

【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18年1月19日(2006.1.19)

【公表番号】特表2003-502272(P2003-502272A)

【公表日】平成15年1月21日(2003.1.21)

【出願番号】特願2000-530520(P2000-530520)

【国際特許分類】

| | |
|-----------------|-----------|
| C 0 7 D 471/04 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4355 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/4545 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/519 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/5377 | (2006.01) |
| A 6 1 K 31/55 | (2006.01) |
| A 6 1 P 1/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 1/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P 3/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P 9/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P 9/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P 11/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P 13/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 17/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P 19/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P 19/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/14 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/20 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/24 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/28 | (2006.01) |
| A 6 1 P 25/30 | (2006.01) |
| A 6 1 P 29/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 P 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P 37/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P 37/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P 37/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P 43/00 | (2006.01) |
| C 0 7 D 487/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D 487/22 | (2006.01) |
| C 0 7 D 491/048 | (2006.01) |
| C 0 7 D 495/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D 519/00 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|-----------------|---------|
| C 0 7 D 471/04 | 1 0 4 Z |
| A 6 1 K 31/4355 | |
| A 6 1 K 31/4545 | |

A 6 1 K 31/519
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/55
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 13/00
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/30
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 37/04
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 487/04 1 4 0
C 0 7 D 487/22
C 0 7 D 491/048
C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
C 0 7 D 519/00 3 0 1
C 0 7 D 519/00 3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月10日(2005.11.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

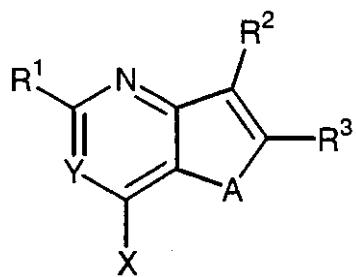
【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】**【特許請求の範囲】**

【請求項1】 下記式で示される化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド：

【化1】



式中、YはNまたはC(R⁶)であり；AはN-H、N-R⁴またはCR⁴R⁷であり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁～C₈)アルキル)、-N((C₁～C₈)アルキル)、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

R¹は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたフェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジルまたはピリダジニル基でなく；

R³は(C₃～C₁₀)シクロアルキル、(C₁～C₈)アルキル、-(C₁～C₈)アルキル-OH、(C₁～C₈)アルコキシ-(C₁～C₈)アルキル)、-(C₁～C₈)アルキル-N(R⁵)₂、-(C₁～C₈)アルキル-S(O)_p(C₁～C₈)アルキル)、-(CH₂)((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_mOH、-(CH₂)((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-D'(NR⁵SO₂R⁵)、-D'(CON(R⁵)₂)、-D'(CO₂R⁵)、-D'(NR⁵CON(R⁵)₂)、-D'(COR⁵)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-D(NR⁵SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(CO₂R⁵)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR⁵CON(R⁵)₂)、-D(NR⁵(CO)R⁵)、-D(NR⁵CO₂R⁵)、-D(COR⁵)または-(NR⁵)_k-D

- Q 基であり；

R^4 は ($C_1 \sim C_8$) アルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、- Z (($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、- Z (アリーロキシ)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)、- Z ($NR^5 SO_2 R^5$)、- Z ($CON(R^5)_2$)、- Z ($CO_2 R^5$)、- Z ($N(R^5)_2$)、- Z ($NR^5 CON(R^5)_2$)、- Z ($NR^5 (CO)R^5$)、- Z ($NR^5 CO_2 R^5$)、- Z (COR^5)、- Z ($S(O)_p R^5$) または - Z (Q) 基であり；

X は ($C_1 \sim C_8$) アルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、- (NR^5)_k (($C_1 \sim C_8$) アルキル) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^5)_k (($C_1 \sim C_8$) アルキル) アリーロキシ、- (NR^5) ($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k $S(O)_p R^5$ 、- (NR^5)_k (($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k $S(O)_p R^5$ 、- (NR^5) $D(C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、- (NR^5) (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^5)_k (CH_2) (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2) アリーロキシ、- (NR^5)_k (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2)_m アリーロキシ、- (NR^5)_k (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) (CH_2)_m アリーロキシ、- Z ($S(O)_q R^5$)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)、- Z ($NR^5 SO_2 R^5$)、- Z ($CON(R^5)_2$)、- Z ($CO_2 R^5$)、- Z ($N(R^5)_2$)、- Z ($NR^5 CON(R^5)_2$)、- Z ($NR^5 (CO)R^5$)、- Z ($NR^5 CO_2 R^5$)、- Z (COR^5)、または - Z (Q) 基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式炭素環式またはヘテロ環式環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R^8 は独立して、- OH 、ハロ、- CF_3 、- $O CF_3$ 、($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- NH_2 、- NH (($C_1 \sim C_8$) アルキル)、- N (($C_1 \sim C_8$) アルキル)₂ または ($C_1 \sim C_8$) アルキル基であり；

各 R^5 および R^7 は、各々独立して、水素、- OH 、($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、アリール、- NH_2 、- NH (($C_1 \sim C_8$) アルキル)、- N (($C_1 \sim C_8$) アルキル)₂、($C_1 \sim C_8$) アルキルまたは ($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル基であり；

D は、- (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2)_m - であり、 D' は、- (($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k - であり；

Z は、 $D(NR^5)_k$ 、- D' (NR^5)_k、(NR^5)_k D または (NR^5)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；

ここで、 X 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 および R^8 のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、 Q 、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、ハロ、- CF_3 、- $O CF_3$ 、- Z ($COOH$)、- Z (OH)、- Z (NO_2)、- Z (SH)、- ($C_1 \sim C_8$) アルキル、- ($C_1 \sim C_8$) アシロキシ、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、- S - (($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k - アリール、- (($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k - $SO_2 NH$ - アリール、- S - ($C_1 \sim C_8$) アルキル、- Z (($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、- Z (アリーロキシ)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)、- Z ($NR^9 SO_2 R^9$)、- Z ($CON(R^9)_2$)、- Z ($CO_2 R^9$)、- Z ($N(R^9)_2$)、- Z ($NR^9 CON(R^9)_2$)、- Z ($NR^9 (CO)R^9$)、- Z ($NR^9 CO_2 R^9$)、- Z (

C O R^9)、 - Z (S (0)_p R⁹) または - Z (Q) の 1 個またはそれ以上の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 以上のハロ、- NO₂ 、- CF₃ 、- OC F₃ 、- N (R⁹)₂ 、- C (O) R⁹ 、- CO₂ R⁹ 、- OR⁹ 、- SR⁹ または (C₁ ~ C₈) アルキル基で任意に置換されており；

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 4 であり；

但し：

(a) A は NH、Y は N、R¹ は H、メチルまたはフェニル、および R³ はメチル、エチルまたはフェニルの場合、(1) R² は H の場合、X は - NH₂ 、- N (CH₂ CH₃)₂ 、- NHCH₂ CH₂ N (CH₂ CH₂)₂ 、- NHCH₂ CH₂ CH₂ CO₂ H 、- NHCH₂ CH₂ OH 、- NH - フェニル、- NHCH₂ CH₂ - フェニル、- NH - CH (CH₃) CH₂ - フェニル、- NH - (メトキシフェニル) 、- NHCH₂ CH₂ - (ジメトキシフェニル) 、- NHCH₂ CH₂ - イミダゾリル、- NHCH₂ CH₂ - (メチルチオイミダゾリル) 、- NHCH₂ CH₂ - シクロヘキシリル、- NH - シクロヘキシリル、ピペリジニル、モルホリニル、- NH NH₂ 、- NHCH (CH₃)₂ 、- NH - ブチル、- NH - CH (CH₃) (CH₂)₄ CH₃ 、- NH (CH₂)₂ シクロヘキセニル、- NH - (CH₂)₅ CH₃ 、- NHCH₂ CH = CH₂ 、- NH - CH₂ - フェニル、4 - メチルピペラジン、- NH SO₂ (4 - アミノフェニル) または - NH - (4 - メチルピペラジン) でなく；(2) R² は - CH₂ N (CH₂ CH₃)₂ 、- CH₂ NH - ブチル、- CH₂ NHCH₂ CH₂ - シクロヘキセニルまたは - CH₂ NHCH₂ CH₂ COOH の場合、X は - NH (CH₂)₂ シクロヘキセニルでなく；および(3) R² は、メチル、アセチルまたは - COOCH₂ CH₃ の場合、X は - NH₂ または - NH (C (O) CH₃) でなく；

(b) R¹ はエトキシ、R² は H、R³ は - COOCH₂ CH₃ 、A は NH および Y は N の場合、X は - NH₂ でなく；

(c) A は N - H または N - R⁴ 、Y は C - H および R¹ は水素、ハロ、アルキル、シクロアルキル、アルコキシまたはアルキルチオの場合、(1) R³ はメチルおよび R² はアセチルまたは - COOCH₃ の場合、X は NH₂ またはトリフルオロメチルフェニルでなく；(2) R³ はメチルまたは - COOCH₂ CH₃ 、および R² は H の場合、X はメチルでなく；および(3) R² 、R³ または R⁴ のうちの 1 つが任意に置換された - エチル - NR⁵ CONHR⁵ の場合、X はアルキルまたはシクロアルキルでなく；

(d) A は N - R⁴ および Y は C - H の場合、R³ は - CO₂ R⁵ でなく；

(e) A は N - C₁ ~ C₆ アルキル、Y は C - H または N、R¹ および R³ は水素、ハロ、アルキル、アルコキシまたはアルキルチオの場合、R² は 1 ~ 3 個のハロ、ヒドロキシ、アルキルまたはアルコキシ基で任意に置換されたチエニルでなく；

(f) A は CH₂ 、Y は C - H 、R¹ は NH₂ 、R³ はメチルおよび X はメチルの場合、R² は C (O) NH₂ でなく；

(g) A は N - H または N - R⁴ および R³ はアリールまたはヘテロアリールの場合、R² はアリールまたはヘテロアリールでなく；

(h) A は N - R⁴ 、Y は N、R¹ は H および R³ はアルキルの場合、X は - NH₂ でなく；および

(i) A は N - H または N - R⁴ および R² は H の場合、R³ は - N (R⁵) - (C₂ ~ C₆ アルキル) - N (R⁵)₂ または - N (R⁵) - (C₂ ~ C₆ アルキル) - Q により置換された任意に置換されたフェニルでない。

【請求項 2】 Y は N または C (R⁶) であり；A は N - H、N - R⁴ または CR⁴ R⁷ であり；

R⁶ は水素、- OH、ハロ、- CF₃ 、- OC F₃ 、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、- NH₂ 、- NH ((C₁ ~ C₈) アルキル) 、- N ((C₁ ~ C₈) アルキル)

C_2 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキルまたは $-Z(Q)$ 基であり；

R^1 は水素、ハロ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NHOH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $-Z((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルコキシ)、 $-Z(\text{アリーロキシ})$ 、 $-Z(\text{アリール})$ 、 $-Z(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-Z((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル)、 $-Z(\text{NR}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{N}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{COR}^5)$ 、 $-Z(\text{S(O)}_p \text{R}^5)$ または $-Z(Q)$ 基であり；

但し、 R^1 は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でない；

R^2 は水素、ハロ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $-Z((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルコキシ)、 $-Z(\text{アリーロキシ})$ 、 $-Z(\text{アリール})$ 、 $-Z(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-Z((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル)、 $-Z(\text{NR}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{N}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{S(O)}_p \text{R}^5)$ または $-Z(Q)$ 基であり；ただし、 R^2 は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R^3 は $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル OH 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル)、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル $\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル $\text{S(O)}_p ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル)、 $-((\text{CH}_2))((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2)_m \text{O}\text{H}$ 、 $-((\text{CH}_2))_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m \text{O}\text{H}$ 、 $-((\text{CH}_2))_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2) \text{O}\text{H}$ 、 $-((\text{CH}_2))((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2)(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2)_m \text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m \text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $k(\text{CH}_2)_m \text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m \text{S(O)}_p \text{R}^5$ 、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m (\text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-((\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル $(\text{CH}_2)_m (\text{COR}^5)$ 、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル $(\text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8))$ アルキル (COR^5) 、 $-D'(\text{S(O)}_q \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{アリーロキシ})$ 、 $-D'(\text{アリール})$ 、 $-D'(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-D'((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル、 $-D'(\text{NR}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-D'(\text{NR}^5 \text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-D'(\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D'(Q)$ 、 $-D(\text{アリーロキシ})$ 、 $-D(\text{アリール})$ 、 $-D(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-D((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}))$ シクロアルキル)、 $-D(\text{NR}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-D(\text{S(O)}_q \text{R}^5)$ 、 $-D(\text{NR}^5 \text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-D(\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-D(\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、または $-((\text{NR}^5)_k - D - Q$ 基であり、但

し R³ は - SO₂ NH₂ でない；

R⁴ は (C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、- Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- Z (アリーロキシ)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、- Z (NR⁵ SO₂ R⁵)、- Z (CON(R⁵)₂)、- Z (CO₂ R⁵)、- Z (N(R⁵)₂)、- Z (NR⁵ CON(R⁵)₂)、- Z (NR⁵ (CO) R⁵)、- Z (NR⁵ CO₂ R⁵)、- Z (COR⁵)、- Z (S(0)_p R⁵) または - Z (Q) 基であり；
X は - (NR⁵)_k ((C₁ ~ C₈) アルキル) (C₁ ~ C₈) アルコキシ、- (NR⁵)_k ((C₁ ~ C₈) アルキル) アリーロキシ、- (NR⁵) (C₁ ~ C₈) アルキル) S(0)_p R⁵、- (NR⁵) D(C₁ ~ C₈) アルコキシ、- (NR⁵) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- (NR⁵) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m ((C₁ ~ C₈) アリーロキシ)、- (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m アリーロキシ、
- (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m アリーロキシ、- Z (S(0)_q R⁵)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、- Z (NR⁵ SO₂ R⁵)、- Z (CON(R⁵)₂)、- Z (CO₂ R⁵)、- Z (N(R⁵)₂)、- Z (NR⁵ CON(R⁵)₂)、- Z (NR⁵ (CO) R⁵)、- Z (NR⁵ CO₂ R⁵)、- Z (COR⁵)、または - Z (Q) 基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式炭素環式またはヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R⁸ は独立して、- OH、ハロ、- CF₃、- OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、- NH₂、- NH ((C₁ ~ C₈) アルキル)、- N ((C₁ ~ C₈) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり；

各 R⁵ および R⁷ は、各々独立して、水素、- OH、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、- NH₂、- NH ((C₁ ~ C₈) アルキル)、- N ((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキルまたは (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル基であり；

D は、- (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) k (CH₂)_m - であり、D' は、- ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - であり；

Z は、D(NR⁵)_k、- D' (NR⁵)_k、(NR⁵)_k D または (NR⁵)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の - CF₃、- OCF₃、- Z (COOH)、- Z (OH)、- Z (NO₂)、- Z (SH)、- (C₁ ~ C₈) アルキル、- (C₁ ~ C₈) アシロキシ、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、- S - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - アリール、- ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - SO₂ NH - アリール、- S - (C₁ ~ C₈) アルキル、- Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- Z (アリーロキシ)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、- Z (NR⁹ SO₂ R⁹)、- Z (CON(R⁹)₂)、- Z (CO₂ R⁹)、- Z (N(R⁹)₂)、- Z (NR⁹ CON(R⁹)₂)、- Z (NR⁹ (CO) R⁹)、- Z (NR⁹)

CO_2R^9)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)_pR⁹)または-Z(Q)の基により任意に置換されており、ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁~C₈)アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびQ部分は、1~3個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹または(C₁~C₈)アルキルで任意に置換されている、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項3】 YはNであり；AはN-H、N-R⁴またはCHR⁴であり；R¹は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z((C₃~C₆)シクロアルキル)、-Z(NR¹⁰SO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、または-Z(Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR¹⁰SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-Z(NR¹⁰(CO)R⁵)、-Z(NR¹⁰CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³は(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₃~C₈)アルキル、-((C₁~C₈)アルキル)OH、(C₁~C₈)アルコキシ-(C₁~C₈)アルキル)、-、-((C₁~C₈)アルキル)N(R⁵)₂、-((C₁~C₈)アルキル)S(O)_p((C₁~C₈)アルキル)、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)OH、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)N(R⁵)₂、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-CH₂((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-((C₁~C₈)アルキル)(CO₂R⁵)、-((C₁~C₈)アルキル)(COR⁵)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D'(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D'(CON(R⁵)₂)、-D'(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D'(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D'(NR¹⁰CO₂R⁵)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D(CON(

$R^5)_2$)、

- $D(S(O)_q R^5)$ 、 - $D(NR^{10} CON(R^5)_2)$ 、 - $D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 - $D(NR^{10} CO_2 R^5)$ 、または - $(NR^{10})_k D$ - Q 基であり、但し R^3 は - $SO_2 NH_2$ でない；

R^4 は ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、- $N(R^5)_2$ または - $Z(Q)$ 基であり；

X は - $(NR^{10})(C_1 \sim C_8)$ アルキル ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、
- $(NR^{10})(C_1 \sim C_8)$ アルキル アリーロキシ、
- $(NR^{10})S(O)_p R^5$ 、
- $(NR^{10})(C_1 \sim C_8)$ アルキル $S(O)_p R^5$ 、
- $(NR^{10})D(C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)_m (C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $k (CH_2)(C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $k (CH_2)_m (C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)_m (C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $(CH_2)_m (C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)_m (C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $k (CH_2)_m$ アリロキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $k (CH_2)_m$ アリロキシ、
- $(NR^{10})(CH_2)_m (C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $(CH_2)_m$ アリロキシ、

