

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 24 年 1 月 5 日 (2012.1.5)

【公表番号】特表 2011-503199 (P2011-503199A)

【公表日】平成 23 年 1 月 27 日 (2011.1.27)

【年通号数】公開・登録公報 2011-004

【出願番号】特願 2010-534194 (P2010-534194)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

C 0 7 D 295/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 19/02

C 0 7 D 295/14 A

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 11 月 9 日 (2011.11.9)

【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

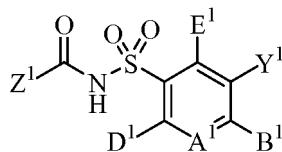
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) :

【化 1】



(I)

[ 式中、

A<sup>1</sup> は N または C ( A<sup>2</sup> ) であり ;

A<sup>2</sup>、B<sup>1</sup>、D<sup>1</sup> および E<sup>1</sup> のうちの 1 個または 2 個または 3 個もしくはそれぞれは、独立に選択される R<sup>1</sup>、OR<sup>1</sup>、SR<sup>1</sup>、S ( O ) R<sup>1</sup>、SO<sub>2</sub> R<sup>1</sup>、C ( O ) R<sup>1</sup>、C ( O ) OR<sup>1</sup>、OC ( O ) R<sup>1</sup>、NHR<sup>1</sup>、N ( R<sup>1</sup> )<sub>2</sub>、C ( O ) NHR<sup>1</sup>、C ( O ) N ( R<sup>1</sup> )<sub>2</sub>、NHC ( O ) R<sup>1</sup>、NHC ( O ) OR<sup>1</sup>、NR<sup>1</sup> C ( O ) NHR<sup>1</sup>、NR<sup>1</sup> C ( O ) N ( R<sup>1</sup> )<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub> NHR<sup>1</sup>、SO<sub>2</sub> N ( R<sup>1</sup> )<sub>2</sub>、NH SO<sub>2</sub> R<sup>1</sup>、NH SO<sub>2</sub> NHR<sup>1</sup> または N ( CH<sub>3</sub> ) SO<sub>2</sub> N ( CH<sub>3</sub> ) R<sup>1</sup> であり、残りのものは、独立に選択される H、F、Cl、Br、I、CN、CF<sub>3</sub>、C ( O ) OH、C ( O ) NH<sub>2</sub> または C ( O ) OR<sup>1A</sup> であり ;

Y<sup>1</sup> は、H、CN、NO<sub>2</sub>、C ( O ) OH、F、Cl、Br、I、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>、OCF<sub>2</sub> CF<sub>3</sub>、R<sup>17</sup>、OR<sup>17</sup>、C ( O ) R<sup>17</sup>、C ( O ) OR<sup>17</sup>、SR<sup>17</sup>、NH<sub>2</sub>、NHR<sup>17</sup>、N ( R<sup>17</sup> )<sub>2</sub>、NHC ( O ) R<sup>17</sup>、C ( O ) NH<sub>2</sub>、C ( O ) NHR<sup>17</sup>、C ( O ) N ( R<sup>17</sup> )<sub>2</sub>、NHS ( O ) R<sup>17</sup> または NH SO

$R^1$  であり；または

$B^1$  および  $Y^1$  が、それらが結合している原子とともに、イミダゾールまたはトリアゾールであり；

$A^2$ 、 $D^1$  および  $E^1$  のうちの 1 個または 2 個もしくはそれぞれは、独立に選択される  $R^1$ 、 $OR^1$ 、 $SR^1$ 、 $S(O)R^1$ 、 $SO_2R^1$ 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $OC(O)R^1$ 、 $NHR^1$ 、 $N(R^1)_2$ 、 $C(O)NHR^1$ 、 $C(O)N(R^1)_2$ 、 $NHC(O)R^1$ 、 $NHC(O)OR^1$ 、 $NHC(O)NHR^1$ 、 $N(CH_3)C(O)N(CH_3)R^1$ 、 $SO_2NHR^1$ 、 $SO_2N(R^1)_2$ 、 $NHSO_2R^1$ 、 $NHSO_2NHR^1$  または  $N(CH_3)SO_2N(CH_3)R^1$  であり、残りのものは、独立に選択される H、F、Cl、Br、I、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $CF_2CF_2CF_3$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$  または  $C(O)OR^1$  <sup>A</sup> であり；

$R^1$  は  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  または  $R^5$  であり；

$R^1$  <sup>A</sup> は、アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニルまたは  $C_3 - C_6$  - アルキニルであり；

$R^2$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $R^2$  <sup>A</sup> と縮合しているフェニルであり； $R^2$  <sup>A</sup> はシクロアルカンまたは複素環アルカンであり；

$R^3$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $R^3$  <sup>A</sup> と縮合しているヘテロアリールであり； $R^3$  <sup>A</sup> はシクロアルカンまたは複素環アルカンであり；

