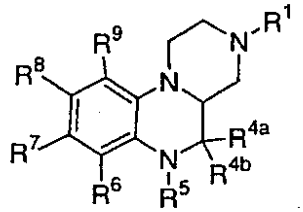
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-524298(P2004-524298A)
【公表日】平成16年8月12日(2004.8.12)
【年通号数】公開・登録公報2004-031
【出願番号】特願2002-559429(P2002-559429)
【国際特許分類第７版】
　Ｃ０７Ｄ 487/04
　Ａ６１Ｋ　31/4985
　Ａ６１Ｐ　 3/04
　Ａ６１Ｐ　25/18
　Ａ６１Ｐ　25/24
　Ａ６１Ｐ　43/00
【ＦＩ】
　Ｃ０７Ｄ 487/04　　１４７
　Ａ６１Ｋ　31/4985
　Ａ６１Ｐ　 3/04
　Ａ６１Ｐ　25/18
　Ａ６１Ｐ　25/24
　Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
　Ａ６１Ｐ　43/00　　１１４

【手続補正書】
【提出日】平成16年9月29日(2004.9.29)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）：
【化１】

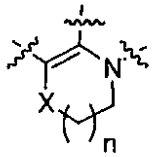


(I)

［式中、
R^1 は
　Ｈ、
　Ｃ(＝Ｏ)R^2 、
　Ｃ(＝Ｏ)ＯR^2 、
　$C_{1\sim8}$ アルキル、
　$C_{2\sim8}$ アルケニル、

$C_{2\sim8}$アルキニル、
$C_{3\sim7}$シクロアルキル、
Ｚで置換された$C_{1\sim6}$アルキル、
Ｚで置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、
Ｚで置換された$C_{2\sim6}$アルキニル、
Ｚで置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
Ｚで置換されたアリール、
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つＺで置換されている）、
Ｙで置換された$C_{1\sim3}$アルキル、
Ｙで置換された$C_{2\sim3}$アルケニル、
Ｙで置換された$C_{2\sim3}$アルキニル、
０～２個のR^2で置換された$C_{1\sim6}$アルキル、
０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、
０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルキニル、
０～２個のR^2で置換されたアリール、および
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つ０～２個のR^2で置換されている）
から選ばれる。
Ｙは、
Ｚで置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
Ｚで置換されたアリール、
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つＺで置換されている）、
－($C_{1\sim3}$アルキル)－Ｚで置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
－($C_{1\sim3}$アルキル)－Ｚで置換されたアリール、および
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つ－($C_{1\sim3}$アルキル)－Ｚで置換されている）
から選ばれる。
Ｚは、
Ｈ、
－ＣＨ(ＯＨ)R^2、
－Ｃ(エチレンジオキシ)R^2、
－ＯR^2、
－ＳR^2、
－ＮR^2 R^3、
－Ｃ(Ｏ)R^2、
－Ｃ(Ｏ)ＮR^2 R^3、
－ＮR^3 Ｃ(Ｏ)R^2、
－Ｃ(Ｏ)ＯR^2、
－ＯＣ(Ｏ)R^2、
－ＣＨ(＝ＮR^4)ＮR^2 R^3、
－ＮＨＣ(＝ＮR^4)ＮR^2 R^3、
－Ｓ(Ｏ)R^2、
－$S(O)_2$ R^2、
－$S(O)_2$ ＮR^2 R^3、および
－ＮR^3 $S(O)_2$ R^2
から選ばれる。
各R^2は独立して、
ハロ、

$C_{1\sim3}$ ハロアルキル、
$C_{1\sim4}$ アルキル、
$C_{2\sim4}$ アルケニル、
$C_{2\sim4}$ アルキニル、
$C_{3\sim6}$ シクロアルキル、
０～５個のR^{42}で置換されたアリール、
０～３個のR^{41}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{41}で置換されている）、
から選ばれて、
各R^3は独立して、Ｈ、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれるか；あるいは、
R^2およびR^3は一緒になって、適宜－Ｏ－または－Ｎ(R^4)－で置換された５または６員環を形成する。
各R^4は独立して、Ｈおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。
R^{4a}は、Ｈまたは$C_{1\sim4}$アルキルであって、
R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏまたは＝Ｓを形成する。
R^5は、Ｈまたは$C_{1\sim4}$アルキルであって、
R^6は、Ｈまたは$C_{1\sim4}$アルキルであるか；あるいは、
R^5およびR^6は一緒になって、式：
【化２】



［式中、
Ｘは、結合、－CH_2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ(＝Ｏ)－、－$S(=O)_2$－、－NR^{10}－、－CH_2CH_2－、－OCH_2－、－SCH_2－、－CH_2O－、－CH_2S－、－CH_2NR^{10}－、－$NR^{10}CH_2$－、－ＮＨＣ(＝Ｏ)－または－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－である。そして、
ｎは、１または２である］
の縮合したヘテロ環を形成する。
R^7およびR^9は各々独立して、
Ｈ、ハロ、－CF_3、－OCF_3、－ＯＨ、－ＣＮ、－NO_2、－$NR^{46}R^{47}$、
$C_{1\sim8}$アルキル、$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim8}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$の炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、Ｃ(Ｏ)Ｈ、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}$

$S(O)_2R^{15}$および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^8は、
H、ハロ、$-CF_3$、$-OCF_3$、$-OH$、$-CN$、$-NO_2$、
$C_{1\sim8}$アルキル、$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim8}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
0～2個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSから選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$C(O)H$、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{10}は、
H、
0～2個のR^{10A}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～2個のR^{10A}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{10A}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、および
$C_{1\sim4}$アルコキシ
から選ばれる。
R^{10A}は、
$C_{1\sim4}$アルコキシ、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$炭素環基、
0～3個のR^{33}で置換されたフェニル、および
5～6員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1、2または3個含有し、且つ0～2個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
R^{11}は、
H、ハロ、$-CF_3$、$-CN$、$-NO_2$、
$C_{1\sim8}$アルキル、$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim8}$アルコキシ、$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$C(O)H$、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。

各R^{12}は独立して、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{1～4}$アルキル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2～4}$アルケニル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2～4}$アルキニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3～6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{12a}は独立して、
０～５個のR^{33}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれ、そして、
各R^{13}は独立して、Ｈ、$C_{1～4}$アルキル、$C_{2～4}$アルケニルおよび$C_{2～4}$アルキニルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－Ｏ－または－Ｎ(R^{14})－で置換された５または６員の環を形成するか；あるいは、
Ｎと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、不飽和または一部飽和であり、そして０～３個のR^{16}で置換されている）を形成し得る。
各R^{14}は独立して、Ｈおよび$C_{1～4}$アルキルから選ばれる。
各R^{15}は独立して、Ｈ、$C_{1～4}$アルキル、$C_{2～4}$アルケニルおよび$C_{2～4}$アルキニルから選ばれる。
各R^{16}は独立して、
Ｈ、ＯＨ、ハロ、ＣＮ、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－Ｃ(＝Ｏ)Ｈ、
$C_{1～4}$アルキル、$C_{2～4}$アルケニル、$C_{2～4}$アルキニル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～3}$ハロアルキル－オキシ－および$C_{1～3}$アルキルオキシ－
から選ばれる。
各R^{31}は独立して、Ｈ、ＯＨ、ハロ、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$および$C_{1～4}$アルキルから選ばれる。
各R^{33}は独立して、
Ｈ、ＯＨ、ハロ、ＣＮ、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－Ｃ(＝Ｏ)Ｈ、
フェニル、$C_{1～6}$アルキル、$C_{2～6}$アルケニル、$C_{2～6}$アルキニル、$C_{3～6}$シクロアルキル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～4}$ハロアルキル－オキシ－、$C_{1～4}$アルキルオキシ－、$C_{1～4}$アルキルチオ－、$C_{1～4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)－、$C_{1～4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、$C_{1～4}$アルキル－ＯＣ(＝Ｏ)－、$C_{1～4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)Ｏ－、$C_{3～6}$シクロアルキル－オキシ－、$C_{3～6}$シクロアルキルメチル－オキシ－、
置換された$C_{1～6}$アルキル（該置換基は、ＯＨ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO_2R^{45}、－$NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}$Ｃ(＝Ｏ)－または($C_{1～4}$アルキル)CO_2－である）および
置換された$C_{2～6}$アルケニル（該置換基は、ＯＨ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO_2R^{45}、－$NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}$Ｃ(＝Ｏ)－または($C_{1～4}$アルキル)CO_2－である）
から選ばれる。

各R^{41}は独立して、
H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、＝O、
$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、
0～1個のR^{43}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～3個のR^{42}で置換されたアリール、および
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{42}は独立して、
H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、SOR^{45}、SR^{45}、$NR^{46}SO_2R^{45}$、$NR^{46}COR^{45}$、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、$CH(=NH)NH_2$、$NHC(=NH)NH_2$、
$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
0～1個のR^{43}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～3個のR^{44}で置換されたアリールおよび
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
R^{43}は、0～3個のR^{44}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキルまたはアリールである。
各R^{44}は独立して、H、ハロ、－OH、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、－CF_3、－OCF_3、－CN、－NO_2、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれる。
R^{45}は、$C_{1\sim4}$アルキルである。
各R^{46}は独立して、Hおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。そして、
各R^{47}は独立して、H、$C_{1\sim4}$アルキル、－$C(=O)NH(C_{1\sim4}$アルキル)、－$SO_2(C_{1\sim4}$アルキル)、－$C(=O)O(C_{1\sim4}$アルキル)、－$C(=O)(C_{1\sim4}$アルキル)および－C(＝O)Hから選ばれる。
但し、R^5がHまたは$C_{1\sim4}$アルキルであって、R^6がHまたは$C_{1\sim4}$アルキルである場合には、R^7、R^8およびR^9の少なくとも1個は、1）1～5個のR^{33}で置換されたアリール基；2）1～5個のR^{33}で置換されたアリールメチル基；または3）－$NR^{12}R^{13}$（ここで、R^{12}は1～5個のR^{33}で置換されたアリール基である）のいずれかでなければいけない］
の化合物、またはその立体異性体もしくは医薬的に許容し得る塩。
【請求項2】
式（I）の請求項1に記載の化合物：
［該式（I）中、
R^1は、
H、
$C(=O)R^2$、
$C(=O)OR^2$、
$C_{1\sim8}$アルキル、
$C_{2\sim8}$アルケニル、
$C_{2\sim8}$アルキニル
$C_{3\sim7}$シクロアルキル、
0～2個のR^2で置換された$C_{1\sim6}$アルキル、
0～2個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、