- $(NR^{10})D(S(O)_q R^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(S(O)_q R^5)$ 、 - $(NR^{10})D(Arielle)$ 、 - $(NR^{10})D'(Arielle)$ 、 - $(NR^{10})D(HeteroArielle)$ 、 - $(NR^{10})D'(HeteroArielle)$ 、 - $(NR^{10})D((C_3 \sim C_1)_0)$ シクロアルキル)、 - $(NR^{10})D'((C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、 - $(NR^{10})D(NR^{10} SO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(NR^{10} SO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D(DON(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D'(DON(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D(CO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(CO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D(N(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D'(N(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D(NR^{10} CON(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D'(NR^{10} CON(R^5)_2)$ 、 - $(NR^{10})D(NR^{10} (CO)R^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(NR^{10} (CO)R^5)$ 、 - $(NR^{10})D(DNR^{10} CO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(DNR^{10} CO_2 R^5)$ 、 - $(NR^{10})D(DCOR^5)$ 、 - $(NR^{10})D'(DCOR^5)$ 、 - $(NR^{10})D - Q$ 、 - $(NR^{10})D' - Q$ または Q 基であり；

ここで、各 R^{10} は独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環式環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R^8 は独立して、- OH 、ハロ、- CF_3 、- $OCAF_3$ 、($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- NH_2 、- $NH(C_1 \sim C_4)$ アルキル)、- $N(C_1 \sim C_4)_2$ または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、- OH 、($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、- NH_2 、- $NH(C_1 \sim C_4)$ アルキル)、- $N((C_1 \sim C_4)_2)$ アルキル基、($C_1 \sim C_4$) アルキルまたは ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル基であり；

D は、- $(CH_2)_m (C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル $k (CH_2)_m$ - であり、

D' は、- $((C_1 \sim C_8))$ アルキル k - であり；

Z は、 $D(NR^{10})_k$ 、- $D'(NR^{10})_k$ 、 $(NR^{10})_k D$ または $(NR^5)_k D'$ であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴ および R⁵ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の - C F₃、- O C F₃、- O R⁹、- S R⁹、- N O₂、- (C₁ ~ C₄) アルキル、- (C₁ ~ C₄) アシロキシ、- (C₃ ~ C₆) シクロアルキル、- S - (C₁ ~ C₄) アルキル) _k - アリール、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) _k - S O₂ N H - アリール、アリーロキシ、アリール、- N R⁹ S O₂ R⁹、- C O N (R⁹)₂、- C O₂ R⁹、- N (R⁹)₂、- N R⁹ C O N (R⁹)₂、- N R⁹ (C O) R⁹、- N R⁹ C O₂ R⁹、- C O R⁹、- S (O)₂ (C₁ ~ C₄) アルキルまたは Q で任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 部分は、1 ~ 3 個のハロ、- N O₂、- C F₃、- O C F₃、- N (R⁹)₂、- C (O) R⁹、- C O₂ R⁹、- O R⁹、- S R⁹ または (C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 3 である、請求項 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N - オキシド。

【請求項 4】 Y は N であり；A は N - H または N - R⁴ であり；

R¹ は水素、ハロ、- O H、- N O₂、- N H O H、- C F₃、- O C F₃、(C₁ ~ C₄) アルキル、(C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - シクロプロピルまたは - (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - N (R¹₀)₂ 基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、- C F₃、- O C F₃、(C₁ ~ C₄) アルキル、(C₃ ~ C₆) シクロアルキル、- (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - (C₁ ~ C₄) アルコキシ)、- (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - (C O N (R⁵)₂)、- (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - (N (R⁵)₂)、- (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - (S (O)_p R⁵) または - (N R¹₀)_k ((C₁ ~ C₂) アルキル) _k - (Q) 基であり；

R³ は (C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、(C₃ ~ C₆) アルキル、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) O H、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル) -、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) N (R⁵)₂、- (C H₂) ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) _k (C H₂)_m O H、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m O H、- (C H₂) ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) _k (C H₂)_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m N (R⁵)₂、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m N (R⁵)₂、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m S (O)_p R⁵、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C O₂ R⁵)、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C O R⁵)、- D' (S (O)_p R⁵)、- D' (アリーロキシ)、- D' (アリール)、- D' (ヘテロアリール)、- D' ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、- D' (Q)、- D (アリーロキシ)、- D (アリール)、- D (ヘテロアリール)、- D (N R¹₀ S O₂ R⁵)、- D (C O N (R⁵)₂)、- D (S (O)_q R⁵)、- D (N R¹₀ C O N (R⁵)₂)、- D (N R¹₀ (C O) R⁵)、- D (N R¹₀ C O₂ R⁵) または - (N R¹₀)_k - D - Q 基であり；但し R³ は - S O₂ N H₂

でない；

R^4 は ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

X は - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (($C_1 \sim C_4$) アルキル) アリーロキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル)_k (CH₂) ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル)_k (CH₂)_m ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル) ((CH₂)_m ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル)_k (CH₂) アリーロキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル) ((CH₂)_m アリーロキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル) ((CH₂)_m アリーロキシ、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (アリール)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D' (アリール)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (ヘテロアリール)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D' (ヘテロアリール)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} SO₂ R⁵)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (CON(R⁵)₂)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} CON(R⁵)₂)、 - N(R⁵)₂、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} CO₂ R⁵)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} COR⁵)、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D - Q、 - (N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)) - D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 $R^{1 0}$ は、独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R^8 は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、-NH₂、-NH (($C_1 \sim C_4$) アルキル)、-N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)₂ または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、-OH、($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、-NH₂、-NH (($C_1 \sim C_4$) アルキル)、-N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)₂、または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

D は、- (CH₂)_m (($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル)_k (CH₂)_m - であり、 D' は、- (($C_1 \sim C_4$) アルキル)_k - であり；

Z は、(NR^{1 0})_k D、または (NR^{1 0})_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 3 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、 X 、 R^2 および R^3 のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、 Q 、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、- ($C_1 \sim C_4$) アシロキシ、-N(R⁹)SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹ または -S(O)₂ ($C_1 \sim C_4$) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R^9 は、独立して、水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり、および

但し、 A 、 X 、 Y 、 R^1 、 R^2 および R^3 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N -オキシド。

【請求項 5】 Y は N であり； A は N -H であり；

R^1 は、プロモ、クロロ、フルオロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルキル、(C₁~C₂)アルコキシ、-(NR^{1 0})_k((C₁~C₂)アルキル)基であり；

R^2 は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルキル、または(C₁~C₂)アルコキシ基であり；

R^3 は(C₃~C₆)シクロアルキル)、(C₃~C₆)アルキル、-((C₁~C₄)アルキル)OH、(C₁~C₄)アルコキシ-(C₁~C₄)アルキル)、-((C₁~C₄)アルキル)N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₂)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₂)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁~C₂)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃~C₆)シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR^{1 0}SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR^{1 0}CON(R⁵)₂)、-D(NR^{1 0}(CO)R⁵)、-D(NR^{1 0}CO₂R⁵)または-(NR^{1 0})_k-D-Q基であり；但しR³は-SO₂NH₂でない；

Xは-N((C₁~C₄)アルキル)₂または、Xに隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで、各R^{1 0}は、独立して水素または(C₁~C₂)アルキル基であり；またはXおよびAは、隣接炭素原子と一緒にになって、1~2個のR⁸基で任意に置換されている8員乃至10員二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Qは、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各R⁸は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₂)アルキル)、-N((C₁~C₂)アルキル)₂または(C₁~C₂)アルキル基であり；

各R⁵は、独立して、水素、-OH、(C₁~C₂)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₂)アルキル)、-N((C₁~C₂)アルキル)₂または(C₁~C₂)アルキル基であり；

Dは、-(CH₂)_m((C₅~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D'は、-(C₁~C₄)アルキル)_k-であり；

Zは、(NR^{1 0})_kD、または(NR^{1 0})_kD'であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0~2の整数であり；

各pは独立して0~2の整数であり；および

各qは独立して1または2であり；および

ここで、X、R²およびR³のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1~2個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁~C₄)アルキル、-(C₁~C₄)アシロキシ、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON

(R⁹)₂、 -NR⁹(CO)R⁹、 -NR⁹CO₂R⁹、 -COR⁹または-S(O)₂(C₁~C₄)アルキルで任意に置換されており；ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁~C₂)アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は1~2である、請求項4に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項6】 YはC(R⁶)であり；AはN-H、N-R⁴またはCHR⁴であり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)₂、(C₁~C₄)アルキルまたは(C₃~C₆)シクロアルキル基であり；

R¹は、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z((C₃~C₆)シクロアルキル)、-Z(NR¹⁰SO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、または-Z(Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR¹⁰SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-Z(NR¹⁰(CO)R⁵)、-Z(NR¹⁰CO₂R⁵)、-Z(S(O)_qR⁵)または-Z(Q)基であり；但し、R₂は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基ではない；

R³は(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₃~C₈)アルキル、-(C₁~C₈)アルキル-OH、(C₁~C₈)アルコキシ-(C₁~C₈)アルキル)、-、-(C₁~C₈)アルキル)N(R⁵)₂、-(C₁~C₈)アルキル)S(0)p((C₁~C₈)アルキル)、-(CH₂)((C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)(C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)k(CH₂)N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mS(0)pR⁵、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-(C₁~C₈)アルキル)(CO₂R⁵)、-(C₁~C₈)アルキル)(COR⁵)、-D'(S(0)_qR⁵)、-D'(アリロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D'(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D'(CON(R⁵)₂)、-D'(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D'(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D'(NR¹⁰CO₂R⁵)、-D'(Q)、-D(アリロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D(NR⁵SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D(NR¹⁰CO₂R⁵)、または-D(NR¹⁰)_k-D-Q基であり；但し、R³は-SO₂NH₂ではない；

R⁴は(C₁~C₄)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-N(R⁵)₂または-Z(Q)基であり；

Xは-(NR¹⁰)((C₁~C₈)アルキル)(C₁~C₈)アルコキシ、-(NR

R^1) (($C_1 \sim C_8$) アルキル) アリーロキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) $S(0)_p R^5$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) (($C_1 \sim C_8$) アルキル) $S(0)_p R^5$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(C_1 \sim C_8)$) アルコキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k ($C H_2$) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2) (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2)_m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) (CH_2)_m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2) アリーロキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2) (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2)_m アリーロキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) (CH_2)_m アリーロキシ、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(S(0)_q R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(S(0)_q R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) D (アリール) 、 - ($NR^{1\ 0}$) D' (アリール) 、 - ($NR^{1\ 0}$) D (ヘテロアリール) 、 - ($NR^{1\ 0}$) D' (ヘテロアリール) 、 - ($NR^{1\ 0}$) D (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) 、 - ($NR^{1\ 0}$) D' (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(NR^{1\ 0} SO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(NR^{1\ 0} SO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(CON(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(CON(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(CO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(CO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(N(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(N(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(NR^{1\ 0} CON(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(NR^{1\ 0} CON(R^5)_2)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(NR^{1\ 0}(CO)R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(NR^{1\ 0}(CO)R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(NR^{1\ 0} CO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(NR^{1\ 0} CO_2 R^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(COR^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'(COR^5)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D(Q)$ 、 - ($NR^{1\ 0}$) $D'Q$ または Q 基であり；

ここで、各 $R^{1\ 0}$ は、独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；または X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R^8 は独立して、- OH、ハロ、- CF_3 、- $O CF_3$ 、($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、- NH_2 、- NH (($C_1 \sim C_4$) アルキル)、- N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)₂ または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、- OH、($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、- NH_2 、- NH (($C_1 \sim C_4$) アルキル)、- N (($C_1 \sim C_4$) アルキル)₂、($C_1 \sim C_4$) アルキルまたは ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル基であり；

D は、- (CH_2)_m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k (CH_2)_m - であり、 D' は、- (($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k - であり；

Z は、 $D(NR^{1\ 0})_k$ 、 $D'(NR^{1\ 0})_k$ 、($NR^{1\ 0})_k D$ または ($NR^{1\ 0})_k D'$ であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、 X 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 のいずれかのアリール、ヘテロアリール、シクロアリール、 Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロおよび 1 ~ 2 個の- CF_3 、- $O CF_3$ 、- OR^9 、- SR^9 、- NO_2 、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、- ($C_1 \sim C_4$) アシロキシ、- ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、- S - (($C_1 \sim C_4$) アルキル)_k - アリール、- (($C_1 \sim C_4$) アルキル)_k - $SO_2 NH$ - アリール、アリーロキシ、アリール、- $NR^9 SO_2 R^9$ 、- $CON(R^9)_2$ 、- $CO_2 R^9$ 、- $N(R^9)_2$ 、- $NR^9 CON(R^9)_2$ 、- $NR^9 (CO)R^9$ 、- $NR^9 CO_2 R^9$ 、- COR^9 、- $S(0)_2 (C_1 \sim C_4)$ アルキルまたは Q で任意に置換されており、ここで、各 R^9 は独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり、ここでそのよ

うなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびQ置換基は、1～2個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹または(C₁～C₄)アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は0～3である、請求項2に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項7】 YはC(R⁶)であり；AはN-HまたはN-R⁴であり；

R⁶は水素、-OH、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₂)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁～C₂)アルキル)、-N((C₁～C₂)アルキル)₂、または(C₁～C₄)アルキル基であり；

R¹は、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₄)アルキル、(C₁～C₄)アルコキシ、-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_kシクロプロピルまたは-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-N(R¹⁰)₂基であり；

R²は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₄)アルキル、(C₃～C₆)シクロアルキル、-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-((C₁～C₄)アルコキシ)、-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-CON(R⁵)₂、-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-(NR⁵)₂、-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-(SO_pR⁵)または-(NR¹⁰)_k((C₁～C₂)アルキル)_k-(Q)基であり；

R³は(C₃～C₆)シクロアルキル、(C₃～C₆)アルキル、-((C₁～C₄)アルキル)OH、(C₁～C₄)アルコキシ-((C₁～C₄)アルキル)-、-((C₁～C₄)アルキル)N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁～C₄)アルコキシ、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁～C₄)アルコキシ、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(CO₂R⁵)、

-((CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(COR⁵)、

-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃～C₁₀)シクロアルキル、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D(NR¹⁰CO₂R⁵)または-(NR¹⁰)_k-D-Q基であり；但しR³は-SO₂NH₂でない；

R⁴は(C₁～C₄)アルキル基であり；

Xは-((N((C₁～C₄)アルキル))-(C₁～C₄)アルキル)アリ-ロキシ、-((N((C₁～C₄)アルキル))-(CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁～C₄)アルコキシ、-((N((C₁～C₄)アルキル))-(CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁～C₄)アルコキシ、-((N((C₁～C₄)アルキル))-(CH₂)_m((C₃～C₆)シクロアルキル)(

C H_2)_m ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルコキシ、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - (C H_2)_m (($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$) シクロアルキル)_k (C H_2) アリーロキシ、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - (C H_2) (($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$) シクロアルキル)_k (C H_2)_m アリーロキシ、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - (C H_2)_m (($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$) シクロアルキル) (C H_2)_m アリーロキシ、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (アリール)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D' (アリール)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (ヘテロアリール)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} SO₂ R⁵)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (CON(R⁵)₂)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (CO₂ R⁵)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (N(R⁵)₂)、- N ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D ((R⁵)₂)、- N (R⁵)₂)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} CON(R⁵)₂)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (NR^{1 0} (CO) R⁵)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D (COR⁵)、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D - Q、- (N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)) - D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R^{1 0} は、独立して水素または ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、- OH、ハロ、- CF₃、- OCF₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルコキシ、- NH₂、- NH (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)、- N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)₂ または ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル基であり；

各 R⁵ は独立して、水素、- OH、($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルコキシ、- NH₂、- NH (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)、- N (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)₂ または ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル基であり；

D は、- (C H_2)_m (($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$) シクロアルキル)_k (C H_2)_m - であり、D' は、- (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル)_k - であり；

Z は、(NR^{1 0})_k D または (NR^{1 0})_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 3 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；

ここで、X、R² および R³ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、- CF₃、- OCF₃、- OR⁹、- SR⁹、- NO₂、($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル、- (($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アシロキシ、NR⁹ SO₂ R⁹、CON(R⁹)₂、CO₂ R⁹、N(R⁹)₂、NR⁹ CON(R⁹)₂、NR⁹ (CO) R⁹)、NR⁹ CO₂ R⁹、COR⁹ または - S (O)₂ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキルで任意に置換されており；ここで、各 R⁹ は、独立して、水素または ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$) アルキル基であり；

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N - オキシド。

【請求項 8】 Y は C (R⁶) であり；A は N - H であり；

R⁶ は水素、- OH、クロロ、フルオロ、- CF₃、- OCF₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルコキシまたは ($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルキル基であり；

R¹ はブロモ、クロロ、フルオロ、- OH、- NO₂、- NH OH、- CF₃、- OC F₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルキル、($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルコキシ、- (NR^{1 0})_k (($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルキル)_k - シクロプロピル、- NH₂ または - NH (($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルキル) 基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、- CF₃、- OCF₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_2$) アルキルまた