$R^4$  は、それぞれが縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $R^4$  <sup>A</sup> と縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり； $R^4$  <sup>A</sup> は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^5$  は、それぞれ置換されていないか 1 個または 2 個または 3 個の独立に選択される  $R^6$ 、 $NC(R^6)$ 、 $R^7$ 、 $OR^7$ 、 $SR^7$ 、 $S(O)R^7$ 、 $SO_2R^7$ 、 $NHR^7$ 、 $N(R^7)_2$ 、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NHSO_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^7$ 、 $SO_2N(R^7)_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^7$ 、OH、(O)、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、CN、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、F、Cl、Br または I で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^6$  は、置換されていないか OH、(O)、 $N_3$ 、CN、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、F、Cl、Br、I、 $NH_2$ 、 $NH(CH_3)$  または  $N(CH_3)_2$  で置換されている  $C_2 - C_5$  - スピロアルキルであり；

$R^6$  <sup>A</sup> および  $R^6$  <sup>B</sup> は、独立に選択されるアルキルであるか、それらが結合している N と一体となって  $R^6$  <sup>C</sup> であり；

$R^6$  <sup>C</sup> は、それぞれ置き換わっていないか O、C(O)、CNOH、CNOCH<sub>3</sub>、S、S(O)、 $SO_2$  または NH で置き換わっている 1 個の  $CH_2$  部分を有するアジリジン - 1 - イル、アゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イルまたはピペリジン - 1 - イルであり；

$R^7$  は、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  または  $R^{11}$  であり；

$R^8$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^8$  <sup>A</sup> と縮合しているフェニルであり； $R^8$  <sup>A</sup> は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^9$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^9$  <sup>A</sup> と縮合しているヘテロアリールであり； $R^9$  <sup>A</sup> は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{10}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{10}$  <sup>A</sup> と縮合している  $C_3 - C_{10}$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_{10}$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_{10}$  - 複素環アルケニルであり； $R^{10}$  <sup>A</sup> は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{11}$  は、それぞれ置換されていないか 1 個または 2 個または 3 個の独立に選択される  $R^{12}$ 、 $OR^{12}$ 、 $NHR^{12}$ 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$

、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ または $I$ で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{12}$ は、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ または $R^{16}$ であり；

$R^{13}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{13A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{13A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{14}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{14A}$ と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{14A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{15}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{15A}$ と縮合しているシクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり； $R^{15A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{16}$ は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{17}$ は、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$ または $R^{21}$ であり；

$R^{18}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{18A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{18A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{19}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{19A}$ と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{19A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{20}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{20A}$ と縮合している $C_3 - C_{10}$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_{10}$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_{10}$ -複素環アルケニルであり； $R^{20A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{21}$ は、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の独立に選択される $R^{22}$ 、 $OR^{22}$ 、 $NHR^{22}$ 、 $N(R^{22})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{22}$ 、 $C(O)N(R^{22})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ または $I$ で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{22}$ は、 $R^{23}$ 、 $R^{24}$ または $R^{25}$ であり；

$R^{23}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{23A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{23A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{24}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{24A}$ と縮合しているヘテロアレンであり； $R^{24A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{25}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{25A}$ と縮合している $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_6$ -複素環アルケニルであり； $R^{25A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$Z^1$ は、それぞれが $R^{28}$ 、 $R^{29}$ または $R^{30}$ {それぞれ、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CH_2R^{37}$ 、 $CH(R^{31})(R^{37})$ 、 $C(R^{31})(R^{31A})(R^{37})$ 、 $C(O)R^{37}$ 、 $OR^{37}$ 、 $SR^{37}$ 、 $S(O)R^{37}$ 、 $SO_2R^{37}$ 、 $NHR^{37}$ または $N(R^{32})R^{37}$ で置換されている}で置換されている $R^{26}$ または $R^{27}$ であり；

$R^{26}$ は、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{27}$ は、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているヘテロアレンであり；

$R^{28}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{28A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{28A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{29}$  は、ヘテロアリールまたは  $R^{29A}$  であり； $R^{29A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{30}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{30A}$  と縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり； $R^{30A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{31}$  および  $R^{31A}$  は、独立に選択される F、Cl、Br もしくは独立に選択されるアルキルであるか、一体となって  $C_2 - C_5$  - スピロアルキルであり；

$R^{32}$  は、 $R^{33}$ 、 $C(O)R^{33}$  または  $C(O)OR^{33}$  であり；

$R^{33}$  は、 $R^{34}$  または  $R^{35}$  であり；

$R^{34}$  は、縮合していないかアリール、ヘテロアリールまたは  $R^{34A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{34A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{35}$  は、置換されていないか  $R^{36}$  で置換されているアルキルであり；

