

【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	
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

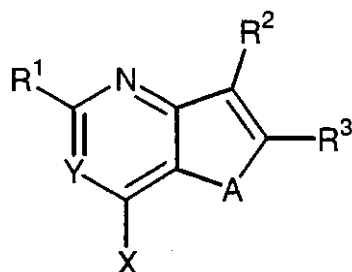
【補正方法】変更

【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( $R^6$ )であり；AはN-H、N- $R^4$ またはC $R^4R^7$ であり；

$R^6$ は水素、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、アリアル、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

$R^1$ は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリアル)、-Z(ヘテロアリアル)、-Z((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり；

$R^2$ は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ)、-Z(アリーロキシ)、-Z(アリアル)、-Z(ヘテロアリアル)、-Z((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)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(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)-、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリアル)、-D'(ヘテロアリアル)、-D'((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D'(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D'(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(COR<sup>5</sup>)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリアル)、-D(ヘテロアリアル)、-D((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(COR<sup>5</sup>)または-(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>-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、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル) ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル) アリーロキシ、- ( $NR^5$ ) ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル)<sub>k</sub>  $S(O)_p R^5$ 、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル)  $S(O)_p R^5$ 、- ( $NR^5$ ) D ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ ) ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ ) ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( $CH_2$ ) ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( $CH_2$ ) ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( $CH_2$ ) ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( $CH_2$ ) ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> アリーロキシ、- ( $NR^5$ )<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル) ( $CH_2$ )<sub>m</sub> 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あって、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  $R^8$  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、-  $CF_3$ 、-  $OCF_3$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) 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)<sub>2</sub> 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)<sub>2</sub>、( $C_1 \sim C_8$ ) 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、- ( $CH_2$ )<sub>m</sub> ( ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> ( $CH_2$ )<sub>m</sub> - であり、D' は、- ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Z は、D ( $NR^5$ )<sub>k</sub>、- D' ( $NR^5$ )<sub>k</sub>、( $NR^5$ )<sub>k</sub> D または ( $NR^5$ )<sub>k</sub> 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、-  $CF_3$ 、-  $OCF_3$ 、- 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)<sub>k</sub> - アリール、- ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル)<sub>k</sub> -  $SO_2 NH$  - 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 (

COR<sup>9</sup> )、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup>)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R<sup>9</sup>は、独立して、水素または(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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以上の八口、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>または(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル基で任意に置換されており；

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>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、R<sup>1</sup>はH、メチルまたはフェニル、およびR<sup>3</sup>はメチル、エチルまたはフェニルの場合、(1)R<sup>2</sup>はHの場合、Xは-NH<sub>2</sub>、-N(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-NH-フェニル、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-フェニル、-NH-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-フェニル、-NH-(メトキシフェニル)、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-(ジメトキシフェニル)、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-イミダゾリル、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-(メチルチオイミダゾリル)、-NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-シクロヘキシル、-NH-シクロヘキシル、ピペリジニル、モルホリニル、-NHNH<sub>2</sub>、-NHCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NH-ブチル、-NH-CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>、-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>シクロヘキセニル、-NH-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CH<sub>3</sub>、-NHCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、-NH-CH<sub>2</sub>-フェニル、4-メチルピペラジン、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(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)R<sup>2</sup>は-CH<sub>2</sub>N(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>NH-ブチル、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-シクロヘキセニルまたは-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOHの場合、Xは-NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>シクロヘキセニルでなく；および(3)R<sup>2</sup>は、メチル、アセチルまたは-COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>の場合、Xは-NH<sub>2</sub>または-NH(C(O)CH<sub>3</sub>)でなく；

(b) R<sup>1</sup>はエトキシ、R<sup>2</sup>はH、R<sup>3</sup>は-COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、AはNHおよびYはNの場合、Xは-NH<sub>2</sub>でなく；