は(C₁ ~ C₂)アルコキシ基であり；

R³は(C₃ ~ C₆)シクロアルキル)、(C₃ ~ C₆)アルキル、- ((C₁ ~ C₄)アルキル) OH、(C₁ ~ C₄)アルコキシ- (C₁ ~ C₄)アルキル) - 、- ((C₁ ~ C₄)アルキル) N (R⁵)₂ 、- (C H₂) ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) k (C H₂)_m OH、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) k (C H₂)_m OH、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) k (C H₂)_m (C₁ ~ C₂)アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) (C H₂)_m (C₁ ~ C₂)アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) k (C H₂)_m N (R⁵)₂ 、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) (C H₂)_m S (O)_p R⁵ 、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) (C H₂)_m (C O₂ R⁵)、- (C H₂)_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C H₂)_m (C O R⁵)、- D' (S (O)_q R⁵)、- D' (アリーロキシ)、- D' (アリール)、- D' (ヘテロアリール)、- D' ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)、- D' (Q)、- D (アリーロキシ)、- D (アリール)、- D (ヘテロアリール)、- D (N R¹ ⁰ S O₂ R⁵)、- D (C O N (R⁵)₂)、- D (S (O)_q R⁵)、- D (N R¹ ⁰ C O N (R⁵)₂)、- D (N R¹ ⁰ (C O) R⁵)、- D (N R¹ ⁰ C O₂ R⁵)または- (N R¹ ⁰)_k - D - Q 基であり；但しR³は- S O₂ N H₂でない；

Xは- (N ((C₁ ~ C₄)アルキル))₂ または、Xに隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで各R¹⁰は、独立して水素または(C₁ ~ C₂)アルキル基である；または

XおよびAは、隣接炭素原子と一緒にになって、1~2個のR⁸基で任意に置換されている8員乃至10員二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Qは、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各R⁸は独立して、- OH、ハロ、- C F₃、- O C F₃、(C₁ ~ C₂)アルコキシ、- N H₂、- N H ((C₁ ~ C₂)アルキル)、- N ((C₁ ~ C₂)アルキル))₂ または(C₁ ~ C₂)アルキル基であり；

各R⁵は、独立して、水素、- OH、(C₁ ~ C₂)アルコキシ、- N H₂、- N H ((C₁ ~ C₂)アルキル)、- N ((C₁ ~ C₂)アルキル))₂ または(C₁ ~ C₂)アルキル基であり；

Dは、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆)シクロアルキル) k (C H₂)_m - であり、D'は、- ((C₁ ~ C₄)アルキル) k - であり；

Zは、(N R¹ ⁰)_k D、または(N R¹ ⁰)_k D' であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0~2の整数であり；

各pは独立して0~2の整数であり；および

各qは独立して1または2であり；および

ここで、X、R²およびR³のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1~2個のハロ、- C F₃、- O C F₃、- O R⁹、- S R⁹、- N O₂、- (C₁ ~ C₄)アルキル、- (C₁ ~ C₄)アシロキシ、- N R⁹ S O₂ R⁹、- C O N (R⁹)₂、- C O₂ R⁹、- N (R⁹)₂、- N R⁹ C O N (R⁹)₂、- N R⁹ (C O) R⁹、- N R⁹ C O₂ R⁹、- C O R⁹ または- S (O)₂ (C₁ ~ C₄)アルキルで任意に置換されており；ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁ ~ C₂)アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は1~2である、請求項7に記載の化合物、または

その薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項 9】 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (2 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリノ - 2 - イル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) ピロリジン - 2 - イル] メタン - 1 - オール ;
 1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) ピロリジン - 3 - オール ;
 4 - ホモピペリジル - 2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピロリジニルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - (4 - メチルフェニル) - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 ジメチル [1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) (4 - ピペリジル)] アミン ;
 ジメチル { [1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) (2 - ピペリジル)] メチル } アミン ;
 2 - イソプロピル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 シス / トランス - 4 - (3 , 5 - ジメチルピペリジニル) - 2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 [1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 3 - ピペリジル] メタン - 1 - オール
 2 , 5 - ジメチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - (3 - ヒドロキシフェニル) - 7 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - b] ピリジン ;
 7 - ピペリジル - 2 - (2 - ピリジル) ピロロ [3 , 2 - b] ピリジン ;
 2 - シクロヘクス - 1 - エニル - 7 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - b] ピリジン 塩酸塩 ;
 2 - シクロヘキシル - 7 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - b] ピリジン ;
 2 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) チオフェン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (3 - ピリジニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール ;
 2 - メチル - 4 - (2 - メチルピロリジン - 1 - イル) - 6 - フェニルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (ピロリニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (2 - ピペリジンエタノリル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (2 - メチルピペリジニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (2 - エチルピペリジニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリジニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イルアミン ;
 2 - メチルチオ - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - エチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - シクロプロピル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (3 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;

4 - メトキシ - 1 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) ベンゼン ;
4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェノール ;
6 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
4 - アゼチジニル - 2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) チオフェン ;
2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (2 - ピリジル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - アダマンタニル - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - ピラジン - 2 - イルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) ベンゾ [b] フラン ;
2 , 7 - ジメチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - フェニル - 4 - ピペリジル - 2 - (トリフルオロメチル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - (4 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
(6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イル) プロピルアミン ;
6 - (tert - ブチル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 6 - (2 - メチルシクロヘキサメチル - 1 - エネイル) - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 , 5 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) チオフェン ;
2 - メチル - 6 - (4 - フェニルフェニル) - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
3 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 1 - (フェニルスルホニル) ピロール ;
6 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - (4 - フェニルピペラジニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
6 - (2 , 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (3 , 4 , 5 - トリクロロフェニル) ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
5 - [2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル] - 2

H - ベンゾ [d] 1 , 3 - ジオキソラン ;
 2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロフェニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - フルオロ - 1 - メトキシ - 4 - [2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル] ベンゼン ;
 2 - フルオロ - 4 - [2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル] フェノール ;
 6 - ((3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 トリフルオロ [4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェニルチオ] メタン ;
 6 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 2 H , 3 H - ベンゾ [e] 1 , 4 - ジオキサン ;
 1 , 2 - ジメトキシ - 4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) ベンゼン ;
 6 - フルオレン - 2 - イル - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 4 - ピペリジル - 6 - (2 - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフチル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 2 - メチル - 6 - (5 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イル) - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - インダン - 5 - イル - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 5 - [2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル] - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [b] フラン ;
 2 , 4 - ジメチル - 5 - [2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル] - 1 , 3 - チアゾール ;
 2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジル - 6 - ((4 - トリフルオロメチル) フェニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (4 - フルオロフェニル) - 2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 6 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 1 - (2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 4 - メトキシベンゼン ;
 4 - (2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェノール ;
 6 - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;
 1 - (2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 3 - メトキシベンゼン ;
 4 - (6 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - メチルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) モルホリン ;
 1 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 4

- (メチルスルホニル)ベンゼン；
 1, 2, 3 - トリメトキシ - 5 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)ベンゼン；
 7 - エチル - 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 5 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)フラン；
 6 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (2 - メチルピペリジル)ピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 6 - ブチル - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 2, 6 - ジメチル - 4 - ピペリジル - 7 - プロピルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 1 - (4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)フェニル)エタン - 1 - オン；
 2 - メチル - 6 - (4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)フェニル) - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 7 - フルオロ - 2 - メチル - 6 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジル - 7 - ピロリジニル [3, 2 - d] ピリミジン；
 3 - メチル - 2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)ベンゾ [b] チオフェン；
 4 - クロロ - 1 - ((2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)メチル)スルホニル)ベンゼン；
 4 - メトキシ - 1 - ((2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)メチル)ベンゼン；
 1 - (2, 6 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン - 7 - イル) - 4 - メトキシベンゼン；
 2 - メチル - 6 - (2 - ナフチル) - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 3, 5 - ジメチル - 2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)ベンゾ [b] チオフェン；
 7 - メトキシ - 2 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)ベンゾ [b] フラン；
 6 - ((4 - フルオロフェニル)メチル) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 7 - (4 - フルオロフェニル) - 2, 6 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 ((2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル)メトキシ)ベンゼン；
 2, 6 - ジメチル - 7 - フェノキシ - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 2 - メチル - 6 - (2 - フェニルエチル) - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 2, 6 - ジメチル - 7 - ベンジル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 5 - (2, 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロロ [4, 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) - 2 H - ベンゾ [d] 1, 3 - ジオキソラン；
 6 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 2, 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロロ [3, 2 - d] ピリミジン；
 1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2, 3 - e] ピリミジン - 4 - イル)ピペリジン - 3 - オール；
 1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [2, 3 - e] ピリミジン - 4 - イル)ピペリ

ジン - 4 - オール ;

8 - アザ - 8 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 1 , 4 - ジオキサスピロ [4 , 5] デカン ;

1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 4 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピペリジン - 4 - オール ;

1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) ピペリジン - 2 - オン ;

2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 1 - オール ;

4 - ((6 S , 2 R) - 2 , 6 - ジメチル) - 2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

4 - ((6 S , 2 R) - 2 , 6 - ジメチルピペリジル) - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

3 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェニルアミン ;

4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェニルアミン ;

1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 4 - ナフチルスルホニル) ピペラジン ;

2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピロリジニルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

トリフルオロ (4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェノキシ) メタン ;

6 - フェニル - 4 - ピペリジル - 2 - プロピルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

2 - メチル - 4 - (3 - ピロリニル) - 6 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

6 - (3 - クロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (3 - ピロリニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

6 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (3 - ピロリニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

6 - フェニル - 4 - ピペリジル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イルヒドロキシルアミン ;

6 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メチル - 4 - (3 - ピロリニル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

2 - (2 - メチルプロピル) - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

2 - エチル - 6 - フェニル - 4 - (2 - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリル) ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

2 - クロロ - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

ジメチル (6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イル) アミン ;

2 - メトキシ - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

メチル (6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イル) アミン ;

6 - フェニル - 2 - (4 - フェニルピペラジニル) - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

2 - シクロプロピル - 6 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン ;

4 - (2 - メチル - 4 - ピペリジルピロ口 [4 , 5 - d] ピリミジン - 6 - イル) フェニル 2 , 2 - ジメチルプロパノエート ;

7 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミ

ジン；

4 - (8 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクト - 8 - イル) - 2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン；

(1 - [2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 2 - ピペリジル) メタン - 1 - オール；

4 - インドリニル - 2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン；

2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピラゾリピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン；

2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - [1 , 2 , 4 - チアゾリル] ピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン；

4 - (2 , 5 - ジメチル (3 - ピロリニル) - 2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン；

1 - (2 - フラニルカルボニル) - 4 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) ピペラジン；

1 - アセチル - 4 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) ピペラジン；

1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) - 4 - (メチルスルホニル) ピペラジン；

1 - (2 - メチル - 6 - フェニルピロ口 [2 , 3 - e] ピリミジン - 4 - イル) (フェニルスルホニル) ピペラジン；

2 - メチル - 5 - フェニル - 7 , 7 a , 8 , 9 , 10 , 11 - ヘキサヒドロ - 1 , 3 , 11 a - トリアザ - ピロ口 [3 , 2 , 1 - d e] フェナンスリジン；

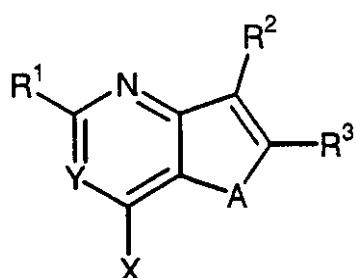
5 - メチル - 2 - (4 - フルオロフェニル) - 7 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - b] ピリジン；

(7 - アミノヘプチル) - (6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イル) アミン；もしくは

(4 - アミノブチル) - (6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロ口 [3 , 2 - d] ピリミジン - 2 - イル) アミンである請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 10】 下記式で示される化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN - オキシド。

【化 2】



式中、Y は N または C (R⁶) であり；A は S、S (O)、S (O)₂ または O であり；

R⁶ は水素、- OH、ハロ、- CF₃、- OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、- NH₂、- NH ((C₁ ~ C₈) アルキル)、- N ((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキルまたは - Z (Q) 基であり；

R¹ は水素、ハロ、- OH、- NO₂、- NH OH、- CF₃、- OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、- Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、- Z (アリーロキシ)、- Z (アリール)、- Z (ヘテロアリール)、- Z ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、- Z (NR⁵ SO₂ R⁵)、- Z (CON(R⁵)₂)、- Z (CO₂ R⁵)、- Z (N(R⁵)₂)、- Z (NR⁵ CON(R⁵)₂)、- Z (

$\text{N R}^5 (\text{C O}) \text{R}^5$)、 $-Z(\text{N R}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$)、 $-Z(\text{C O R}^5)$)、 $-Z(\text{S(O)}_p \text{R}^5)$)または $-Z(Q)$ 基であり；

R^2 は水素、ハロ、 $-\text{O H}$ 、 $-\text{N O}_2$ 、 $-\text{C F}_3$ 、 $-\text{O C F}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $-Z((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ)、 $-Z(\text{アリーロキシ})$ 、 $-Z(\text{アリール})$ 、 $-Z(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-Z((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル)、 $-Z(\text{N R}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$)、 $-Z(\text{CON(R}^5)_2)$)、 $-Z(\text{CO}_2 \text{R}^5)$)、 $-Z(\text{N(R}^5)_2)$)、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CON(R}^5)_2)$)、 $-Z(\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$)、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$)、 $-Z(\text{C O R}^5)$)、 $-Z(\text{S(O)}_p \text{R}^5)$)または $-Z(Q)$ 基であり；ただし、 R^2 は任意に置換されたフェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジルまたはピリダジニル基でなく；

R^3 は $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) O H 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル)、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) $\text{N(R}^5)_2$ 、 $-((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) $\text{S(O)}_p ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル)、 $-((\text{C H}_2)((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{O H}$ 、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{O H}$ 、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{N(R}^5)_2$ 、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{N(R}^5)_2$ 、 $-((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{S(O)}_p \text{R}^5$ 、 $-D'(\text{S(O)}_q \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{アリーロキシ})$ 、 $-D'(\text{アリール})$ 、 $-D'(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-D'((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル)、 $-D'(\text{N R}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{CON(R}^5)_2)$ 、 $-D'(\text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{N R}^5 \text{CON(R}^5)_2)$ 、 $-D'(\text{N R}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{N R}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-D'(\text{C O R}^5)$ または $-D(\text{N R}^5)_k -D(Q)$ 基であり；

X は $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) $(\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) $\text{S(O)}_p \text{R}^5$ 、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルキル) $\text{S(O)}_p \text{R}^5$ 、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$ アルコキシ、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{Ari-LOKishi}$ 、 $-((\text{N R}^5)_k ((\text{C H}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル) $\text{k} (\text{C H}_2)_m \text{Ari-ROKishi}$ 、 $-Z(\text{S(O)}_q \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{アリール})$ 、 $-Z(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-Z((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$ シクロアルキル)、 $-Z(\text{N R}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{CON(R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{N(R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{NR}^5 \text{CON(R}^5)_2)$ 、 $-Z(\text{N R}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{N R}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)$ 、 $-Z(\text{C O R}^5)$ 、または $-Z(Q)$ 基であり；

Q は、1～2個の R^8 基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R^8 は独立して、 $-\text{O H}$ 、ハロ、 $-\text{C F}_3$ 、 $-\text{O C F}_3$ 、

(C₁ ~ C₈) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキルまたは(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル基であり；

D は、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k(CH₂)_m- であり、D' は、-((C₁ ~ C₈) アルキル)_k- であり；

Z は、D(NR⁵)_k、-D'(NR⁵)_k、(NR⁵)_kD または (NR⁵)_kD' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷ および R⁸ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、ハロ、-CF₃、-OCF₃、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO₂)、-Z(SH)、-(C₁ ~ C₈) アルキル、-(C₁ ~ C₈) アシロキシ、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル_k-アリール、-(C₁ ~ C₈) アルキル_k-SO₂NH-アリール、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁹SO₂R⁹)、-Z(CON(R⁹)₂)、-Z(CO₂R⁹)、-Z(N(R⁹)₂)、-Z(NR⁹CON(R⁹)₂)、-Z(NR⁹(CO)R⁹)、-Z(NR⁹CO₂R⁹)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)_pR⁹) または -Z(Q) の 1 個またはそれ以上の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 個またはそれ以上のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹ または (C₁ ~ C₈) アルキルで任意に置換されており；

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 4 であり；および、

但し、

(a) A は S、Y は N、R² は H、R³ はメチルまたはフェニルおよび R¹ はフェニル、NH₂、ビペラジニルまたはメチルの場合、X は NH₂、モルホリニル、1-オキシドチオモルホリニルまたはチオモルホリニルでなく；

(b) A は O、Y は C-H、R¹ は H、R² は H および R³ はプロピル、ブチルまたはヒドロキシプロピルの場合、X はメチル、ベンジルまたはメトキシフェニル-CH₂- でなく；

(c) A は S、Y は N、R² は H またはアルキル、R³ はメチルの場合、R¹ はニトロフリル、-NH-(C₂ ~ C₁₀) アルキル-NH₂、-N(アルキル)-(C₂ ~ C₁₀) アルキル-NH₂ または -N(メチル)-エチル-NHSO₂-トリルでなく；

(d) A は S、Y は N、R² は H、ハロ、-NO₂ またはアルキル、R³ はアルキルまたはフェニルおよび X は Q、-N(アルキル-OH)₂、-N(メチル)-エチル-S-メチルまたは -N(メチル)-エチル-S(O)-メチルの場合、R¹ は Q、-N(アルキル-OH)₂、-N(メチル)-エチル-S-メチルまたは -N(メチル)-エチル-S(O)-メチルでなく；

(e) A は O または S、Y は CH、R¹ は H および R² は H の場合、R³ は -SO₂NH₂ でなく；

(f) A は S、Y は N、R¹ は H および R² は H の場合、(1) R³ はフェニルの場合、X は -NH-NH₂、任意に置換されたインドリルアルキルアミノ、任意に置換された