$R^{36}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{36A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{36A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{37}$  は、それぞれ F、Cl、Br、I、 $R^{41}$ 、 $OR^{41}$ 、 $NHR^{41}$ 、 $N(R^{41})_2$ 、 $NHC(O)OR^{41}$ 、 $SR^{41}$ 、 $S(O)R^{41}$  または  $SO_2R^{41}$  で置換されている  $R^{38}$ 、 $R^{39}$  または  $R^{40}$  であり；

$R^{38}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{38A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{38A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{39}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{39A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{39A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{40}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{40A}$  と縮合している  $C_3 - C_8$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_8$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_8$  - 複素環アルケニルであり； $R^{40A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{41}$  は、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$ 、 $R^{44}$  または  $R^{45}$  であり；

$R^{42}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{42A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{42A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{43}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{43A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{43A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{44}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{44A}$  と縮合している  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{44A}$  はシクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{45}$  は、それぞれ置換されていないか 1 個または 2 個の独立に選択される  $R^{46}$ 、 $OR^{46}$ 、 $NHR^{46}$ 、 $N(R^{46})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{46}$ 、 $C(O)N(R^{46})_2$ 、OH、(O)、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、CN、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2C$ 、 $F_3$ 、F、Cl、Br または I 置換基で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{46}$  は、 $R^{47}$ 、 $R^{48}$  または  $R^{49}$  であり；

$R^{47}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{47A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{47A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{48}$  は、ヘテロアリールまたは  $R^{48A}$  であり； $R^{48A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{49}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{49A}$  と縮合している  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{49A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

前記各環状部分は独立に、置換されていないか、さらに置換されていないか、置換されているか、1個または2個または3個または4個または5個の独立に選択される  $R^{50}$ 、 $OR^{50}$ 、 $SR^{50}$ 、 $S(O)R^{50}$ 、 $SO_2R^{50}$ 、 $C(O)R^{50}$ 、 $CO(O)R^{50}$ 、 $OC(O)R^{50}$ 、 $OC(O)OR^{50}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{50}$ 、 $N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{50}$ 、 $C(O)N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{50}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{50}$ 、 $C(O)NR^{55}SO_2R^{50}$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^{50}$ 、 $SO_2N(R^{50})_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(N)NH_2$ 、 $C(N)NHR^{50}$ 、 $C(N)N(R^{50})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $N_3$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  でさらに置換されており；

$R^{50}$  は、 $R^{51}$ 、 $R^{52}$ 、 $R^{53}$  または  $R^{54}$  であり；

$R^{51}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{51A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{51A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{52}$  は、ヘテロアリールまたは  $R^{52A}$  であり； $R^{52A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{53}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{53A}$  と縮合している  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{53A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{54}$  は、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の、もしくは独立に選択される  $R^{55}$ 、 $OR^{55}$ 、 $SR^{55}$ 、 $S(O)R^{55}$ 、 $SO_2R^{55}$ 、 $NHR^{55}$ 、 $N(R^{55})_2$ 、 $C(O)R^{55}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{55}$ 、 $NHC(O)R^{55}$ 、 $NH SO_2R^{55}$ 、 $NHC(O)OR^{55}$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^{55}$ 、 $SO_2N(R^{55})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{55}$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $(O)$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{55}$  は、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニル、ヘテロアリール、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルキルである ] を有する化合物、または該化合物の治療上許容される塩を含む、哺乳動物の関節炎を治療するための医薬組成物。

#### 【請求項2】

$A^1$  が  $C(A^2)$  であり；

$A^2$ 、 $B^1$ 、 $D^1$  および  $E^1$  のうちの1個または2個または3個もしくはそれぞれが、独立に選択される  $R^1$ 、 $OR^1$ 、 $SR^1$ 、 $S(O)R^1$ 、 $SO_2R^1$ 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $OC(O)R^1$ 、 $NHR^1$ 、 $N(R^1)_2$ 、 $C(O)NHR^1$ 、 $C(O)N(R^1)_2$ 、 $NHC(O)R^1$ 、 $NHC(O)OR^1$ 、 $NR^1C(O)NHR^1$ 、 $NR^1C(O)N(R^1)_2$ 、 $SO_2NHR^1$ 、 $SO_2N(R^1)_2$ 、 $NH SO_2R^1$ 、 $NH SO_2NHR^1$  または  $N(CH_3)SO_2N(CH_3)R^1$  であり、残りのものは、独立に選択される  $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$  ま

たは  $C(O)OR^{1A}$  であり；

$Y^1$  が、 $H$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $R^{17}$ 、 $OR^{17}$ 、 $C(O)R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、 $SR^{17}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{17}$ 、 $N(R^{17})_2$ 、 $NHC(O)R^{17}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{17}$ 、 $C(O)N(R^{17})_2$ 、 $NHS(O)R^{17}$  または  $NHSO_2R^{17}$  であり；