０～２個のR^{2}で置換されたC$_{2～6}$アルキニル、
０～２個のR^{2}で置換されたアリール、および
５～６員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つ０～２個のR^{2}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{2}は独立して、
F、Cl、CH$_{2}$F、CHF$_{2}$、CF$_{3}$、
C$_{1～4}$アルキル、、
C$_{2～4}$アルケニル、
C$_{2～4}$アルキニル、
C$_{3～6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{41}で置換されたC$_{3～10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{41}で置換されている）、
から選ばれる。
R^{4a}は、HまたはC$_{1～4}$アルキルであって、
R^{4b}は、Hであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Oまたは＝Sを形成する。
R^{5}は、HまたはC$_{1～4}$アルキルである。
R^{6}は、HまたはC$_{1～4}$アルキルである。
R^{7}は、
H、F、Cl、－CF$_{3}$、－OCF$_{3}$、－OH、－CN、－NO$_{2}$、NR^{12}R^{13}、
C$_{1～8}$アルキル、C$_{2～8}$アルケニル、C$_{2～8}$アルキニル、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{1～8}$アルコキシ、(C$_{1～4}$ハロアルキル)オキシ、
R^{11}で置換されたメチル、
０～３個のR^{33}で置換されたC$_{3～6}$炭素環基、および
０～５個のR^{33}で置換されたアリール
から選ばれる。
R^{8}は、
H、F、Cl、－CF$_{3}$、－OCF$_{3}$、－OH、－CN、－NO$_{2}$、NR^{12}R^{13}、
C$_{1～8}$アルキル、C$_{2～8}$アルケニル、C$_{2～8}$アルキニル、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{1～8}$アルコキシ、(C$_{1～4}$ハロアルキル)オキシ、
R^{11}で置換されたメチル、
０～３個のR^{33}で置換されたC$_{3～6}$炭素環基、および
０～５個のR^{33}で置換されたアリール
から選ばれる。
R^{9}は、
H、F、Cl、－CF$_{3}$、－OCF$_{3}$、－OH、－CN、－NO$_{2}$、
C$_{1～8}$アルキル、C$_{2～8}$アルケニル、C$_{2～8}$アルキニル、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{1～8}$アルコキシおよび(C$_{1～4}$ハロアルキル)オキシ
から選ばれる。
R^{11}は、０～５個のR^{33}で置換されたアリールである。
R^{12}は、０～５個のR^{33}で置換されたアリールであって、
各R^{13}は独立して、H、C$_{1～4}$アルキル、C$_{2～4}$アルケニルおよびC$_{2～4}$アルキニルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－O－または－N(R^{14})－で置換された５または６員の環を形成するか；あるいは、

Nと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、不飽和または一部飽和であり、そして０～３個のR^{16}で置換されている）を形成し得る。

各R^{14}は独立して、Hおよび$C_{1～4}$アルキルから選ばれる。

各R^{16}は独立して、

H、OH、ハロ、CN、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－C(＝O)H、

$C_{1～4}$アルキル、$C_{2～4}$アルケニル、$C_{2～4}$アルキニル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～3}$ハロアルキル－オキシ－および$C_{1～3}$アルコキシ－

から選ばれる。

各R^{33}は独立して、

H、OH、ハロ、CN、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－C(＝O)H、

フェニル、$C_{1～6}$アルキル、$C_{2～6}$アルケニル、$C_{2～6}$アルキニル、$C_{3～6}$シクロアルキル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～4}$ハロアルキル－オキシ－、$C_{1～4}$アルキルオキシ－、$C_{1～4}$アルキルチオ－、$C_{1～4}$アルキル－C(＝O)－、$C_{1～4}$アルキル－C(＝O)NH－、$C_{1～4}$アルキル－OC(＝O)－、$C_{1～4}$アルキル－C(＝O)O－、$C_{3～6}$シクロアルキル－オキシ－、$C_{3～6}$シクロアルキルメチル－オキシ－、

置換された$C_{1～6}$アルキル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、$－SO_2R^{45}$、$－NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(＝O)－$または$(C_{1～4}アルキル)CO_2－$である）、および

置換された$C_{2～6}$アルケニル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、$－SO_2R^{45}$、$－NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(＝O)－$または$(C_{1～4}アルキル)CO_2－$である）

から選ばれる。

各R^{41}は独立して、

H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、＝O、

$C_{2～8}$アルケニル、$C_{2～8}$アルキニル、$C_{1～4}$アルコキシ、$C_{1～4}$ハロアルキル、

０～１個のR^{43}で置換された$C_{1～4}$アルキル、

０～３個のR^{42}で置換されたアリール、および

５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）

から選ばれる。

各R^{42}は独立して、

H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、SOR^{45}、SR^{45}、$NR^{46}SO_2R^{45}$、$NR^{46}COR^{45}$、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、$CH(＝NH)NH_2$、$NHC(＝NH)NH_2$、

$C_{2～6}$アルケニル、$C_{2～6}$アルキニル、$C_{1～4}$アルコキシ、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{3～6}$シクロアルキル、

０～１個のR^{43}で置換された$C_{1～4}$アルキル、

０～３個のR^{44}で置換されたアリール、および

５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）

から選ばれる。

R^{43}は、０～３個のR^{44}で置換された$C_{3～6}$シクロアルキルまたはアリールである。

各R^{44}は独立して、H、ハロ、－OH、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、

－CF_3、－OCF_3、－CN、－NO_2、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれる。
R^{45}は、$C_{1\sim4}$アルキルである。
各R^{46}は独立して、Hおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。そして、
各R^{47}は独立して、H、$C_{1\sim4}$アルキル、－C(＝O)NH($C_{1\sim4}$アルキル)、－SO_2($C_{1\sim4}$アルキル)、－C(＝O)O($C_{1\sim4}$アルキル)、－C(＝O)($C_{1\sim4}$アルキル)および－C(＝O)Hから選ばれる。
但し、R^7またはR^8の少なくとも１個は、１）１～５個のR^{33}で置換されたアリール基；２）１～５個のR^{33}で置換されたアリールメチル基；または３）－$NR^{12}R^{13}$（ここで、R^{12}は１～５個のR^{33}で置換されたアリール基である）のいずれかでなければいけない］。
【請求項３】
式（Ｉ）の請求項２に記載の化合物：
［該式（Ｉ）中、
R^1は、
Ｈ、
０～１個のR^2で置換された$C_{1\sim5}$アルキル、
０～１個のR^2で置換された$C_{2\sim5}$アルケニル、および
０～１個のR^2で置換された$C_{2\sim3}$アルキニル
から選ばれる。
R^2は、$C_{3\sim6}$シクロアルキルである。
R^{4a}は、Ｈである。
R^{4b}は、Ｈである。
R^7は、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、－CH_3、－OCH_3、－CF_3、－OCF_3、－CN、－NO_2、$NR^{12}R^{13}$、R^{11}、R^{11}で置換されたメチルおよび０～２個のR^{33}で置換されたフェニルから選ばれる。
R^8は、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、－CH_3、－OCH_3、－CF_3、－OCF_3、－CN、－NO_2、$NR^{12}R^{13}$、R^{11}、R^{11}で置換されたメチル、および０～２個のR^{33}で置換されたフェニルから選ばれる。
R^9は、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、－CH_3、－OCH_3、－CF_3、－OCF_3、－CNおよび－NO_2から選ばれる。
R^{11}は、
０～５個のフルオロで置換されたフェニル－、
０～３個のR^{33}で置換されたナフチル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(HC(＝O))－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(H_3COCH_2)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3COCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH(OMe)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3COC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2CH=CH$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－((MeOC＝O)CH＝CH)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(メチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(エチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(ｉ－プロピル)－フェニル－、

R^{33}で置換された２－(F_3C)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(H_3CS)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(エトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(ｉ－プロポキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(ｉ－ブトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(($(H_3C)_2CHC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(($(H_3C)_2CHCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(シクロプロピルオキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(シクロブチルオキシ)－フェニル－
R^{33}で置換された４－(シクロペンチルオキシ)－フェニル－、および
から選ばれる。
R^{12}は、
０～５個のフルオロで置換されたフェニル－、
０～３個のR^{33}で置換されたナフチル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(H_3COCH_2)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3COCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3CCH(OMe)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($H_3COC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－($HOCH_2CH=CH$)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－((MeOC＝O)CH＝CH)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(メチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(エチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(ｉ－プロピル)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(F_3C)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(NC)－フェニル－、

R^{33}で置換された２－(Ｈ$_3$ＣＯ)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された２－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(ＮＣ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(Ｈ$_3$ＣＯ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された３－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(ＮＣ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＳ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＯ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(エトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(ｉ－プロポキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(ｉ－ブトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$ＣＨ$_2$Ｃ(＝Ｏ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－((Ｈ$_3$Ｃ)$_2$ＣＨＣ(＝Ｏ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$Ｃ(＝Ｏ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣ(＝Ｏ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ(ＯＨ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－((Ｈ$_3$Ｃ)$_2$ＣＨＣＨ(ＯＨ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$ＣＨ(ＯＨ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(Ｈ$_3$ＣＣＨ(ＯＨ))－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(シクロプロピルオキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された４－(シクロブチルオキシ)－フェニル－、および
R^{33}で置換された４－(シクロペンチルオキシ)－フェニル－
から選ばれて、
R^{13}は、Ｈ、メチルまたはエチルであるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、５または６員の環（これは、ピロリル、ピロリジニル、イミダゾリル、ピペリジニル、ピペリジニル、メチルピペリジニルおよびモルホリニルから選ばれる）を形成するか；あるいは、
Ｎと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイミダゾリニルおよびベンゾトリアゾリルから選ばれ、０～１個のR^{16}で置換されている）
を形成し得る。
R^{15}は、Ｈ、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである。
各R^{16}は独立して、Ｈ、ＯＨ、Ｆ、Ｃｌ、ＣＮ、ＮＯ$_2$、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。そして、
各R^{33}は独立して、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、－ＣＨ$_3$、－ＯＣＨ$_3$、－ＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＮ、および－ＮＯ$_2$から選ばれる。
但し、R^{7}およびR^{8}の少なくとも１個は、１）１～５個のR^{33}で置換されたアリール基；２）１～５個のR^{33}で置換されたアリールメチル基；または３）－ＮR^{12} R^{13}（ここで、R^{12}は１～５個のR^{33}で置換されたアリール基である）のいずれかでなければいけない］。
【請求項４】
式（Ｉ）の請求項２に記載の化合物：
［該式（Ｉ）中、
R^{1}は、水素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｎ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、ｎ－ヘキシル、２－プロピル、２－ブチル、２－ペンチル、２－ヘキシ

ル、２－メチルプロピル、２－メチルブチル、３－メチルペンチル、２－エチルブチル、２－メチルペンチル、３－メチルブチル、４－メチルペンチル、２－フルオロエチル、２,２－ジフルオロエチル、２,２,２－トリフルオロエチル、２－プロペニル、２－メチル－２－プロペニル、トランス－２－ブテニル、３－エチル－ブテニル、３－ブテニル、トランス－２－ペンテニル、シス－２－ペンテニル、４－ペンテニル、４－メチル－３－ペンテニル、３,３－ジクロロ－２－プロペニル、トランス－３－フェニル－２－プロペニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、－ＣＨ＝ＣＨ$_2$、－ＣＨ$_2$－ＣＨ＝ＣＨ$_2$、－ＣＨ＝ＣＨ－ＣＨ$_3$、－Ｃ≡ＣＨ、－Ｃ≡Ｃ－ＣＨ$_3$および－ＣＨ$_2$－Ｃ≡ＣＨから選ばれる。

Ｒ^{4a}は、Ｈであって、

Ｒ^{4b}は、Ｈであるか；あるいは

Ｒ^{4a}およびＲ^{4b}は一緒になって、＝Ｏを形成する。

Ｒ^{7}は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｔ－ブチル、ニトロ、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。

Ｒ^{8}は、

２－クロロフェニル、２－フルオロフェニル、２－ブロモフェニル、２－シアノフェニル、２－メチルフェニル、２－トリフルオロメチルフェニル、２－メトキシフェニル、２－トリフルオロメトキシフェニル、

３－クロロフェニル、３－フルオロフェニル、３－ブロモフェニル、３－シアノフェニル、３－メチルフェニル、３－エチルフェニル、３－プロピルフェニル、３－イソプロピルフェニル、３－ブチルフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、３－メトキシフェニル、３－イソプロポキシフェニル、３－トリフルオロメトキシフェニル、３－チオメトキシフェニル、

４－クロロフェニル、４－フロオロフェニル、４－ブロモフェニル、４－シアノフェニル、４－メチルフェニル、４－エチルフェニル、４－プロピルフェニル、４－イソプロピルフェニル、４－ブチルフェニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－メトキシフェニル、４－イソプロポキシフェニル、４－トリフルオロメトキシフェニル、４－チオメトキシフェニル、

