノ-1-メチル-5-(3-メチルスルホニルフェニル)ピラジン-2-オン；

3-アミノ-5-(3-エチルスルホニルフェニル)-1-メチルピラジン-2-オン；

N-[5-(6-アミノ-4-メチル-5-オキソピラジン-2-イル)-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

3-アミノ-1-メチル-5-(3-メチルスルホニルフェニル)ピリジン-2-オン；

3-アミノ-5-(3-エチルスルホニルフェニル)-1-メチルピリジン-2-オン；

N-[5-(5-アミノ-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

N-[2-メトキシ-5-[1-メチル-5-(メチルアミノ)-6-オキソピリジン-3-イル]フェニル]メタンスルホンアミド；

N-[5-[5-(エチルアミノ)-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル]-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

N-[5-[5-(シクロプロピルメチルアミノ)-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル]-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

N-[5-[5-(ジメチルアミノ)-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル]-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

N-[5-[5-(ジエチルアミノ)-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル]-2-メトキシフェニル]メタンスルホンアミド；

N-[3-(5-アミノ-1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)-4-(2,4-ジフルオロフェノキシ)フェニル]エタンスルホンアミド；

3-アミノ-5-[2-(シクロプロピルメトキシ)-5-メチルスルホニルフェニル]-1-メチルピリジン-2-オン；

4-エトキシ-3-(1-メチル-6-オキソピリジン-3-イル)ベンゼンスルホンアミド；

4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ベンゼンスルホンアミド ;

5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - フルオロ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - フルオロ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - フルオロ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - フルオロ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;

N - [3 - (5 - クロロ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;

6 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 , 4 - ジメチルピリダジン - 3 - オン ;

6 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 , 5 - ジメチルピリダジン - 3 - オン ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] フェニル] エタンスルホンアミド ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (4 - フルオロ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;

N - [3 - (5 - シクロプロピル - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;

N - { 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [1 - ($^2\text{H}_3$) メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル] フェニル } エタンスルホンアミド ; ;

5 - [5 - (シクロプロピルメトキシ) - 2 - (メチルスルホニルメチル) ピリミジン - 4 - イル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - (メチルスルホニルメチル) ピリミジン - 4 - イル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - (メチルスルホニルメチル) ピリミジン - 4 - イル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

N - [5 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンアミド ;

N - [5 - (シクロプロピルメトキシ) - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] - N - エチルメタンスルホンアミド ;

N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンアミド ;

N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンアミド ;

N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;

N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;

[4 - (シクロプロピルメトキシ) - 3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] スルファミン酸塩 ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピ
 リジン - 3 - イル) フェニル] - N - (オキセタン - 3 - イル) メタンスルホンアミド ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - (シク
 ロプロピルメチル) - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - メチル
 - 1 - (2 - メチルプロピル) ピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - (2 -
 メトキシエチル) - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - メチル
 - 1 - (オキセタン - 3 - イルメチル) ピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - メチル
 - 1 - (1 , 3 - オキサゾル - 4 - イルメチル) ピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - [1 - (シクロプロピルメチル) - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イ
 ル] - 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [4 - [1 - (シクロプロピルメチル) - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イ
 ル] - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンア
 ミド ;
 N - [4 - [1 - (シクロプロピルメチル) - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イ
 ル] - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンア
 ミド ;
 1 - (シクロプロピルメチル) - 5 - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 1 - (
 メチルスルホニルメチル) - 6 - オキソピリジン - 3 - イル] - 3 - メチルピリジン - 2
 - オン ;
 1 - シクロプロピル - 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフ
 ェニル] - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - フルオロ - 1 - メチル - 6 -
 オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 3 - クロロ - 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル]
 - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - フルオ
 ロ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 3 - クロロ - 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニ
 ル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メタンスルホニルメチル) フェニ
 ル] - 3 - ($^2\text{H}_3$) メチル - 1 - メチル - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [5 - ($^2\text{H}_3$) メチル - 1 - メチ
 ル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル] フェニル] メタンスルホンアミ
 ド ;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [5 - ($^2\text{H}_3$) メチル - 1 - メチ
 ル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - イル] フェニル] エタン - 1 - スルホ
 ンアミド ;
 N - [3 - (5 - シクロプロピル - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 -
 (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 3 - シクロプロピル - 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフ
 ェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - ピ
 ロリジン - 1 - イルピリジン - 3 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 - 3 - ピロリジン - 1 - イルピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - エチニル - 1 - メチル - 6 -

オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - エチニ
 ル - 1 - メチルピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - エチニ
 ル - 1 - メチルピリジン - 2 - オン;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - エチニル - 1 - メチル - 6 -
 オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - (ジフ
 ルオロメトキシ) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 - 3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリジン - 2 - オン;
 N - [3 - [5 - (ジフルオロメトキシ) - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル
] - 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] エタンスルホンアミド;
 N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - (2 , 2 , 2 -
 トリフルオロエトキシ) ピリジン - 3 - イル] フェニル] エタンスルホンア
 ミド;
 3 - (ジフルオロメトキシ) - 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (エ
 チルスルホニルメチル) フェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (エチルスルホニルメチル) フェニ
 ル] - 1 - メチル - 3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 - 3 - (1 - メチルピラゾル - 4 - イル) オキシピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 - 3 - (1 - プロパン - 2 - イルピラゾル - 4 - イル) オキシピリジン - 2 - オン;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 - 3 - フェノキシピリジン - 2 - オン;
 N - [4 - (1 - ブチル - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - (2 , 4
 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンアミド;
 N - [4 - (1 - ブチル - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - (2 , 4
 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド;
 N - [4 - [1 - (シクロブチルメチル) - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル
] - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] メタンスルホンアミ
 ド;
 N - [4 - [1 - (シクロブチルメチル) - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル
] - 5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミ
 ド;
 5 - (5 - エチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 1 , 3 - ジメチルピ
 リジン - 2 - オン;
 1 , 3 - ジメチル - 5 - (2 - メチルスルホニル - 5 - プロピルピリミジン - 4 - イル)
 ピリジン - 2 - オン;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 1 , 3 - ジメチルピ
 リジン - 2 - オン;
 N - [4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - エチルピリミジ
 ン - 2 - イル] エタンスルホンアミド;
 N - [4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - プロピルピリミ
 ジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド;
 N - [5 - ブチル - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジ
 ン - 2 - イル] エタンスルホンアミド;
 5 - (2 - エチル - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン;
 1 - メチル - 5 - (5 - メチルスルホニル - 2 - プロピルフェニル) ピリジン - 2 - オン

;

5 - [2 - (2 - シクロプロピルエチル) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル
 ピリジン - 2 - オン ;

5 - (2 - ブチル - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - [(4 - メトキシフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェニル] -
 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - (3 - メチルスルホニル - 5 - フェニルメトキシフェニル) ピリ
 ジン - 2 - オン ;

5 - [3 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジ
 メチルピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (2 - フェニルエトキシ) フェニ
 ル] ピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - (2 - シクロプロピルエトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 -
 ジメチルピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエト
 キシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - [(3 - メチルオキセタン - 3 - イル) メトキシ] - 5 -
 メチルスルホニルフェニル] ピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (ピリジン - 2 - イルメトキシ)
 フェニル] ピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - [(2 , 6 - ジメチルフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェニル
] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - [(2 - クロロフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1
 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - [[2 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] メトキシ] - 5 - メチルスルホ
 ニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

2 - [[3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - メチルスルホ
 ニルフェノキシ] メチル] ベンゾニトリル ;

5 - [3 - [(2 , 4 - ジフルオロフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェ
 ニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (1 - フェニルエトキシ) フェ
 ニル] ピリジン - 2 - オン ;

5 - [3 - [(2 , 3 - ジクロロフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェ
 ニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (ピリジン - 3 - イルメトキシ)
 フェニル] ピリジン - 2 - オン ;

3 - [[3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - メチルスルホ
 ニルフェノキシ] メチル] ベンゾニトリル ;

5 - (3 - ブト - 2 - イノキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 1 , 3 - ジメチル
 ピリジン - 2 - オン ;

1 , 3 - ジメチル - 5 - [3 - メチルスルホニル - 5 - (1 - フェニルエトキシ) フェ
 ニル] ピリジン - 2 - オン ;

N - [3 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソ
 ピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;

4 - [3 - [(4 - メトキシフェニル) メトキシ] - 5 - メチルスルホニルフェニル] -
 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン ;

2 - メチル - 4 - (3 - メチルスルホニル - 5 - フェニルメトキシフェニル) イソキノ
 リン - 1 - オン ;

4 - [3 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチ
 ルイソキノリン - 1 - オン ;