$R^1$  が  $R^2$ 、 $R^4$  または  $R^5$  であり；

$R^{1A}$  が、アルキル、 $C_3 - C_6$ -アルケニルまたは  $C_3 - C_6$ -アルキニルであり；

$R^2$  が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^4$  が、それぞれが縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり；

$R^5$  が、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の独立に選択される  $NC(R^{6A})(R^{6B})$ 、 $R^7$ 、 $OR^7$ 、 $SR^7$ 、 $S(O)R^7$ 、 $SO_2R^7$ 、 $NHR^7$ 、 $N(R^7)_2$ 、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NHSO_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{6A}$  および  $R^{6B}$  が、独立に選択されるアルキルであるか、それらが結合している  $N$  と一体となって  $R^{6C}$  であり；

$R^{6C}$  が、アジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イルまたはピペリジン-1-イルであり；

$R^7$  が、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  または  $R^{11}$  であり；

$R^8$  が、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{8A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{8A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^9$  が、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{10}$  が、それぞれ縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合している  $C_3 - C_{10}$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_{10}$ -複素環アルキルまたは  $C_4 - C_{10}$ -複素環アルケニルであり；

$R^{11}$  が、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の独立に選択される  $R^{12}$ 、 $OR^{12}$ 、 $NHR^{12}$ 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{12}$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{12}$  が、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  または  $R^{16}$  であり；

$R^{13}$  が、縮合していないか複素環アルカンと縮合しているフェニルであり；

$R^{14}$  が、それぞれ縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{15}$  が、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{16}$  が、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{17}$  が、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の独立に選択される  $R^{22}$ 、 $OR^{22}$ 、 $NHR^{22}$ 、 $N(R^{22})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{22}$ 、 $C(O)N(R^{22})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$Z^1$  が、それぞれが  $R^{28}$ 、 $R^{29}$  または  $R^{30}$  {それぞれ、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $C_2H_5$ 、 $R^{37}$ 、 $C(R^{31})(R^{31A})(R^{37})$ 、 $C(O)R^{37}$ 、 $OR^{37}$ 、 $SR^3$

$R^7$ 、 $S(O)R^{37}$ 、 $SO_2R^{37}$ 、 $NHR^{37}$ または $N(R^{32})R^{37}$ で置換されている}で置換されている $R^{26}$ または $R^{27}$ であり；

$R^{26}$ が、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{27}$ が、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているヘテロアレンであり；

$R^{28}$ が、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{29}$ が、ヘテロアリールまたは $R^{29A}$ であり； $R^{29A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{30}$ が、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{30A}$ と縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり； $R^{30A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{31}$ および $R^{31A}$ が、一体となって $C_2 - C_5$ -スピロアルキルであり；

$R^{37}$ が、それぞれF、Cl、Br、I、 $R^{41}$ 、 $OR^{41}$ 、 $NHR^{41}$ 、 $N(R^{41})_2$ 、 $NHC(O)OR^{41}$ 、 $SR^{41}$ 、 $S(O)R^{41}$ または $SO_2R^{41}$ で置換されている $R^{38}$ 、 $R^{39}$ または $R^{40}$ であり；

$R^{38}$ が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{39}$ が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{40}$ が、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_8$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_8$ -複素環アルケニルであり；

$R^{41}$ が、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$ 、 $R^{44}$ または $R^{45}$ であり；

$R^{42}$ が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{43}$ が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{44}$ が、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_6$ -複素環アルケニルであり；

$R^{45}$ が、アルキルであり；

前記各環状部分が独立に、置換されていないか、さらに置換されていないか、置換されているか、1個または2個または3個または4個または5個の独立に選択される $R^{50}$ 、 $OR^{50}$ 、 $SR^{50}$ 、 $SO_2R^{50}$ 、 $C(O)R^{50}$ 、 $CO(O)R^{50}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{50}$ 、 $N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NH SO_2R^{50}$ 、 $C(O)OH$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、F、Cl、BrまたはIでさらに置換されており；

$R^{50}$ が、 $R^{51}$ 、 $R^{52}$ 、 $R^{53}$ または $R^{54}$ であり；

$R^{51}$ が、縮合していないかベンゼンと縮合しているフェニルであり；

$R^{52}$ が、ヘテロアリールであり；

$R^{53}$ が、それぞれ縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合している $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_6$ -複素環アルケニルであり；

$R^{54}$ が、置換されていないか $R^{55}$ 、 $OR^{55}$ 、 $SR^{55}$ もしくは $N(R^{55})_2$ で置換されているアルキルであり；

$R^{55}$ が、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニル、ヘテロアリール、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_6$ -複素環アルケニルである、請求項1に記載の医薬組成物。

#### 【請求項3】

$A^1$ が $C(A^2)$ であり；

$A^2$ 、 $B^1$ 、 $D^1$  および  $E^1$  のうちの 1 個または 2 個または 3 個もしくはそれぞれが、独立に選択される  $R^1$ 、 $OR^1$ 、 $SO_2R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $NHR^1$ 、 $NR^1C(O)N(R^1)_2$  であり、残りのものは、独立に選択される  $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CF_3$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$  または  $C(O)OR^{1A}$  であり； $R^{1A}$  はアルキルであり；