２,３－ジクロロフェニル、２,３－ジフルオロフェニル、２,３－ジメチルフェニル、２,３－ジトリフルオロメチルフェニル、２,３－ジメトキシフェニル、２,３－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,４－ジクロロフェニル、２,４－ジフルオロフェニル、２,４－ジメチルフェニル、２,４－ジトリフルオロメチルフェニル、２,４－ジメトキシフェニル、２,４－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,５－ジクロロフェニル、２,５－ジフルオロフェニル、２,５－ジメチルフェニル、２,５－ジトリフルオロメチルフェニル、２,５－ジメトキシフェニル、２,５－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,６－ジクロロフェニル、２,６－ジフルオロフェニル、２,６－ジメチルフェニル、２,６－ジトリフルオロメチルフェニル、２,６－ジメトキシフェニル、２,６－ジトリフルオロメトキシフェニル、

３,４－ジクロロフェニル、３,４－ジフルオロフェニル、３,４－ジメチルフェニル、３,４－ジトリフルオロメチルフェニル、３,４－ジメトキシフェニル、３,４－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,４,６－トリクロロフェニル、２,４,６－トリフルオロフェニル、２,４,６－トリメチルフェニル、２,４,６－トリトリフルオロメチルフェニル、２,４,６－トリメトキシフェニル、２,４,６－トリトリフルオロメトキシフェニル、

２－クロロ－４－ＣＦ$_3$－フェニル、２－フルオロ－３－クロロ－フェニル、２－クロロ－４－ＣＦ$_3$－フェニル、２－クロロ－４－メトキシ－フェニル、２－メトキシ－４

－イソプロピル－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－メトキシ－フェニル、２－メチル－４－メトキシ－５－フルオロ－フェニル、２－メチル－４－メトキシ－フェニル、２－クロロ－４－ＣＦ$_3$Ｏ－フェニル、２，４，５－トリメチル－フェニル、２－メチル－４－クロロ－フェニル、

４－アセチルフェニル、３－アセトアミドフェニル、２－ナフチル、

２－Ｍｅ－５－Ｆ－フェニル、２－Ｆ－５－Ｍｅ－フェニル、２－ＯＭｅ－５－Ｆ－フェニル、２－Ｍｅ－３－Ｃｌ－フェニル、３－ＮＯ$_2$－フェニル、２－ＮＯ$_2$－フェニル、２－Ｃｌ－３－Ｍｅ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＥｔＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－６－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－４－(ＣＨＦ$_2$)Ｏ－フェニル、２，４－ジＭｅＯ－６－Ｆ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－６－Ｆ－フェニル、２－ＭｅＳ－フェニル、２，６－ジＣｌ－４－ＭｅＯ－フェニル、２，３，４－トリＦ－フェニル、２，６－ジＦ－４－Ｃｌ－フェニル、２，３，４，６－テトラＦ－フェニル、２，３，４，５，６－ペンタＦ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－ＥｔＯ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－ｉＰｒＯ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－Ｃｌ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－４－ＥｔＯ－フェニル、２－Ｃｌ－４－ｉＰｒＯ－フェニル、２－Ｅｔ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨＯ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＣＨ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｆ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｃｌ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｍｅ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＣＨ(ＯＭｅ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨ$_3$Ｃ(＝Ｏ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨ$_3$Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｆ－フェニル、２－ＣＨ$_3$Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｃｌ－フェニル、２－ＣＨ$_3$Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｍｅ－フェニル、２－Ｈ$_2$Ｃ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｈ$_2$Ｃ(ＯＭｅ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$ＣＨ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｈ$_3$ＣＣＨ$_2$Ｃ(＝Ｏ)－４－ＭｅＯ－フェニル、

２－ＣＨ$_3$ＣＯ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｚ)－２－ＨＯＣＨ$_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｅ)－２－ＨＯＣＨ$_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｚ)－２－ＣＨ$_3$ＣＯ$_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｅ)－２－ＣＨ$_3$ＣＯ$_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨ$_3$ＯＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｆ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｃｌ－４－Ｆ－フェニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキシルメチル、

ベンジル、２－Ｆ－ベンジル、３－Ｆ－ベンジル、４－Ｆ－ベンジル、３－ＭｅＯ－ベンジル、３－ＯＨ－ベンジル、２－ＭｅＯ－ベンジル、２－ＯＨ－ベンジル、２－ＭｅＯＣ(＝Ｏ)－３－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＣＮ－フェニル、２－Ｍｅ－３－ＣＮ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＭｅＳ－フェニル、２－ＣＦ$_3$－４－ＣＮ－フェニル、２－ＣＨＯ－フェニル、３－ＣＨＯ－フェニル、２－ＨＯＣＨ$_2$－フェニル、３－ＨＯＣＨ$_2$－フェニル、３－ＭｅＯＣＨ$_2$－フェニル、３－Ｍｅ$_2$ＮＣＨ$_2$－フェニル、３－ＣＮ－４－Ｆ－フェニル、２－Ｍｅ－４－Ｈ$_2$ＮＣＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＭｅＯＣ(＝Ｏ)－フェニル、３－Ｈ$_2$ＮＣＯ－４－Ｆ－フェニル、２－Ｍｅ$_2$ＮＣＨ$_2$－４－ＭｅＯ－フェニル－、２－Ｍｅ－４－ＣＨ$_3$Ｃ(＝Ｏ)－フェニル、

フェニル－ＮＨ－、(１－ナフチル)－ＮＨ－、(２－ナフチル)－ＮＨ－、(２－[１，１’－ビフェニル])－ＮＨ－、(３－[１，１’－ビフェニル])－ＮＨ－、(４－[１，１’－ビフェニル])－ＮＨ－、(２－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＣＨ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＣＨ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＯＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＣＨ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＯＣＦ$_3$－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２，３－ジＣｌ－フェニ

ル)－ＮＨ－、(２,４－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジＦ-フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－Ｆ－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－ＣＨ３－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－Ｃｌ－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃ１－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－CH_3－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－CF_3－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＣＦ３－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－ＯＭｅ－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ

－、(２－ＯＭｅ－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、

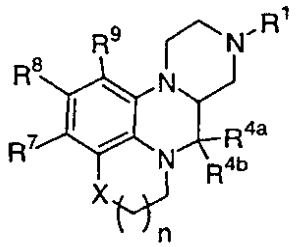
(３－CF_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－CF_3－４－Ｃ(Ｏ)CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３,５－トリＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－CH_3－４－CO_2Ｍｅ－フェニル)－ＮＨ－、および(３－ＣＨＯ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－
から選ばれる。そして、

R^9は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｔ－ブチル、ニトロ、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシおよびトリフルオロメトキシから選ばれる］。

【請求項５】

式（Ｉ－ａ）：

【化３】



(I-a)

［式中、

Ｘは、結合、－CH_2－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ(＝Ｏ)－、－Ｓ(＝Ｏ)$_2$－、－NR^{10}－、－CH_2CH_2－、－OCH_2－、－SCH_2－、－CH_2O－、－CH_2S－、－$NR^{10}CH_2$－または－CH_2NR^{10}－である。

ｎは、１または２である。

R^1は、

Ｈ、

Ｃ(＝Ｏ)R^2、

Ｃ(＝Ｏ)ＯR^2、

$C_{1\sim8}$アルキル、

$C_{2\sim8}$アルケニル、

$C_{2\sim8}$アルキニル、

$C_{3\sim7}$シクロアルキル、

０～２個のR^2で置換された$C_{1\sim6}$アルキル、

０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、

０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルキニル、

０～２個のR^2で置換されたアリール、および

５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つ０～２個のR^2で置換されている）
から選ばれる。

各R^2は独立して、

Ｆ、Ｃｌ、CH_2F、CHF_2、CF_3、

$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{3\sim6}$シクロアル

キル、
０～５個のR^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{41}で置換された$C_{3～10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{41}で置換されている）
から選ばれる。
R^{4a}は、Ｈまたは$C_{1～4}$アルキルであって、
R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏまたは＝Ｓを形成する。
R^{7}およびR^{9}は各々独立して、
Ｈ、ハロ、－CF_3、－OCF_3、－ＯＨ、－ＣＮ、－NO_2、－$NR^{46}R^{47}$、
$C_{1～8}$アルキル、$C_{2～8}$アルケニル、$C_{2～8}$アルキニル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～8}$アルコキシ、($C_{1～4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$シクロアルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{1～4}$アルキル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、C(O)H、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{8}は、
Ｈ、ハロ、－CF_3、－OCF_3、－ＯＨ、－ＣＮ、－NO_2、
$C_{1～8}$アルキル、$C_{2～8}$アルケニル、$C_{2～8}$アルキニル、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{1～8}$アルコキシ、($C_{1～4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$シクロアルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{1～4}$アルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{2～4}$アルケニル、
０～１個のR^{11}で置換された$C_{2～4}$アルキニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3～10}$炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、C(O)H、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{10}は、Ｈ、$C_{1～4}$アルキル、$C_{2～4}$アルケニル、$C_{2～4}$アルキニルおよび$C_{1～4}$アルコキシから選ばれる。
R^{11}は、
Ｈ、ハロ、－CF_3、－ＣＮ、－NO_2、
$C_{1～8}$アルキル、$C_{2～8}$アルケニル、$C_{2～8}$アルキニル、$C_{1～4}$ハロアルキ

ル、$C_{1\sim8}$アルコキシ、$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、C(O)H、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
各R^{12}は独立して、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{12a}は独立して、
０～５個のR^{33}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれ、そして
各R^{13}は独立して、Ｈ、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニルおよび$C_{2\sim4}$アルキニルであるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－Ｏ－または－Ｎ(R^{14})－で置換された５または６員の環を形成するか；あるいは、
Ｎと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、不飽和または一部飽和であり、そして０～３個のR^{16}で置換されている）
を形成し得る。
各R^{14}は独立して、Ｈおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。
各R^{15}は独立して、Ｈ、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニルおよび$C_{2\sim4}$アルキニルから選ばれる。
各R^{16}は独立して、
Ｈ、ＯＨ、ハロ、ＣＮ、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－C(=O)H、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim3}$ハロアルキル－オキシ－および$C_{1\sim3}$アルキルオキシ－
から選ばれる。
各R^{31}は独立して、Ｈ、ＯＨ、ハロ、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$および$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。
各R^{33}は独立して、
Ｈ、ＯＨ、ハロ、ＣＮ、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－C(=O)H、

フェニル、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル－オキシ－、$C_{1\sim4}$アルキルオキシ－、$C_{1\sim4}$アルキルチオ－、$C_{1\sim4}$アルキル－C(＝O)－、$C_{1\sim4}$アルキル－C(＝O)NH－、$C_{1\sim4}$アルキル－OC(＝O)－、$C_{1\sim4}$アルキル－C(＝O)O－、$C_{3\sim6}$シクロアルキル－オキシ－、$C_{3\sim6}$シクロアルキルメチル－オキシ－、

置換された$C_{1\sim6}$アルキル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、$-SO_2R^{45}$、$-NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(=O)-$または$(C_{1\sim4}\text{アルキル})CO_2-$である）、および

置換された$C_{2\sim6}$アルケニル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、$-SO_2R^{45}$、$-NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(=O)-$または$(C_{1\sim4}\text{アルキル})CO_2-$である）

から選ばれる。

各R^{41}は独立して、

H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、

$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、

0～1個のR^{43}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、

0～3個のR^{42}で置換されたアリール、および

5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{44}で置換されている）

から選ばれる。

各R^{42}は独立して、

H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、$CH(=NH)NH_2$、$NHC(=NH)NH_2$、