インドリルアミノ、任意に置換されたチアゾリジノニルアミノまたは任意に置換されたアゼチジノニルアミノでなく、および(2)R³はメチルの場合、Xはピペリジニルでなく；

(g) AはO、YはN、R¹は任意に置換されたフェニル、R²はHおよびR³はアルキルの場合、Xは任意に置換されたフェニルでない。

【請求項11】 YはNまたはC(R⁶)であり；AはS、S(O)、S(O)₂またはOであり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₈)アルキル)、-N((C₁~C₈)アルキル)₂、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

R¹は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；但し、R₁は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でない；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³は(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₃~C₈)アルキル、-(C₁~C₈)アルキル)OH、(C₁~C₈)アルコキシ-(C₁~C₈)アルキル)、-(C₁~C₈)アルキル)N(R⁵)₂、-(C₁~C₈)アルキル)S(O)_p((C₁~C₈)アルキル)、-(CH₂)((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)OH、-(CH₂)((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁~C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R₅)、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR₅)、-(C₁~C₈)アルキル)(CO₂R₅)、-(C₁~C₈)アルキル)(COR₅)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D'(NR⁵SO₂R⁵)、-D'(CON(R⁵)₂)、-D'(NR⁵CON(R⁵)₂)、-D'(NR⁵(CO)R⁵)、-D'(NR⁵CO₂R⁵)または-D'(NR⁵)_k-D-Q基であり；ただし、R³は-SO₂NH₂でなく；

Xは-(NR⁵)_k((C₁~C₈)アルキル)(C₁~C₈)アルコキシ、-(NR

$\overset{5}{\text{) }}_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルキル}) \text{アリーロキシ}、 - (\text{NR}^5) (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルキル}$
 $\overset{5}{\text{) }}_k \text{S(O)}_p \text{R}^5、 - (\text{NR}^5)_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルキル}) \text{S(O)}_p \text{R}^5、 - (\text{NR}^5)_k \text{D} (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ}、 - (\text{NR}^5) (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})_k (\text{CH}_2) (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ}、 - (\text{NR}^5)_k (\text{CH}_2) ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})_k (\text{CH}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ}、 - (\text{NR}^5)_k (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル}) (\text{CH}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ}、 - (\text{NR}^5) (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})_k (\text{CH}_2) \text{アリーロキシ}、 - (\text{NR}^5)_k (\text{CH}_2) ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})_k (\text{CH}_2)_m \text{アリーロキシ}、$
 $- (\text{NR}^5)_k (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル}) (\text{CH}_2)_m \text{アリーロキシ}、 - \text{Z} (\text{S(O)}_q \text{R}^5)、 - \text{Z} (\text{アリール})、 - \text{Z} (\text{ヘテロアリール})、 - \text{Z} ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})、 - \text{Z} (\text{NR}^5 \text{SO}_2 \text{R}^5)、 - \text{Z} (\text{CON(R}^5)_2)、 - \text{Z} (\text{CO}_2 \text{R}^5)、 - \text{Z} (\text{N(R}^5)_2)、 - \text{Z} (\text{NR}^5 \text{CON(R}^5)_2)、 - \text{Z} (\text{NR}^5 (\text{CO}) \text{R}^5)、 - \text{Z} (\text{NR}^5 \text{CO}_2 \text{R}^5)、 - \text{Z} (\text{COR}^5)、 \text{または} - \text{Z} (\text{Q}) \text{基} \text{であり}； \text{または}$

Q は、1～2個の R^8 基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R^8 は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルコキシ、-NH₂、-NH(($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)、-N(($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)₂または($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、-OH、($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH(($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)、-N(($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)₂、($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキルまたは($\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}$)シクロアルキル基であり；

D は、- (CH_2)_m (($\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}$)シクロアルキル)_k (CH_2)_m - であり、
 D' は、- (($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)_k - であり；
 Z は、 $\text{D} (\text{NR}^5)_k$ 、- $\text{D}' (\text{NR}^5)_k$ 、(NR^5)_k D または(NR^5)_k D' であり；

各 k は独立して0または1であり；

各 m は独立して0～6の整数であり；

各 p は独立して0～2の整数であり；

各 q は独立して1または2であり；

ここで、 X 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 および R^6 のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、 Q 、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1～3個のハロ、および1～2個の- CF_3 、- OCF_3 、- $\text{Z} (\text{COOH})$ 、- $\text{Z} (\text{OH})$ 、- $\text{Z} (\text{NO}_2)$ 、- $\text{Z} (\text{SH})$ 、- ($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル、- ($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アシロキシ、- ($\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}$)シクロアルキル、- $\text{S} - ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルキル})_k$ - アリール、- - (($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル)_k - $\text{SO}_2 \text{NH}$ - アリール、- $\text{S} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルキル}$ 、- $\text{Z} ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ})$ 、- $\text{Z} (\text{アリーロキシ})$ 、- $\text{Z} (\text{アリール})$ 、- $\text{Z} (\text{ヘテロアリール})$ 、- $\text{Z} ((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}) \text{シクロアルキル})$ 、- $\text{Z} (\text{NR}^9 \text{SO}_2 \text{R}^9)$ 、- $\text{Z} (\text{CON(R}^9)_2)$ 、- $\text{Z} (\text{CO}_2 \text{R}^9)$ 、- $\text{Z} (\text{N(R}^9)_2)$ 、- $\text{Z} (\text{NR}^9 \text{CON(R}^9)_2)$ 、- $\text{Z} (\text{NR}^9 (\text{CO}) \text{R}^9)$ 、- $\text{Z} (\text{NR}^9 \text{CO}_2 \text{R}^9)$ 、- $\text{Z} (\text{COR}^9)$ 、- $\text{Z} (\text{S(O)}_p \text{R}^9)$ または- $\text{Z} (\text{Q})$ により任意に置換されており、ここで各 R^9 は、独立して、水素または($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1～3個のハロ、- NO_2 、- CF_3 、- OCF_3 、- $\text{N(R}^9)_2$ 、- C(O)R^9 、- $\text{CO}_2 \text{R}^9$ 、- OR^9 、- SR^9 または($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキルで任意に置換されている、請求項10に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項12】 Y は N であり； A は S 、 S(O)_2 または O であり；

R^1 は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、($\text{C}_1 \sim \text{C}_8$)アルキル、($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$)シクロアルキル、- $\text{Z} ((\text{C}_1 \sim \text{C}_8) \text{アルコキシ})$ 、

- Z ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)、- Z (NR^{1 0} SO₂ R⁵)、- Z (N(R⁵)₂)または-Z (Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈)アルキル、(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、-Z ((C₁ ~ C₈)アルコキシ)、-Z (アリーロキシ)、-Z (アリール)、-Z (ヘテロアリール)、-Z ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-Z (NR^{1 0} SO₂ R⁵)、-Z (CON(R⁵)₂)、-Z (N(R⁵)₂)、-Z (NR^{1 0} CON(R⁵)₂)、-Z (NR^{1 0} (CO)R⁵)、-Z (NR^{1 0} CO₂ R⁵)、-Z (S(0)_p R⁵)または-Z (Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³は(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、(C₃ ~ C₈)アルキル、-(C₁ ~ C₈)アルキル)OH、(C₁ ~ C₈)アルコキシ-(C₁ ~ C₈)アルキル)-、-(C₁ ~ C₈)アルキル)N(R⁵)₂、-(C₁ ~ C₈)アルキル)S(0)_p((C₁ ~ C₈)アルキル)、-(CH₂)((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mS(0)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-(C₁ ~ C₈)アルキル)(CO₂R⁵)、-(C₁ ~ C₈)アルキル)(COR⁵)、-D'(S(0)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-D'((NR^{1 0} SO₂ R⁵)、-D'((CON(R⁵)₂)、-D'((NR^{1 0} CON(R⁵)₂)、-D'((NR^{1 0} (CO)R⁵)、-D'((NR^{1 0} CO₂ R⁵)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-D((NR^{1 0} SO₂ R⁵)、-D((CON(R⁵)₂)、-D(S(0)q R⁵)、-D((NR^{1 0} CON(R⁵)₂)、-D((NR^{1 0} (CO)R⁵)、-D((NR^{1 0} CO₂ R⁵)、または-(NR^{1 0})_k-D-Q基であり；ただし、R³は-SO₂NH₂でなく；

Xは-(NR^{1 0})((C₁ ~ C₈)アルキル)(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(NR^{1 0})((C₁ ~ C₈)アルキル)アリーロキシ、-(NR^{1 0})S(0)_pR⁵、-(NR^{1 0})((C₁ ~ C₈)アルキル)S(0)_pR⁵、-(NR^{1 0})D(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(NR^{1 0})(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(NR^{1 0})(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-(NR^{1 0})(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(NR^{1 0})(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mアリーロキシ、-(NR^{1 0})(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mアリーロキシ、-(NR^{1 0})D(S(0)_qR⁵)、-(NR^{1 0})D'(S(0)_qR⁵)、-(NR^{1 0})D(アリール)、-(NR^{1 0})D'(アリール)、-(NR^{1 0})D(ヘテロアリール)、-(NR^{1 0})D'(ヘテロアリール)、-(NR^{1 0})D((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-(NR^{1 0})D'((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-(NR^{1 0})D((NR^{1 0} SO₂ R⁵)、-(NR^{1 0})D'((NR^{1 0} SO₂ R⁵)、-(NR^{1 0})D'((CON(R⁵)₂)、-(NR^{1 0})D'((CON(R⁵)₂))

、 - (N R ^{1 0}) D (C O ₂ R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D ' (C O ₂ R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D (N (R ⁵) ₂) 、 - N (R ⁵) ₂ 、 - (N R ^{1 0}) D ' (N (R ⁵) ₂) 、 - (N R ^{1 0}) D (N R ^{1 0} C O N (R ⁵) ₂) 、 - (N R ^{1 0}) D ' (N R ^{1 0} C O N (R ⁵) ₂) 、 - (N R ^{1 0}) D (N R ^{1 0} (C O) R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D ' (N R ^{1 0} (C O) R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D (N R ^{1 0} C O ₂ R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D ' (N R ^{1 0} C O ₂ R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D (C O R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D ' (C O R ⁵) 、 - (N R ^{1 0}) D - Q 、 - (N R ^{1 0}) D ' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R ^{1 0} は独立して水素または (C ₁ ~ C ₄) アルキル基であり；または Q は、1 ~ 2 個の R ⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R ⁸ は独立して、- O H 、ハロ、- C F ₃ 、- O C F ₃ 、(C ₁ ~ C ₄) アルコキシ、- N H ₂ 、- N H ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) 、- N ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) ₂ または (C ₁ ~ C ₄) アルキル基であり；

各 R ⁵ は、独立して、水素、- O H 、(C ₁ ~ C ₄) アルコキシ、- N H ₂ 、- N H ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) 、- N ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) ₂ 、(C ₁ ~ C ₄) アルキルまたは (C ₃ ~ C ₆) シクロアルキル基であり；

D は、- (C H ₂) _m ((C ₃ ~ C ₁₀) シクロアルキル) _k (C H ₂) _m - であり、D ' は、- ((C ₁ ~ C ₈) アルキル) _k - であり；

Z は、D (N R ^{1 0}) _k 、- D ' (N R ^{1 0}) _k 、(N R ^{1 0}) _k D または (N R ^{1 0}) _k D ' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X 、 R ¹ 、 R ² 、 R ³ および R ⁵ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の- C F ₃ 、- O C F ₃ 、- O R ⁹ 、- S R ⁹ 、- N O ₂ 、- (C ₁ ~ C ₄) アルキル、- (C ₁ ~ C ₄) アシロキシ、- (C ₃ ~ C ₆) シクロアルキル、- S - ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) _k - アリール、- ((C ₁ ~ C ₄) アルキル) _k - S O ₂ N H - アリール、アリーロキシ、アリール、- N R ⁹ S O ₂ R ⁹ 、- C O N (R ⁹) ₂ 、- C O ₂ R ⁹ 、- N (R ⁹) ₂ 、- N R ⁹ C O N (R ⁹) ₂ 、- N R ⁹ (C O) R ⁹ 、- N R ⁹ C O ₂ R ⁹ 、- C O R ⁹ 、- S (O) ₂ (C ₁ ~ C ₄) アルキルまたは Q で任意に置換されており；ここで各 R ⁹ は、独立して、水素または (C ₁ ~ C ₄) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 ~ 3 個のハロ、- N O ₂ 、- C F ₃ 、- O C F ₃ 、- N (R ⁹) ₂ 、- C (O) R ⁹ 、- C O ₂ R ⁹ 、- O R ⁹ 、- S R ⁹ または (C ₁ ~ C ₄) アルキルで任意に置換されており；および

但し、A 、 X 、 Y 、 R ¹ 、 R ² および R ³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 3 である、請求項 1 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N - オキシド。

【請求項 13】 Y は N であり；A は S または O であり；

R ¹ は水素、ハロ、- O H 、- N O ₂ 、- N H O H 、- C F ₃ 、- O C F ₃ 、(C ₁ ~ C ₄) アルキル、(C ₁ ~ C ₄) アルコキシ、- (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - シクロプロピルまたは - (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - N (R _{1 0}) ₂ 基であり；

R ² は水素、クロロ、フルオロ、- C F ₃ 、- O C F ₃ 、(C ₁ ~ C ₄) アルキル、(C ₃ ~ C ₆) シクロアルキル、- (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - (C ₁ ~ C ₄) アルコキシ）、- (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - (C O N (R ⁵) ₂) 、- (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - (S (O) _p R ⁵) または - (N R ^{1 0}) _k ((C ₁ ~ C ₂) アルキル) _k - Q 基であり；

R ³ は (C ₃ ~ C ₆) シクロアルキル) 、(C ₃ ~ C ₆) アルキル、- ((C ₁ ~ C ₄

) アルキル) OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル) - 、 - ((C₁ ~ C₄) アルキル) N(R⁵)₂、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_mOH、 - (CH₂)((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)pR⁵、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、 - D'(S(O)qR⁵)、 - D'(アリーロキシ)、 - D'(アリール)、 - D'(ヘテロアリール)、 - D'((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、 - D'((Q))、 - D(アリーロキシ)、 - D(アリール)、 - D(ヘテロアリール)、 - D(NR¹⁰SO₂R⁵)、 - D(CON(R⁵)₂)、 - D(S(O)qR⁵)、 - D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - D(NR¹⁰(CO)R⁵)、 - D(NR¹⁰CO₂R⁵) または - (NR¹⁰)_k-D-Q 基であり；但し R³ は - SO₂NH₂ でない；

X は - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - ((C₁ ~ C₄) アルキル) アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂) アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_m アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D'(アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(ヘテロアリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰SO₂R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(CON(R⁵)₂)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(CO₂R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰(CO)R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - N(R⁵)₂、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰(CO)R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(NR¹⁰CO₂R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D(COR⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D - Q、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R¹⁰ は、独立して水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OCF₃、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、 - OH、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N((C₁ ~ C₄) アルキル)₂、または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

D は、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_m - であり、 D' は、 - ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - であり；

Z は、 (NR¹⁰)_kD、または (NR¹⁰)_kD' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 3 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R² および R³ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁ ~ C₄) アルキル、-(C₁ ~ C₄) アシロキシ、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹ または -S(O)₂(C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₄) アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 1 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N-オキシド。

【請求項 1 4】 Y は N であり；A は S または O であり；

R¹ は、プロモ、クロロ、フルオロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルキル、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-(NR¹⁰)_k((C₁ ~ C₂) アルキル) - シクロプロピル、-NH₂ または -NH((C₁ ~ C₂) アルキル) 基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルキル、または(C₁ ~ C₂) アルコキシ基であり；

R³ は(C₃ ~ C₆) シクロアルキル、(C₃ ~ C₆) アルキル、-(C₁ ~ C₄) アルキル) OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル) -、-(C₁ ~ C₄) アルキル) N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k(CH₂)_m(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k(CH₂)(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m(COR⁵)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D(NR¹⁰CO₂R⁵) または -(NR¹⁰)_k-D-Q 基であり；但し R³ は -SO₂NH₂ でない；

X は -N((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または、X に隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで、各 R¹⁰ は、独立して水素または(C₁ ~ C₂) アルキル基であり；または Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₂) アルキル)、-N((C₁ ~ C₂) アルキル)₂ または(C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₂)

(C₁ ~ C₂) アルキル)、-N((C₁ ~ C₂) アルキル)₂、または(C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

Dは、-(CH₂)_m((C₅ ~ C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D'は、-((C₁ ~ C₄)アルキル)_k-であり；

Zは、(NR^{1 0})_kD、または(NR^{1 0})_kD'であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0 ~ 2の整数であり；

各pは独立して0 ~ 2の整数であり；および

各qは独立して1または2であり；および

ここで、X、R²およびR³のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁ ~ C₄)アルキル、-(C₁ ~ C₄)アシロキシ、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹または-S(O)R₂(C₁ ~ C₄)アルキルで任意に置換されており；ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁ ~ C₂)アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は1 ~ 2である、請求項13に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項15】 YはC(R⁶)であり；AはS、S(O)₂またはOであり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)₂、(C₁ ~ C₄)アルキルまたは(C₃ ~ C₆)シクロアルキル基であり；

R¹は、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈)アルキル、(C₃ ~ C₆)シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈)アルコキシ)、-Z((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)、-Z(NR^{1 0}SO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、または-Z(Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈)アルキル、(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈)アルコキシ)、-Z(アリロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR^{1 0}SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR^{1 0}CON(R⁵)₂)、-Z(NR^{1 0}(CO)R⁵)、-Z(NR^{1 0}CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；但し、R₂は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基ではない；