$Y^1$  が、 $H$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CF_3$ 、 $R^{17}$ 、 $NH_2$ 、 $C(O)NH_2$  であり；

$R^1$  がフェニル、 $R^4$  または  $R^5$  であり；

$R^4$  が、シクロアルキルまたは複素環アルキルであり；

$R^5$  が、置換されていないか 1 個もしくは 2 個の独立に選択される  $R^7$ 、 $OR^7$ 、 $SR^7$ 、 $SO_2R^7$ 、 $NHR^7$ 、 $N(R^7)_2$ 、 $C(O)R^7$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^7$ 、 $NHC(O)R^7$ 、 $NHSO_2R^7$ 、 $NHC(O)OR^7$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキルであり；

$R^7$  が、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  または  $R^{11}$  であり；

$R^8$  が、縮合していないか複素環アルカンと縮合しているフェニルであり；

$R^9$  が、縮合していないかベンゼンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{10}$  が、 $C_3 - C_{10}$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_{10}$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_{10}$  - 複素環アルケニルであり；

$R^{11}$  が、置換されていないか  $R^{12}$ 、 $N(R^{12})_2$ 、 $C(O)N(R^{12})_2$ 、 $OH$ 、 $C(O)OH$ 、 $CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキルであり；

$R^{12}$  が、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  または  $R^{16}$  であり；

$R^{13}$  が、縮合していないか複素環アルカンと縮合しているフェニルであり；

$R^{14}$  が、ヘテロアリールであり；

$R^{15}$  が、複素環アルカンであり；

$R^{16}$  が、アルキルであり；

$R^{17}$  が、アルキルであり；

$Z^1$  が、それぞれが  $R^{30}$  {それぞれ、 $CH_2R^{37}$  または  $C(R^{31})(R^{31A})$  ( $R^{37}$ ) で置換されている} で置換されている  $R^{26}$  または  $R^{27}$  であり；

$R^{26}$  が、フェニルであり；

$R^{27}$  が、ヘテロアレンであり；

$R^{30}$  が、それぞれ縮合していないか複素環アルカンと縮合しているシクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり；

$R^{31}$  および  $R^{31A}$  が、一体となって  $C_2 - C_5$  - スピロアルキルであり；

$R^{37}$  が、それぞれ  $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $R^{41}$ 、 $NHC(O)OR^{41}$ 、 $SR^{41}$  または  $SO_2R^{41}$  で置換されている  $R^{38}$ 、 $R^{39}$  または  $R^{40}$  であり；

$R^{38}$  が、縮合していないかベンゼンと縮合しているフェニルであり；

$R^{39}$  が、ヘテロアリールであり；

$R^{40}$  が、 $C_4 - C_8$  - シクロアルケニルまたは  $C_4 - C_8$  - 複素環アルケニルであり；

；

$R^{41}$  が、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$ 、 $R^{44}$  または  $R^{45}$  であり；

$R^{42}$  が、縮合していないかベンゼンもしくはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{43}$  が、縮合していないかベンゼンと縮合しているヘテロアリールであり；

$R^{44}$  が、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルであり；

$R^{45}$  が、アルキルであり；

前記各環状部分が独立に、置換されていないか、さらに置換されていないか、置換されているか、1 個もしくは 2 個の独立に選択される  $R^{50}$ 、 $OR^{50}$ 、 $SR^{50}$ 、 $SO_2R^{50}$ 、 $C(O)R^{50}$ 、 $CO(O)R^{50}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{50}$ 、 $N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHSO_2R^{50}$ 、 $C(O)OH$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $CF_3$ 、 $OC$



$F_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ または $I$ でさらに置換されており；  
 $R^{50}$ が、 $R^{51}$ 、 $R^{52}$ 、 $R^{53}$ または $R^{54}$ であり；  
 $R^{51}$ が、ベンゼンと縮合しているフェニルであり；  
 $R^{52}$ が、ヘテロアリールであり；  
 $R^{53}$ が、それぞれ縮合していないかベンゼンと縮合している $C_3 - C_6$ -シクロアルキルまたは $C_3 - C_6$ -複素環アルキルであり；  
 $R^{54}$ が、置換されていないか $R^{55}$ 、 $SR^{55}$ もしくは $N(R^{55})_2$ で置換されているアルキルであり；  
 $R^{55}$ が、アルキル、フェニルまたは $C_3 - C_6$ -複素環アルキルである、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