$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、

0～1個のR^{43}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、

0～3個のR^{44}で置換されたアリール、および

5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{44}で置換されている）

から選ばれる。

R^{43}は、0～3個のR^{44}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキルまたはアリールである。

各R^{44}は独立して、H、ハロ、－OH、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、$-CF_3$、$-OCF_3$、－CN、$-NO_2$、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれる。

R^{45}は、$C_{1\sim4}$アルキルである。

各R^{46}は独立して、Hおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。そして、

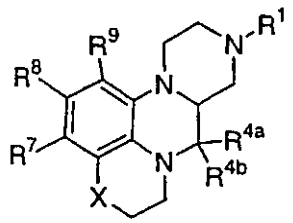
各R^{47}は独立して、Hおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる］

の請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

式（Ｉ－ｂ）：

【化４】



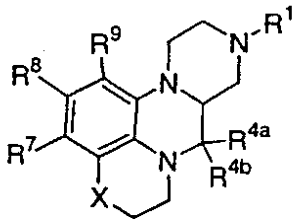
(I-b)

［式中、
Ｘは、－ＣＨ$_2$－、－Ｏ－、－Ｓ－、－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$－、－ＯＣＨ$_2$－、－ＳＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｏ－または－ＣＨ$_2$Ｓ－である。
Ｒ^{1}は、
Ｈ、
Ｃ(＝Ｏ)Ｒ^2、
Ｃ(＝Ｏ)ＯＲ^2、
Ｃ$_{1～6}$アルキル、
Ｃ$_{2～6}$アルケニル、
Ｃ$_{2～6}$アルキニル、
Ｃ$_{3～6}$シクロアルキル、
０～２個のＲ^{2}で置換されたＣ$_{1～4}$アルキル、
０～２個のＲ^{2}で置換されたＣ$_{2～4}$アルケニル、および
０～２個のＲ^{2}で置換されたＣ$_{2～4}$アルキニル
から選ばれる。
各Ｒ^{2}は独立して、
Ｃ$_{1～4}$アルキル、
Ｃ$_{2～4}$アルケニル、
Ｃ$_{2～4}$アルキニル、
Ｃ$_{3～6}$シクロアルキル、
０～５個のＲ^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたＣ$_{3～10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のＲ^{41}で置換されている）
から選ばれる。
Ｒ^{4a}は、ＨまたはＣ$_{1～4}$アルキルであって、
Ｒ^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
Ｒ^{4a}およびＲ^{4b}は一緒になって、＝Ｏまたは＝Ｓを形成する。
Ｒ^{7}およびＲ^{9}は各々独立して、
Ｈ、ハロ、－ＣＦ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＯＨ、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＮＲ^{46}Ｒ^{47}、
Ｃ$_{1～6}$アルキル、Ｃ$_{2～6}$アルケニル、Ｃ$_{2～6}$アルキニル、Ｃ$_{1～6}$ハロアルキル、Ｃ$_{1～6}$アルコキシ、(Ｃ$_{1～4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のＲ^{33}で置換されたＣ$_{3～10}$シクロアルキル、
０～２個のＲ^{11}で置換されたＣ$_{1～4}$アルキル、
０～３個のＲ^{33}で置換されたＣ$_{3～10}$炭素環基、
０～５個のＲ^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のＲ^{31}で置換されている）、
ＯＲ^{12}、ＳＲ^{12}、ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、Ｃ(Ｏ)Ｈ、Ｃ(Ｏ)Ｒ^{12}、Ｃ(Ｏ)ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、ＮＲ^{14}Ｃ(Ｏ)Ｒ^{12}、Ｃ(Ｏ)ＯＲ^{12}、ＯＣ(Ｏ)Ｒ^{12}、ＯＣ(Ｏ)ＯＲ^{12}、ＣＨ(＝ＮＲ^{14})ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、ＮＨＣ(＝ＮＲ^{14})ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、Ｓ(Ｏ)Ｒ^{12}、Ｓ

$(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$および$NR^{14}S(O)_2R^{12}$
から選ばれる。
R^8は、
H、ハロ、$-CF_3$、$-OCF_3$、$-OH$、$-CN$、$-NO_2$、
$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{1\sim6}$ハロアルキル、$C_{1\sim6}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
0～2個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$C(O)H$、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{11}は、
H、ハロ、$-CF_3$、$-CN$、$-NO_2$、
$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim6}$アルコキシ、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$C(O)H$、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$および$NR^{14}S(O)_2R^{12}$
から選ばれる。
各R^{12}は独立して、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$炭素環基、および
5～10員のヘテロ環系（これは、N，OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{12a}は独立して、
0～5個のR^{33}で置換されたフェニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原

子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{13}は独立して、H、C$_{1～4}$アルキル、C$_{2～4}$アルケニルおよびC$_{2～4}$アルキニルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－O－または－N(R^{14})－で置換された５または６員環を形成するか；あるいは、
Nと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、不飽和または一部飽和であり、そして０～３個のR^{16}で置換されている）
を形成し得る。
各R^{14}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{15}は独立して、H、C$_{1～4}$アルキル、C$_{2～4}$アルケニルおよびC$_{2～4}$アルキニルから選ばれる。
各R^{16}は独立して、H、OH、F、Cl、CN、NO$_2$、CF$_3$、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、－C(＝O)H、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。
各R^{31}は独立して、H、OH、ハロ、CF$_3$、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}およびC$_{1～4}$アルキルから選ばれる。
各R^{33}は独立して、
H、OH、ハロ、CN、NO$_2$、CF$_3$、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、－C(＝O)H、
フェニル、C$_{1～6}$アルキル、C$_{2～6}$アルケニル、C$_{2～6}$アルキニル、C$_{3～6}$シクロアルキル、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{1～4}$ハロアルキル－オキシ－、C$_{1～4}$アルキルオキシ－、C$_{1～4}$アルキルチオ－、C$_{1～4}$アルキル－C(＝O)－、C$_{1～4}$アルキル－C(＝O)NH－、C$_{1～4}$アルキル－OC(＝O)－、C$_{1～4}$アルキル－C(＝O)O－、C$_{3～6}$シクロアルキル－オキシ－、C$_{3～6}$シクロアルキルメチル－オキシ－、
置換されたC$_{1～6}$アルキル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO$_2$R^{45}、－NR^{46}R^{47}、NR^{46}R^{47}C(＝O)－または(C$_{1～4}$アルキル)CO$_2$－である）、および
置換されたC$_{2～6}$アルケニル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO$_2$R^{45}、－NR^{46}R^{47}、NR^{46}R^{47}C(＝O)－または(C$_{1～4}$アルキル)CO$_2$－である）
から選ばれる。
各R^{41}は独立して、
H、CF$_3$、ハロ、OH、CO$_2$H、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、NO$_2$、CN、
C$_{2～8}$アルケニル、C$_{2～8}$アルキニル、C$_{1～4}$アルコキシ、C$_{1～4}$ハロアルキル、
０～１個のR^{43}で置換されたC$_{1～4}$アルキル、
０～３個のR^{42}で置換されたアリール、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{42}は独立して、
H、CF$_3$、ハロ、OH、CO$_2$H、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、NO$_2$、CN、CH(＝NH)NH$_2$、NHC(＝NH)NH$_2$、
C$_{2～6}$アルケニル、C$_{2～6}$アルキニル、C$_{1～4}$アルコキシ、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{3～6}$シクロアルキル、
０～１個のR^{43}で置換されたC$_{1～4}$アルキル、

０～３個のR^{44}で置換されたアリール、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
R^{43}は、０～３個のR^{44}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキルまたはアリールである。
各R^{44}は独立して、Ｈ、ハロ、－ＯＨ、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、$-CF_3$、$-OCF_3$、－ＣＮ、$-NO_2$、$C_{1\sim4}$アルキルおよび$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれる。
R^{45}は、$C_{1\sim4}$アルキルである。
各R^{46}は独立して、Ｈおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。そして、
各R^{47}は独立して、Ｈおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる］
の請求項５に記載の化合物。
【請求項７】
式（Ｉ－ｂ）：
【化５】



(I-b)

［式中、
Ｘは、$-CH_2-$、－Ｏ－、－Ｓ－、$-CH_2CH_2-$、$-OCH_2-$または$-SCH_2-$である。
R^{1}は、
Ｈ、
$C_{1\sim4}$アルキル、
$C_{2\sim4}$アルケニル、
$C_{2\sim4}$アルキニル、
$C_{3\sim4}$シクロアルキル、
０～１個のR^{2}で置換された$C_{1\sim3}$アルキル、
０～１個のR^{2}で置換された$C_{2\sim3}$アルケニル、および
０～１個のR^{2}で置換された$C_{2\sim3}$アルキニル
から選ばれる。
各R^{2}は独立して、
$C_{1\sim4}$アルキル、
$C_{2\sim4}$アルケニル、
$C_{2\sim4}$アルキニル、
$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{41}で置換された$C_{3\sim6}$炭素環基、および
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１、２または３個含有し、且つ０～３個のR^{41}で置換されている）
から選ばれる。
R^{4a}は、Ｈ、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであって、
R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏまたは＝Ｓを形成する。

R^7およびR^9は各々独立して、
H、ハロ、－CF_3、－OCF_3、－OH、－CN、－NO_2、－$NR^{46}R^{47}$、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
0～2個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、および
5～6員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1、2または3個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）
から選ばれる。
R^8は、
H、ハロ、－CF_3、－OCF_3、－OH、－CN、－NO_2、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
0～2個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～2個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
5～6員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1、2または3個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{11}は、
H、ハロ、－CF_3、－CN、－NO_2、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
0～2個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環系、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、および
5～6員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1、2または3個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{12}は独立して、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
0～1個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
0～5個のR^{33}で置換されたアリール、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$の炭素環基、および
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を1～4個含有し、且つ0～3個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{12a}は独立して、
0～5個のR^{33}で置換されたフェニル、
0～3個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
5～10員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原

子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、そして
各R^{13}は独立して、H、C$_{1～4}$アルキル、C$_{2～4}$アルケニルおよびC$_{2～4}$アルキニルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－O－または－N(R^{14})－で置換された５または６員の環を形成するか；あるいは、
Nと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、１個のN、２個のN、３個のN、１個のNと１個のOおよび１個のNと１個のSからなる群から選ばれる１～３個のヘテロ原子を含有し、不飽和または一部飽和であり、そして０～２個のR^{16}で置換されている）
を形成し得る。
各R^{14}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{15}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{16}は独立して、H、OH、F、Cl、CN、NO$_2$、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。
各R^{31}は独立して、H、OH、ハロ、CF$_3$、メチル、エチルおよびプロピルから選ばれる。
各R^{33}は独立して、
H、OH、ハロ、CN、NO$_2$、CF$_3$、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、－C(＝O)H、
フェニル、C$_{1～6}$アルキル、C$_{2～6}$アルケニル、C$_{2～6}$アルキニル、C$_{3～6}$シクロアルキル、C$_{1～4}$ハロアルキル、C$_{1～4}$ハロアルキル－オキシ－、C$_{1～4}$アルキルオキシ－、C$_{1～4}$アルキルチオ－、C$_{1～4}$アルキル－C(＝O)－、C$_{1～4}$アルキル－C(＝O)NH－、C$_{1～4}$アルキル－OC(＝O)－、C$_{1～4}$アルキル－(＝O)O－、C$_{3～6}$シクロアルキル－オキシ－、C$_{3～6}$シクロアルキルメチル－オキシ、
置換されたC$_{1～6}$アルキル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO$_2$R^{45}、－NR^{46}R^{47}、NR^{46}R^{47}C(＝O)－または(C$_{1～4}$アルキル)CO$_2$－である）、および
置換されたC$_{2～6}$アルケニル（ここで、置換基はOH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO$_2$R^{45}、－NR^{46}R^{47}、NR^{46}R^{47}C(＝O)－または(C$_{1～4}$アルキル)CO$_2$－である）
から選ばれる。
各R^{41}は独立して、
H、CF$_3$、ハロ、OH、CO$_2$H、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、NO$_2$、CN、
C$_{2～4}$アルケニル、C$_{2～4}$アルキニル、C$_{1～3}$アルコキシ、C$_{1～3}$ハロアルキルおよびC$_{1～3}$アルキル
から選ばれる。
各R^{42}は独立して、
H、CF$_3$、ハロ、OH、CO$_2$H、SO$_2$R^{45}、NR^{46}R^{47}、NO$_2$、CN、CH(＝NH)NH$_2$、NHC(＝NH)NH$_2$、
C$_{2～4}$アルケニル、C$_{2～4}$アルキニル、C$_{1～3}$アルコキシ、C$_{1～3}$ハロアルキル、C$_{3～6}$シクロアルキルおよびC$_{1～3}$アルキル
から選ばれる。
R^{43}は、各々０～３個のR^{44}で置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニルまたはピリジルである。
各R^{44}は独立して、
H、ハロ、－OH、NR^{46}R^{47}、CO$_2$H、SO$_2$R^{45}、－CF$_3$、－OCF$_3$、－CN、－NO$_2$、
メチル、エチル、プロピル、ブチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシおよびブトキ

シから選ばれる。
R^{45}は、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである。
各R^{46}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルである。そして、
各R^{47}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる］
の請求項５に記載の化合物。
【請求項８】
請求項７に記載の化合物：
［該化合物中、
Xは、－CH_2－、－Ｏ－または－Ｓ－である。
R^1は、
Ｈ、
$C_{1\sim4}$アルキル、
$C_{2\sim4}$アルケニル、
$C_{2\sim4}$アルキニル、
$C_{3\sim4}$シクロアルキル、
０～１個のR^2で置換された$C_{1\sim3}$アルキル、
０～１個のR^2で置換された$C_{2\sim3}$アルケニル、および
０～１個のR^2で置換された$C_{2\sim3}$アルキニル
から選ばれる。
各R^2は独立して、
$C_{1\sim4}$アルキル、
$C_{2\sim4}$アルケニル、
$C_{2\sim4}$アルキニル、
$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{41}で置換された$C_{3\sim6}$炭素環基、および
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１、２または３個含有し、且つ０～３個のR^{41}で置換されている）
から選ばれる。
R^{4a}は、Ｈであって、
R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏを形成する。
R^7およびR^9は各々独立して、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、－CH_3、－OCH_3、－CF_3、－OCF_3、－ＣＮおよび－NO_2から選ばれる。
R^8は、
Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒ、－CF_3、－OCF_3、－ＯＨ、－ＣＮ、－NO_2、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
０～２個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
０～１個のR^{11}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１、２または３個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{11}は、

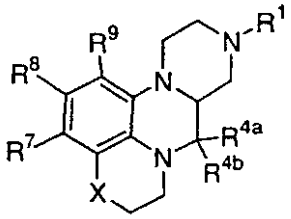
H、ハロ、－CF_3、－CN、－NO_2、
$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、($C_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$シクロアルキル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、および
５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１、２または３個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{12}は独立して、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{1\sim4}$アルキル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルケニル、
０～１個のR^{12a}で置換された$C_{2\sim4}$アルキニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、
０～５個のR^{33}で置換されたアリール、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、
各R^{12a}は独立して、
０～５個のR^{33}で置換されたフェニル、
０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれ、そして
各R^{13}は独立して、H、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニルおよび$C_{2\sim4}$アルキニルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－Ｏ－または－Ｎ(R^{14})－で置換された５または６員環を形成するか；あるいは、
Ｎと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイミダゾリニルおよびベンゾトリアゾリルから選ばれ、そして０～１個のR^{16}で置換されている）を形成し得る。
各R^{14}は独立して、Ｈ、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{15}は独立して、Ｈ、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{16}は独立して、Ｈ、ＯＨ、Ｆ、Ｃｌ、ＣＮ、NO_2、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。
各R^{31}は独立して、Ｈ、ＯＨ、ハロ、CF_3、メチル、エチルおよびプロピルから選ばれる。
各R^{33}は独立して、
Ｈ、ＯＨ、ハロ、ＣＮ、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、－Ｃ(＝Ｏ)Ｈ、
フェニル、$C_{1\sim6}$アルキル、$C_{2\sim6}$アルケニル、$C_{2\sim6}$アルキニル、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル－オキシ－、$C_{1\sim4}$アルキルオキシ－、$C_{1\sim4}$アルキルチオ－、$C_{1\sim4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)－、$C_{1\sim4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、$C_{1\sim4}$アルキル－ＯＣ(＝Ｏ)－、$C_{1\sim4}$アルキル－Ｃ(＝Ｏ)Ｏ－、$C_{3\sim6}$シクロアルキル－オキシ－、$C_{3\sim6}$シクロアルキルメチル－オキシ－、
置換された$C_{1\sim6}$アルキル（該置換基は、ＯＨ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ

、ブトキシ、－SO_2R^{45}、－$NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(=O)$－、または($C_{1\sim4}$アルキル)CO_2－である）、および
置換された$C_{2\sim6}$アルケニル（該置換基は、OH、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、－SO_2R^{45}、－$NR^{46}R^{47}$、$NR^{46}R^{47}C(=O)$－、または($C_{1\sim4}$アルキル)CO_2－である）
から選ばれる。
各R^{41}は独立して、
H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、
$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim3}$アルコキシ、$C_{1\sim3}$ハロアルキル、および$C_{1\sim3}$アルキル
から選ばれる。
各R^{42}は独立して、
H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、$CH(=NH)NH_2$、$NHC(=NH)NH_2$、
$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、$C_{1\sim3}$アルコキシ、$C_{1\sim3}$ハロアルキル、$C_{3\sim6}$シクロアルキル、および$C_{1\sim3}$アルキル
から選ばれる。
R^{43}は、各々0～3個のR^{44}で置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニルまたはピリジルである。
各R^{44}は独立して、
H、ハロ、－OH、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、－CF_3、－OCF_3、－CN、－NO_2、
メチル、エチル、プロピル、ブチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、およびブトキシ
から選ばれる。
R^{45}は、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである。
各R^{46}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。そして、
各R^{47}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる］。
【請求項９】
請求項８に記載の化合物：
［該化合物中、
Xは、－CH_2－、－O－または－S－である。
R^1は、
H、
0～1個のR^2で置換された$C_{1\sim5}$アルキル、
0～1個のR^2で置換された$C_{2\sim5}$アルケニル、および
0～1個のR^2で置換された$C_{2\sim3}$アルキニル
から選ばれる。
R^2は、$C_{3\sim6}$シクロアルキルである。
R^{4a}は、Hである。
R^{4b}は、Hである。
R^7およびR^9は各々独立して、H、F、Cl、－CH_3、－OCH_3、－CF_3、－OCF_3、－CNおよび－NO_2から選ばれる。
R^8は、
R^{11}、
R^{11}で置換されたメチル、
0～2個のR^{33}で置換されたフェニル、
OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR$

R^{15}、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。
R^{11}は、
0～5個のフルオロで置換されたフェニル－、
0～3個のR^{33}で置換されたナフチル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(HC(=O))－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(H_3COCH_2)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3COCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH(OMe)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3COC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2CH=CH$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－((MeOC=O)CH=CH)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(メチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(エチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(i－プロピル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(F_3C)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(H_3CS)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(エトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(i－プロポキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(i－ブトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(($(H_3C)_2CHC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(($(H_3C)_2CHCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(シクロプロピルオキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(シクロブチルオキシ)－フェニル－、および
R^{33}で置換された4－(シクロペンチルオキシ)－フェニル－
から選ばれる。

R^{12}は、
0～5個のフルオロで置換されたフェニル－、
0～3個のR^{33}で置換されたナフチル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(HC(=O))－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(H_3COCH_2)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3COCH_2CH_2$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3CCH(OMe)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($H_3COC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－($HOCH_2CH=CH$)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－((MeOC=O)CH=CH)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(メチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(エチル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(i－プロピル)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(F_3C)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された2－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された3－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(NC)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(フルオロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(クロロ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(H_3CS)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(H_3CO)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(エトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(i－プロポキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(i－ブトキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($(H_3C)_2CHC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2C(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CC(=O)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($(H_3C)_2CHCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH_2CH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－($H_3CCH(OH)$)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(シクロプロピルオキシ)－フェニル－、
R^{33}で置換された4－(シクロブチルオキシ)－フェニル－、および
R^{33}で置換された4－(シクロペンチルオキシ)－フェニル－
から選ばれ、そして
R^{13}は、H、メチルまたはエチルから選ばれるか；
R^{12}およびR^{13}は一緒になって、ピロリル、ピロリジニル、イミダゾリル、ピペリ

ジニル、ピペリジニル、メチルピペリジニルおよびモルホリルから選ばれる５または６員の環を形成するか；あるいは、
Ｎと結合したR^{12}およびR^{13}は一緒になって、９または１０員の二環式ヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳから選ばれるヘテロ原子を１～３個含有し、インドリル、インドリニル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾイミダゾリニルおよびベンゾトリアゾリルからなる群から選ばれ、そして０～１個のR^{16}で置換されている）
を形成し得る。
R^{15}は、Ｈ、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである。
各R^{16}は独立して、Ｈ、ＯＨ、Ｆ、Ｃｌ、ＣＮ、NO_2、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから選ばれる。そして、
各R^{33}は独立して、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、$-CH_3$、$-OCH_3$、$-CF_3$、$-OCF_3$、－ＣＮおよび$-NO_2$から選ばれる］。
【請求項１０】
式（Ｉ－ｂ）：
【化６】



(I-b)

［式中、
R^1は、水素、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｎ－ブチル、ｓ－ブチル、ｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、ｎ－ヘキシル、２－プロピル、２－ブチル、２－ペンチル、２－ヘキシル、２－メチルプロピル、２－メチルブチル、２－メチルペンチル、２－エチルブチル、３－メチルペンチル、３－メチルブチル、４－メチルペンチル、２－フルオロエチル、２,２－ジフルオロエチル、２,２,２－トリフルオロエチル、２－プロペニル、２－メチル－２－プロペニル、トランス－２－ブテニル、３－メチル－ブテニル、３－ブテニル、トランス－２－ペンテニル、シス－２－ペンテニル、４－ペンテニル、４－メチル－３－ペンテニル、３,３－ジクロロ－２－プロペニル、トランス－３－フェニル－２－プロペニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、$-CH=CH_2$、$-CH_2-CH=CH_2$、$-CH=CH-CH_3$、$-C\equiv CH$、$-C\equiv C-CH_3$および$-CH_2-C\equiv CH$
から選ばれる。
R^{4a}は、Ｈであって、
R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏを形成する。
R^7およびR^9は各々独立して、水素、フルオロ、メチル、トリフルオロメチルおよびメトキシから選ばれる。
R^8は、
水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｔ－ブチル、ニトロ、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フェニル、
メチルＣ(＝Ｏ)－、エチルＣ(＝Ｏ)－、プロピルＣ(＝Ｏ)－、イソプロピルＣ(＝Ｏ)－、ブチルＣ(＝Ｏ)－、フェニルＣ(＝Ｏ)－、
メチルCO_2－、エチルCO_2－、プロピルCO_2－、イソプロピルCO_2－、ブチルCO_2－、フェニルCO_2－、

ジメチルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、ジエチルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、ジプロピルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、ジ－イソプロピルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、ジブチルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、ジフェニルアミノ－Ｓ(＝Ｏ)－、