N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 6 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピ
 リジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 6 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピ
 リジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イル] エタンスルホンアミド ;
 1 - メチル - 5 - (2 - メチルスルホニル - 5 - プロピルピリミジン - 4 - イル) ピリジ
 ン - 2 - オン ;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 1 - メチルピリジン
 - 2 - オン ;
 3 - クロロ - 1 - メチル - 5 - (2 - メチルスルホニル - 5 - プロピルピリミジン - 4 -
 イル) ピリジン - 2 - オン ;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 3 - クロロ - 1 - メ
 チルピリジン - 2 - オン ;
 3 - メトキシ - 1 - メチル - 5 - (2 - メチルスルホニル - 5 - プロピルピリミジン - 4
 - イル) ピリジン - 2 - オン ;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 3 - メトキシ - 1 -
 メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - プロピルピリミジン -
 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2
 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (5 - クロロ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - プロピル
 ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (5 - クロロ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピ
 リミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - プロピ
 ルピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル)
 ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) ピリミジ
 ン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 5 - (2 - ブト - 2 - イノキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 1 , 3 - ジメチルピ
 リジン - 2 - オン ;
 5 - (2 - ブト - 2 - イノキシ - 5 - エチルスルホニルフェニル) - 3 - メトキシ - 1 -
 メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - (5 - エチルスルホニル - 2 - p e n t - 2 - インオキシフェニル) - 3 - メトキシ
 - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (3 - シクロプロピル p r o p - 2 - y n o x y) - 5 - エチルスルホニルフ
 ェニル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 -
 メチル - 3 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - プロパン - 2 - イルスルホニルフェニル]
 - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 5 - フェニルメトキ
 シフェニル] エタンスルホンアミド ;
 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロアニリノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 , 3
 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - [(4 , 4 - ジフルオロシクロヘキシル) アミノ] - 5 - エチルスルホニルフ
 ェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロアニリノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3
 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (4 - ヒドロキシシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1 - メチル - 5 - メチルスルファニル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - (4 - アミノシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (4 - アミノシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 1 , 3 - ジメチル - 5 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロポキシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [5 - (エチルスルホニルメチル) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル - 3 - (メチルアミノ)ピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - メチル - 3 - (メチルアミノ)ピリジン - 2 - オン ;
- N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [1 - メチル - 5 - (メチルアミノ) - 6 - オキソピリジン - 3 - イル] フェニル] エタンスルホンアミド ;
- 5 - [5 - (エチルスルホニルメチル) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- N - [4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [1 - メチル - 5 - (メチルアミノ) - 6 - オキソピリジン - 3 - イル] フェニル] メタンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - [(4 , 4 - ジフルオロシクロヘキシル) アミノ] - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - メトキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (4 , 4 - ジフルオロシクロヘキシル) オキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロペンチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロペンチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 3 - クロロ - 1 - メチル - 5 - [5 - (メチルスルホニルメチル) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
- 5 - (2 - シクロペンチルオキシ - 5 - メチルスルホニルフェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 1 , 3 - ジメチル - 5 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサン - 4 - イルオキシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
- 3 - フルオロ - 1 - メチル - 5 - [5 - (メチルスルホニルメチル) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 , 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

1, 3 - ジメチル - 5 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキシラン - 3 - イルアミノ)
 フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
 1, 3 - ジメチル - 5 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキシラン - 3 - イルオキシ)
 フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
 1, 3 - ジメチル - 5 - [5 - (メチルスルホニルメチル) - 2 - (2, 2, 2 - トリフ
 ルオロエトキシ) フェニル] ピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - エ
 チル - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル) フェニ
 ル] - 1 - エチル - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (4 - ヒドロキ
 シシクロヘキシル) オキシフェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (4 - ヒドロキ
 シシクロヘキシル) オキシフェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (4 - ヒドロキ
 シシクロヘキシル) オキシフェニル] メタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (4 - ヒドロキ
 シシクロヘキシル) オキシフェニル] メタンスルホンアミド ;
 1, 3 - ジメチル - 5 - [5 - メチルスルホニル - 2 - (オキサン - 4 - イルアミノ) フ
 ェニル] ピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル) フェニ
 ル] - 3 - フルオロ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - (ジ
 メチルアミノ) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキサン - 4
 - イルオキシ) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 3 - (ジ
 メチルアミノ) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキサン - 4
 - イルオキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 -
 オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - メトキシ - 1 - メチル - 6 -
 オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキシラン -
 3 - イルオキシ) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキシラン -
 3 - イルオキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキサン - 3
 - イルオキシ) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (4, 4 - ジフルオロシクロヘキシル) オキシ - 3 - (1, 5 - ジメチル - 6
 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (オキサン - 3
 - イルオキシ) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (4, 4 - ジフルオロシクロヘキシル) オキシ - 3 - (1, 5 - ジメチル - 6
 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1, 3 - ジ
 メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 6
 - オキソピリジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;