R³は(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、(C₃ ~ C₈)アルキル、-(C₁ ~ C₈)アルキル-OH、(C₁ ~ C₈)アルコキシ-(C₁ ~ C₈)アルキル)、-、-(C₁ ~ C₈)アルキル)N(R⁵)₂、-(C₁ ~ C₈)アルキル)S(O)_p((C₁ ~ C₈)アルキル)、-(CH₂)((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₈)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mCO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mCOR⁵)、-(C₁ ~ C₈)アルキル)CO₂R⁵)、-(C₁ ~ C₈)アルキル)COR

⁵)、 - D' (S(0)_q R⁵)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、 - D' (NR¹⁰ S O₂ R⁵)、 - D' (CON(R⁵)₂)、 - D' (NR¹⁰ CON(R⁵)₂)、 - D' (NR¹⁰ (CO) R⁵)、 - D' (NR¹⁰ CO₂ R⁵)、 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - D (NR⁵ SO₂ R⁵)、 - D (CON(R⁵)₂)、 - D (S(0)_q R⁵)、 - D (NR¹⁰ CON(R⁵)₂)、 - D (NR¹⁰ (CO) R⁵)、 - D (NR¹⁰ CO₂ R⁵)、または - (NR¹⁰)_k - D - Q 基であり；但し、R³ は - S O₂ NH₂ ではない；

X は - (NR¹⁰) ((C₁ ~ C₈) アルキル) (C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - (NR¹⁰) ((C₁ ~ C₈) アルキル) アリーロキシ、 - (NR¹⁰) S(0)_p R⁵、 - (NR¹⁰) ((C₁ ~ C₈) アルキル) S(0)_p R⁵、 - (NR¹⁰) D(C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂) (C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂) ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂)_m (C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m (C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂) アリーロキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂) ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂)_m アリーロキシ、 - (NR¹⁰) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) (CH₂)_m アリーロキシ、 - (NR¹⁰) D(S(0)_q R⁵)、 - (NR¹⁰) D' (S(0)_q R⁵)、 - (NR¹⁰) D (アリール)、 - (NR¹⁰) D' (アリール)、 - (NR¹⁰) D (ヘテロアリール)、 - (NR¹⁰) D' (ヘテロアリール)、 - (NR¹⁰) D ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、 - (NR¹⁰) D' ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、 - (NR¹⁰) D (NR¹⁰ SO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D' (NR¹⁰ SO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D (CON(R⁵)₂)、 - (NR¹⁰) D' (CON(R⁵)₂)、 - (NR¹⁰) D (CO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D' (CO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D (N(R⁵)₂)、 - N(R⁵)₂、 - (NR¹⁰) D' (N(R⁵)₂)、 - (NR¹⁰) D (NR¹⁰ CON(R⁵)₂)、 - (NR¹⁰) D' (NR¹⁰ CON(R⁵)₂)、 - (NR¹⁰) D (NR¹⁰ (CO) R⁵)、 - (NR¹⁰) D' (NR¹⁰ (CO) R⁵)、 - (NR¹⁰) D (NR¹⁰ CO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D' (NR¹⁰ CO₂ R⁵)、 - (NR¹⁰) D (COR⁵)、 - (NR¹⁰) D' (COR⁵)、 - (NR¹⁰) D - Q、 - (NR¹⁰) D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R¹⁰ は、独立して水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；または Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OCF₃、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、 - OH、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₄) アルキル)₂、 (C₁ ~ C₄) アルキルまたは (C₃ ~ C₆) シクロアルキル基であり；

D は、 - (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂)_m - であり、 D' は、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - であり；

Z は、 D (NR¹⁰)_k、 D' (NR¹⁰)_k、 (NR¹⁰)_k D または (NR¹⁰)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ のいずれかのアリール、ヘテロアリール、シクロアリール、Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロおよび 1 ~ 2 個の - C

F_3 、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁~C₄)アルキル、-(C₁~C₄)アシロキシ、-(C₃~C₆)シクロアルキル、-S-(C₁~C₄)アルキル)k-アリール、-((C₁~C₄)アルキル)k-SO₂NH-アリール、アリーロキシ、アリール、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹、-S(O)₂(C₁~C₄)アルキルまたはQで任意に置換されており、ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁~C₄)アルキル基であり、そのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびQ置換基は、1~2個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹または(C₁~C₄)アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は0~3である、請求項11に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項16】 YはC(R⁶)であり；AはSまたはOであり

R⁶は水素、-OH、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₂)アルキル)、-N((C₁~C₂)アルキル)₂、または(C₁~C₄)アルキル基であり；

R¹は、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₁~C₄)アルコキシ、-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)kシクロプロピルまたは-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)k-N(R¹⁰)₂基であり；

R²は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)k-(C₁~C₄)アルコキシ)、-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)k-C(ON(R⁵)₂)、-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)k-(S(O)pR⁵)または-(NR¹⁰)k((C₁~C₂)アルキル)k-Q基であり；

R³は(C₃~C₆)シクロアルキル)、(C₃~C₆)アルキル、-((C₁~C₄)アルキル)OH、(C₁~C₄)アルコキシ-(C₁~C₄)アルキル)-、-((C₁~C₄)アルキル)N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)mOH、-、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、

-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)OH、
-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、
-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、
-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)(C₁~C₄)アルコキシ、

-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)_mN(R⁵)₂、
-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、
-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)k(CH₂)N(R⁵)₂、
-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)pR⁵、- (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、- (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、
-D'(S(O)qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)qR⁵)、-D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D(NR¹⁰CO₂R⁵)または-(NR¹⁰

)_k - D - Q 基であり；但し R³ は - SO₂ NH₂ でない；

X は - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - ((C₁ ~ C₄) アルキル) アリ - 口キシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂) (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂)_m((C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂)_m((C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂) アリ - 口キシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂) ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂)_m アリ - 口キシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂)_m アリ - 口キシ、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D' (アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (ヘテロアリール)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (N R¹₀ SO₂ R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (CON(R⁵)₂)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (CO₂ R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (NR(R⁵)₂)、 - N(C₁ ~ C₄) アルキル) - D ((R⁵)₂)、 - N(R⁵)₂、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (NR¹₀ CO₂ R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D (NR¹₀ COR⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D - Q、 - (N((C₁ ~ C₄) アルキル)) - D' - Q または Q 基

ここで、各 R¹₀ は、独立して水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；または Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OC₂F₃、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

各 R⁵ は独立して、水素、 - OH、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

D は、 - (CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k (CH₂)_m - であり、 D' は、 - ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - であり；

Z は、 D (NR¹₀)_k D または (NR¹₀)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 3 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；

ここで、 X、 R² および R³ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q またはアリ - 口キシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、 - CF₃、 - OC₂F₃、 - OR⁹、 - SR⁹、 - NO₂、 (C₁ ~ C₄) アルキル、 - (C₁ ~ C₄) アシロキシ、 NR⁹ S O₂ R⁹、 CON(R⁹)₂、 CO₂ R⁹、 N(R⁹)₂、 NR⁹ CON(R⁹)₂、 NR⁹ (CO) R⁹、 NR⁹ CO₂ R⁹、 COR⁹、 - S(0)₂ (C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換され、ここで、各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 15 に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物または N - オキシド。

【請求項 17】 Y は C(R⁶) であり；A は S または O であり；

R⁶ は水素、 - OH、クロロ、フルオロ、 - CF₃、 - OC₂F₃、 (C₁ ~ C₂) アルコキシまたは (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

R¹ はブロモ、クロロ、フルオロ、 - OH、 - NO₂、 - NH₂、 - CF₃、 - OC

F_3 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-NR^{1\ 0})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル)基であり；

R^2 は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルキルまたは $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ基であり；

R^3 は $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキル、 $-((C_1 \sim C_4)$ アルキル) OH 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル)、 $-((C_1 \sim C_4)$ アルキル) $N(R^5)_2$ 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_mOH$ 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_m(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_m(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $(CH_2)_mS(O)pR^5$ 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 (CO_2R^5) 、 $-CH_2((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 (COR^5) 、 $-D'(S(O)_qR^5)$ 、 $-D'(アリーロキシ)$ 、 $-D'(アリール)$ 、 $-D'(ヘテロアリール)$ 、 $-D'((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $-D'(Q)$ 、 $-D(アリーロキシ)$ 、 $-D(アリール)$ 、 $-D(ヘテロアリール)$ 、 $-D(NR^{1\ 0}SO_2R^5)$ 、 $-D(CON(R^5)_2)$ 、 $-D(S(O)_qR^5)$ 、 $-D(NR^{1\ 0}CO)R^5$ 、 $-D(NR^{1\ 0}CO_2R^5)$ または $-NR^{1\ 0}k-D-Q$ 基であり；但し R^3 は $-SO_2NH_2$ でない；

X は $-N((C_1 \sim C_4)$ アルキル) $_2$ または、 X に隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、1~2個の R^8 基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで各 $R^{1\ 0}$ は、独立して水素または $(C_1 \sim C_2)$ アルキル基である；または

Q は、1~2個の R^8 基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R^8 は独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH((C_1 \sim C_2)$ アルキル)、 $-N((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_2$ または $(C_1 \sim C_2)$ アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、 $-OH$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH((C_1 \sim C_2)$ アルキル)、 $-N((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_2$ 、または $(C_1 \sim C_2)$ アルキル基であり；

D は、 $-CH_2(m((C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_m$ -であり、 D' は、 $-((C_1 \sim C_4)$ アルキル) $_k-$ であり；

Z は、 $(NR^{1\ 0})_kD$ 、または $(NR^{1\ 0})_kD'$ であり；

各 k は独立して0または1であり；

各 m は独立して0~2の整数であり；

各 p は独立して0~2の整数であり；および

各 q は独立して1または2であり；および

ここで、 X 、 R^2 および R^3 のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、 Q 、またはアリーロキシ部分は、1~2個のハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-((C_1 \sim C_4)$ アルキル)、 $-((C_1 \sim C_4)$ アシロキシ)、 $-NR^9SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON(R^9)_2$ 、 $-NR^9(CO)R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$ または $-S(O)_2(C_1 \sim C_4)$ アルキルで任意に置換されており；ここで各 R^9 は、独立して、水素または $(C_1 \sim C_2)$ アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R² およびR³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は1～2である、請求項16に記載の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシド。

【請求項18】 2-メチル-6-フェニル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(4-クロロフェニル)-2-メチル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(tert-ブチル)-2-メチル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(4-クロロフェニル)-2-メチル-4-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(4-クロロフェニル)-2-エチル-4-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(tert-ブチル)-2-メチル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン-1-オール；

2-メチル-6-フェニル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン-1-オール；

6-(4-クロロフェニル)-2-メチル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン-1-オール；

6-フェニル-4-ピペリジル-2-(トリフルオロメチル)チオフェン[3,2-d]ピリミジン；

2-メチル-6-フェニル-4-(3-ビロリニル)フラノ[3,2-d]ピリミジン；

6-(4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-ピペリジルチオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

2-メチル-6-フェニル-4-(2-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル)チオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

2-メチル-6-フェニル-4-(1,2,5,6-テトラヒドロピリジル)チオフェノ[3,2-d]ピリミジン；

2-メチル-6-フェニル-4-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；

5-メチル-2-フェニル-7-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；

2-ブチル-5-メチル-7-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；

2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-7-ピペリジルフラノ[3,2-d]ピリミジン；または

5-メチル-7-ピペリジル-2-(4-ピペリジルフェニル)フラノ[3,2-d]ピリミジンである請求項10に記載の化合物、または

その薬学的に許容できる塩。

【請求項19】 請求項1～18に記載の化合物および薬学的に許容できるキャリアを含んでなる薬剤組成物。

【請求項20】 摂食挙動の調整に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項21】 肥満の予防または治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項22】 糖尿の予防または治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項23】 腫瘍病の予防または治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項24】 炎症性病または疾患の予防または治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項25】 温血動物においてC.R.Fを調整することによりもたらされるまたは

促進される病気または疾患の予防または治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項26】 リューマチ性関節炎；変形性関節炎；疼痛；喘息；乾癬；アレルギー；汎発性不安疾患；パニック；恐怖；強迫性障害；外傷後ストレス疾患；睡眠障害；ストレス誘発精神病性挿入；痛知覚；線維筋痛；気分障害；抑鬱；気分変調；双極性障害；循環気質；慢性疲労症候群；ストレス誘発頭痛；癌；過敏性腸症候群；クローン病；結腸痙攣；術後腸閉塞；潰瘍；下痢；発熱；ヒト免疫不全ウイルス（HIV）感染；神経退化疾患；アルツハイマー病；パーキンソン病；ハンチントン病；胃腸疾患；摂食不全；食欲不振；過食神経障害；出血性ストレス；化学物質依存症；嗜癖；薬剤またはアルコール禁断症状；ストレス誘発精神病性挿入；甲状腺機能病症候群；不適切下痢止めホルモン（ADH）症候群；肥満；不妊；頭部外傷；脊髄外傷；虚血性神経損傷；興奮毒性神経損傷；てんかん；発作；免疫不全；筋肉痙攣；尿失禁；アルツハイマー型老人性痴呆；多発性梗塞痴呆；筋萎縮性側索硬化症；高血圧；頻脈；うつ血性心不全；骨粗鬆症；早産；低血糖；下痢；または慢性過敏症の治療に用いる組成物の調製のための請求項1～18に記載の化合物の使用。

【請求項27】 請求項1～18に記載の化合物を含む、摂食挙動を調整するための医薬組成物。

【請求項28】 請求項1～18に記載の化合物を含む、肥満を予防または治療するための医薬組成物。

【請求項29】 請求項1～18に記載の化合物を含む、糖尿を予防または治療するための医薬組成物。

【請求項30】 請求項1～18に記載の化合物を含む、温血動物における腫瘍病を予防または治療するための医薬組成物。

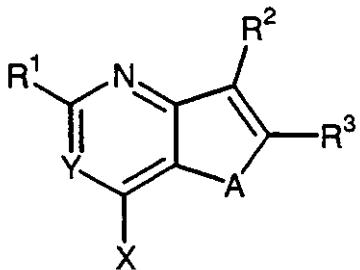
【請求項31】 請求項1～18に記載の化合物を含む、炎症性病または疾患を予防または治療するための医薬組成物。

【請求項32】 請求項1～18に記載の化合物を含む、温血動物においてCRFを調整することによりもたらされるまたは促進され得る病気または疾患を予防または治療するための医薬組成物。

【請求項33】 病気または疾患が、リューマチ性関節炎；変形性関節炎；疼痛；喘息；乾癬；アレルギー；汎発性不安疾患；パニック；恐怖；強迫性障害；外傷後ストレス疾患；睡眠障害；ストレス誘発精神病性挿入；痛知覚；線維筋痛；気分障害；抑鬱；気分変調；双極性障害；循環気質；慢性疲労症候群；ストレス誘発頭痛；癌；過敏性腸症候群；クローン病；結腸痙攣；術後腸閉塞；潰瘍；下痢；発熱；ヒト免疫不全ウイルス（HIV）感染；神経退化疾患；アルツハイマー病；パーキンソン病；ハンチントン病；胃腸疾患；摂食不全；食欲不振；過食神経障害；出血性ストレス；化学物質依存症；嗜癖；薬剤またはアルコール禁断症状；ストレス誘発精神病性挿入；甲状腺機能病症候群；不適切下痢止めホルモン（ADH）症候群；肥満；不妊；頭部外傷；脊髄外傷；虚血性神経損傷；興奮毒性神経損傷；てんかん；発作；免疫不全；筋肉痙攣；尿失禁；アルツハイマー型老人性痴呆；多発性梗塞痴呆；筋萎縮性側索硬化症；高血圧；頻脈；うつ血性心不全；骨粗鬆症；早産；低血糖；下痢；または慢性過敏症である請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項34】 下記式で示される化合物、またはその薬学的に許容できる塩、エステル、溶媒和物またはN-オキシドを含む、摂食挙動、肥満または糖尿、または摂食挙動、肥満または糖尿を調整する同じまたは関連経路に係わる他の病状を調整する為の医薬組成物：

【化3】



式中、YはNまたはC(R⁶)であり；AはO、S、S(O)、S(O)₂、N-H、N-R⁴またはCR⁴R⁷であり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルコキシ、-Z(アリール)、-NH₂、-NH((C₁~C₈)アルキル)、-N((C₁~C₈)アルキル)₂、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

R¹およびXは、各々独立して、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)pR⁵)または-Z(Q)基であり；または

XおよびAは、AがNまたはCの場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1~2個のR⁸基で任意に置換されている5員乃至10員单環式または二環式炭素環式またはヘテロ環式環を形成し；

R²およびR³は、各々独立して、水素、ハロ、-NO₂、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)pR⁵)または-Z(Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R⁴は水素、(C₁~C₈)アルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁~C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)pR⁵)または-Z(Q)基であり；

各R⁵およびR⁷は、各々独立して、水素、-OH、(C₁~C₈)アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁~C₈)アルキル)、-N((C₁~C₈)アルキル)₂、(C₁~C₈)アルキルまたは(C₃~C₁₀)シクロアルキル基であり；

Qは、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各R⁸は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₈)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₈)アルキル)、-N((C₁~C₈)アルキル)₂または(C₁~C₈)アルキル基であり；

Zは、D(NR⁵)_k、-D'(NR⁵)_k、(NR⁵)_kDまたは(NR⁵)_kD'であり；

Dは、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D'は、-((C₁~C₈)アルキル)_k-であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0～6の整数であり；