ジメチルアミノ－SO_2－、ジエチルアミノ－SO_2－、ジプロピルアミノ－SO_2－、ジイソプロピルアミノ－SO_2－、ジブチルアミノ－SO_2－、ジフェニルアミノ－SO_2－、

ジメチルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、ジエチルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、ジプロピルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、ジ－イソプロピルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、ジブチルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、ジフェニルアミノ－Ｃ(＝Ｏ)－、

２－クロロフェニル、２－フルオロフェニル、２－ブロモフェニル、２－シアノフェニル、２－メチルフェニル、２－トリフルオロメチルフェニル、２－メトキシフェニル、２－トリフルオロメトキシフェニル、

３－クロロフェニル、３－フルオロフェニル、３－ブロモフェニル、３－シアノフェニル、３－メチルフェニル、３－エチルフェニル、３－プロピルフェニル、３－イソプロピルフェニル、３－ブチルフェニル、３－トリフルオロメチルフェニル、３－メトキシフェニル、３－イソプロポキシフェニル、３－トリフルオロメトキシフェニル、３－チオメトキシフェニル、

４－クロロフェニル、４－フルオロフェニル、４－ブロモフェニル、４－シアノフェニル、４－メチルフェニル、４－エチルフェニル、４－プロピルフェニル、４－イソプロピルフェニル、４－ブチルフェニル、４－トリフルオロメチルフェニル、４－メトキシフェニル、４－イソプロポキシフェニル、４－トリフルオロメトキシフェニル、４－チオメトキシフェニル、

２,３－ジクロロフェニル、２,３－ジクロロフェニル、２,３－ジメチルフェニル、２,３－ジトリフルオロメチルフェニル、２,３－ジメトキシフェニル、２,３－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,４－ジクロロフェニル、２,４－ジフルオロフェニル、２,４－ジメチルフェニル、２,４－ジトリフルオロメチルフェニル、２,４－ジメトキシフェニル、２,４－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,５－ジクロロフェニル、２,５－ジフルオロフェニル、２,５－ジメチルフェニル、２,５－ジトリフルオロメチルフェニル、２,５－ジメトキシフェニル、２,５－ジトリフルオロメトキシフェニル、

２,６－ジクロロフェニル、２,６－ジフルオロフェニル、２,６－ジメチルフェニル、２,６－ジトリフルオロメチルフェニル、２,６－ジメトキシフェニル、２,６－ジトリフルオロメトキシフェニル、

３,４－ジクロロフェニル、３,４－ジフルオロフェニル、３,４－ジメチルフェニル、３,４－ジトリフルオロメチルフェニル、３,４－ジメトキシフェニル、３,４－ジトリフルオロメチルフェニル、

２,４,６－トリクロロフェニル、２,４,６－トリフルオロフェニル、２,４,６－トリメチルフェニル、２,４,６－トリフルオロメチルフェニル、２,４,６－トリメトキシフェニル、２,４,６－トリトリフルオロメトキシフェニル、２－クロロ－４－CF_3－フェニル、２－フルオロ－３－クロロ－フェニル、２－クロロ－４－CF_3－フェニル、２－クロロ－４－メトキシ－フェニル、２－メトキシ－４－イソプロピル－フェニル、２－CF_3－４－メトキシ－フェニル、２－メチル－４－メトキシ－５－フルオロ－フェニル、２－メチル－４－メトキシ－フェニル、２－クロロ－４－CF_3O－フェニル、２,４,５－トリメチル－フェニル、２－メチル－４－クロロ－フェニル、

メチル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、エチル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、プロピル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、イソプロピル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、ブチル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、フェニル－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－、

４－アセチルフェニル、３－アセトアミドフェニル、４－ピリジル、２－フラニル、２－チオフェニル、２－ナフチル、

２－Ｍｅ－５－Ｆ－フェニル、２－Ｆ－５－Ｍｅ－フェニル、２－ＭｅＯ－５－Ｆ-

フェニル、２－Ｍｅ－３－Ｃｌ－フェニル、３－NO_2－フェニル、２－NO_2－フェニル、２－Ｃｌ－３－Ｍｅ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＥｔＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－６－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－４－(CHF_2)Ｏ－フェニル、２,４－ジＭｅＯ－６－Ｆ－フェニル、２－CF_3－６－Ｆ－フェニル、２－ＭｅＳ－フェニル、２,６－ジＣｌ－４－ＭｅＯ－フェニル、２,３,４－トリＦ－フェニル、２,６－ジＦ－４－Ｃｌ－フェニル、２,３,４,６－テトラＦ－フェニル、２,３,４,５,６－ペンタＦ－フェニル、２－CF_3－４－ＥｔＯ－フェニル、２－CF_3－４－ｉＰｒＯ－フェニル、２－CF_3－４－Ｃｌ－フェニル、２－CF_3－４－Ｆ－フェニル、２－Ｃｌ－４－ＥｔＯ－フェニル、２－Ｃｌ－４－ｉＰｒＯ－フェニル、２－Ｅｔ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－ＣＨＯ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－CH_3ＣＨ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－CH_3ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｆ－フェニル、２－CH_3ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｃｌ－フェニル、２－CH_3ＣＨ(ＯＨ)－４－Ｍｅ－フェニル、２－CH_3ＣＨ(ＯＭｅ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－CH_3Ｃ(＝Ｏ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－CH_3Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｆ－フェニル、２－CH_3Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｃｌ－フェニル、２－CH_3Ｃ(＝Ｏ)－４－Ｍｅ－フェニル、２－H_2Ｃ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－H_2Ｃ(ＯＭｅ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－H_3ＣＣH_2ＣＨ(ＯＨ)－４－ＭｅＯ－フェニル、２－H_3ＣＣH_2Ｃ(＝Ｏ)－４－ＭｅＯ－フェニル、

２－$CH_3$$CO_2$$CH_2$$CH_2$－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｚ)－２－ＨＯ$CH_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｅ)－２－ＨＯCH_2ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｚ)－２－$CH_3$$CO_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、(Ｅ)－２－$CH_3$$CO_2$ＣＨ＝ＣＨ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－$CH_3$Ｏ$CH_2$$CH_2$－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｆ－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｃｌ－４－Ｆ－フェニル、(２－Ｃｌ－フェニル)－ＣＨ＝ＣＨ－、(３－Ｃｌ－フェニル)－ＣＨ＝ＣＨ－、(２,６－ジＦ－フェニル)－ＣＨ＝ＣＨ－、－CH_2ＣＨ＝CH_2、フェニル－ＣＨ＝ＣＨ－、(２－Ｍｅ－４－ＭｅＯ－フェニル)－ＣＨ＝ＣＨ－、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキシルメチル、ＥｔＣ$O_2$$CH_2$$CH_2$－、ＥｔＣ$O_2$$CH_2$$CH_2$$CH_2$－、ＥｔＣ$O_2$$CH_2$$CH_2$$CH_2$$CH_2$－、

ベンジル、２－Ｆ－ベンジル、３－Ｆ－ベンジル、４－Ｆ－ベンジル、３－ＭｅＯ－ベンジル、３－ＯＨ－ベンジル、２－ＭｅＯ－ベンジル、２－ＯＨ－ベンジル、２－ＭｅＯＣ(＝Ｏ)－３－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＣＮ－フェニル、２－Ｍｅ－３－ＣＮ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＭｅＳ－フェニル、２－CF_3－４－ＣＮ－フェニル、２－ＣＨＯ－フェニル、３－ＣＨＯ－フェニル、２－ＨＯCH_2－フェニル、３－ＨＯCH_2－フェニル、３－ＭｅOCH_2－フェニル、３－$Me_2$$NCH_2$－フェニル、３－ＣＮ－４－Ｆ－フェニル、２－Ｍｅ－４－H_2ＮＣＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－ＭｅＯＣ(＝Ｏ)－フェニル、３－H_2ＮＣＯ－４－Ｆ－フェニル、２－$Me_2$$NCH_2$－４－ＭｅＯ－フェニル、２－Ｍｅ－４－$CH_3$Ｃ(＝Ｏ)－フェニル、フェニル－Ｓ－、$Me_2$Ｎ－、１－ピロリジニル、

フェニル－ＮＨ－、ベンジル－ＮＨ－、(１－ナフチル)－ＮＨ－、(２－ナフチル)－ＮＨ－、(２－[１,１'－ビフェニル])－ＮＨ－、(３－[１,１'－ビフェニル])－ＮＨ－、(４－[１,１'－ビフェニル])－ＮＨ－、(２－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(２－OCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(３－OCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＣＮ－フェニル)－ＮＨ－、(４－OCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(４－ＳＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＣｌ－フ

ェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＦ－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジCH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジCF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,４－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,５－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２,６－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３,４－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(３,５－ジＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－Ｆ－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｆ－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－Ｃｌ－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃ１－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃ１－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－Ｃｌ－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－CH_3－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－CF_3－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CH_3－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－ＣＨ３－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－３－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－５－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、(２－CF_3－６－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－、

(２－ＯＭｅ－３－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－Ｆ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－Ｆ－フェニル)－ＮＨ

－、(２－ＯＭｅ－３－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－Ｃ１－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－３－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－３－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－４－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－５－CF_3－フェニル)－ＮＨ－、(２－ＯＭｅ－６－CF_3－フェニル)－ＮＨ、

(３－CF_3－４－Ｃｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－CF_3－４－C(O)CH_3－フェニル)－ＮＨ－、(２,３,５－トリＣｌ－フェニル)－ＮＨ－、(３－CH_3－４－CO_2Ｍｅ－フェニル)－ＮＨ－および(３－ＣＨＯ－４－ＯＭｅ－フェニル)－ＮＨ－

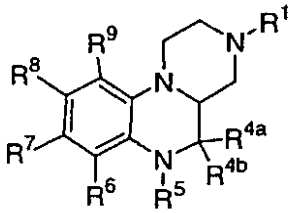
から選ばれる］

の請求項５に記載の化合物。

【請求項１１】

式（Ｉ）：

【化７】



(I)

［式中、

R^1は、

Ｚで置換された$C_{1\sim6}$アルキル、

Ｚで置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、

Ｚで置換された$C_{2\sim6}$アルキニル、

Ｚで置換された$C_{3\sim6}$シクロアルキル、

Ｚで置換されたアリール、

５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つＺで置換されている）、

０～２個のR^2で置換された$C_{1\sim6}$アルキル、

０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルケニル、

０～２個のR^2で置換された$C_{2\sim6}$アルキニル、

０～２個のR^2で置換されたアリール、および

５～６員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を少なくとも１個含有し、且つ０～２個のR^2で置換されている）