(c) AはN-HまたはN-R<sup>4</sup>、YはC-HおよびR<sup>1</sup>は水素、八口、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)R<sup>3</sup>はメチルおよびR<sup>2</sup>はアセチルまたは-COOCH<sub>3</sub>の場合、XはNH<sub>2</sub>またはトリフルオロメチルフェニルでなく；(2)R<sup>3</sup>はメチルまたは-COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、およびR<sup>2</sup>はHの場合、Xはメチルでなく；および(3)R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>またはR<sup>4</sup>のうちの1つが任意に置換された-エチル-NR<sup>5</sup>CONHR<sup>5</sup>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-R<sup>4</sup>およびYはC-Hの場合、R<sup>3</sup>は-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>でなく；

(e) AはN-C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、YはC-HまたはN、R<sup>1</sup>およびR<sup>3</sup>は水素、八口、アルキル、アルコキシまたはアルキルチオの場合、R<sup>2</sup>は1~3個の八口、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CH<sub>2</sub>、YはC-H、R<sup>1</sup>はNH<sub>2</sub>、R<sup>3</sup>はメチルおよびXはメチルの場合、R<sup>2</sup>はC(O)NH<sub>2</sub>でなく；

(g) AはN-HまたはN-R<sup>4</sup>およびR<sup>3</sup>はアリールまたはヘテロアリールの場合、R<sup>2</sup>はアリールまたはヘテロアリールでなく；

(h) AはN-R<sup>4</sup>、YはN、R<sup>1</sup>はHおよびR<sup>3</sup>はアルキルの場合、Xは-NH<sub>2</sub>でなく；および

(i) AはN-HまたはN-R<sup>4</sup>およびR<sup>2</sup>はHの場合、R<sup>3</sup>は-N(R<sup>5</sup>)-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)-N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>または-N(R<sup>5</sup>)-(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>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(R<sup>6</sup>)であり；AはN-H、N-R<sup>4</sup>またはCR<sup>4</sup>R<sup>7</sup>であり；

R<sup>6</sup>は水素、-OH、八口、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、アリール、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)

2、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

R<sup>1</sup>は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり；

但し、R<sup>1</sup>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<sup>2</sup>は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり；ただし、R<sup>2</sup>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<sup>3</sup>は(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル、  
 (C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)OH、  
 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)-、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)(COR<sup>5</sup>)、  
 -D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、  
 -D'(ヘテロアリール)、-D'((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、  
 -D'(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 -D'(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 -D'(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、  
 -D'(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、または-(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>-D-Q基であり、但

し  $R^3$  は  $-SO_2NH_2$  でない；

$R^4$  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)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^5CO_2R^5)$ 、 $-Z(COR^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$  または  $-Z(Q)$  基であり；

$X$  は  $-(NR^5)_k((C_1 \sim C_8)$  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、 $-(NR^5)_k((C_1 \sim C_8)$  アルキル) $S(O)_pR^5$ 、 $-(NR^5)_k((C_1 \sim C_8)$  アルキル) $S(O)_pR^5$ 、 $-(NR^5)_kD((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-(NR^5)_k(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-(NR^5)_k(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-(NR^5)_k(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-(NR^5)_k(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m$ アリーロキシ、 $-(NR^5)_k(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m$ アリーロキシ、 $-Z(S(O)_qR^5)$ 、 $-Z(アリール)$ 、 $-Z(ヘテロアリール)$ 、 $-Z((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^5CO_2R^5)$ 、 $-Z(COR^5)$ 、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あって、1～2個の  $R^8$  基で任意に置換されている5員乃至10員単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  $R^8$  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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$  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、 $D(NR^5)_k$ 、 $-D'(NR^5)_k$ 、 $(NR^5)_kD$  または  $(NR^5)_kD'$  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、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  および  $R^7$  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  $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  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) $_k-SO_2NH$ -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)、 $-Z(NR^9SO_2R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9(CO)R^9)$ 、 $-Z(NR^9$

CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup> )、 - Z (COR<sup>9</sup> )、 - Z (S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup> ) または - Z (Q) の基により任意に置換されており、ここで各R<sup>9</sup> は、独立して、水素または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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個の八口、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup> または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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-R<sup>4</sup> またはCHR<sup>4</sup> であり；

