

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成22年4月2日 (2010.4.2)

【公表番号】特表2009-531309(P2009-531309A)

【公表日】平成21年9月3日 (2009.9.3)

【年通号数】公開・登録公報2009-035

【出願番号】特願2008-558542(P2008-558542)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 475/02 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 473/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

C 0 7 D 473/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 5/50 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

C 1 2 N 9/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/517

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/513

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N
 C 0 7 D 475/02
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
 C 0 7 D 487/04 1 4 3
 C 0 7 D 513/04 3 5 1
 C 0 7 D 473/30
 A 6 1 K 31/522
 C 0 7 D 473/06
 A 6 1 K 31/5377
 C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z
 C 0 7 D 409/14
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 413/14
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 5/50
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 15/08
 A 6 1 P 9/00
 C 1 2 N 9/12

【手続補正書】

【提出日】平成22年2月15日(2010.2.15)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

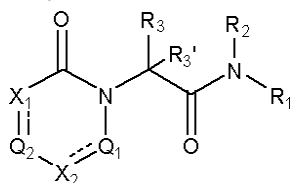
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



を含む化合物、あるいはその多形体、溶媒和物、エステル、互変異性体、エナンチオマー、薬学的に許容し得る塩またはプロドラッグ：

(式中、

X_1 および X_2 は、 CR_4R_5 および NR_6 からなる群からそれぞれ独立して選択され、但し、 X_1 と X_2 のうちの1つが NR_6 であり；

Q_1 および Q_2 は、CO、CSおよび CR_7R_8 からなる群からそれぞれ独立して選択され；

R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビスシクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビスシクロアリールからなる群から選択され；

R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；

R_3 および $R_{3'}$ は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})

アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択されるか、あるいはR₃とR₃'が一緒になって置換または非置換の環を形成し;

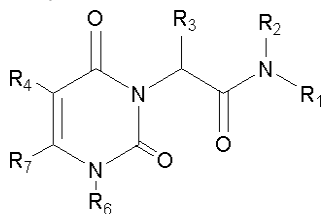
R₄およびR₅は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択され、但し、R₅は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず;

R₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、R₆は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず; かつ

R₇およびR₈は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択されるか、あるいはR₇とR₄またはR₆が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、R₈は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項2】

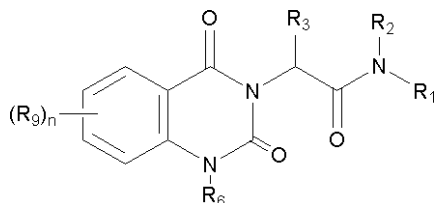
【化 2】



を含む、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

【化 3】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

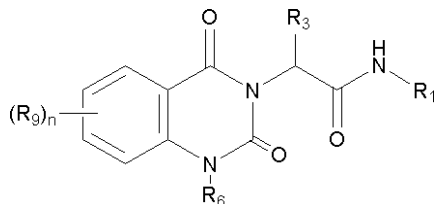
(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；かつ

R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_9 と R_6 または2個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 4】

【化 4】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

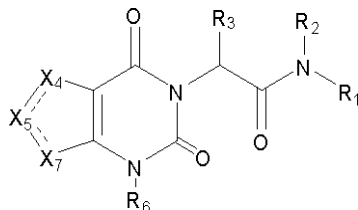
n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；かつ

R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、

イミノ (C_{1-3}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_9 と R_6 または 2 個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 5】

【化 5】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

X_4 、 X_5 および X_7 は、 $CR_{14}R_{15}$ 、CO、CS、 $C(NR_{16})$ 、 NR_{17} 、S および O からなる群から、それぞれ独立して選択され；

R_{13} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_{13} と R_6 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

R_{14} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、(C_{1-10}) オキサアルキル、(C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは 2 個の R_{14} または R_{14} と R_{13} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

R_{15} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10})

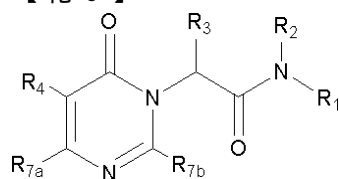
$_{1-10}$)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、(C_{1-10})オキサアルキル、(C_{1-10})オキソアルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、 R_{15} は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず;

R_{16} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリールオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリールオキシ、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され;かつ

R_{17} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリールオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{17} または R_{17} と R_{13} が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、 R_{17} は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項6】

【化6】



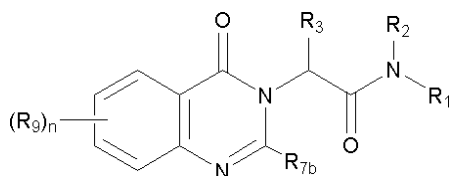
を含む、請求項1記載の化合物:

(式中、

R_{7a} および R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群からそれぞれ独立して選択されるか、あるいは R_{7a} と R_4 が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 7】

【化 7】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

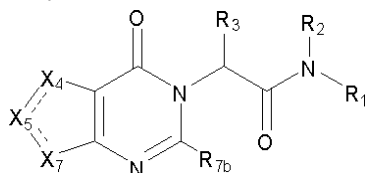
n は、0、1、2、3 および 4 からなる群から選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは 2 個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 8】

【化 8】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

X_4 、 X_5 および X_7 は、 $CR_{14}R_{15}$ 、CO、CS、 $C(NR_{16})$ 、 NR_{17} 、S および O からなる群から、それぞれ独立して選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_{13} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリーロキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリーロキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_{14} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリーロキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリーロキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{1-10}) オキサアルキル、 (C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは 2 個の R_{14} または R_{14} と R_{13} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

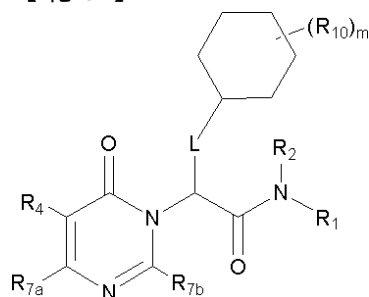
R₁₅は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリアルオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアルオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₁₋₁₀)オキサアルキル、(C₁₋₁₀)オキソアルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリアル(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリアル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアルおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリアルからなる群から選択され、但し、R₁₅は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず；

R₁₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリアルオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアルオキシ、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリアル(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリアル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアルおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリアルからなる群から選択され；かつ

R₁₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリアルオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアルオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリアル(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリアル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリアル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリアル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリアルおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリアルからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₇またはR₁₇とR₁₃が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、R₁₇は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項9】