から選ばれる。

Ｚは、

Ｈ、

－ＣＨ(ＯＨ)R^2、

－Ｃ(エチレンジオキシ)R^2、

－ＯR^2、

－ＳR^2、

－ＮR^2 R^3、

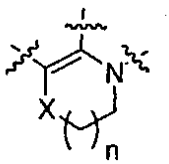
－Ｃ(Ｏ)R^2、

－Ｃ(Ｏ)ＮR^2 R^3、

－ＮR^3 Ｃ(Ｏ)R^2、

－Ｃ(Ｏ)ＯR^2、

－ＯＣ(Ｏ)Ｒ^{2}、
－ＣＨ(＝ＮＲ^{4})ＮＲ^{2}Ｒ^{3}、
－ＮＨＣ(＝ＮＲ^{4})ＮＲ^{2}Ｒ^{3}、－Ｓ(Ｏ)Ｒ^{2}、－Ｓ(Ｏ)$_{2}$Ｒ^{2}、－Ｓ(Ｏ)$_{2}$ＮＲ^{2}Ｒ^{3}および－ＮＲ^{3}Ｓ(Ｏ)$_{2}$Ｒ^{2}から選ばれる。
各Ｒ^{2}は独立して、
Ｃ$_{1\sim4}$アルキル、
Ｃ$_{2\sim4}$アルケニル、
Ｃ$_{2\sim4}$アルキニル、
Ｃ$_{3\sim6}$シクロアルキル、
０～５個のＲ^{42}で置換されたアリール、
０～３個のＲ^{41}で置換されたＣ$_{3\sim10}$炭素環基、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のＲ^{41}で置換されている）
から選ばれて、
各Ｒ^{3}は独立して、Ｈ、Ｃ$_{1\sim4}$アルキル、Ｃ$_{2\sim4}$アルケニル、Ｃ$_{2\sim4}$アルキニルおよびＣ$_{1\sim4}$アルコキシから選ばれるか；あるいは、
Ｒ^{2}およびＲ^{3}は一緒になって、適宜－Ｏ－または－Ｎ(Ｒ^{4})－で置換された５または６員の環を形成する。
各Ｒ^{4}は独立して、Ｈ、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
Ｒ^{4a}は、ＨまたはＣ$_{1\sim4}$アルキルであって、
Ｒ^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
Ｒ^{4a}およびＲ^{4b}は一緒になって、＝Ｏまたは＝Ｓを形成する。
Ｒ^{5}は、ＨまたはＣ$_{1\sim4}$アルキルであって、
Ｒ^{6}は、ＨまたはＣ$_{1\sim4}$アルキルであるか；あるいは、
Ｒ^{5}およびＲ^{6}は一緒になって、式：
【化８】



［式中、
Ｘは、結合、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ(＝Ｏ)－、－Ｓ(＝Ｏ)$_{2}$－、－ＮＲ^{10}－、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$－、－ＯＣＨ$_{2}$－、－ＳＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$Ｏ－、－ＣＨ$_{2}$Ｓ－、－ＣＨ$_{2}$ＮＲ^{10}－、－ＮＲ^{10}ＣＨ$_{2}$－、－ＮＨＣ(＝Ｏ)－、または－Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ－である。そして、
ｎは、１または２である］
の縮合したヘテロ環を形成する。
Ｒ^{7}、Ｒ^{8}およびＲ^{9}は各々独立して、
Ｈ、ハロ、－ＣＦ$_{3}$、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＨ、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＮＲ^{46}Ｒ^{47}、
Ｃ$_{1\sim8}$アルキル、Ｃ$_{2\sim8}$アルケニル、Ｃ$_{2\sim8}$アルキニル、Ｃ$_{1\sim4}$ハロアルキル、Ｃ$_{1\sim8}$アルコキシ、(Ｃ$_{1\sim4}$ハロアルキル)オキシ、
０～２個のＲ^{11}で置換されたＣ$_{1\sim4}$アルキル、
０～３個のＲ^{33}で置換されたＣ$_{3\sim10}$炭素環基、
０～５個のＲ^{33}で置換されたアリール、
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のＲ^{31}で置換されている）、
ＯＲ^{12}、ＳＲ^{12}、ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、Ｃ(Ｏ)Ｈ、Ｃ(Ｏ)Ｒ^{12}、Ｃ(Ｏ)ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、ＮＲ^{14}Ｃ(Ｏ)Ｒ^{12}、Ｃ(Ｏ)ＯＲ^{12}、ＯＣ(Ｏ)Ｒ^{12}、ＯＣ(Ｏ)ＯＲ^{12}、Ｃ

$H(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、$NR^{14}S(O)_2R^{12}$、$NR^{12}C(O)R^{15}$、$NR^{12}C(O)OR^{15}$、$NR^{12}S(O)_2R^{15}$、および$NR^{12}C(O)NHR^{15}$
から選ばれる。

R^{10}は、H、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、$C_{2\sim4}$アルキニル、および$C_{1\sim4}$アルコキシから選ばれる。

R^{11}は、

H、ハロ、－CF_3、－CN、－NO_2、

$C_{1\sim8}$アルキル、$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、$C_{1\sim8}$アルコキシ、$C_{3\sim10}$シクロアルキル、

０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、

０～５個のR^{33}で置換されたアリール、

５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）、

OR^{12}、SR^{12}、$NR^{12}R^{13}$、C(O)H、$C(O)R^{12}$、$C(O)NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}C(O)R^{12}$、$C(O)OR^{12}$、$OC(O)R^{12}$、$OC(O)OR^{12}$、$CH(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$NHC(=NR^{14})NR^{12}R^{13}$、$S(O)R^{12}$、$S(O)_2R^{12}$、$S(O)NR^{12}R^{13}$、$S(O)_2NR^{12}R^{13}$、$NR^{14}S(O)R^{12}$、および$NR^{14}S(O)_2R^{12}$
から選ばれる。

各R^{12}は独立して、

$C_{1\sim4}$アルキル、

$C_{2\sim4}$アルケニル、

$C_{2\sim4}$アルキニル、

$C_{3\sim6}$シクロアルキル、

０～５個のR^{33}で置換されたアリール、

０～３個のR^{33}で置換された$C_{3\sim10}$炭素環基、および

５～１０員のヘテロ環系（これは、N、OおよびSからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{31}で置換されている）
から選ばれて、

各R^{13}は独立して、H、$C_{1\sim4}$アルキル、$C_{2\sim4}$アルケニル、および$C_{2\sim4}$アルキニルから選ばれるか；あるいは、

R^{12}およびR^{13}は一緒になって、適宜－O－または－N(R^{14})－で置換された５または６員の環を形成する。

各R^{14}は独立して、Hおよび$C_{1\sim4}$アルキルから選ばれる。

各R^{31}は独立して、H、OH、ハロ、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、メチル、エチルおよびプロピルから選ばれる。

各R^{33}は独立して、

H、OH、ハロ、CN、NO_2、CF_3、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、

$C_{1\sim3}$アルキル、$C_{2\sim3}$アルケニル、$C_{2\sim3}$アルキニル、$C_{3\sim5}$シクロアルキル、$C_{1\sim3}$ハロアルキル、$C_{1\sim3}$ハロアルキル－オキシ－、$C_{1\sim3}$アルキルオキシ－、$C_{1\sim3}$アルキルチオ－、$C_{1\sim3}$アルキル－C(＝O)－、および$C_{1\sim3}$アルキル－C(＝O)NH－
から選ばれる。

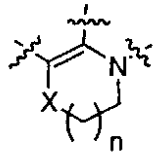
各R^{41}は独立して、

H、CF_3、ハロ、OH、CO_2H、SO_2R^{45}、$NR^{46}R^{47}$、NO_2、CN、＝O、

$C_{2\sim8}$アルケニル、$C_{2\sim8}$アルキニル、$C_{1\sim4}$アルコキシ、$C_{1\sim4}$ハロアルキル、

０～１個のR^{43}で置換された$C_{1～4}$アルケニル、
０～３個のR^{42}で置換されたアリール、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）
から選ばれる。
各R^{42}は独立して、
Ｈ、CF_3、ハロ、ＯＨ、CO_2H、SO_2R^{45}、SR^{45}、$NR^{46}R^{47}$、OR^{48}、NO_2、ＣＮ、$CH(=NH)NH_2$、$NHC(=NH)NH_2$、
$C_{2～6}$アルケニル、$C_{2～6}$アルキニル、$C_{1～4}$アルコキシ、$C_{1～4}$ハロアルキル、$C_{3～6}$シクロアルキル、
０～１個のR^{43}で置換された$C_{1～4}$アルキル、
０～３個のR^{44}で置換されたアリール、および
５～１０員のヘテロ環系（これは、Ｎ、ＯおよびＳからなる群から選ばれるヘテロ原子を１～４個含有し、且つ０～３個のR^{44}で置換されている）から選ばれる。
R^{43}は、０～３個のR^{44}で置換された$C_{3～6}$シクロアルキルまたはアリールである。
各R^{44}は独立して、Ｈ、ハロ、－ＯＨ、$NR^{46}R^{47}$、CO_2H、SO_2R^{45}、－CF_3、－OCF_3、－ＣＮ、－NO_2、$C_{1～4}$アルキルおよび$C_{1～4}$アルコキシから選ばれる。
R^{45}は、$C_{1～4}$アルキルである。
各R^{46}は独立して、Ｈおよび$C_{1～4}$アルキルから選ばれる。
各R^{47}は独立して、Ｈ、$C_{1～4}$アルキル、－$C(=O)NH(C_{1～4}$アルキル)、－SO_2($C_{1～4}$アルキル)、－SO_2(フェニル)、－$C(=O)O(C_{1～4}$アルキル)、－$C(=O)(C_{1～4}$アルキル)および$C(=O)H$から選ばれる。そして、
各R^{48}は独立して、Ｈ、$C_{1～4}$アルキル、－$C(=O)NH(C_{1～4}$アルキル)、－$C(=O)O(C_{1～4}$アルキル)、－$C(=O)(C_{1～4}$アルキル)および－$C(=O)H$から選ばれる。
但し、R^5がＨまたは$C_{1～4}$アルキルであって、R^6がＨまたは$C_{1～4}$アルキルである場合には、R^1は$C_{1～6}$アルキルではない］
の化合物、またはその立体異性体もしくは医薬的に許容し得る塩。
【請求項１２】
請求項１１に記載の化合物：
［該化合物中、
R^1は、
Ｚで置換されたエチル、
Ｚで置換されたプロピル、
Ｚで置換されたブチル、
Ｚで置換されたプロペニル、
Ｚで置換されたブテニル、
R^2で置換されたエチル、、
R^2で置換されたプロピル、
R^2で置換されたブチル、
R^2で置換されたプロペニル、および
R^2で置換されたブテニル
から選ばれる。
Ｚは、
Ｈ、
－$CH(OH)R^2$、
－OR^2、
－SR^2、

－ＮＲ^{2} Ｒ^{3}、
－Ｃ(Ｏ)Ｒ^{2}、
－Ｃ(Ｏ)ＮＲ^{2} Ｒ^{3}、
－ＮＲ^{3} Ｃ(Ｏ)Ｒ^{2}、
－Ｃ(Ｏ)ＯＲ^{2}、
－Ｓ(Ｏ)Ｒ^{2}、
－Ｓ(Ｏ)$_{2}$ Ｒ^{2}、
－Ｓ(Ｏ)$_{2}$ ＮＲ^{2} Ｒ^{3}、および
－ＮＲ^{3} Ｓ(Ｏ)$_{2}$ Ｒ^{2}
から選ばれる。
各Ｒ^{2}は独立して、
０～３個のＲ^{42}で置換されたフェニル、
０～３個のＲ^{42}で置換されたナフチル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたシクロプロピル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたシクロブチル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたシクロペンチル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたシクロヘキシル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたピリジル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたインドリル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたインドリニル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたベンゾイミダゾリル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたベンゾトリアゾリル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたベンゾチエニル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたベンゾフラニル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたフタルイミド－１－イル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたインデン－２－イル、
０～３個のＲ^{41}で置換された２,３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－２－イル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたインダゾリル、
０～３個のＲ^{41}で置換されたテトラヒドロキノリニル、および
０～３個のＲ^{41}で置換されたテトラヒドロ－イソキノリニル
から選ばれる。
各Ｒ^{3}は独立して、Ｈ、メチルおよびエチルから選ばれる。
Ｒ^{4a}は、ＨまたはＣ$_{1～4}$アルキルであって、
Ｒ^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、
Ｒ^{4a}およびＲ^{4b}は一緒になって、＝Ｏを形成する。
Ｒ^{5}は、ＨまたはＣ$_{1～4}$アルキルであって、
Ｒ^{6}は、ＨまたはＣ$_{1～4}$アルキルであるか；あるいは、
Ｒ^{5}およびＲ^{6}は一緒になって、式：
【化９】