R<sup>1</sup> は水素、八口、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ)、-Z((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)、-Z(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、または-Z(Q)基であり；

R<sup>2</sup> は水素、八口、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-Z(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>) または-Z(Q)基であり；ただし、R<sup>2</sup> 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<sup>3</sup> は(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、  
 (C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)OH、  
 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)-、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)OH、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 -(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)(COR<sup>5</sup>)、  
 -D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、  
 -D'(ヘテロアリール)、-D'((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、  
 -D'(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 -D'(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 -D'(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、  
 -D'(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、  
 -D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-D(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(



$R^5$ )<sub>2</sub>)、  
 - D ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - D ( NR<sup>1 0</sup> CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - D ( NR<sup>1 0</sup> ( CO )  
 $R^5$  )、 - D ( NR<sup>1 0</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、または - ( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub> - D - Q 基であり、但し  
 $R^3$  は - SO<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> でない；

$R^4$  は ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、 - N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> また  
 は - Z ( Q ) 基であり；

X は - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) アリーロキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> ) ( C<sub>1</sub> ~  
 $C_8$  ) アルコキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~  
 $C_8$  ) アルコキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~  
 $C_8$  ) アルコキシ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> ) アリロキ  
 シ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリロキ  
 シ、  
 - ( NR<sup>1 0</sup> ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリロキ  
 シ、

- ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N  
 $R^{1 0}$  ) D ( アリール )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( アリール )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( ヘテロ  
 アリール )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( ヘテロアリール )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>1</sub>  
<sub>0</sub> ) シクロアルキル )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - ( NR<sup>1 0</sup> )  
 $D$  ( NR<sup>1 0</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( NR<sup>1 0</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 -  
 ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> )  
 $D$  ( CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> )  
 $D$  ( NR<sup>1 0</sup> CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( NR<sup>1 0</sup> CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( NR<sup>1 0</sup> ( CO ) R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( NR<sup>1 0</sup> ( CO )  
 $R^5$  )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( NR<sup>1 0</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( NR<sup>1 0</sup> C  
 $O_2 R^5$  )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D ( COR<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D' ( COR<sup>5</sup> )、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) D - Q、 - ( NR<sup>1 0</sup> ) 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<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル基であり；

X および A は、隣接炭素原子と一緒にあって、1 ~ 2 個の  $R^8$  基で任意に置換されている5員乃至10員単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<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、  
 ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )、- N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> )  
 アルキル )<sub>2</sub> または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル基であり；

各  $R^5$  は、独立して、水素、- OH、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> )  
 アルキル )、- N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )<sub>2</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキルまたは ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル基であり；

D は、- ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - であり、

D' は、- ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル )<sub>k</sub> - であり；

Z は、D ( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub>、- D' ( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub>、( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub> D または ( NR<sup>5</sup> )  
 $k$  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、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  および  $R^5$  のいずれかの各アリーール、ヘテロアリーール、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 個の八口、および 1 ~ 2 個の -CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>、-NO<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アシロキシ、-(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル、-S-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-アリーール、-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-SO<sub>2</sub>NH-アリーール、アリーロキシ、アリーール、-NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>、-NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>9</sup>、-S(O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキルまたは Q で任意に置換されており ; ここで各 R<sup>9</sup> は、独立して、水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル基であり、およびここでそのようなアリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキルおよび Q 部分は、1 ~ 3 個の八口、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)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  $R^3$  中のアリーール、ヘテロアリーール、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-R<sup>4</sup> であり ;

$R^1$  は水素、八口、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-シクロプロピルまたは -(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub> 基であり ;

$R^2$  は水素、ク口、フルオ口、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ)、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または -(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-(Q) 基であり ;

$R^3$  は (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)OH、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)-、-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、-D'(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリーール)、-D'(ヘテロアリーール)、-D'((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリーール)、-D(ヘテロアリーール)、-D(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)または -(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>-D-Q 基であり ; 但し  $R^3$  は -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>