【化 9】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

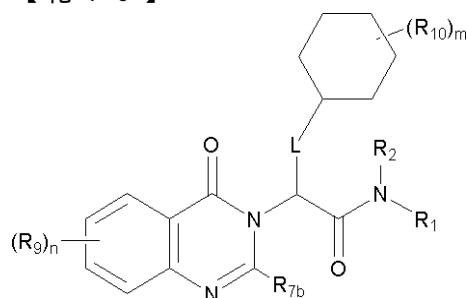
L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7a} および R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択されるか、あるいは R_{7a} と R_4 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 10】

【化 10】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

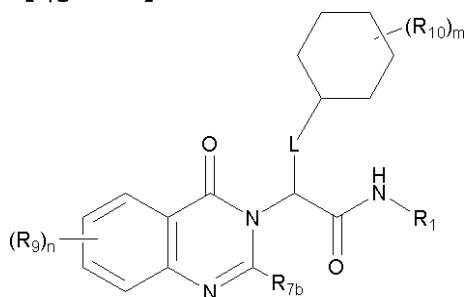
R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 11】

【化 1 1】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

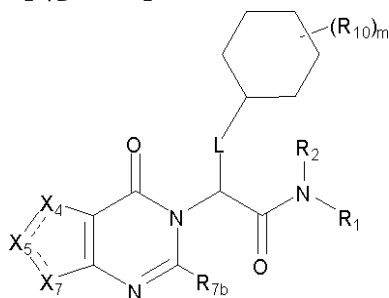
R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリール

およびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリアルからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 1 2】

【化 1 2】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

X_4 、 X_5 および X_7 は、 $CR_{14}R_{15}$ 、 CO 、 CS 、 $C(NR_{16})$ 、 NR_{17} 、 S および O からなる群から、それぞれ独立して選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリアルオキシ、ヘテロアリアルオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリアル(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリアル(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリアル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリアル(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリアル、ヘテロアリアル、(C_{9-12})ビシクロアリアルおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリアルからなる群から選択され；

R_{13} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリアルオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリアルオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリアル(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリアル(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリアル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリアル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリアル、ヘテロ(C_{1-10})アリアル、(C_{9-12})ビシクロアリアルおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリアルからなる群から選択され；

R_{14} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリアルオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリアルオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル

ル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、(C_{1-10})オキサアルキル、(C_{1-10})オキソアルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{14} または R_{14} と R_{13} が一緒になって置換または非置換の環を形成し;

R_{15} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリールオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、(C_{1-10})オキサアルキル、(C_{1-10})オキソアルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、 R_{15} は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず;

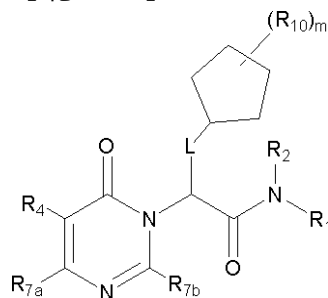
R_{16} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリールオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリールオキシ、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され;かつ

R_{17} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10})アルコキシ、(C_{4-12})アリールオキシ、ヘテロ(C_{1-10})アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、ヒドロキシ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-10})アルキル、チオカルボニル(C_{1-10})アルキル、スルホニル(C_{1-10})アルキル、スルフィニル(C_{1-10})アルキル、アザ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-10})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{1-10})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、(C_{4-12})アリール、ヘテロ(C_{1-10})アリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{17} または R_{17} と R_{13} が一緒になって置換または非置換

の環を形成し、但し、 R_{1-7} は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項 1 3】

【化 1 3】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8および9からなる群から選択され；

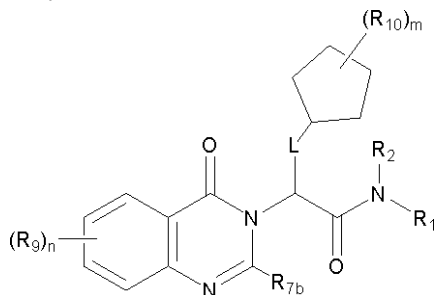
L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7a} および R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択されるか、あるいは R_{7a} と R_4 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 1 4】

【化 1 4】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

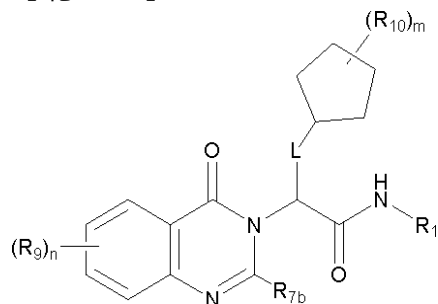
R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリール

およびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₀が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 15】

【化 15】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、CとLが結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；

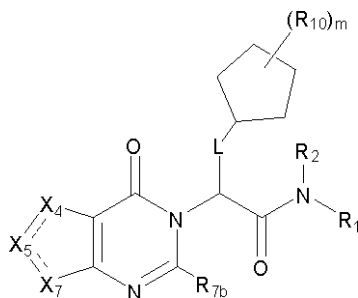
R₉ は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₉が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R₁₀ は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉

$-_{12}$) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 16】

【化 16】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10および11からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

X_4 、 X_5 および X_7 は、 $CR_{14}R_{15}$ 、 CO 、 CS 、 $C(NR_{16})$ 、 NR_{17} 、 S および O からなる群から、それぞれ独立して選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

R_{13} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、

スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_{14} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{1-10}) オキサアルキル、 (C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{14} または R_{14} と R_{13} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

R_{15} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{1-10}) オキサアルキル、 (C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、 R_{15} は、それが結合する原子が二重結合の部分进行する場合に存在せず；

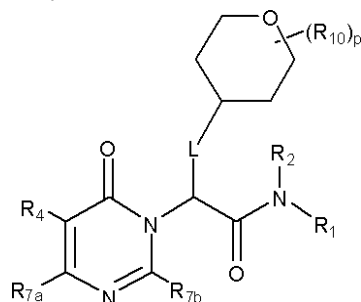
R_{16} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 (C_{1-10}) アルコキシ、 (C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、オキシカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12})

アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₁₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₇または R₁₇ と R₁₃が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、R₁₇は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項 17】

【化 17】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8および9からなる群から選択され；

L は、C とLが結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

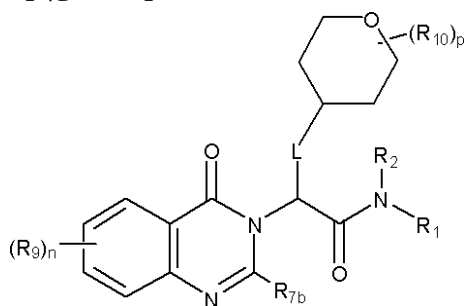
R_{7a}およびR_{7b}は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から、それぞれ独立して選択されるか、あるいはR_{7a}と R₄が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R₁₀は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル

、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₀が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 18】

【化 18】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8および9からなる群から選択され；

L は、CとLが結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7b}は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択され；

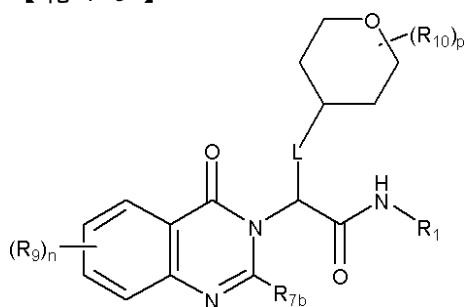
R₉は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₉が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R₁₀は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ

シ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリーール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、(C_{9-12})ビシクロアリーールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリーールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 19】

【化 19】



を含む、請求項 1 記載の化合物：

(式中、

n は、0、1、2、3および4からなる群から選択され；

p は0、1、2、3、4、5、6、7、8および9からなる群から選択され；

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5 または 6 原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され；

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリーール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、(C_{9-12})ビシクロアリーールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリーールからなる群から選択され；

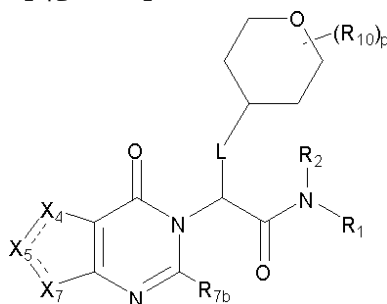
R_9 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリーール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリーール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、(C_{9-12})ビシクロアリーール

およびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_9 が一緒になって置換または非置換の環を形成し; かつ

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個の R_{10} が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 20】

【化 20】



を含む、請求項1記載の化合物:

(式中、

p は、0、1、2、3、4、5、6、7、8および9からなる群から選択され;

L は、 C と L が結合する環との間に0、1、2、3、4、5または6原子の分離を提供するリンカーであり、該分離を提供するリンカーの原子は、炭素、酸素、窒素および硫黄からなる群から選択され;

X_4 、 X_5 および X_7 は、 $CR_{14}R_{15}$ 、 CO 、 CS 、 $C(NR_{16})$ 、 NR_{17} 、 S および O からなる群から、それぞれ独立して選択され;

R_{7b} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ビシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ビシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ビシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ビシクロアリールからなる群から選択され;

R_{10} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロア

ルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₀が一緒になって置換または非置換の環を形成し;

R₁₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され;

R₁₄は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₁₋₁₀)オキサアルキル、(C₁₋₁₀)オキソアルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₄または R₁₄ と R₁₃が一緒になって置換または非置換の環を形成し;

R₁₅は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₁₋₁₀)オキサアルキル、(C₁₋₁₀)オキソアルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、R₁₅は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在せず;

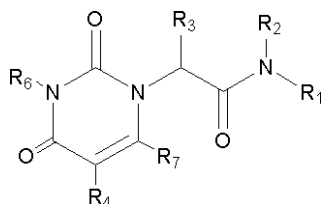
R₁₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)

アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₁₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₁₀)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、(C₄₋₁₂)アリール、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2個のR₁₇または R₁₇ と R₁₃が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、R₁₇は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項 2 1】

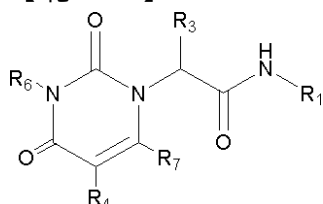
【化 2 1】



を含む、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 2】

【化 2 2】



を含む、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 3】

(S)-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-4-メチルペンタン酸；
(S)-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-4-メチル-N-(チアゾール-2-イル)ペンタンアミド；

(S)-4-メチル-2-(1-メチル-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)ペンタン酸;
(S)-4-メチル-2-(1-メチル-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)ペンタンアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-2-フェニル-N-(チアゾール-2-イル)アセトアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-フェニル-N-(ピリジン-2-イル)プロパンアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)-3-フェニルプロパンアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-フェニル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1H-イミダゾール-4-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;
2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1H-イミダゾール-4-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピリジン-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;
2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-N-(4-メチル-ピリジン-2-イル)アセトアミド;
N-(5-プロモ-6-メチルピリジン-2-イル)-2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)アセトアミド;
2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-N-(5-フェニル-ピリジン-2-イル)アセトアミド;
N-(ベンゾ[d]チアゾール-2-イル)-2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)アセトアミド;
メチル6-(2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)アセトアミド)ニコチネート;
N-(5-プロモピリジン-2-イル)-2-(5-メチル-2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)アセトアミド;
(S)-メチル 2-(2-アミノベンズアミド)-3-シクロヘキシルプロパノエート;
(S)-メチル 3-シクロヘキシル-2-(4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパノエート;
(S)-3-シクロヘキシル-2-(4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
(S)-3-シクロヘキシル-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)-2-(4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;
(S)-シクロヘキシル-2-(4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピリジン-2-イル)プロパンアミド;
(R)-3-シクロヘキシル-2-(2-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
(R)-3-シクロヘキシル-2-(2-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピリジン-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(ヒドロキシメチル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
メチル 2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)プロパノエート;

2-(2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)プロパン酸;

2-(2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;

N-(ベンゾ[d]チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピリジン-2-イル)プロパンアミド;

2-(6-クロロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

2-(6-クロロ-1-メチル-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

6-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ピコリン酸;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)プロパンアミド;

2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(6-クロロ-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-N-チアゾール-2-イル-プロピオンアミド;

2-(6-メタンスルホニル-1, 3-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-N-チアゾール-2-イル-プロピオンアミド;

2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-N-チアゾール-2-イル-プロピオンアミド;

2-(6-クロロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-プロピオンアミド;

2-(6-クロロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-シクロヘキシル-N-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

2-(6-クロロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-シクロヘキシル-N-(5-メチル-[1, 3, 4]チアジアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロペンチル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロペンチル-2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-フルオロ-チアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロペンチル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-フルオロ-チアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-ピリジン-2-イル-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-メチル-チアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-2-チオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-N-チアゾール-2-イル-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-2-チオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-N-ピリジン-2-イル-プロピオンアミド;

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸;