各pは独立して0～2の整数であり；

各qは独立して1または2であり；

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR⁸のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、ハロ、-CF₃、-OCF₃、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO₂)、-Z(SH)、-(C₁～C₈)アルキル、-(C₁～C₈)アシロキシ、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-S-((C₁～C₈)アルキル)_k-アリール、-(C₁～C₈)アルキル)k-SO₂NH-アリール、-S-((C₁～C₈)アルキル)、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁹SO₂R⁹)、-Z(CON(R⁹)₂)、-Z(CO₂R⁹)、-Z(N(R⁹)₂)、-Z(NR⁹CON(R⁹)₂)、-Z(NR⁹(CO)R⁹)、-Z(NR⁹CO₂R⁹)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)pR⁹)または-Z(Q)の1個またはそれ以上の基により任意に置換されており、ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁～C₈)アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびQ部分は、1以上のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹または(C₁～C₈)アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は0～4である。

【請求項35】 YはNまたはC(R⁶)であり；AはO、S、S(O)、S(O)₂、N-H、N-R⁴またはCR⁴R⁷であり；

R⁶は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁～C₈)アルキル)、-N((C₁～C₈)アルキル)₂、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

R¹は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)pR⁵)または-Z(Q)基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)pR⁵)または-Z(Q)基であり；ただし、R²は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³は(C₃～C₁₀)シクロアルキル、(C₁～C₈)アルキル、

-((C₁～C₈)アルキル)OH、

(C₁～C₈)アルコキシ-(C₁～C₈)アルキル)、

-((C₁～C₈)アルキル)N(R⁵)₂、

-((C₁～C₈)アルキル)S(O)p((C₁～C₈)アルキル)、

-(CH₂)((C₃～C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、

-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、

- (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂})OH、
 - (C_{H₂}) ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m (C₁ ~ C₈)アルコキシ、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_m (C₁ ~ C₈)アルコキシ、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) (C₁ ~ C₈)アルコキシ、
 - (C_{H₂}) ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m N(R⁵)₂、 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_m N(R⁵)₂、 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_m S(O)_pR⁵、
 - D' (S(O)_qR⁵)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、
 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、
 - D' (NR⁵SO₂R⁵)、 - D' (CON(R⁵)₂)、
 - D' (CO₂R⁵)、 - D' (NR⁵CON(R⁵)₂)、
 - D' (NR⁵(CO)R⁵)、
 - D' (NR⁵CO₂R⁵)、 - D' (COR⁵)、
 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - D (NR⁵SO₂R⁵)、 - D (CON(R⁵)₂)、 - D (COR⁵)、 - D (S(O)_qR⁵)、 - D (NR⁵CON(R⁵)₂)、 - D (NR⁵(CO)R⁵)、 - D (NR⁵CO₂R⁵)、 - D (COR⁵)、または - (NR⁵)_k - D - Q 基であり；

R⁴ は (C₁ ~ C₈)アルキル、(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、 - Z ((C₁ ~ C₈)アルコキシ)、 - Z (アリーロキシ)、 - Z (アリール)、 - Z (ヘテロアリール)、 - Z ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - Z (NR⁵SO₂R⁵)、 - Z (CON(R⁵)₂)、 - Z (CO₂R⁵)、 - Z (N(R⁵)₂)、 - Z (NR⁵CON(R⁵)₂)、 - Z (NR⁵(CO)R⁵)、 - Z (NR⁵CO₂R⁵)、 - Z (COR⁵)、 - Z (S(O)_pR⁵) または - Z (Q) 基であり；

X は (C₁ ~ C₈)アルキル、(C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル、
 - (NR⁵)_k ((C₁ ~ C₈)アルキル) (C₁ ~ C₈)アルコキシ、 - (NR⁵)_k ((C₁ ~ C₈)アルキル) アリーロキシ、 - (NR⁵) (C₁ ~ C₈)アルキル)_k S(O)_pR⁵、 - (NR⁵)_k ((C₁ ~ C₈)アルキル) S(O)_pR⁵、 - (NR⁵)D(C₁ ~ C₈)アルコキシ、 - (NR⁵) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (CH₂) (C₁ ~ C₈)アルコキシ、 - (NR⁵)_k (CH₂) ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (CH₂)_m (C₁ ~ C₈)アルコキシ、 - (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (CH₂)_m (C₁ ~ C₈)アルコキシ、 - (NR⁵) (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (CH₂) アリーロキシ、 - (NR⁵)_k (CH₂) ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (CH₂)_m アリーロキシ、

- (NR⁵)_k (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (CH₂)_m アリーロキシ、 - Z (S(O)_qR⁵)、 - Z (アリール)、 - Z (ヘテロアリール)、 - Z ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - Z (NR⁵SO₂R⁵)、 - Z (CON(R⁵)₂)、 - Z (CO₂R⁵)、 - Z (N(R⁵)₂)、 - Z (NR⁵CON(R⁵)₂)、 - Z (NR⁵(CO)R⁵)、 - Z (NR⁵CO₂R⁵)、 - Z (COR⁵)、または - Z (Q) 基であり；

X および A は、A が N または C の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員単環式または二環式炭素環式またはヘテロ環式環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OC_F₃、

(C₁ ~ C₈) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり；

各 R⁵ および R⁷ は、各々独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキルまたは (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル基であり；

D は、- (CH₂)_m ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k (CH₂)_m - であり、D' は、- ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - であり；

Z は、D(NR⁵)_k、-D'(NR⁵)_k、(NR⁵)_k D または (NR⁵)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷ および R⁸ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 個またはそれ以上のハロ、-CF₃、-OCF₃、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO₂)、-Z(SH)、-(C₁ ~ C₈) アルキル、-(C₁ ~ C₈) アシロキシ、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル_k - アリール、-((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - SO₂NH - アリール、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁹SO₂R⁹)、-Z(CON(R⁹)₂)、-Z(CO₂R⁹)、-Z(N(R⁹)₂)、-Z(NR⁹CON(R⁹)₂)、-Z(NR⁹(CO)R⁹)、-Z(NR⁹CO₂R⁹)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)_pR⁹) または -Z(Q) の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 部分は、1 個またはそれ以上のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹ または (C₁ ~ C₈) アルキルで任意に置換されている、請求項 3 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】 Y は N または C(R⁶) であり；A は O、S、S(O)、S(O)₂、N-H、N-R⁴ または CR⁴R⁷ であり；

R⁶ は水素、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキルまたは -Z(Q) 基であり；

R¹ は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)_pR⁵) または -Z(Q) 基であり；

R² は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵) または -Z(Q) 基であり；ただし、R² は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³ は (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、

$C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、または-Z(Q) 基であり；

X および A は、A が N または C の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式炭素環式またはヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R⁸ は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂ または(C₁ ~ C₈) アルキル基であり；

各 R⁵ および R⁷ は、各々独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₈) アルキル)、-N((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、(C₁ ~ C₈) アルキルまたは(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル基であり；

D は、-((CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k(CH₂)_m- であり、D' は、-((C₁ ~ C₈) アルキル)_k- であり；

Z は、D(NR⁵)_k、-D'(NR⁵)_k、(NR⁵)_kD または(NR⁵)_kD' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の -CF₃、-OCF₃、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO₂)、-Z(SH)、-(C₁ ~ C₈) アルキル、-(C₁ ~ C₈) アシロキシ、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-S-((C₁ ~ C₈) アルキル)_k-アリール、-((C₁ ~ C₈) アルキル)_k-SO₂NH-アリール、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁹SO₂R⁹)、-Z(CON(R⁹)₂)、-Z(CO₂R⁹)、-Z(N(R⁹)₂)、-Z(NR⁹CON(R⁹)₂)、-Z(NR⁹(CO)R⁹)、-Z(NR⁹CO₂R⁹)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)_pR⁹) または -Z(Q) の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 ~ 3 個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹ または(C₁ ~ C₈) アルキルで任意に置換されている、請求項 35 に記載の医薬組成物。

【請求項 37】 Y は N であり；A は O、S、S(O)₂、N-H、N-R⁴ または CH-R⁴ であり；

R¹ は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NH₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₆) シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、-Z(NR¹⁰SO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、または -Z(Q) 基であり；

R² は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR¹⁰CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵) または -Z(Q) 基であり；ただし、R² は任

意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R^3 は ($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、
 $(C_3 \sim C_8)$ アルキル、
 $-((C_1 \sim C_8) \text{アルキル})OH$ 、
 $(C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ} - (C_1 \sim C_8) \text{アルキル} -$ 、
 $-((C_1 \sim C_8) \text{アルキル})N(R^5)_2$ 、
 $-((C_1 \sim C_8) \text{アルキル})S(0)_p ((C_1 \sim C_8) \text{アルキル})$ 、
 $(CH_2)((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)_m OH$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m OH$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)_m OH$ 、
 $(CH_2)((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)_m (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)(C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $(CH_2)((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)_m N(R^5)_2$ 、 $- (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m N(R^5)_2$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)N(R^5)_2$ 、 $- (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m S(0)_p R^5$ 、 $- (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m (CO_2R^5)$ 、
 $(CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m (COR^5)$ 、
 $((C_1 \sim C_8) \text{アルキル}) (CO_2R^5)$ 、
 $((C_1 \sim C_8) \text{アルキル}) (COR^5)$ 、
 $D' (S(0)_q R^5)$ 、 $-D' (\text{アリーロキシ})$ 、 $-D' (\text{アリール})$ 、
 $-D' (\text{ヘテロアリール})$ 、 $-D' ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})$ 、
 $-D' (NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-D' (CON(R^5)_2)$ 、
 $-D' (NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、
 $-D' (NR^5(CO)R^5)$ 、
 $-D' (NR^{10}CO_2R^5)$ 、
 $-D' (Q)$ 、 $-D (\text{アリーロキシ})$ 、 $-D (\text{アリール})$ 、 $-D (\text{ヘテロアリール})$ 、 $-D ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})$ 、 $-D (NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-D (CON(R^5)_2)$ 、 $-D (S(O)_q R^5)$ 、 $-D (NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-D (NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-D (NR^{10}CO_2R^5)$ 、または $- (NR^{10})_k - D - Q$ 基であり；

R^4 は ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $-N(R^5)_2$ または $-Z(Q)$ 基であり；

X は $- (NR^{10}) ((C_1 \sim C_8) \text{アルキル}) (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) ((C_1 \sim C_8) \text{アルキル}) \text{アリーロキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) S(O)_p R^5$ 、
 $- (NR^{10}) ((C_1 \sim C_8) \text{アルキル}) S(0)_p R^5$ 、
 $- (NR^{10}) D (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)(C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2)_m (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル}) (CH_2)_m (C_1 \sim C_8) \text{アルコキシ}$ 、
 $- (NR^{10}) (CH_2)_m ((C_3 \sim C_{10}) \text{シクロアルキル})_k (CH_2) \text{アリーロキシ}$

- (N R^{1~0}) (C H₂) ((C₃ ~ C_{1~0}) シクロアルキル)_k (C H₂)_m アリーコキシ

- (N R^{1~0}) (C H₂)_m ((C₃ ~ C_{1~0}) シクロアルキル) (C H₂)_m アリーコキシ

- (N R^{1~0}) D (S (0)_q R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (S (0)_q R⁵)、 - (N R^{1~0}) D (アリール)、 - (N R^{1~0}) D' (アリール)、 - (N R^{1~0}) (ヘテロアリール)、 - (N R^{1~0}) D' (ヘテロアリール)、 - (N R^{1~0}) D ((C₃ ~ C_{1~0}) シクロアルキル)、 - (N R^{1~0}) D' ((C₃ ~ C_{1~0}) シクロアルキル)、 - (N R^{1~0}) D (N R^{1~0} SO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (N R^{1~0} SO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D (CON(R⁵)₂)、 - (N R^{1~0}) D' (CON(R⁵)₂)、 - (N R^{1~0}) D (CO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (CO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D (N R^{1~0} CO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (N R^{1~0} CO₂ R⁵)、 - N (R⁵)₂、 - (N R^{1~0}) D' (N (R⁵)₂)、 - (N R^{1~0}) D (N R^{1~0} CON(R⁵)₂)、 - (N R^{1~0}) D' (N R^{1~0} CON(R⁵)₂)、 - (N R^{1~0}) D (N R^{1~0} (CO) R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (N R^{1~0} (CO) R⁵)、 - (N R^{1~0}) D (N R^{1~0} CO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (N R^{1~0} CO₂ R⁵)、 - (N R^{1~0}) D (COR⁵)、 - (N R^{1~0}) D' (COR⁵)、 - (N R^{1~0}) D - Q、 - (N R^{1~0}) D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R^{1~0} は独立して水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；または、 X および A は、 A は N または C の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環式環を形成し；

Q は、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OCF₃、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₄) アルキル) または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、 - OH、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₄) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₄) アルキル) または (C₁ ~ C₄) アルキルまたは (C₃ ~ C₆) シクロアルキル基であり；

D は、 - (C H₂)_m ((C₃ ~ C_{1~0}) シクロアルキル)_k (C H₂)_m - であり、 D' は、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - であり；

Z は、 D (N R^{1~0})_k、 - D' (N R^{1~0})_k、 (N R^{1~0})_k D または (N R⁵)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、 X、R¹、R²、R³、R⁴ および R⁵ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q またはアリーコキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の - CF₃、 - OCF₃、 - OR⁹、 - SR⁹、 - NO₂、 - (C₁ ~ C₄) アルキル、 - (C₁ ~ C₄) アシロキシ、 - (C₃ ~ C₆) シクロアルキル、 - S - ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - アリール、 - ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - SO₂ NH - アリール、アリーコキシ、アリール、 - NR⁹ SO₂ R⁹、 - CON(R⁹)₂、 - CO₂ R⁹、 - N(R⁹)₂、 - NR⁹ CON(R⁹)₂、 - NR⁹ (CO) R⁹、 - NR⁹ CO₂ R⁹、 - COR⁹、 - S(O)₂ (C₁ ~ C₄) アルキルまたは Q で任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 ~ 2 個のハロ、 - NO₂、 - CF₃、 - OCF₃、 - N(R⁹)₂、 - C(O)R⁹、 - CO₂ R⁹、 - OR⁹、 - SR⁹ または (C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 3 である、請求項 36 に記載の医薬組成物。

【請求項 38】 Y は N であり；A は O、S、N - H または N - R⁴ であり；

R^1 は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₁~C₄)アルコキシ、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-シクロプロピルまたは-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-N(R^{1~0})₂基であり；

R^2 は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(C₁~C₄)アルコキシ)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(CON(R⁵)₂)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(NR⁵)₂)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(S(O)pR⁵)または-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-Q基であり；

R^3 は(C₃~C₆)シクロアルキル)、(C₃~C₆)アルキル、-((C₁~C₄)アルキル)OH、(C₁~C₄)アルコキシ-(C₁~C₄)アルキル)-、-(C₁~C₄)アルキル)N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁~C₄)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)pR⁵、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル、-D'((Q))、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR^{1~0}SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR^{1~0}CON(R⁵)₂)、-D(NR^{1~0}(CO)R⁵)、-D(NR^{1~0}CO₂R⁵)または-(NR^{1~0})_k-D-Q基であり；

R^4 は(C₁~C₄)アルキル基であり；

X は - (N((C₁~C₄)アルキル)) - ((C₁~C₄)アルキル)アリーロキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁~C₄)アルコキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)アリーロキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mアリーロキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mアリーロキシ、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D'(アリール)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D'(アリール)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(ヘテロアリール)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(NR^{1~0}SO₂R⁵)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(CON(R⁵)₂)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(NR⁵)₂、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(N((C₁~C₄)アルキル)) - D(NR^{1~0}CON(R⁵)₂)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(NR^{1~0}(CO)R⁵)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(NR^{1~0}CO₂R⁵)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D(COR⁵)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D'(COR⁵)、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D - Q、- (N((C₁~C₄)アルキル)) - D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 $R^1 \sim R^6$ は、独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；または X および A は、 A が N の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1～2個の R^8 基で任意に置換されている5員乃至10員单環式または二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)、または(C₁ ~ C₄)アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、-OH、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH(C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)₂、または(C₁~C₄)アルキル基であり；

Dは、- (CH₂)_m ((C₃~C₆)シクロアルキル)_k (CH₂)_m-であり、D'は、- ((C₁~C₄)アルキル)_k-であり；

Z は、 $(NR^{1/0})_k D$ 、または $(NR^{1/0})_k D'$ であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して $0 \sim 3$ の整数であり；

各 p は独立して $0 \sim 2$ の整数であり；およ

各 q は独立して 1 または 2 であり；および
 ここで、X、R² および R³ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁ ~ C₄) アルキル、-(C₁ ~ C₄) アシロキシ、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹ または -S(O)₂(C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₄) アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】 YはNであり；AはO、SまたはN-Hであり；

R^1 は、プロモ、クロロ、フルオロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルキル、(C₁~C₂)アルコキシ、-(NR¹⁰)_k(C₁~C₂)アルキル)基であり：

R^2 は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルキル、または(C₁~C₂)アルコキシ基：

R³ は (C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、(C₃ ~ C₆) アルキル、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル - 、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) N(R⁵)₂、- (CH₂) ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂)_m OH、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m OH、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂) OH、- (CH₂) ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂)_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂) (C₁ ~ C₄) アルコキシ、- (CH₂) ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂)_m N(R⁵)₂、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) k (CH₂) N(R⁵)₂、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m S(O)_pR⁵、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m (CO₂R⁵)、- (CH₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (CH₂)_m (COR⁵)、- D' (S(O)_qR⁵)、- D' (アリーロキシ)、- D' (アリール)、- D' (ヘテロアリール)、- D' ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、- D' (Q)、- D (アリーロキシ)、- D (アリール)、- D (ヘテロアリール)、- D (NR¹₀SO₂R⁵)、- D (CON(R⁵)₂)、- D (S(O)_qR⁵)