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))  $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)  
 $)_k(CH_2)_m((C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)  
 $)_k(CH_2)_m((C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)  
 $(CH_2)_m((C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)  
 $)_k(CH_2)_m$  アリーロキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)  
 $(CH_2)_m$  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))  $-D(NR^{10}SO_2R^5)$ 、  
 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(CON(R^5)_2)$ 、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(N(R^5)_2)$ 、  
 $-N(R^5)_2$ 、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、  
 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、  
 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-(N((C_1 \sim C_4)$  アルキル))  $-D(COR^5)$ 、  
 $-(N((C_1 \sim C_4)$  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  $R^{10}$  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あって、1～2 個の  $R^8$  基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員単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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  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) $_2$ 、または  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル基であり；

D は、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  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、 $(NR^{10})_kD$ 、または  $(NR^{10})_kD'$  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、 $R^2$  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  $(C_1 \sim C_4)$  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、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  - シクロプロピル、 $-NH_2$  または  $-NH$  ( $(C_1 \sim C_2)$ 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) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ )  $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_2$ )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) $_k$  ( $CH_2$ ) ( $C_1 \sim C_2$ )アルコキシ、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ )  $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $S(O)_p$   $R^5$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $CO_2$   $R^5$ )、 $-(CH_2)$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $COR^5$ )、 $-D'$  ( $S(O)_q$   $R^5$ )、 $-D'$  (アリーロキシ)、 $-D'$  (アリール)、 $-D'$  (ヘテロアリール)、 $-D'$  ( $(C_3 \sim C_6)$ 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)、 $-D$  ( $NR^{10}SO_2R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_qR^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^{10}(CO)R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CO_2R^5$ ) または  $-(NR^{10})_k$  - D - Q 基であり；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  $R^{10}$  は、独立して水素または  $(C_1 \sim C_2)$ 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あって、1 ~ 2 個の  $R^8$  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  $R^8$  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、 $(NR^{10})_k$  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、 $-NR^9SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON$

(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>、-NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>9</sup>または-S(O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルで任意に置換されており；ここで各R<sup>9</sup>は、独立して、水素または(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>中のアリアル、ヘテロアリアル、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(R<sup>6</sup>)であり；AはN-H、N-R<sup>4</sup>またはCHR<sup>4</sup>であり

；

R<sup>6</sup>は水素、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルまたは(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル基であり；

R<sup>1</sup>は、水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ)、-Z((C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、または-Z(Q)基であり；

R<sup>2</sup>は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ)、-Z(アリロキシ)、-Z(アリアル)、-Z(ヘテロアリアル)、-Z((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり；但し、R<sub>2</sub>は任意に置換されたアリアルまたはヘテロアリアル基ではない；

R<sup>3</sup>は(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)-、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-((CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(COR<sup>5</sup>)、-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリアル)、-D'(ヘテロアリアル)、-D'((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D'(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D'(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリアル)、-D(ヘテロアリアル)、-D((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、または-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>-D-Q基であり；但し、R<sup>3</sup>は-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>ではない；

R<sup>4</sup>は(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル、-N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>または-Z(Q)基であり；

Xは-(NR<sup>10</sup>)((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(NR

$R^{10}$  ) ( (  $C_1 \sim C_8$  ) 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、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル )<sub>k</sub> (  $CH_2$  ) (  $C_1 \sim C_8$  ) アルコキシ、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  ) ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル )<sub>k</sub> (  $CH_2$  )<sub>m</sub> (  $C_1 \sim C_8$  ) アルコキシ、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> (  $C_1 \sim C_8$  ) アルコキシ、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル )<sub>k</sub> (  $CH_2$  )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  ) ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル ) (  $CH_2$  )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (  $NR^{10}$  )  $D(S(0)_q R^5)$ 、 - (  $NR^{10}$  )  $D'(S(0)_q R^5)$ 、 - (  $NR^{10}$  )  $D$  (アリアル)、 - (  $NR^{10}$  )  $D'$  (アリアル)、 - (  $NR^{10}$  )  $D$  (ヘテロアリアル)、 - (  $NR^{10}$  )  $D'$  (ヘテロアリアル)、 - (  $NR^{10}$  )  $D$  ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) 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、隣接炭素原子と一緒に、1 ~ 2 個の  $R^8$  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アル環であり；ここで、各  $R^8$  は独立して、-OH、ハロ、- $CF_3$ 、- $OCF_3$ 、(  $C_1 \sim C_4$  ) 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 )<sub>2</sub> 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 )<sub>2</sub>、(  $C_1 \sim C_4$  ) 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、- (  $CH_2$  )<sub>m</sub> ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル )<sub>k</sub> (  $CH_2$  )<sub>m</sub> - であり、 $D'$  は、- ( (  $C_1 \sim C_8$  ) アルキル )<sub>k</sub> - であり；