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-ヒドロキシメチル-ピリジン-2-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-N-(5-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-2-(7-(メチルスルホニル)-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-ヒドロキシメチル-ピリジン-2-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-N-(5-ヒドロキシメチル-ピリジン-2-イル)-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-エタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-エタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-エタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-ヒドロキシメチル-チアゾール-2-イル)-プロピオンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-シクロプロパンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-プロピオンアミド;

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-シクロプロパンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

3-{6-[3-シクロヘキシル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ピリジン-3-イル}-プロピオン酸 エチル エステル;

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-(2, 6-ジフルオロ-フェニル)-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(7-(シクロプロピルスルホニル)-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド；

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-シクロペンタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチンアミド；

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-エタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチンアミド；

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-メタンスルホニル-2,4-ジオキソ-1,4-ジヒドロ-2H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド；

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-シクロペンタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸 メチル エステル；

N-(5-クロロ-ピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-[4-オキソ-6-(プロパン-2-スルホニル)-4H-キナゾリン-3-イル]-プロピオンアミド；

6-[2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-フラン-2-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸 メチル エステル；

6-[2-(7-シクロペンタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-(テトラヒドロ-フラン-2-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸 メチル エステル；

N-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-3-フラン-2-イル-2-(7-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオンアミド；

N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(テトラヒドロフラン-2-イル)プロパンアミド；

2-(7-シクロペンタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-N-(5-フルオロ-ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-ピラン-4-イル)-プロピオンアミド；

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-シクロプロピルメタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチン酸 メチル エステル；

6-[3-シクロヘキシル-2-(7-シクロプロパンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチンアミド；

6-[2-(8-クロロ-6-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-3-シクロヘキシル-プロピオニルアミノ]-ニコチンアミド；

6-[3-シクロヘキシル-2-(6-メタンスルホニル-4-オキソ-4H-キナゾリン-3-イル)-プロピオニルアミノ]-ニコチンアミド；

N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド；

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソピリド[3,4-d]ピリミジン3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート；

3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(4-オキソピリド[3,4-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド；

3-シクロヘキシル-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロピリド[3,4-d]ピリミジン-3(4H)-イル)-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)プロパンアミド；

3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(6-メトキシ-4-オキソピリド[3,4-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド；

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソピリド[4,3-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート；

3-シクロヘキシル-2-(2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロピリド[4,3-d]ピリミジン-3(4H)-イル)-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)プロパンアミド；

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソプテリジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート；

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート；

3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド；

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(7-(イソプロピルスルホニル)-4-オキソチエノ[3, 2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;
3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(イソプロピルスルホニル)-4-オキソチエノ[3, 2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド;
N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(イソプロピルスルホニル)-4-オキソチエノ[3, 2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド;
N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(7-(イソプロピルスルホニル)-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロチエノ[3, 2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド;
メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(1-メチル-4-オキソ-1H-ピラゾロ[3, 4-d]ピリミジン-5(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;
3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(1-メチル-4-オキソ-1H-ピラゾロ[3, 4-d]ピリミジン-5(4H)-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(1-メチル-4-オキソ-1H-ピラゾロ[3, 4-d]ピリミジン-5(4H)-イル)-N-(5-メチルピリジン-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(1-メチル-3-(メチルスルホニル)-4-オキソ-1H-ピラゾロ[3, 4-d]ピリミジン-5(4H)-イル)プロパンアミド;
N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(1-メチル-3-(メチルスルホニル)-4-オキソ-1H-ピラゾロ[3, 4-d]ピリミジン-5(4H)-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2-(2-(メチルチオ)-7-オキソチアゾロ[5, 4-d]ピリミジン-6(7H)-イル)プロパンアミド;
2-(9-ベンジル-6-オキソ-6, 9-ジヒドロ-1H-プリン-1-イル)-3-シクロヘキシル-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)プロパンアミド;
2-(9-ベンジル-2, 6-ジオキソ-2, 3, 6, 9-テトラヒドロ-1H-プリン-1-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
3-(4, 4-ジフルオロシクロヘキシル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;
N-シクロプロピル-3-(1-(5-フルオロピリジン-2-イルアミノ)-1-オキソ-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン-2-イル)-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
3-(3-シクロヘキシル-1-(5-フルオロピリジン-2-イルアミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
3-(3-シクロヘキシル-1-(5-フルオロピリジン-2-イルアミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
N-シクロプロピル-3-(3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-1-オキソ-1-(チアゾール-2-イルアミノ)プロパン-2-イル)-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
N-シクロプロピル-3-(3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-1-オキソ-1-(チアゾール-2-イルアミノ)プロパン-2-イル)-2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
3-(1-(5-カルバモイルピリジン-2-イルアミノ)-3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
N-シクロプロピル-3-(3-(4-フルオロフェニル)-1-オキソ-1-(チアゾール-2-イルアミノ)プロパン-2-イル)-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
N-シクロプロピル-3-(3-(3-フルオロフェニル)-1-オキソ-1-(チアゾール-2-イルアミノ)プロパン-2-イル)-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;
3-シクロヘキシル-2-(7-フルオロ-6-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イルチオ)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;
3-シクロヘキシル-2-(7-フルオロ-6-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イルチオ)-2, 4-ジオ

キソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルチアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(8-メトキシ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(6-フルオロ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(ピペリジン-1-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

ベンジル-4-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-4-(チアゾール-2-イルカルバモイル)ピペリジン-1-カルボキシレート;

3-シクロヘキシル-2-(8-メトキシ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-メトキシ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-メトキシ-2, 4-ジオキソ-1, 2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-メトキシ-2-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

1-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)シクロペンタンカルボキサミド;

3-シクロヘキシル-2-(8-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(6-アセトアミド-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-8-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(8-クロロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6, 8-ジメチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(6-クロロ-8-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシル-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-8-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

2-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)-チアゾール-5-カルボン酸;

6-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)-ニコチンアミド;

2-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)-N, N-ジエチルチアゾール-5-カルボキサミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(モルホリン-4-カルボニル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(4-メチルピペラジン-1-カルボニル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-(4-アセチルピペラジン-1-カルボニル)チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(4-(2-(イソプロピルアミノ)-2-オキソエチル)ピペラジン-1-カルボニル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-ホルミルチア

ゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-N-(5-((ジエチルアミノ)メチル)チアゾール-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(モルホリノメチル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-((4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-((4-アセチルピペラジン-1-イル)メチル)チアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-((4-(2-(イソプロピルアミノ))-2-オキソエチル)ピペラジン-1-イル)メチル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(ヒドロキシメチル)チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

2-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)イソニコチンアミド;

6-(3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-フルオロピリジン-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-N-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