$N - (4 - (4 - ((4 - \text{クロロ}(1, 1 - \text{ビフェニル}) - 2 - \text{イル}) \text{メチル}) \text{ピペラジン} - 1 - \text{イル}) \text{ベンゾイル}) - 4 - ((1R) - 3 - (\text{ジメチルアミノ}) - 1 - ((\text{フェニルスルファニル}) \text{メチル}) \text{プロピル}) \text{アミノ}) - 3 - \text{ニトロベンゼンスルホンアミド}$ を含む、哺乳動物の関節炎を治療するための医薬組成物。

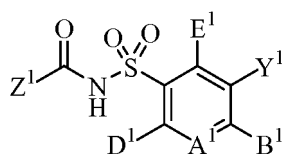
【請求項5】

$N - (4 - (4 - ((2 - (4 - \text{クロロフェニル}) - 5, 5 - \text{ジメチル} - 1 - \text{シクロヘキス} - 1 - \text{エン} - 1 - \text{イル}) \text{メチル}) \text{ピペラジン} - 1 - \text{イル}) \text{ベンゾイル}) - 4 - ((1R) - 3 - (\text{モルホリン} - 4 - \text{イル}) - 1 - ((\text{フェニルスルファニル}) \text{メチル}) \text{プロピル}) \text{アミノ}) - 3 - ((\text{トリフルオロメチル}) \text{スルホニル}) \text{ベンゼンスルホンアミド}$ を含む、哺乳動物の関節炎を治療するための医薬組成物。

【請求項6】

哺乳動物の関節炎を治療するための、下記式(I)：

【化2】



(I)

[式中、

$A^1$ は $N$ または $C(A^2)$ であり；

$A^2$ 、 $B^1$ 、 $D^1$ および $E^1$ のうちの1個または2個または3個もしくはそれぞれは、独立に選択される $R^1$ 、 $OR^1$ 、 $SR^1$ 、 $S(O)R^1$ 、 $SO_2R^1$ 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $OC(O)R^1$ 、 $NHR^1$ 、 $N(R^1)_2$ 、 $C(O)NHR^1$ 、 $C(O)N(R^1)_2$ 、 $NHC(O)R^1$ 、 $NHC(O)OR^1$ 、 $NR^1C(O)NHR^1$ 、 $NR^1C(O)N(R^1)_2$ 、 $SO_2NHR^1$ 、 $SO_2N(R^1)_2$ 、 $NHSO_2R^1$ 、 $NHSO_2NHR^1$ または $N(CH_3)SO_2N(CH_3)R^1$ であり、残りのものは、独立に選択される $H$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $CF_3$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(O)NH_2$ または $C(O)OR^A$ であり；

$Y^1$ は、 $H$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C(O)OH$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $R^{17}$ 、 $OR^{17}$ 、 $C(O)R^{17}$ 、 $C(O)OR^{17}$ 、 $SR^{17}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{17}$ 、 $N(R^{17})_2$ 、 $NHC(O)R^{17}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{17}$ 、 $C(O)N(R^{17})_2$ 、 $NHS(O)R^{17}$ または $NHSO_2R^{17}$ であり；または

$B^1$ および $Y^1$ が、それらが結合している原子とともに、イミダゾールまたはトリアゾールであり；

$A^2$ 、 $D^1$ および $E^1$ のうちの1個または2個もしくはそれぞれは、独立に選択される $R^1$ 、 $OR^1$ 、 $SR^1$ 、 $S(O)R^1$ 、 $SO_2R^1$ 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $OC(O)R^1$ 、 $NHR^1$ 、 $N(R^1)_2$ 、 $C(O)NHR^1$ 、 $C(O)N(R^1)_2$ 、 $N$

$\text{HC}(\text{O})\text{R}^1$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^1$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^1$ 、 $\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)\text{R}^1$ 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^1$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^1$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}^1$  または  $\text{N}(\text{CH}_3)\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{R}^1$  であり、残りのものは、独立に選択される  $\text{H}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$  または  $\text{C}(\text{O})\text{OR}^1\text{A}$  であり；

$\text{R}^1$  は  $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  または  $\text{R}^5$  であり；

$\text{R}^1\text{A}$  は、アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -アルケニルまたは  $\text{C}_3 - \text{C}_6$ -アルキニルであり；

$\text{R}^2$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $\text{R}^2\text{A}$  と縮合しているフェニルであり； $\text{R}^2\text{A}$  はシクロアルカンまたは複素環アルカンであり；

$\text{R}^3$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $\text{R}^3\text{A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $\text{R}^3\text{A}$  はシクロアルカンまたは複素環アルカンであり；