$Z$  は、 $D(NR^{10})_k$ 、 $D'(NR^{10})_k$ 、(  $NR^{10}$  )<sub>k</sub>  $D$  または (  $NR^{10}$  )<sub>k</sub>  $D'$  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  $R^6$  のいずれかのアリアル、ヘテロアリアル、シクロアリアル、 $Q$  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 - $CF_3$ 、- $OCF_3$ 、- $OR^9$ 、- $SR^9$ 、- $NO_2$ 、- (  $C_1 \sim C_4$  ) アルキル、- (  $C_1 \sim C_4$  ) アシロキシ、- (  $C_3 \sim C_6$  ) シクロアルキル、- $S$ - ( (  $C_1 \sim C_4$  ) アルキル )<sub>k</sub> -アリアル、- ( (  $C_1 \sim C_4$  ) アルキル )<sub>k</sub> - $SO_2 NH$ -アリアル、アリーロキシ、アリアル、- $NR^9 SO_2 R^9$ 、- $CON(R^9)_2$ 、- $CO_2 R^9$ 、- $N(R^9)_2$ 、- $NR^9 CON(R^9)_2$ 、- $NR^9 (CO)R^9$ 、- $NR^9 CO_2 R^9$ 、- $COR^9$ 、- $S(0)_2$  (  $C_1 \sim C_4$  ) 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、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ または $(C_1 \sim C_4)$ 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 $C(R^6)$ であり；AはN-Hまたは $N-R^4$ であり；

$R^6$ は水素、 $-OH$ 、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ 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 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル基であり；

$R^1$ は、水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ シクロプロピルまたは $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k-N(R^{10})_2$ 基であり；

$R^2$ は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ 、 $-(CON(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ 、 $-(N(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ 、 $-(S(O)_pR^5)$ または $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ 、 $(Q)$ 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) $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$ 、 $(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)N(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mS(O)_pR^5$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(CO_2R^5)$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(COR^5)$ 、

$-D'(S(O)_qR^5)$ 、 $-D'(アリーロキシ)$ 、 $-D'(アリール)$ 、 $-D'(ヘテロアリール)$ 、 $-D'((C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、 $-D'(Q)$ 、 $-D(アリーロキシ)$ 、 $-D(アリール)$ 、 $-D(ヘテロアリール)$ 、 $-D(NR^{10}SO_2R^5)$ 、

$-D(CON(R^5))_2$ 、 $-D(S(O)_qR^5)$ 、 $-D(NR^{10}CON(R^5))_2$ 、 $-D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-D(NR^{10}CO_2R^5)$ または $-(NR^{10})_k$ 、

$-D-Q$ 基であり；但し $R^3$ は $-SO_2NH_2$ 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)アリロキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル))、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル))、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル))、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)

$\text{CH}_2)_m (\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルコキシ、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$  シクロアルキル) $_k (\text{CH}_2)$  アリーロキシ、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- (\text{CH}_2) ((\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$  シクロアルキル) $_k (\text{CH}_2)_m$  アリーロキシ、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- (\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$  シクロアルキル) $(\text{CH}_2)_m$  アリーロキシ、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}$  (アリーール)、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}'$  (アリーール)、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}$  (ヘテロアリーール)、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{NR}^{10}\text{SO}_2\text{R}^5)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{CO}_2\text{R}^5)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{N}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-(\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}((\text{R}^5)_2)$ 、 $-(\text{N}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{NR}^{10}\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{NR}^{10}(\text{CO})\text{R}^5)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{NR}^{10}\text{CO}_2\text{R}^5)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}(\text{COR}^5)$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}-\text{Q}$ 、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $- \text{D}'-\text{Q}$  または  $\text{Q}$  基であり；