エチル 4-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)-1-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボキシレート;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(モルホリン-4-カルボニル)ピリジン-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-(モルホリン-4-カルボニル)ピリジン-2-イル)プロパンアミド;

N-(5-シアノピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

N-(5-シアノピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

6-(3-シクロヘキシル-2-(6-メトキシ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(6-メトキシ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-(1-(5-カルバモイルピリジン-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロピリジン-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-シクロペンチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-(シクロプロパンスルホンアミド)-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イ

ル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-メチル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-(2-(ジメチルアミノ)エチル)-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-(2-(ジメチルアミノ)エチル)-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-((1-メチルピペリジン-4-イル)メチル)-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-3-シクロヘキシル-1-オキソプロパン-2-イル)-N-((1-メチルピペリジン-4-イル)メチル)-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-1-オキソ-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

3-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-1-オキソ-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-7-カルボキサミド;

6-(3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチンアミド;

N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-4-オキソチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-3-シクロヘキシル-2-(7-(メチルスルホニル)-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロチエノ[3,2-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロピリド[2,3-d]ピリミジン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピリミジン-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピラジン-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(ピラジン-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(1H-ピラゾール-5-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(1H-ピラゾール-5-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(5-メチルピリジン-2-イル)プロパンアミド;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(イソオキサゾール-3-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(キノリン-2-イル)プロパンアミド;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-7-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソピリド[2,3-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(5,7-ジメチル-4-オキソピリド[2,3-d]ピリミジン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(オキサゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-7-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

3-シクロヘキシル-2-(7-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-N-(チアゾール-2-イル)プロパンアミド;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(6,7-ジフルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

(S)-メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

(R)-メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(7-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(6,8-ジクロロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(2-(6-クロロ-8-メチル-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-シクロヘキシルプロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-5-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-8-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

(S)-メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-8-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

(R)-メチル 6-(3-シクロヘキシル-2-(4-オキソ-8-(トリフルオロメチル)キナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド)ニコチネート;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-2,4-ジオキソ-1,2-ジヒドロキナゾリン-3(4H)-イル)-3-[4-(1,1-ジオキソ-(テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-イル)]プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-[4-(1,1-ジオキソ-(テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-イル)]プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-4,4,4-トリフルオロ-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)ブタンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-シクロブチル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(3-フルオロピリジン-2-イル)プロパンアミド;

(S)-N-(5-クロロピリジン-2-イル)-4-シクロヘキシル-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)ブタンアミド;

N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(4-(トリフルオロメチル)シクロヘキシル)プロパンアミド;

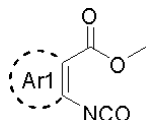
N-(5-クロロピリジン-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-

メチル-1H-ピラゾール-4-イル)プロパンアミド;
 N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-(3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド;
 N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)-3-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)プロパンアミド; および
 N-(5-クロロピリジン-2-イル)-3-(3,3-ジフルオロシクロブチル)-2-(6-フルオロ-4-オキソキナゾリン-3(4H)-イル)プロパンアミド
 からなる群から選択される化合物。

【請求項 2 4】

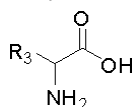
式

【化 2 3】



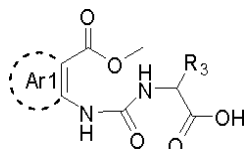
を含む化合物と式

【化 2 4】



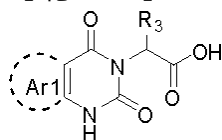
を含む化合物とを、式

【化 2 5】



を含む第一反応生成物を形成する条件下で反応させる工程; および
 該第一反応生成物を、式

【化 2 6】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で処理する工程、
 を含む方法:

(式中、

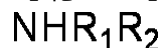
Ar1 は、芳香族環であり; かつ

R₃ は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 2 5】

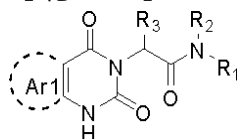
第二反応生成物と式

【化 2 7】



を含む化合物とを、式

【化 2 8】



を含む第三反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 2 4 記載の方法：

(式中、

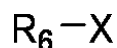
R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択される。)。

【請求項 2 6】

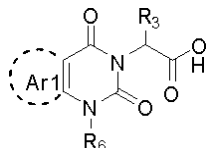
第二反応生成物と式

【化 2 9】



を含む化合物とを、式

【化 3 0】



を含む第四反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；および

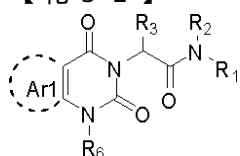
該第四反応生成物と式

【化 3 1】



を含む化合物とを、式

【化 3 2】



を含む第五反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 2 4 記載の方法：

(式中、

X は、脱離基であり；

R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

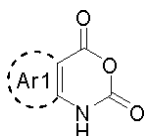
R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；かつ

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 27】

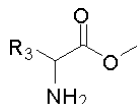
式

【化 3 3】



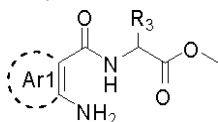
を含む化合物と式

【化 3 4】



を含む化合物とを、式

【化 3 5】



を含む第一反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；

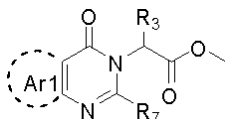
該第一反応生成物と式

【化 3 6】



を含む化合物とを、式

【化 3 7】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；

該第二反応生成物を、式

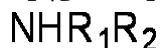
【化 3 8】



を含む第三反応生成物を形成する条件下で処理する工程；および

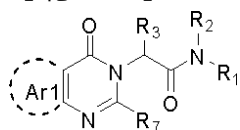
該第三反応生成物と式

【化 3 9】



を含む化合物とを、式

【化 4 0】



を含む第四反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む方法：

(式中、

Ar1 は、芳香族環であり；

R₁ は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択され；

R₂ は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；

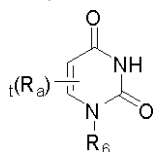
R₃ は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₇ は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 2 8】

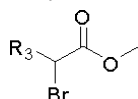
式

【化 4 1】



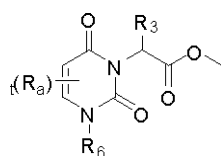
を含む化合物と式

【化 4 2】



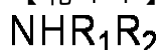
を含む化合物とを、式

【化 4 3】



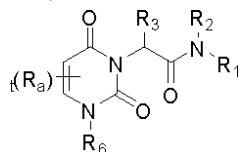
を含む第一反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；および
該第一反応生成物と式