$\text{R}^4$  は、それぞれが縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンもしくは  $\text{R}^4\text{A}$  と縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり； $\text{R}^4\text{A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$\text{R}^5$  は、それぞれ置換されていないか 1 個または 2 個または 3 個の独立に選択される  $\text{R}^6$ 、 $\text{NC}(\text{R}^6\text{A})(\text{R}^6\text{B})$ 、 $\text{R}^7$ 、 $\text{OR}^7$ 、 $\text{SR}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^7$ 、 $\text{NHR}^7$ 、 $\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^7$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}^7$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{OR}^7$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^7$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^7$ 、 $\text{OH}$ 、 $(\text{O})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{N}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$  または  $\text{I}$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$\text{R}^6$  は、置換されていないか  $\text{OH}$ 、 $(\text{O})$ 、 $\text{N}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NH}(\text{CH}_3)$  または  $\text{N}(\text{CH}_3)_2$  で置換されている  $\text{C}_2 - \text{C}_5$ -スピロアルキルであり；

$\text{R}^6\text{A}$  および  $\text{R}^6\text{B}$  は、独立に選択されるアルキルであるか、それらが結合している  $\text{N}$  と一体となって  $\text{R}^6\text{C}$  であり；

$\text{R}^6\text{C}$  は、それぞれ置き換わっていないか  $\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{O})$ 、 $\text{CNOH}$ 、 $\text{CNOCH}_3$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{SO}_2$  または  $\text{NH}$  で置き換わっている 1 個の  $\text{CH}_2$  部分を有するアジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イルまたはピペリジン-1-イルであり；

$\text{R}^7$  は、 $\text{R}^8$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$  または  $\text{R}^{11}$  であり；

$\text{R}^8$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $\text{R}^8\text{A}$  と縮合しているフェニルであり； $\text{R}^8\text{A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$\text{R}^9$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $\text{R}^9\text{A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $\text{R}^9\text{A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$\text{R}^{10}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $\text{R}^{10\text{A}}$  と縮合している  $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ -シクロアルキル、 $\text{C}_4 - \text{C}_{10}$ -シクロアルケニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ -複素環アルキルまたは  $\text{C}_4 - \text{C}_{10}$ -複素環アルケニルであり； $\text{R}^{10\text{A}}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$\text{R}^{11}$  は、それぞれ置換されていないか 1 個または 2 個または 3 個の独立に選択される  $\text{R}^{12}$ 、 $\text{OR}^{12}$ 、 $\text{NHR}^{12}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NHR}^{12}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{OH}$ 、 $(\text{O})$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $\text{N}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$  または  $\text{I}$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$\text{R}^{12}$  は、 $\text{R}^{13}$ 、 $\text{R}^{14}$ 、 $\text{R}^{15}$  または  $\text{R}^{16}$  であり；

$\text{R}^{13}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $\text{R}^{13\text{A}}$  と縮合しているフェニルであり； $\text{R}^{13\text{A}}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複

素環アルケンであり；

$R^{14}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{14A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{14A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{15}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{15A}$  と縮合しているシクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり； $R^{15A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{16}$  は、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{17}$  は、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$  または  $R^{21}$  であり；

$R^{18}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{18A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{18A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{19}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{19A}$  と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{19A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{20}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{20A}$  と縮合している  $C_3 - C_{10}$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_{10}$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_{10}$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_{10}$  - 複素環アルケニルであり； $R^{20A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{21}$  は、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の独立に選択される  $R^{22}$ 、 $OR^{22}$ 、 $NHR^{22}$ 、 $N(R^{22})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{22}$ 、 $C(O)N(R^{22})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{22}$  は、 $R^{23}$ 、 $R^{24}$  または  $R^{25}$  であり；

$R^{23}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{23A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{23A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{24}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{24A}$  と縮合しているヘテロアレンであり； $R^{24A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{25}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{25A}$  と縮合している  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{25A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$Z^1$  は、それぞれが  $R^{28}$ 、 $R^{29}$  または  $R^{30}$  {それぞれ、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CH_2R^{37}$ 、 $CH(R^{31})(R^{37})$ 、 $C(R^{31})(R^{31A})(R^{37})$ 、 $C(O)R^{37}$ 、 $OR^{37}$ 、 $SR^{37}$ 、 $S(O)R^{37}$ 、 $SO_2R^{37}$ 、 $NHR^{37}$  または  $N(R^{32})R^{37}$  で置換されている} で置換されている  $R^{26}$  または  $R^{27}$  であり；

$R^{26}$  は、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているフェニルであり；

$R^{27}$  は、縮合していないかベンゼンまたはヘテロアレンと縮合しているヘテロアレンであり；

$R^{28}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{28A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{28A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{29}$  は、ヘテロアリールまたは  $R^{29A}$  であり； $R^{29A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{30}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{30A}$  と縮合し

ているシクロアルキル、シクロアルケニル、複素環アルキルまたは複素環アルケニルであり； $R^{30A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{31}$ および $R^{31A}$ は、独立に選択されるF、Cl、Brもしくは独立に選択されるアルキルであるか、一体となって $C_2 - C_5$ -スピロアルキルであり；