ここで、各  $\text{R}^{10}$  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；

$\text{X}$  および  $\text{A}$  は、隣接炭素原子と一緒にあって、1～2個の  $\text{R}^8$  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ヘテロ環式部分を形成し；

$\text{Q}$  は、1～2個の  $\text{R}^8$  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ール環であり；ここで、各  $\text{R}^8$  は独立して、 $-\text{OH}$ 、ハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルコキシ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $_2$  または  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル基であり；

各  $\text{R}^5$  は独立して、水素、 $-\text{OH}$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルコキシ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)、 $-(\text{N}((\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)) $_2$  または  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル)基であり；

$\text{D}$  は、 $-(\text{CH}_2)_m ((\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$  シクロアルキル) $_k (\text{CH}_2)_m -$  であり、 $\text{D}'$  は、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル) $_k -$  であり；

$\text{Z}$  は、 $(\text{NR}^{10})_k \text{D}$  または  $(\text{NR}^{10})_k \text{D}'$  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、 $\text{X}$ 、 $\text{R}^2$  および  $\text{R}^3$  のいずれかの各アリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキル、 $\text{Q}$  またはアリーロキシ部分は、1～2個のハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OR}^9$ 、 $-\text{SR}^9$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アシロキシ、 $\text{NR}^9\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{CON}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{N}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9\text{CON}(\text{R}^9)_2$ 、 $\text{NR}^9(\text{CO})\text{R}^9$ 、 $\text{NR}^9\text{CO}_2\text{R}^9$ 、 $\text{COR}^9$  または  $-\text{S}(0)_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4)$  アルキルで任意に置換されており；ここで、各  $\text{R}^9$  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、 $\text{A}$ 、 $\text{X}$ 、 $\text{Y}$ 、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$  および  $\text{R}^3$  中のアリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキル、ヘテロ環および  $\text{Q}$  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  $\text{N}-\text{オキシド}$ 。

【請求項8】  $\text{Y}$  は  $\text{C}(\text{R}^6)$  であり； $\text{A}$  は  $\text{N}-\text{H}$  であり；

$\text{R}^6$  は水素、 $-\text{OH}$ 、クロロ、フルオロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルコキシまたは  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルキル基であり；

$\text{R}^1$  はプロモ、クロロ、フルオロ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NHOH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルキル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルコキシ、 $-(\text{NR}^{10})_k ((\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルキル) $_k -$  シクロプロピル、 $-\text{NH}_2$  または  $-\text{NH}((\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルキル)基であり；

$\text{R}^2$  は水素、クロロ、フルオロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_2)$  アルキルまた



は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ基であり ;

R<sup>3</sup> は (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)、 (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル、 - ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) OH、 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) -、 - ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) N (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>) ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) OH、 - (CH<sub>2</sub>) ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>) ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S (O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (COR<sup>5</sup>)、 - D' (S (O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ( (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) 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<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (CON (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (S (O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CON (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>) または - (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> - D - Q 基であり ; 但し R<sup>3</sup> は - SO<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> でない ;

X は - (N ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub> 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<sup>8</sup> 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<sup>10</sup> は、独立して水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) 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あって、1 ~ 2 個の R<sup>8</sup> 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 R<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、- OH、ハロ、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル)、- N ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル)<sub>2</sub> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基であり ;

各 R<sup>5</sup> は、独立して、水素、- OH、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル)、- N ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基であり ;

D は、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ( (C<sub>5</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D' は、- ( (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>k</sub> - であり ;