【化 4 4】



を含む化合物とを、式

【化 4 5】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、
を含む方法：

（式中、

t は、0、1および2からなる群から選択され；

R_a は、R₄およびR₇からなる群から選択され；

R₁ は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択され；

R₂ は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；

R₃ は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビスシクロアリールからなる群から選択され；

R₄ は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール(C₁₋₅)アルキル

、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択され；

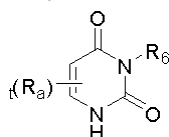
R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_7 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_7 と R_4 または R_6 のいずれかが一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 29】

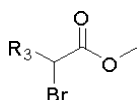
式

【化 46】



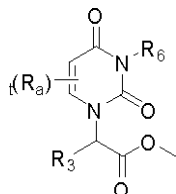
を含む化合物と式

【化 47】



を含む化合物とを、式

【化 48】

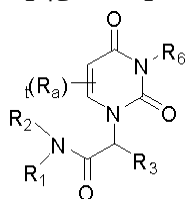


を含む第一反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；および
該第一反応生成物と式

【化 4 9】
 NHR_1R_2

を含む化合物とを、式

【化 5 0】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む方法：

(式 中、

t は、0、1および2からなる群から選択され；

R_a は、 R_4 および R_7 からなる群から選択され；

R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ピシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ(C_{4-12})ピシクロアリールからなる群から選択され；

R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ピシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ピシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ピシクロアリールからなる群から選択され；

R_4 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ピシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ピシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ピシクロアリールからなる群から選択され；

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10})アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10})アルキル、ハロ(C_{1-10})アルキル、カルボニル(C_{1-3})アルキル、チオカルボニル(C_{1-3})アルキル、スルホニル(C_{1-3})アルキル、スルフィニル(C_{1-3})アルキル、アミノ(C_{1-10})アルキル、イミノ(C_{1-3})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル(C_{1-5})アルキル、アリール(C_{1-10})アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{9-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、ヘテロ(C_{8-12})ピシクロアリール(C_{1-5})アルキル、(C_{3-12})シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})シクロアルキル、(C_{9-12})ピシクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12})ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12})ピシクロアリールおよびヘテロ(C_{4-12})ピシクロアリ

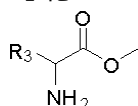
ールからなる群から選択され；かつ

R_7 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_7 と R_4 が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 30】

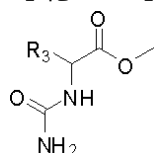
式

【化 5 1】



を含む化合物を、式

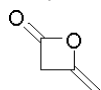
【化 5 2】



を含む第一反応生成物を形成する条件下で処理する工程；

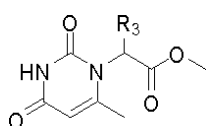
該第一反応生成物と式

【化 5 3】



を含む化合物とを、式

【化 5 4】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む方法：

(式中、

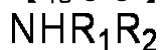
R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、

ル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ピシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 3 1】

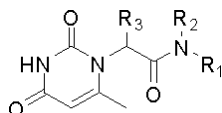
第二反応生成物と式

【化 5 5】



を含む化合物とを、式

【化 5 6】



を含む第三反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 3 0 記載の方法：

(式中、

R₁ は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択され； かつ

R₂ は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択される。)。

【請求項 3 2】

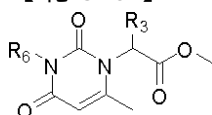
第二反応生成物と式

【化 5 7】



を含む化合物とを、式

【化 5 8】



を含む第四反応生成物を形成する条件下で反応させる工程； および

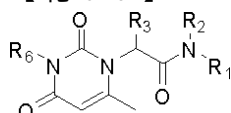
該第四反応生成物と式

【化 5 9】



を含む化合物とを、式

【化 6 0】



を含む第五反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 3 0 記載の方法：

(式中、

X は、脱離基であり；

R₁ は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択され；

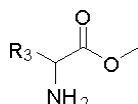
R₂ は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され； かつ

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 33】

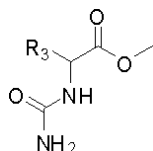
式

【化 6 1】



を含む化合物を、式

【化 6 2】



を含む第一反応生成物を形成する条件下で処理する工程；

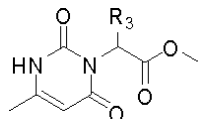
該第一反応生成物と式

【化 6 3】



を含む化合物とを、式

【化 6 4】



を含む第二反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む方法：

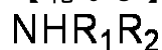
(式中、

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 3 4】

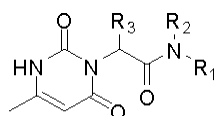
第二反応生成物と式

【化 6 5】



を含む化合物とを、式

【化 6 6】



を含む第三反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 3 3 記載の方法：

(式中、

R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択される。)。

【請求項 3 5】

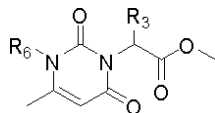
第二反応生成物と式

【化 6 7】



を含む化合物とを、式

【化 6 8】



を含む第四反応生成物を形成する条件下で反応させる工程；および

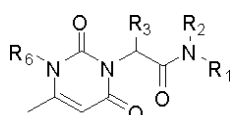
該第四反応生成物と式

【化 6 9】



を含む化合物とを、式

【化 7 0】



を含む第五反応生成物を形成する条件下で反応させる工程、

を含む請求項 3 3 記載の方法：

(式中、

X は、脱離基であり；

R_1 は、それぞれ置換または非置換の、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

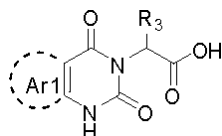
R_2 は、水素およびインビボで水素に変換可能な置換基からなる群から選択され；かつ

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミ

ド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 36】

【化 7 1】



を含む化合物：

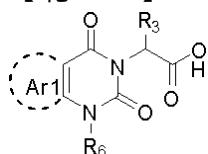
(式中、

Ar1は、芳香族環であり；かつ

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 37】

【化 7 2】



を含む化合物：

(式中、

Ar1は、芳香族環であり；

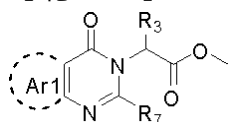
R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビスシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビスシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビスシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビスシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カル

ボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 38】

【化 7 3】



を含む化合物：

(式中、

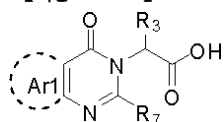
Ar1 は、芳香族環であり；

R₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 39】

【化 7 4】



を含む化合物：

(式中、

Ar1 は、芳香族環であり；

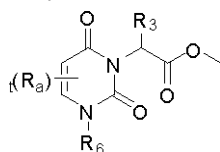
R₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリ

ール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 40】

【化 75】



を含む化合物：

(式中、

t は、0、1および2からなる群から選択され；

R_aは、R₄およびR₇からなる群から選択され；

R₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；

R₄は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；

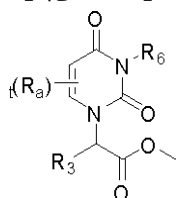
R₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カル

ボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR₇とR₄またはR₆のいずれかが一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 4 1】

【化 7 6】



を含む化合物：

(式中、

t は、0、1および2からなる群から選択され；

R_aは、R₄およびR₇からなる群から選択され；

R₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；

R₄は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、

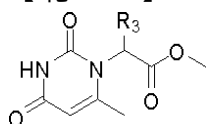
ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ピシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択され；

R₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ピシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₇は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ピシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR₇と R₄が一緒になって置換または非置換の環を形成する。)。

【請求項 4 2】

【化 7 7】



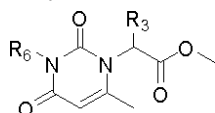
を含む化合物：

(式中、

R₃は、それぞれ置換または非置換の、水素、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ピシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ピシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ピシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ピシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ピシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 4 3】

【化 7 8】



を含む化合物：

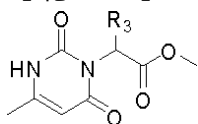
(式中、

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R_6 は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され、但し、 R_6 は、それが結合する原子が二重結合の部分进行する場合に存在しない。)。

【請求項 4 4】

【化 7 9】



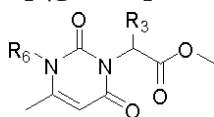
を含む化合物：

(式中、

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 4 5】

【化 8 0】



を含む化合物：

(式中、

R_3 は、それぞれ置換または非置換の、水素、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリ

ール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択され；かつ

R₆は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、スルホニル(C₁₋₃)アルキル、スルフィニル(C₁₋₃)アルキル、アミノ(C₁₋₁₀)アルキル、イミノ(C₁₋₃)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル(C₁₋₅)アルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビシクロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、(C₉₋₁₂)ビシクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C₉₋₁₂)ビシクロアリールおよびヘテロ(C₄₋₁₂)ビシクロアリールからなる群から選択される。)。

【請求項 46】

R₁が置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 ~ 22、25 ~ 29、31、32、34 および 35 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 47】

R₁が、それぞれ置換または非置換の、チアゾリルおよびピリジルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 22、25 ~ 29、31、32、34 および 35 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

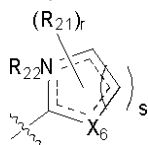
【請求項 48】

R₁が、チアゾール-2-イル、2-ピリジル、5-メチル-チアゾール-2-イル、6-メチル-ピリド-2-イル、4-メチル-ピリド-2-イル、5-プロモ-6-メチル-ピリド-2-イル、5-フェニル-ピリド-2-イル、ベンゾチアゾール-2-イル、ニコチン酸 (a nictoinic acid) メチル エステルおよび5-プロモ-ピリド-2-イルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 22、25 ~ 29、31、32、34 および 35 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 49】

R₁が

【化 81】



を含む、請求項 1 ~ 22、25 ~ 29、31、32、34 および 35 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法；

(式中、

s は、1および2からなる群から選択され；

r は、0、1、2、3、4、5および6からなる群から選択され；

X₆は、CR₁₈R₁₉、NR₂₀、OおよびSからなる群から選択され；

R₁₈は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C₁₋₁₀)アルコキシ、(C₄₋₁₂)アリールオキシ、ヘテロ(C₁₋₁₀)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C₁₋₁₀)アルキル、ハロ(C₁₋₁₀)アルキル、ヒドロキシ(C₁₋₁₀)アルキル、カルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルホニル(C₁₋₁₀)アルキル、スルフィニル(C₁₋₁₀)アルキル、アザ(C₁₋₁₀)アルキル、(C₁₋₁₀)オキサアルキル、(C₁₋₁₀)オキソアルキル、イミノ(

C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

R_{19} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、(C_{1-10}) オキサアルキル、(C_{1-10}) オキソアルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_{18} と R_{19} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；

R_{20} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、(C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択され；

それぞれの R_{21} は、それぞれ置換または非置換の、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、(C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から独立して選択されるか、あるいは 2 個の R_{21} または R_{21} と R_{18} もしくは R_{20} が一緒になって置換または非置換の環を形成し；かつ

R_{22} は、それぞれ置換または非置換の、水素、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C_{1-10}) アルコキシ、(C_{4-12}) アリールオキシ、ヘテロ (C_{1-10}) アリールオキシ、カルボ

ニル、オキシカルボニル、アミノ、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、ヒドロキシ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-10}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-10}) アルキル、スルホニル (C_{1-10}) アルキル、スルフィニル (C_{1-10}) アルキル、アザ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-10}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、 (C_{4-12}) アリール、ヘテロ (C_{1-10}) アリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R_{21} と R_{22} が一緒になって置換または非置換の環を形成し、但し、 R_{22} は、それが結合する原子が二重結合の部分形成する場合に存在しない。)。

【請求項 50】

X_6 が S である、請求項 49 記載の化合物または方法。

【請求項 51】

R_{22} が存在しない、請求項 49 および 50 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 52】

s が 1 である、請求項 49 ~ 51 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 53】

s が 2 である、請求項 49 ~ 51 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 54】

R_1 が、それぞれ置換または非置換の、チアゾリルおよびピリジニルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 22、25 ~ 29、31、32、34 および 35 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 55】

R_2 が水素である、請求項 1 ~ 3、5 ~ 10、12 ~ 14、16 ~ 18、20、21、25 ~ 29、31、32、34、35 および 46 ~ 54 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 56】

R_3 が、それぞれ置換または非置換の、 (C_{1-10}) アルキル、ハロ (C_{1-10}) アルキル、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、アミノ (C_{1-10}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 (C_{9-12}) ビシクロアリールおよびヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリールからなる群から選択される、請求項 1 ~ 8、21、22 および 24 ~ 55 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 57】

R_3 が、それぞれ置換または非置換の、 (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル (C_{1-5}) アルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、およびヘテロアリール (C_{1-5}) アルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 8、21、22 および 24 ~ 55 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 58】

R_3 が、ブチル、ヘキシルメチル、ベンジル、イミダゾール-4-イルメチル、フェニルおよび(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)メチルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 8、21、22 および 24 ~ 55 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 59】