、 - D (N R^{1~0} C O N (R⁵)₂) 、 - D (N R^{1~0} (C O) R⁵) 、 - D (N R^{1~0} C O₂ R⁵) または - (N R^{1~0})_k - D - Q 基であり；

X は - N ((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ または、 X に隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで、 各 R^{1~0} は、 独立して水素または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり； または

X および A は、 A が N の場合、 隣接炭素原子と一緒にになって、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 8 員乃至 10 員二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり； ここで、 各 R⁸ は独立して、 - O H 、 ハロ、 - C F₃ 、 - O C F₃ 、 (C₁ ~ C₂) アルコキシ、 - N H₂ 、 - N H ((C₁ ~ C₂) アルキル) 、 - N ((C₁ ~ C₂) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

各 R⁵ は、 独立して、 水素、 - O H 、 (C₁ ~ C₂) アルコキシ、 - N H₂ 、 - N H ((C₁ ~ C₂) アルキル) 、 - N ((C₁ ~ C₂) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

D は、 - (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂)_m - であり、 D' は、 - ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - であり；

Z は、 (N R^{1~0})_k D 、 または (N R^{1~0})_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり； および

各 q は独立して 1 または 2 であり； および

ここで、 X 、 R² および R³ のいずれかの各アリール、 ヘテロアリール、 シクロアルキル、 Q 、 またはアリーロキシ部分は、 1 ~ 2 個のハロ、 - C F₃ 、 - O C F₃ 、 - O R⁹ 、 - S R⁹ 、 - N O₂ 、 - (C₁ ~ C₄) アルキル、 - (C₁ ~ C₄) アシロキシ、 - N R⁹ S O₂ R⁹ 、 - C O N (R⁹)₂ 、 - C O₂ R⁹ 、 - N (R⁹)₂ 、 - N R⁹ C O N (R⁹)₂ 、 - N R⁹ (C O) R⁹ 、 - N R⁹ C O₂ R⁹ 、 - C O R⁹ または - S (O)₂ (C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており； ここで各 R⁹ は、 独立して、 水素または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり、 および

但し、 A 、 X 、 Y 、 R¹ 、 R² および R³ 中のアリール、 ヘテロアリール、 シクロアルキル、 ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 2 である、 請求項 3 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】 Y は C (R⁶) であり； A は O 、 S 、 S (O)₂ 、 N - H 、 N - R⁴ または C H R⁴ であり；

R⁶ は水素、 - O H 、 ハロ、 - C F₃ 、 - O C F₃ 、 (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - N H₂ 、 - N H ((C₁ ~ C₄) アルキル) 、 - N ((C₁ ~ C₄) アルキル)₂ 、 (C₁ ~ C₄) アルキルまたは (C₃ ~ C₆) シクロアルキル基であり；

R¹ は、 水素、 ハロ、 - O H 、 - N O₂ 、 - N H O H 、 - C F₃ 、 - O C F₃ 、 (C₁ ~ C₈) アルキル、 (C₃ ~ C₆) シクロアルキル、 - Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ) 、 - Z ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル) 、 - Z (N R^{1~0} S O₂ R⁵) 、 - Z (N (R⁵)₂) 、 または - Z (Q) 基であり；

R² は水素、 ハロ、 - O H 、 - N O₂ 、 - C F₃ 、 - O C F₃ 、 (C₁ ~ C₈) アルキル、 (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、 - Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ) 、 - Z (アリロキシ) 、 - Z (アリール) 、 - Z (ヘテロアリール) 、 - Z ((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) 、 - Z (N R^{1~0} S O₂ R⁵) 、 - Z (C O N (R⁵)₂) 、 - Z (N (R⁵)₂) 、 - Z (N R^{1~0} C O N (R⁵)₂) 、 - Z (N R^{1~0} (C O) R⁵) 、 - Z (N R^{1~0} C O₂ R⁵) 、 - Z (S (O)_p R⁵) または - Z (Q) 基であり； 但し、 R₂ は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基ではない；

R³ は (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル) 、 (C₃ ~ C₈) アルキル、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル) O H 、 (C₁ ~ C₈) アルコキシ - (C₁ ~ C₈) アルキル) - 、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル) N (R⁵)₂ 、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル) S (O)_p ((C

$C_1 \sim C_8$) アルキル)、- (CH_2) ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2)
 $m OH$ 、- (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) $m OH$ 、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) $m N(R^5)_2$ 、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) $m N(R^5)_2$ 、- (CH_2)
 m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) $m S(0)_p R^5$ 、- (CH_2) m ($C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) $m CO_2 R^5$)、- (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) $m COR^5$)、- ($(C_1 \sim C_8)$ アルキル) ($CO_2 R^5$)、- ($(C_1 \sim C_8)$ アルキル) (COR^5)、- D' ($S(0)_q R^5$)、- D' (アリーロキシ)、- D' (アリール)、- D' (ヘテロアリール)、- D' ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、- D' ($NR^{10} SO_2 R^5$)、- D' ($CON(R^5)_2$)、- D' ($NR^{10} CON(R^5)_2$)、- D' ($NR^{10} (CO) R^5$)、- D' ($NR^{10} CO_2 R^5$)、- D' (Q)、- D (アリーロキシ)、- D (アリール) - D (ヘテロアリール)、- D ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、- D ($NR^5 SO_2 R^5$)、- D ($CON(R^5)_2$)、- D ($S(0)_q R^5$)、- D ($NR^{10} CON(R^5)_2$)、- D ($NR^{10} (CO) R^5$)、- D ($NR^{10} CO_2 R^5$)、または- (NR^{10}) k - D - Q 基であり；

R^4 は ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、- $N(R^5)_2$ または- Z (Q) 基であり；

X は - (NR^{10}) ($(C_1 \sim C_8)$ アルキル) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^{10}) ($(C_1 \sim C_8)$ アルキル) アリーロキシ、- (NR^{10}) $S(0)_p R^5$ 、- (NR^{10}) ($(C_1 \sim C_8)$ アルキル) $S(0)_p R^5$ 、- (NR^{10}) $D(C_1 \sim C_8)$ アルコキシ、- (NR^{10}) (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^{10}) (CH_2) ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^{10}) (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) m ($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、- (NR^{10}) (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) アリーロキシ、- (NR^{10}) (CH_2) ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) k (CH_2) m アリーロキシ、- (NR^{10}) (CH_2) m ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル) (CH_2) m アリーロキシ、- (NR^{10}) $D(S(0)_q R^5)$ 、- (NR^{10}) $D'(S(0)_q R^5)$ 、- (NR^{10}) D (アリール)、- (NR^{10}) D' (アリール)、- (NR^{10}) D (ヘテロアリール)、- (NR^{10}) D' (ヘテロアリール)、- (NR^{10}) D ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、- (NR^{10}) D' ($(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、- (NR^{10}) D ($NR^{10} SO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D' ($NR^{10} SO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D ($CON(R^5)_2$)、- (NR^{10}) D' ($CON(R^5)_2$)、- (NR^{10}) D ($CO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D' ($CO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D ($(N(R^5)_2$)、- $N(R^5)_2$ 、- (NR^{10}) D' ($(N(R^5)_2$)、- (NR^{10}) D ($NR^{10} CON(R^5)_2$)、- (NR^{10}) D' ($NR^{10} CON(R^5)_2$)、- (NR^{10}) D ($NR^{10} (CO) R^5$)、- (NR^{10}) D' ($NR^{10} (CO) R^5$)、- (NR^{10}) D ($NR^{10} CO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D' ($NR^{10} CO_2 R^5$)、- (NR^{10}) D (COR^5)、- (NR^{10}) D' (COR^5)、- (NR^{10}) D - Q、- (NR^{10}) D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R^{10} は、独立して水素または ($C_1 \sim C_4$) アルキル基であり；または X および A は、A が N または C の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員二環式ヘテロ環式環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R^8 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテ

ロアリール環であり；ここで、各 R^8 は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)または(C₁~C₄)アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、-OH、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)または(C₁~C₄)アルキルまたは(C₃~C₆)シクロアルキル基であり；

D は、-(CH₂)_m((C₃~C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D' は、-((C₁~C₈)アルキル)_k-であり；

Z は、D(NR¹⁰)_k、D'(NR¹⁰)_k、(NR¹⁰)_kD または(NR¹⁰)_kD' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 4 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

X、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁶ のいずれかのアリール、ヘテロアリール、シクロアリール、Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロおよび 1 ~ 2 個の-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁~C₄)アルキル、-(C₁~C₄)アシロキシ、-(C₃~C₆)シクロアルキル、-S-(C₁~C₄)アルキル)_k-アリール、-((C₁~C₄)アルキル)_k-SO₂NH-アリール、アリーロキシ、アリール、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹、-S(O)₂(C₁~C₄)アルキルまたは Q で任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁~C₄)アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 置換基は、1 ~ 2 個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹ または(C₁~C₄)アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 3 である、請求項 3 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】 Y は C(R⁶) であり；A は O、S、N-H または N-R⁴ であり

R⁶ は水素、-OH、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₂)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₂)アルキル)、-N((C₁~C₂)アルキル)₂、または(C₁~C₄)アルキル基であり；

R¹ は、水素、ハロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₁~C₄)アルコキシ、-(NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k シクロプロピルまたは - (NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k-N(R¹⁰)₂ 基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-(NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(C₁~C₄)アルコキシ)、-(NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(CON(R⁵)₂)、-(NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(S(O)_pR⁵) または -(NR¹⁰)_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(Q) 基であり；

R³ は (C₃~C₆)シクロアルキル)、(C₃~C₆)アルキル、-((C₁~C₄)アルキル)OH、(C₁~C₄)アルコキシ-(C₁~C₄)アルキル) - 、 - ((C₁~C₄)アルキル)N(R⁵)₂、- (CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、- (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH

、- (CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mO、- (CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、

- (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m (C₁ ~ C₄)アルコキシ、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) (C₁ ~ C₄)アルコキシ、
 - (C_{H₂}) ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m N(R⁵)₂、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m N(R⁵)₂、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) N(R⁵)₂、
 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m S(O)_pR⁵、 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m (CO₂R⁵)、 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m (COR⁵)、
 - D' (S(O)_qR⁵)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D (NR¹⁰SO₂R⁵)、 - D (CON(R⁵)₂)、 - D (S(O)_qR⁵)、 - D (NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - D (NR¹⁰(CO)R⁵)、 - D (NR¹⁰CO₂R⁵)または - (NR¹⁰)_k - D - Q基であり；

R⁴ は (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

X は - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - ((C₁ ~ C₄)アルキル) アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m (C₁ ~ C₄) アルコキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂}) ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル) (C_{H₂})_m アリーロキシ、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D' (アリール)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (ヘテロアリール)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D' (ヘテロアリール)、 - D (NR¹⁰SO₂R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (CON(R⁵)₂)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (S(O)_qR⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - D (NR¹⁰(CO)R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (NR¹⁰CO₂R⁵)、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D (NR¹⁰)_k D - Q、 - (N((C₁ ~ C₄)アルキル)) - D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R¹⁰ は、独立して水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

X および A は、A が N の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員单環式または二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₄) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

各 R⁵ は独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)₂ または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

D は、- (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₆)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m - であり、D' は、- ((C₁ ~ C₄)アルキル)_k - であり；

Z は、D (NR¹⁰)_k D または (NR¹⁰)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 3 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；

ここで、X、R² および R³ のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、(C₁ ~ C₄) アルキル、-(C₁ ~ C₄) アシロキシ、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹、または-S(O)₂(C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており、ここで、各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₄) アルキル基であり；

但し、A、X、Y、R¹、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 3 である、請求項 4 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】 Y は C(R⁶) であり； A は O、S または N-H であり；

R⁶ は水素、-OH、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルコキシまたは(C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

R¹ はプロモ、クロロ、フルオロ、-OH、-NO₂、-NHOH、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルキル、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-(NR¹⁰)_k((C₁ ~ C₂) アルキル) - シクロプロピル、-NH₂ または-NH((C₁ ~ C₂) アルキル) 基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルキルまたは(C₁ ~ C₂) アルコキシ基であり；

R³ は(C₃ ~ C₆) シクロアルキル、(C₃ ~ C₆) アルキル、-(C₁ ~ C₄) アルキル) OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル - 、-(C₁ ~ C₄) アルキル) N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁ ~ C₄) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁ ~ C₄) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)_k(CH₂)N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-D'(S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR¹⁰SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR¹⁰CON(R⁵)₂)、-D(NR¹⁰(CO)R⁵)、-D(NR¹⁰CO₂R⁵) または-(NR¹⁰)_k-D-Q 基であり；

X は -(N((C₁ ~ C₄) アルキル))₂ または、X に隣接している炭素原子に直接結合している窒素原子環員を有しており、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；

ここで各 R¹⁰ は、独立して水素または(C₁ ~ C₂) アルキル基である；または

X および A は、A が N の場合、隣接炭素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 8 員乃至 10 員二環式ヘテロ環式部分を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；各 R⁸ は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₂) アルキル)、-N((C₁ ~ C₂)

C_2) アルキル) $_2$ または ($C_1 \sim C_2$) アルキル基であり；

各 R^5 は、独立して、水素、-OH、($C_1 \sim C_2$) アルコキシ、-NH $_2$ 、-NH($C_1 \sim C_2$) アルキル)、-N(($C_1 \sim C_2$) アルキル) $_2$ 、または($C_1 \sim C_2$) アルキル基であり；

D は、- (CH_2) m (($C_5 \sim C_6$) シクロアルキル) k (CH_2) m - であり、D' は、- (($C_1 \sim C_4$) アルキル) k - であり；

Z は、(NR^{10}) k D、または(NR^{10}) k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

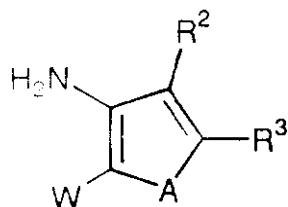
各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、X、 R^2 および R^3 のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、-CF $_3$ 、-OCF $_3$ 、-OR 9 、-SR 9 、-NO $_2$ 、- ($C_1 \sim C_4$) アルキル、- ($C_1 \sim C_4$) アシロキシ、-NR 9 SO $_2$ R 9 、-CON(R 9) $_2$ 、-CO $_2$ R 9 、-N(R 9) $_2$ 、-NR 9 CON(R 9) $_2$ 、-NR 9 (CO)R 9 、-NR 9 CO $_2$ R 9 、-COR 9 または -S(O) 2 ($C_1 \sim C_4$) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R 9 は、独立して、水素または($C_1 \sim C_2$) アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、 R^1 、 R^2 および R^3 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 1 ~ 2 である、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】 下記式で示される化合物：

【化 4】



式中、A は O、S、S(O)、S(O) $_2$ 、N-H、N-R 4 または CR 4 R 7 であり；W は -CN または -C(O)L であり；ここで、L はハロまたは $C_1 \sim C_2$ アルコキシ基であり；

R^2 は水素、ハロ、-OH、-NO $_2$ 、-CF $_3$ 、-OCF $_3$ 、($C_1 \sim C_8$) アルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、-Z(($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z(($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)、-Z(NR 5 SO $_2$ R 5)、-Z(CON(R 5) $_2$)、-Z(CO $_2$ R 5)、-Z(N(R 5) $_2$)、-Z(NR 5 CON(R 5) $_2$)、-Z(NR 5 (CO)R 5)、-Z(NR 5 CO $_2$ R 5)、-Z(COR 5)、-Z(S(O) $_p$ R 5) または -Z(Q) 基であり；

R^3 は ($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_1 \sim C_8$) アルキル、-(($C_1 \sim C_8$) アルキル)OH、($C_1 \sim C_8$) アルコキシ-(($C_1 \sim C_8$) アルキル)、-(($C_1 \sim C_8$) アルキル)N(R 5) $_2$ 、-(($C_1 \sim C_8$) アルキル)S(O) $_p$ (($C_1 \sim C_8$) アルキル)、-((CH $_2$)(($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m OH、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m OH、-((CH $_2$)(($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m (($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m (($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m (($C_1 \sim C_8$) アルコキシ)、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m N(R 5) $_2$ 、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m N(R 5) $_2$ 、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m N(R 5) $_2$ 、-((CH $_2$) m (($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル) k (CH $_2$) m

C_{1_0}) シクロアルキル) ($C H_2$)_m S(0)_p R⁵、 - D' (S(0)_q R⁵)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル、 - D' (NR⁵ SO₂ R⁵)、 - D' (CON(R⁵)₂)、 - D' (CO₂ R⁵)、 - D' (NR⁵ CON(R⁵)₂)、 - D' (NR⁵ (CO) R⁵)、 - D' (NR⁵ CO₂ R⁵)、 - D' (COR⁵)、 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル)、 - D (NR⁵ SO₂ R⁵)、 - D (CON(R⁵)₂)、 - D (CO₂ R⁵)、 - D (S(O)_q R⁵)、 - D (NR⁵ CON(R⁵)₂)、 - D (NR⁵ (CO) R⁵)、 - D (NR⁵ CO₂ R⁵)、 - D (COR⁵) または - (NR⁵)_k - D - Q 基であり；

R⁴ は (C₁ ~ C₈) アルキル、 (C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル、 - Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、 - Z (アリーロキシ)、 - Z (アリール)、 - Z (ヘテロアリール)、 - Z ((C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル)、 - Z (NR⁵ SO₂ R⁵)、 - Z (CON(R⁵)₂)、 - Z (CO₂ R⁵)、 - Z (NR⁵ (CO) R⁵)、 - Z (NR⁵ CON(R⁵)₂)、 - Z (NR⁵ (CO) R⁵)、 - Z (NR⁵ CO₂ R⁵)、 - Z (COR⁵)、 - Z (S(O)_p R⁵) または - Z (Q) 基であり；