Z は、(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> D、または (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> 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<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、- OR<sup>9</sup>、- SR<sup>9</sup>、- NO<sub>2</sub>、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アシロキシ、- NR<sup>9</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- CON (R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- N (R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>9</sup> CON (R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>9</sup> (CO) R<sup>9</sup>、- NR<sup>9</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- COR<sup>9</sup> または - S (O)<sub>2</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルで任意に置換されており ; ここで各 R<sup>9</sup> は、独立して、水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub>) アルキル基であり、および

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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-ピリジニル)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 - メチルシクロペント - 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 ) ピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 6 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 2 - フルオロ - 1 - メトキシ - 4 - [ 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 トリフルオロ [ 4 - ( 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 6 - ( 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 , 3 H - ベンゾ [ e ] 1 , 4 - ジオキサ ;  
 1 , 2 - ジメトキシ - 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 ) ベンゼン ;  
 6 - フルオレン - 2 - イル - 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 ) ピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 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 , 3 - ジヒドロベンゾ [ b ] フラン ;  
 2 , 4 - ジメチル - 5 - [ 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 ) ピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 1 - ( 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 ) - 4 - メトキシベンゼン ;  
 4 - ( 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 ) フェノール ;  
 6 - ( 3 , 5 - ジフルオロフェニル ) - 2 , 7 - ジメチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;  
 1 - ( 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 ) - 3 - メトキシベンゼン ;  
 4 - ( 6 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 2 - メチルピロロ [ 2 , 3 - e ] ピリミジン - 4 - イル ) モルホリン ;  
 1 - ( 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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]チオフエン；
- 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]チオフエン；
- 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) - 2H - ベンゾ [d] 1, 3 - ジオキサラン；
- 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 - フェニルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 ) フェニルアミン ;

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 ) フェニルアミン ;

1 - ( 2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [ 2 , 3 - e ] ピリミジン - 4 - イル ) - 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 - ピロリジニルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;

トリフルオロ ( 4 - ( 2 - メチル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 - プロピルピロロ [ 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 ) ピロロ [ 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 ) ピロロ [ 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 ) ピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン ;

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

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

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

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 - イル ) アミン ;

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

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 ) フェニル 2 , 2 - ジメチルプロパノエート ;

7 - プロモ - 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；

4 - ( 8 - アザピシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) - 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 ) - 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 - フェニルピロロ [ 3 , 2 - d ] ピリミジン；

2 - メチル - 6 - フェニル - 4 - ピラゾリピロロ [ 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 ] ピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 2 , 3 - e ] ピリミジン - 4 - イル ) ピペラジン；

1 - ( 2 - メチル - 6 - フェニルピロロ [ 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 - フェニルピロロ [ 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 - ピロロ [ 3 , 2 , 1 - d e ] フェナンスリジン；

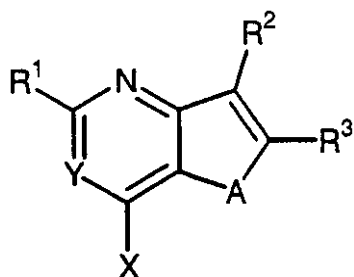
5 - メチル - 2 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 7 - ピペリジルピロロ [ 3 , 2 - b ] ピリジン；

( 7 - アミノヘプチル ) - ( 6 - フェニル - 4 - ピペリジルピロロ [ 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 - ピペリジルピロロ [ 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 ( R<sup>6</sup> ) であり； A は S、S ( O )、S ( O )<sub>2</sub> または O であり；

R<sup>6</sup> は水素、- OH、ハロ、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、アリーール、- NH<sub>2</sub>、- NH ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル )、- N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル )<sub>2</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキルまたは - Z ( Q ) 基であり；

R<sup>1</sup> は水素、ハロ、- OH、- NO<sub>2</sub>、- NHOH、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル、- Z ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ )、- Z ( アリーール )、- Z ( ヘテロアリーール )、- Z ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、- Z ( NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、- Z ( CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、- Z ( CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、- Z ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、- Z ( NR<sup>5</sup> CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、- Z (