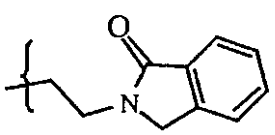
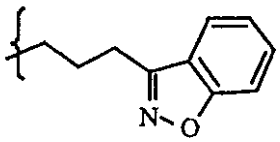
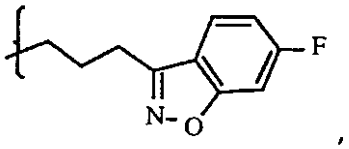
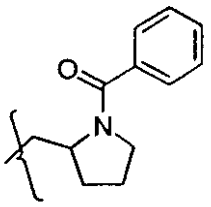
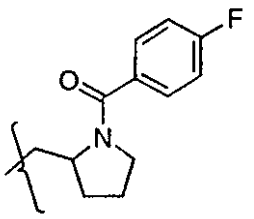
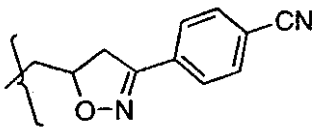
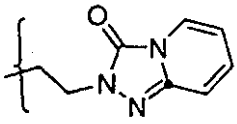
（式中、Ｘは、－ＣＨ$_{2}$－、－Ｏ－または－Ｓ－であり、ｎは、１である）
の縮合したヘテロ環を形成する。
Ｒ^{7}、Ｒ^{8}およびＲ^{9}は各々独立して、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、メチル、エチル、メトキシ、－ＣＦ$_{3}$および－ＯＣＦ$_{3}$から選ばれる。
各Ｒ^{41}は独立して、Ｈ、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒ、ＯＨ、ＣＦ$_{3}$、ＮＯ$_{2}$、ＣＮ、＝Ｏ、メチ

ル、エチル、プロピル、ブチル、メトキシおよびエトキシから選ばれる。
各R^{42}は独立して、H、F、Cl、Br、OH、CF_3、SO_2R^{45}、SR^{45}、$NR^{46}R^{47}$、OR^{48}、NO_2、CN、＝O、メチル、エチル、プロピル、ブチル、メトキシおよびエトキシから選ばれる。
R^{45}は、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである。
各R^{46}は独立して、H、メチル、エチル、プロピルおよびブチルから選ばれる。
各R^{47}は独立して、H、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、ｎ－ブチル、ｉ－ブチル、－C(＝O)NH(メチル)、－C(＝O)NH(エチル)、－SO_2(メチル)、－SO_2(エチル)、－SO_2(フェニル)、－C(＝O)O(メチル)、－C(＝O)O(エチル)、－C(＝O)(メチル)、－C(＝O)(エチル)および－C(＝O)Hから選ばれる。
各R^{48}は独立して、H、メチル、エチル、ｎ－プロピル、ｉ－プロピル、－C(＝O)NH(メチル)、－C(＝O)NH(エチル)、－C(＝O)O(メチル)、－C(＝O)O(エチル)、－C(＝O)(メチル)、－C(＝O)(エチル)および－C(＝O)Hから選ばれる］。
【請求項１３】
請求項１１に記載の化合物：
［該化合物中、
R^1は、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－ブロモ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－メチル－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－メトキシ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－(３,４－ジクロロ－フェニル)フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(３－メチル－４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(２,３－ジメトキシ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－クロロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(３－メチル－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－ｔ－ブチル－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(３,４－ジフルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(２－メトキシ－５－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－フルオロ－１－ナフチル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(ベンジル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(４－ピリジル)、
－(CH_2)$_3$C(＝O)(３－ピリジル)、
－(CH_2)$_3$CH(OH)(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$CH(OH)(４－ピリジル)、
－(CH_2)$_3$CH(OH)(２,３－ジメトキシ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$S(３－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$S(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$S(＝O)(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$$SO_2$(３－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$$SO_2$(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(４－フルオロ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(３－ピリジル)、
－(CH_2)$_3$O(４－ピリジル)、
－(CH_2)$_3$O(２－NH_2－フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(２－NH_2－５－Ｆ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(２－NH_2－４－Ｆ－フェニル)、
－(CH_2)$_3$O(２－NH_2－３－Ｆ－フェニル)、

－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｏ(２－ＮＨ$_2$－４－Ｃｌ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｏ(２－ＮＨ$_2$－４－ＯＨ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｏ(２－ＮＨ$_2$－４－Ｂｒ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｏ(２－ＮＨＣ(＝Ｏ)Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｏ(２－ＮＨＣ(＝Ｏ)Ｍｅ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$ＮＨ(４－フルオロ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｎ(メチル)(４－フルオロ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$ＣＯ$_2$(エチル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)Ｎ(メチル)(メトキシ)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)ＮＨ(４－フルオロ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＨＣ(＝Ｏ)(フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＭｅＣ(＝Ｏ)(フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＨＣ(＝Ｏ)(２－フルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＭｅＣ(＝Ｏ)(２－フルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＨＣ(＝Ｏ)(４－フルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＭｅＣ(＝Ｏ)(４－フルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＨＣ(＝Ｏ)(２，４－ジフルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$ＮＭｅＣ(＝Ｏ)(２，４－ジフルオロフェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(３－インドリル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１－メチル－３－インドリル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１－インドリル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１－インドリニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１－ベンズイミダゾリル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１Ｈ－１，２，３－ベンゾトリアゾリール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１Ｈ－１，２，３－ベンゾトリアゾリール－２－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$(１Ｈ－１，２，３－ベンゾトリアゾリール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$(１Ｈ－１，２，３－ベンゾトリアゾリール－２－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(３，４－ジヒドロ－１(２Ｈ)－キノリニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(＝Ｏ)(４－フルオロ－フェニル)、
－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$(３－インドリル)、
－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$(１－フタルイミジル)、
－(ＣＨ$_2$)$_4$Ｃ(＝Ｏ)Ｎ(メチル)(メトキシ)、
－(ＣＨ$_2$)$_4$ＣＯ$_2$(エチル)、
－(ＣＨ$_2$)$_4$Ｃ(＝Ｏ)(フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_4$(シクロヘキシル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$ＣＨ(フェニル)$_2$、
－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ＝Ｃ(フェニル)$_2$、
－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ＝ＣＭｅ(４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$ＣＨ(４－フルオロ－フェニル)$_2$、
－ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$ＣＨ＝Ｃ(４－フルオロ－フェニル)$_2$、
－(ＣＨ$_2$)$_3$ＣＨ(２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－２－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－５－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－３－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－４－Ｃｌ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－４－ＯＨ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨ$_2$－４－Ｂｒ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１Ｈ－インダゾール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(５－Ｆ－１Ｈ－インダゾール－３－イル)、

－(ＣＨ$_2$)$_3$(７－Ｆ－１Ｈ－インダゾール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｃｌ－１Ｈ－インダゾール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｂｒ－１Ｈ－インダゾール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＭｅ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(１－ベンゾチエン－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｆ－１Ｈ－インドール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(５－Ｆ－１Ｈ－インドール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｆ－２,３－ジヒドロ－１Ｈ－インドール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(５－Ｆ－２,３－ジヒドロ－１Ｈ－インドール－１－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｆ－１Ｈ－インドール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(５－Ｆ－１Ｈ－インドール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(５－Ｆ－１Ｈ－インドール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(９Ｈ－プリン－９－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(７Ｈ－プリン－７－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$(６－Ｆ－１Ｈ－インダゾール－３－イル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＳＯ$_2$Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＣ(＝Ｏ)Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＣ(＝Ｏ)Ｍｅ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＣＯ$_2$Ｅｔ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＣ(＝Ｏ)ＮＨＥｔ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＣＨＯ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＯＨ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＭｅＳ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_3$Ｃ(＝Ｏ)(２－ＮＨＳＯ$_2$Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＯ$_2$Ｍｅ、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(ＯＨ)(４－Ｆ－フェニル)$_2$、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(ＯＨ)(４－Ｃｌ－フェニル)$_2$、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(＝Ｏ)(４－Ｃｌ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(＝Ｏ)(２－ＭｅＯ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(＝Ｏ)(３－Ｍｅ－４－Ｆ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(＝Ｏ)(２－Ｍｅ－フェニル)、
－(ＣＨ$_2$)$_2$Ｃ(Ｍｅ)ＣＨ(＝Ｏ)(フェニル)、

【化１０】


,

,

,

,

,

および


から選ばれる。

R^{4a}は、Ｈであって、

R^{4b}は、Ｈであるか；あるいは、

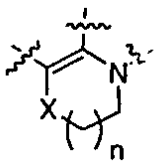
R^{4a}およびR^{4b}は一緒になって、＝Ｏを形成する。

R^{5}は、Ｈ、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであって、

R^{6}は、Ｈ、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであるか；あるいは、

R^{5}およびR^{6}は一緒になって、式：

【化１１】



（式中、Ｘは、－CH_2－、－Ｏ－または－Ｓ－であり、ｎは、１である）

の縮合したヘテロ環を形成する。

R^{7}、R^{8}およびR^{9}は各々独立して、

水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｔ－ブチル、ニトロ、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、フェニル、ベンジル、

ＨＣ(＝Ｏ)－、メチルＣ(＝Ｏ)－、エチルＣ(＝Ｏ)－、プロピルＣ(＝Ｏ)－、イソプロピルＣ(＝Ｏ)－、ｎ－ブチルＣ(＝Ｏ)－、イソブチルＣ(＝Ｏ)－、ｓｅｃ－ブチルＣ(＝Ｏ)－、ｔｅｒｔ－Ｃ(＝Ｏ)－、フェニルＣ(＝Ｏ)－、

メチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、エチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、プロピルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、イソプロピルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、ｎ－ブチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、イソブチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、ｓｅｃ－ブチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、ｔｅｒｔ－ブチルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、フェニルＣ(＝Ｏ)ＮＨ－、

メチルアミノ－、エチルアミノ－、プロピルアミノ－、イソプロピルアミノ－、ｎ－ブチルアミノ－、イソブチルアミノ－、ｓｅｃ－ブチルアミノ－、ｔｅｒｔ－ブチルアミノ－、フェニルアミノ－、

から選ばれる。

ただし、置換基：R^{7}、R^{8}およびR^{9}の内の２つは独立して、水素、フルオロ、クロ

ロ、ブロモ、シアノ、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｔ－ブチル、ニトロ、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシおよびトリフルオロメトキシから選ばれる］。

【請求項１４】

医薬的に許容し得る担体、および請求項１、２、３、４、５、６、７、８、９もしくは１０のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩の治療上の有効量を含有する、医薬組成物。

【請求項１５】

医薬的に許容し得る担体、および請求項１１、１２もしくは１３のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩の治療上の有効量を含有する、医薬組成物。

【請求項１６】

請求項１、２、３、４、５、６、７、８、９もしくは１０のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩を含む、５ＨＴ２Ｃ受容体の調節に関連する障害を治療するための医薬組成物。

【請求項１７】

該化合物が５ＨＴ２Ｃアゴニストである、請求項１６に記載の医薬組成物。

【請求項１８】

請求項１１、１２もしくは１３のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩を含む、５ＨＴＡ２受容体の調節に関連する障害を治療するための医薬組成物。

【請求項１９】

該化合物が５ＨＴＡ２アンタゴニストである、請求項１８に記載の医薬組成物。

【請求項２０】

請求項１、２、３、４、５、６、７、８、９もしくは１０のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩を含む、肥満症を治療するための医薬組成物。

【請求項２１】

請求項１１、１２もしくは１３のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩を含む、精神分裂病を治療するための医薬組成物。

【請求項２２】

請求項１１、１２もしくは１３のいずれか１つに記載の化合物またはそれらの医薬的に許容し得る塩を含む、うつ病を治療するための医薬組成物。