Q は、 1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各 R⁸ は独立して、 - OH、ハロ、 - CF₃、 - OCF₃、 (C₁ ~ C₈) アルコキシ、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₈) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₈) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり；

各 R⁵ および R⁷ は、各々独立して、水素、 - OH、 (C₁ ~ C₈) アルコキシ、アリール、 - NH₂、 - NH ((C₁ ~ C₈) アルキル)、 - N ((C₁ ~ C₈) アルキル)₂、 (C₁ ~ C₈) アルキルまたは (C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル基であり；

D は、 - (CH₂)_m ((C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル)_k (CH₂)_m - であり、

D' は、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - であり；

Z は、 D (NR⁵)_k、 - D' (NR⁵)_k、 (NR⁵)_k D または (NR⁵)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 q は独立して 1 または 2 であり；

ここで、 R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷ および R⁸ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、ハロ、 - CF₃、 - OCF₃、 - Z (COOH)、 - Z (OH)、 - Z (NO₂)、 - Z (SH)、 - (C₁ ~ C₈) アルキル、 - (C₁ ~ C₈) アシロキシ -、 (C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル、 - S - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - アリール、 - ((C₁ ~ C₈) アルキル)_k - SO₂ NH - アリール、 - S - (C₁ ~ C₈) アルキル、 - Z ((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、 - Z (アリーロキシ)、 - Z (アリール)、 - Z (ヘテロアリール)、 - Z ((C₃ ~ C_{1_0}) シクロアルキル)、 - Z (NR⁹ SO₂ R⁹)、 - Z (CON(R⁹)₂)、 - Z (CO₂ R⁹)、 - Z (N(R⁹)₂)、 - Z (NR⁹ CON(R⁹)₂)、 - Z (NR⁹ (CO) R⁹)、 - Z (NR⁹ CO₂ R⁹)、 - Z (COR⁹)、 - Z (S(O)_p R⁹) または - Z (Q) の 1 個またはそれ以上の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 部分は、1 個またはそれ以上のハロ、 - NO₂、 - CF₃、 - OCF₃、 - N(R⁹)₂、 - C(O) R⁹、 - CO₂ R⁹、 - OR⁹、 - SR⁹ または (C₁ ~ C₈) アルキルで任意に置換されており；

但し、A、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 3 である。

【請求項 4 4】 A は O、S、S(O)、S(O)₂、N-H、N-R⁴ または CR

⁴ R⁷ であり；Wは-CNまたは-C(O)Lであり；

ここで、LはハロまたはC₁～C₂アルコキシ基であり；

R²は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；

R³は(C₃～C₁₀)シクロアルキル、

(C₁～C₈)アルキル、

-((C₁～C₈)アルキル)OH、

(C₁～C₈)アルコキシ-((C₁～C₈)アルキル)-、

-((C₁～C₈)アルキル)N(R⁵)₂、

-((C₁～C₈)アルキル)S(O)_p((C₁～C₈)アルキル)、

-(CH₂)((C₃～C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、

-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、

-(CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)_k(CH₂)OH、

-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、

-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、

-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁～C₈)アルコキシ、

-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mN(R⁵)₂、-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(CO₂R⁵)、

-((CH₂)_m((C₃～C₁₀)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、

-((C₁～C₈)アルキル)(CO₂R⁵)、

-((C₁～C₈)アルキル)(COR⁵)、

-D'((S(O)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、

-D'((ヘテロアリール)、-D'((C₃～C₁₀)シクロアルキル、

-D'((NR⁵SO₂R⁵)、-D'((CON(R⁵)₂)、

-D'((NR⁵CON(R⁵)₂)、

-D'((NR⁵(CO)R⁵)、

-D'((NR⁵CO₂R⁵)、

-D'((Q))、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-D(NR⁵SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR⁵CON(R⁵)₂)、-D(NR⁵(CO)R⁵)、-D(NR⁵CO₂R⁵)、または-D(NR⁵)_k-D-Q基であり；

R⁴は(C₁～C₈)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキル、-Z((C₁～C₈)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃～C₁₀)シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(CO₂R⁵)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR⁵CO₂R⁵)、-Z(COR⁵)、-Z(S(O)_pR⁵)または-Z(Q)基であり；

Qは、1～2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各R⁸は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁～C₈)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁～C₈)アルキル)、-N((C₁～C₈)

$C_1 \sim C_8$) アルキル) $_2$ または ($C_1 \sim C_8$) アルキル基であり；各 R^5 および R^7 は、各自独立して、水素、-OH、($C_1 \sim C_8$) アルコキシ、アリール、-NH₂、-NH(($C_1 \sim C_8$) アルキル)、-N(($C_1 \sim C_8$) アルキル) $_2$ 、($C_1 \sim C_8$) アルキルまたは($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル基であり；D は、-(CH₂)_m(($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D' は、-(($C_1 \sim C_8$) アルキル)_k-であり；Z は、D(NR⁵)_k、-D'(NR⁵)_k、(NR⁵)_kD または(NR⁵)_kD' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 6 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、R²、R³、R⁴、R⁵ および R⁷ のいずれかの各アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 ~ 3 個のハロ、および 1 ~ 2 個の-CF₃、-OCF₃、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO₂)、-Z(SH)、-(C₁ ~ C₈) アルキル、-(C₁ ~ C₈) アシロキシ、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル)_k-アリール、-(C₁ ~ C₈) アルキル)_k-SO₂NH-アリール、-S-(C₁ ~ C₈) アルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁹SO₂R⁹)、-Z(CON(R⁹)₂)、-Z(CO₂R⁹)、-Z(N(R⁹)₂)、-Z(NR⁹CON(R⁹)₂)、-Z(NR⁹(CO)R⁹)、-Z(NR⁹CO₂R⁹)、-Z(COR⁹)、-Z(S(O)_pR⁹) または -Z(Q) の基により任意に置換されており、ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁ ~ C₈) アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよび Q 部分は、1 ~ 3 個のハロ、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹ または(C₁ ~ C₈) アルキルで任意に置換されている、請求項 4 3 に記載の化合物。

【請求項 4 5】 A は O、S、N-H または N-R⁴ であり；W は -CN または -C(O)L であり；ここで、L はハロまたは C₁ ~ C₂ アルコキシ基であり；

R² は水素、ハロ、-OH、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₈) アルキル、(C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、-Z((C₁ ~ C₈) アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリール)、-Z(ヘテロアリール)、-Z((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)、-Z(NR⁵SO₂R⁵)、-Z(CON(R⁵)₂)、-Z(N(R⁵)₂)、-Z(NR⁵CON(R⁵)₂)、-Z(NR⁵(CO)R⁵)、-Z(NR¹CO₂R⁵)、-Z(S(O)_pR⁵) または -Z(Q) 基であり；ただし、R² は任意に置換されたアリールまたはヘテロアリール基でなく；

R³ は (C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル、(C₃ ~ C₈) アルキル、-(C₁ ~ C₈) アルキル-OH、(C₁ ~ C₈) アルコキシ-(C₁ ~ C₈) アルキル) -、-(C₁ ~ C₈) アルキル) N(R⁵)₂、-(C₁ ~ C₈) アルキル) S(O)_p((C₁ ~ C₈) アルキル)、-(CH₂)((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k(CH₂)OH、-(CH₂)((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁ ~ C₈) アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃ ~ C₁₀) シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁ ~ C₈) アルコキシ、

- (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂}) (C₁ ~ C₈)アルコキシ、

- (C_{H₂}) ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_mN(R⁵)₂、 - (C_{H₂})_m ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_mN(R⁵)₂、 - (C_{H₂})_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_mS(0)_pR⁵、 - (C_{H₂})_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_m(CO₂R⁵)、

- (C_{H₂})_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル) (C_{H₂})_m(COR⁵)、 - ((C₁ ~ C₈)アルキル) (CO₂R⁵)、

- ((C₁ ~ C₈)アルキル) (COR⁵)、

- D' (S(0)_qR⁵)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、

- D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、

- D' (NR¹⁰SO₂R⁵)、 - D' (CON(R⁵)₂)、

- D' (NR¹⁰CON(R⁵)₂)、

- D' (NR⁵(CO)R⁵)、

- D' (NR¹⁰CO₂R⁵)、

- D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)、 - D (NR¹⁰SO₂R⁵)、 - D (CON(R⁵)₂)、

- D (S(0)_qR⁵)、 - D (NR¹⁰CON(R⁵)₂)、 - D (NR¹⁰(CO)R⁵)、 - D (NR¹⁰CO₂R⁵)、または - (NR¹⁰)_k - D - Q基であり、但しR³は - SO₂NH₂でない；

R⁴は(C₁ ~ C₄)アルキル、(C₃ ~ C₆)シクロアルキル、-N(R⁵)₂または-Z(Q)基であり；

ここで、各R¹⁰は独立して水素または(C₁ ~ C₄)アルキル基であり；

Qは、1 ~ 2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで各R⁸は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁ ~ C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)₂または(C₁ ~ C₄)アルキル基であり；

各R⁵は、独立して、水素、-OH、(C₁ ~ C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁ ~ C₄)アルキル)、-N((C₁ ~ C₄)アルキル)₂、(C₁ ~ C₄)アルキルまたは(C₃ ~ C₆)シクロアルキル基であり；

Dは、- (C_{H₂})_m((C₃ ~ C₁₀)シクロアルキル)_k (C_{H₂})_m-であり、D'は、- ((C₁ ~ C₈)アルキル)_k-であり；

Zは、D(NR¹⁰)_k、-D'(NR¹⁰)_k、(NR¹⁰)_kDまたは(NR⁵)_kD'であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0 ~ 4の整数であり；

各pは独立して0 ~ 2の整数であり；および

各qは独立して1または2であり；および

ここで、R²、R³、R⁴およびR⁵のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、アルコキシまたはアリーロキシ部分は、1 ~ 3個のハロ、および1 ~ 2個の-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、-SR⁹、-NO₂、-(C₁ ~ C₄)アルキル、-(C₁ ~ C₄)アシロキシ、-(C₃ ~ C₆)シクロアルキル、-S-(C₁ ~ C₄)アルキル_k-アリール、-(C₁ ~ C₄)アルキル_k-アリーロキシ、アリール、-NR⁹SO₂R⁹、-CON(R⁹)₂、-CO₂R⁹、-N(R⁹)₂、-NR⁹CON(R⁹)₂、-NR⁹(CO)R⁹、-NR⁹CO₂R⁹、-COR⁹、-S(O)₂(C₁ ~ C₄)アルキルまたはQで任意に置換されており；ここで各R⁹は、独立して、水素または(C₁ ~ C₄)アルキル基であり、およびここでそのようなアリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびQ部分は、1 ~ 2個のハ

口、-NO₂、-CF₃、-OCF₃、-N(R⁹)₂、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-OR⁹、-SR⁹または(C₁~C₄)アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、R²およびR³中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環およびQ部分の合計数は0~2である、請求項44に記載の化合物。

【請求項46】 AはO、S、N-HまたはN-R⁴であり；Wは-CNまたは-C(O)Lであり；ここで、LはハロまたはC₁~C₂アルコキシ基であり；

R²は水素、クロロ、フルオロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルキル、(C₃~C₆)シクロアルキル、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(C₁~C₄)アルコキシ)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(CON(R⁵)₂)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(NR⁵)₂)、-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(SOR_pR⁵)または-(NR^{1~0})_k((C₁~C₂)アルキル)_k-(Q)基であり；

R³は(C₃~C₆)シクロアルキル)、(C₃~C₆)アルキル、-((C₁~C₄)アルキル)OH、(C₁~C₄)アルコキシ-(C₁~C₄)アルキル-、-((C₁~C₄)アルキル)N(R⁵)₂、-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_mOH、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mOH、-(CH₂)((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(C₁~C₄)アルコキシ、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)(C₁~C₄)アルコキシ、-(CH₂)(C₁~C₄)シクロアルキル)、(CH₂)_mN(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)N(R⁵)₂、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_mS(O)_pR⁵、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)(CH₂)_m(COR⁵)、-D'(SOR_qR⁵)、-D'(S(0)_qR⁵)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、

-D'((C₃~C₁₀)シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D(NR^{1~0}SO₂R⁵)、-D(CON(R⁵)₂)、-D(S(O)_qR⁵)、-D(NR^{1~0}CON(R⁵)₂)、-D(NR^{1~0}(CO)R⁵)、-D(NR^{1~0}COR⁵)または-(NR^{1~0})_k-D-Q基であり；但しR³は-SO₂NH₂でない；

R⁴は(C₁~C₄)アルキル基であり；

ここで、各R^{1~0}は、独立して水素または(C₁~C₄)アルキル基であり；またはQは、1~2個のR⁸基で任意に置換されている4員乃至10員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各R⁸は独立して、-OH、ハロ、-CF₃、-OCF₃、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)₂または(C₁~C₄)アルキル基であり；

各R⁵は、独立して、水素、-OH、(C₁~C₄)アルコキシ、-NH₂、-NH((C₁~C₄)アルキル)、-N((C₁~C₄)アルキル)₂または(C₁~C₄)アルキル基であり；

Dは、-(CH₂)_m((C₃~C₆)シクロアルキル)_k(CH₂)_m-であり、D'は、-(C₁~C₄)アルキル)_k-であり；

Zは、(NR^{1~0})_kD、または(NR^{1~0})_kD'であり；

各kは独立して0または1であり；

各mは独立して0~3の整数であり；

各pは独立して0~2の整数であり；および

各qは独立して1または2であり；および

ここで、R²およびR³のいずれかの各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1~2個のハロ、の-CF₃、-OCF₃、-OR⁹、

- S R⁹、 - N O₂、 - (C₁ ~ C₄) アルキル、 - (C₁ ~ C₄) アシロキシ、 - N R⁹ S O₂ R⁹、 - C O N (R⁹)₂、 - C O₂ R⁹、 - N (R⁹)₂、 - N R⁹ C O N (R⁹)₂、 - N R⁹ (C O) R⁹、 - N R⁹ C O₂ R⁹、 - C O R⁹ または - S (O)₂ (C₁ ~ C₄) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または (C₁ ~ C₄) アルキル基であり、および

但し、A、R² および R³ 中のアリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロ環および Q 部分の合計数は 0 ~ 1 である、請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 4 7】 A は O、S または N - H；W は - C N または - C (O) L であり；ここで、L はハロまたは C₁ ~ C₂ アルコキシ基であり；

R² は水素、クロロ、フルオロ、- C F₃、- O C F₃、(C₁ ~ C₂) アルキル、または (C₁ ~ C₂) アルコキシ基であり；

R³ は (C₃ ~ C₆) シクロアルキル、(C₃ ~ C₆) アルキル、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) OH、(C₁ ~ C₄) アルコキシ - (C₁ ~ C₄) アルキル -、- ((C₁ ~ C₄) アルキル) N (R⁵)₂、- (C H₂) ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂)_m OH、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m OH、- (C H₂) ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂)_m (C₁ ~ C₂) アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂) (C₁ ~ C₂) アルコキシ、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂)_m N (R⁵)₂、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m S (O)_p R⁵、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C O₂ R⁵)、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル) (C H₂)_m (C O R⁵)、- D' (S (O)_q R⁵)、- D' (アリーロキシ)、- D' (アリール)、- D' (ヘテロアリール)、- D' ((C₃ ~ C₆) シクロアルキル)、- D' (Q)、- D (アリーロキシ)、- D (アリール)、- D (ヘテロアリール)、- D (N R¹₀ S O₂ R⁵)、- D (C O N (R⁵)₂)、- D (S (O)_q R⁵)、- D (N R¹₀ C O N (R⁵)₂)、- D (N R¹₀ (C O) R⁵)、- D (N R¹₀ C O₂ R⁵) または - (N R¹₀)_k - D - Q 基であり；但し R³ は - S O₂ N H₂ でない；

ここで、各 R¹₀ は、独立して水素または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；または Q は、1 ~ 2 個の R⁸ 基で任意に置換されている 4 員乃至 10 員ヘテロ環式またはヘテロアリール環であり；ここで、各 R⁸ は独立して、- OH、ハロ、- C F₃、- O C F₃、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、- N H₂、- N H ((C₁ ~ C₂) アルキル)、- N ((C₁ ~ C₂) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

各 R⁵ は、独立して、水素、- OH、(C₁ ~ C₂) アルコキシ、- N H₂、- N H ((C₁ ~ C₂) アルキル)、- N ((C₁ ~ C₂) アルキル)₂ または (C₁ ~ C₂) アルキル基であり；

D は、- (C H₂)_m ((C₅ ~ C₆) シクロアルキル)_k (C H₂)_m - であり、D' は、- ((C₁ ~ C₄) アルキル)_k - であり；

Z は、(N R¹₀)_k D、または (N R¹₀)_k D' であり；

各 k は独立して 0 または 1 であり；

各 m は独立して 0 ~ 2 の整数であり；

各 p は独立して 0 ~ 2 の整数であり；および

各 q は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、R³ の各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、Q、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個のハロ、- C F₃、- O C F₃、- O R⁹、- S R⁹、- N O₂、- (C₁ ~ C₄) アルキル、- (C₁ ~ C₄) アシロキシ、- N R⁹ S O₂ R⁹、- C O N (R⁹)₂、- C O₂ R⁹、- N (R⁹)₂、- N R⁹ C O N (R⁹)₂、- N R⁹ (C

O) R⁹、-N R⁹ CO₂ R⁹、-COR⁹ または -S(O)₂(C₁~C₄) アルキルで任意に置換されており；ここで各 R⁹ は、独立して、水素または(C₁~C₂) アルキル基である、請求項 4 6 に記載の化合物。