$R^{32}$ は、 $R^{33}$ 、 $C(O)R^{33}$ または $C(O)OR^{33}$ であり；

$R^{33}$ は、 $R^{34}$ または $R^{35}$ であり；

$R^{34}$ は、縮合していないかアリール、ヘテロアリールまたは $R^{34A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{34A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{35}$ は、置換されていないか $R^{36}$ で置換されているアルキルであり；

$R^{36}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{36A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{36A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{37}$ は、それぞれF、Cl、Br、I、 $R^{41}$ 、 $OR^{41}$ 、 $NHR^{41}$ 、 $N(R^{41})_2$ 、 $NHC(O)OR^{41}$ 、 $SR^{41}$ 、 $S(O)R^{41}$ または $SO_2R^{41}$ で置換されている $R^{38}$ 、 $R^{39}$ または $R^{40}$ であり；

$R^{38}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{38A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{38A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{39}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{39A}$ と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{39A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{40}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{40A}$ と縮合している $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_8$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_8$ -複素環アルケニルであり； $R^{40A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{41}$ は、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$ 、 $R^{44}$ または $R^{45}$ であり；

$R^{42}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{42A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{42A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{43}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{43A}$ と縮合しているヘテロアリールであり； $R^{43A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{44}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{44A}$ と縮合している $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_4 - C_6$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$ -複素環アルキルまたは $C_4 - C_6$ -複素環アルケニルであり； $R^{44A}$ はシクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{45}$ は、それぞれ置換されていないか1個または2個の独立に選択される $R^{46}$ 、 $OR^{46}$ 、 $NHR^{46}$ 、 $N(R^{46})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{46}$ 、 $C(O)N(R^{46})_2$ 、OH、(O)、 $C(O)OH$ 、 $N_3$ 、CN、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、F、Cl、BrまたはI置換基で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{46}$ は、 $R^{47}$ 、 $R^{48}$ または $R^{49}$ であり；

$R^{47}$ は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{47A}$ と縮合しているフェニルであり； $R^{47A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{48}$ は、ヘテロアリールまたは $R^{48A}$ であり； $R^{48A}$ は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{49}$ は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは $R^{49A}$ と縮合し

ている  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{49A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

前記各環状部分は独立に、置換されていないか、さらに置換されていないか、置換されているか、1個または2個または3個または4個または5個の独立に選択される  $R^{50}$ 、 $OR^{50}$ 、 $SR^{50}$ 、 $S(O)R^{50}$ 、 $SO_2R^{50}$ 、 $C(O)R^{50}$ 、 $CO(O)R^{50}$ 、 $OC(O)R^{50}$ 、 $OC(O)OR^{50}$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^{50}$ 、 $N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{50}$ 、 $C(O)N(R^{50})_2$ 、 $C(O)NHOH$ 、 $C(O)NHOR^{50}$ 、 $C(O)NH SO_2R^{50}$ 、 $C(O)NR^{55}SO_2R^{50}$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^{50}$ 、 $SO_2N(R^{50})_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $C(O)H$ 、 $C(O)OH$ 、 $C(N)NH_2$ 、 $C(N)NHR^{50}$ 、 $C(N)N(R^{50})_2$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $N_3$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  でさらに置換されており；

$R^{50}$  は、 $R^{51}$ 、 $R^{52}$ 、 $R^{53}$  または  $R^{54}$  であり；

$R^{51}$  は、縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{51A}$  と縮合しているフェニルであり； $R^{51A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{52}$  は、ヘテロアリールまたは  $R^{52A}$  であり； $R^{52A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{53}$  は、それぞれ縮合していないかベンゼン、ヘテロアレンまたは  $R^{53A}$  と縮合している  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルケニルであり； $R^{53A}$  は、シクロアルカン、シクロアルケン、複素環アルカンまたは複素環アルケンであり；

$R^{54}$  は、それぞれ置換されていないか1個または2個または3個の、もしくは独立に選択される  $R^{55}$ 、 $OR^{55}$ 、 $SR^{55}$ 、 $S(O)R^{55}$ 、 $SO_2R^{55}$ 、 $NHR^{55}$ 、 $N(R^{55})_2$ 、 $C(O)R^{55}$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(O)NHR^{55}$ 、 $NHC(O)R^{55}$ 、 $NH SO_2R^{55}$ 、 $NHC(O)OR^{55}$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^{55}$ 、 $SO_2N(R^{55})_2$ 、 $NHC(O)NH_2$ 、 $NHC(O)NHR^{55}$ 、 $OH$ 、 $(O)$ 、 $C(O)OH$ 、 $(O)$ 、 $N_3$ 、 $CN$ 、 $NH_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $CF_2CF_3$ 、 $OCF_2CF_3$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$  または  $I$  で置換されているアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；

$R^{55}$  は、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニル、ヘテロアリール、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_4 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  - 複素環アルキルまたは  $C_4 - C_6$  - 複素環アルキルである ] を有する化合物、または該化合物の治療上許容される塩。