R_4 が置換または非置換の (C_{1-10}) アルキルである、請求項 1、2、6、9、13、17

、21、22、28、29、40、41および46～58のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項60】

R_4 がメチルである、請求項1、2、6、9、13、17、21、22、28、29、40、41および46～58のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項61】

R_4 と R_7 が一緒になって置換または非置換の環を形成する、請求項1、2、21、22、28、29、40、41および46～58のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項62】

R_4 と R_7 が一緒になって置換または非置換のアリール環を形成する、請求項1、2、21、22、28、29、40、41および46～58のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項63】

R_6 が、水素および置換または非置換の(C_{1-10})アルキルからなる群から選択される、請求項1～5、21、22、26、28、29、32、35、37、40、41、43および45～62のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項64】

R_6 がメチルである、請求項1～5、21、22、26、28、29、32、35、37、40、41、43および45～62のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項65】

R_7 が、水素および置換または非置換の(C_{1-10})アルキルからなる群から選択される、請求項1、2、21、22、27～29、38～41および46～64のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項66】

R_7 がメチルである、請求項1、2、21、22、27～29、38～41および46～64のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項67】

R_{7a} が水素および置換または非置換の(C_{1-10})アルキルからなる群から選択される、請求項6、9、13、17および46～64のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項68】

R_{7a} がメチルである、請求項6、9、13、17および46～64のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項69】

R_{7b} が、水素および置換または非置換の(C_{1-10})アルキルからなる群から選択される、請求項6～11、13～20、46～64、67および68のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項70】

R_{7b} がメチルである、請求項6～11、13～20、46～64、67および68のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項71】

R_9 が、水素、ハロおよび置換または非置換のスルホニル(C_{1-3})アルキルからなる群から選択される、請求項3、4、7、10、11、14、15、18、19および46～70のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項72】

R_9 が、それぞれ置換または非置換の、スルホニルメチル、メチルスルホニル、シクロプロピルスルホニルおよびシクロペンチルスルホニルからなる群から選択される、請求項3、4、7、10、11、14、15、18、19および46～70のいずれか1項に記載の化合物または方法。

【請求項73】

Lが、それぞれ置換または非置換の、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2C(O)-$ 、 $-CH_2$

-C(O)CH₂-, -CH₂CH₂C(O)-, -CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂NH-, -CH₂NHCH₂-, -CH₂CH₂NH-, -CH₂NHC(O)-, -CH₂C(O)NH-, -CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂S-, -CH₂C(O)S- および -CH₂SC(O)- からなる群から選択される、請求項 9 ~ 20 および 46 ~ 72 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 74】

n が、0、1 および 2 からなる群から選択される、請求項 3、4、7、10、11、14、15、18、19 および 46 ~ 73 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 75】

m が、0、1 および 2 からなる群から選択される、請求項 9 ~ 16 および 46 ~ 74 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 76】

p が、0、1 および 2 からなる群から選択される、請求項 17 ~ 20 および 46 ~ 75 のいずれか 1 項に記載の化合物または方法。

【請求項 77】

化合物が薬学的に許容し得る塩の形態である、請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 76 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 78】

化合物が立体異性体の混合物で存在している、請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 77 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 79】

化合物が単一の立体異性体を含む、請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 77 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 80】

請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 79 のいずれか 1 項に記載の化合物を有効成分として含む医薬組成物。

【請求項 81】

組成物が経口投与に適した固体製剤である、請求項 80 記載の医薬組成物。

【請求項 82】

組成物が経口投与に適した液体製剤である、請求項 80 記載の医薬組成物。

【請求項 83】

組成物が錠剤である、請求項 80 記載の医薬組成物。

【請求項 84】

組成物が非経口投与に適した液体製剤である、請求項 80 記載の医薬組成物。

【請求項 85】

組成物が、経口、非経口、腹腔内、静脈内、動脈内、経皮、舌下、筋肉内、直腸内、経頬、鼻腔内、リポソーム、吸入経路、膺、眼内、局所送達経路、皮下、脂肪内、関節内およびくも膜下腔内からなる群から選択される経路による投与に適している、請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 79 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 86】

請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 79 のいずれか 1 項に記載の化合物；および

該化合物が投与される疾患状態の表示、化合物の保存情報、投薬情報および化合物の投与方法に関する指示からなる群から選択される 1 つ以上の形態の情報を含む説明書、を含むキット。

【請求項 87】

複数回の投与形態で化合物を含む、請求項 86 記載のキット。

【請求項 88】

請求項 1 ~ 23 および 46 ~ 79 のいずれか 1 項に記載の化合物；および包装材料、を含む製品。

【請求項 89】

包装材料が化合物を収容する容器を含む、請求項 8 8 記載の製品。

【請求項 9 0】

容器が、化合物が投与される疾患状態、保存情報、投薬情報、および / または化合物の投与方法に関する指示からなる群の 1 以上の要素を示すラベルを含む、請求項 8 9 記載の製品。

【請求項 9 1】

複数回の投与形態で化合物を含む、請求項 8 8 記載の製品。

【請求項 9 2】

請求項 1 ~ 2 3 および 4 6 ~ 7 9 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する、グルコキナーゼの活性化剤。

【請求項 9 3】

インビボで第二の化合物に変換される第一の化合物を含有する、グルコキナーゼの活性化剤であって、当該第二の化合物がインビボでグルコキナーゼを活性化し、当該第二の化合物が請求項 1 ~ 2 3 および 4 6 ~ 7 9 のいずれか 1 項に記載の化合物である、活性化剤。

【請求項 9 4】

グルコキナーゼ活性の増大が疾患状態の病理および / または症状を改善する当該疾患状態の治療剤であって、当該治療剤が、請求項 1 ~ 2 3 および 4 6 ~ 7 9 のいずれか 1 項に記載の化合物を当該疾患状態に対する治療有効量で含有する、治療剤。

【請求項 9 5】

グルコキナーゼ活性の増大が疾患状態の病理および / または症状を改善する当該疾患状態の治療剤であって、当該治療剤が、インビボで第二の化合物に変換される第一の化合物を含有し、当該第二の化合物がグルコキナーゼをインビボで活性化し、当該第二の化合物が請求項 1 ~ 2 3 および 4 6 ~ 7 9 のいずれか 1 項に記載の化合物である、治療剤。

【請求項 9 6】

疾患状態が、高血糖、糖尿病、脂質代謝異常症、肥満、インスリン抵抗性、メタボリックシンドローム X、耐糖能障害、多嚢胞性卵巣症候群および心臓血管疾患からなる群から選択される、請求項 9 4 および 9 5 のいずれか 1 項に記載の治療剤。