- 4 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;
- 4 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル)ベンゼンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 1, 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 1, 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - (2 - エトキシ - 5 - エチルスルホニルフェニル) - 1 - ($^2\text{H}_3$)メチル - 4 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - ($^2\text{H}_3$)メチル - 4 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - (2 - エトキシ - 5 - エチルスルホニルフェニル) - 1, 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロブチルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1, 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロブチルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - (5 - エチルスルホニル - 2 - メトキシフェニル) - 3 - ヒドロキシ - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1, 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [5 - (ジメチルアミノ) - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル]フェニル]メタンスルホンアミド ;
- N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - [5 - (ジメチルアミノ) - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル]フェニル]エタンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1, 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1, 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
- N - [3 - (5 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル)フェニル]メタンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 3 - (ジメチルアミノ) - 5 - (2 - エトキシ - 5 - エチルスルホニルフェニル) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- N - [3 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - フェニルメトキシピリジン - 3 - イル)フェニル]メタンスルホンアミド ;
- N - [4 - (2, 4 - ジフルオロフェノキシ) - 3 - (1, 5 - ジメチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル)フェニル]エタンスルホンアミド ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - エチルスルホニルフェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - (ジメチルアミノ) - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [4 - フルオロ - 2 - メトキシ - 5 - (メチルスルホニルメチル)フェニル] - 1 - メチルピリジン - 2 - オン ;
- 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1, 3 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;

5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 1 , 4 - ジメチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [6 - [3 - (メタンスルホンアミド) フェニル] - 4 - メチル - 3 - オキソピラジン - 2 - イル] アセトアミド ;
 N - [3 - (1 , 4 - ジメチル - 6 - オキソピリダジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [3 - (1 , 5 - ジメチル - 6 - オキソピリダジン - 3 - イル) フェニル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - [3 - (メタンスルホンアミド) フェニル] - 1 - メチル - 2 - オキソピリジン - 3 - イル] プロパンアミド ;
 N - [5 - [3 - (メタンスルホンアミド) フェニル] - 1 - メチル - 2 - オキソピリジン - 3 - イル] アセトアミド ;
 1 - シクロブチル - 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - (1 - シクロブチル - 5 - メチル - 6 - オキソピリジン - 3 - イル) - 4 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) フェニル] メタンスルホンアミド ;
 1 - ベンジル - 5 - [2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 3 - メチルピリジン - 2 - オン ;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 3 - メチル - 1 - プロパン - 2 - イルピリジン - 2 - オン ;
 N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (5 - メチル - 6 - オキソ - 1 - プロパン - 2 - イルピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル] - 3 - メチル - 1 - プロパン - 2 - イルピリジン - 2 - オン ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (5 - メチル - 6 - オキソ - 1 - プロパン - 2 - イルピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 N - [5 - ブチル - 4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - プロパン - 2 - イルピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 5 - (5 - ブチル - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル) - 1 - メチル - 3 - プロパン - 2 - イルピリジン - 2 - オン ;
 N - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 5 - プロパン - 2 - イルピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 2 - イル] エタンスルホンアミド ;
 または、
 5 - [5 - (2 , 4 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - メチルスルホニルピリミジン - 4 - イル] - 1 - メチル - 3 - プロパン - 2 - イルピリジン - 2 - オンから選択される、化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 70】

式 (I I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 71】

式 (I I) の化合物に、タンパク質を含むプロモドメインをさらす工程を含む、細胞中の遺伝子転写を制御する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 72】

式 (I I) の化合物にプロモドメインをさらす工程を含む、タンパク質のアセチルリジン領域のプロモドメイン媒介性の認識を阻害する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 73】

患者の癌を処置するための製剤の製造における式 (I I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 74】

請求項 69 の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能な賦形

剤を含む、医薬組成物。

【請求項 75】

請求項 69 の化合物に、タンパク質を含むプロモドメインをさらす工程を含む、細胞中の遺伝子転写を制御する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 76】

請求項 69 の化合物にプロモドメインをさらす工程を含む、タンパク質のアセチルリジン領域のプロモドメイン媒介性の認識を阻害する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 77】

患者の癌を処置するための製剤の製造における請求項 69 の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 78】

式 (I) の化合物に、タンパク質を含むプロモドメインをさらす工程を含む、細胞中の遺伝子転写を制御する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 79】

式 (I) の化合物にプロモドメインをさらす工程を含む、タンパク質のアセチルリジン領域のプロモドメイン媒介性の認識を阻害する、インビトロまたはエキスピボの方法。

【請求項 80】

患者の癌を処置するための製剤の製造における式 (I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。