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

$\text{R}^2$  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、 $-\text{Z}((\text{C}_1 \sim \text{C}_8)$  アルコキシ)、 $-\text{Z}$ (アリーロキシ)、 $-\text{Z}$ (アリール)、 $-\text{Z}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{Z}((\text{C}_3 \sim \text{C}_{10})$  シクロアルキル)、 $-\text{Z}(\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5)$ 、 $-\text{Z}(\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-\text{Z}(\text{CO}_2\text{R}^5)$ 、 $-\text{Z}(\text{N}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-\text{Z}(\text{NR}^5\text{CON}(\text{R}^5)_2)$ 、 $-\text{Z}(\text{NR}^5(\text{CO})\text{R}^5)$ 、 $-\text{Z}(\text{NR}^5\text{CO}_2\text{R}^5)$ 、 $-\text{Z}(\text{COR}^5)$ 、 $-\text{Z}(\text{S}(\text{O})_p\text{R}^5)$  または  $-\text{Z}(\text{Q})$  基であり；ただし、 $\text{R}^2$  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；

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

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

$\text{Q}$  は、1 ~ 2 個の  $\text{R}^8$  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  $\text{R}^8$  は独立して、 $-\text{OH}$ 、ハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、



( $C_1 \sim C_8$ ) 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  $R^5$  は、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；および

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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  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)、 $-Z(NR^9 SO_2 R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2 R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9 CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9 (CO) R^9)$ 、 $-Z(NR^9 CO_2 R^9)$ 、 $-Z(COR^9)$ 、 $-Z(S(O)_p R^9)$  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  $R^9$  は、独立して、水素または ( $C_1 \sim C_8$ ) 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 個またはそれ以上のハロ、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2 R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルで任意に置換されており；

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 ~ 4 であり；および、

但し、

(a)  $A$  は  $S$ 、 $Y$  は  $N$ 、 $R^2$  は  $H$ 、 $R^3$  はメチルまたはフェニルおよび  $R^1$  はフェニル、 $NH_2$ 、ピペラジニルまたはメチルの場合、 $X$  は  $NH_2$ 、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  $C-H$ 、 $R^1$  は  $H$ 、 $R^2$  は  $H$  および  $R^3$  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 -  $CH_2$  - でなく；

(c)  $A$  は  $S$ 、 $Y$  は  $N$ 、 $R^2$  は  $H$  またはアルキル、 $R^3$  はメチルの場合、 $R^1$  はニトロ - フリル、 $-NH$  ( $C_2 \sim C_{10}$ ) アルキル -  $NH_2$ 、 $-N$  (アルキル) - ( $C_2 \sim C_{10}$ ) アルキル -  $NH_2$  または  $-N$  (メチル) - エチル -  $NHSO_2$  - トリルでなく；

(d)  $A$  は  $S$ 、 $Y$  は  $N$ 、 $R^2$  は  $H$ 、ハロ、 $-NO_2$  またはアルキル、 $R^3$  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、 $R^1$  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  $CH$ 、 $R^1$  は  $H$  および  $R^2$  は  $H$  の場合、 $R^3$  は  $-SO_2 NH_2$  でなく；

(f)  $A$  は  $S$ 、 $Y$  は  $N$ 、 $R^1$  は  $H$  および  $R^2$  は  $H$  の場合、(1)  $R^3$  はフェニルの場合、 $X$  は  $-NH-NH_2$ 、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)  $R^3$  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、 $R^1$  は任意に置換されたフェニル、 $R^2$  はHおよび $R^3$  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( $R^6$ )であり；AはS、S(O)、S(O)<sub>2</sub>またはOであり；

$R^6$  は水素、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

$R^1$  は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)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、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)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(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>k</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(COR<sup>5</sup>)、-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D'(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D'(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D'(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-D((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-D(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)または-(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>-D-Q基であり；ただし、 $R^3$  は-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>でなく；

Xは-(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-(NR

$^5$ )<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (NR<sup>5</sup>) D(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - Z(S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z(アリール)、 - Z(ヘテロアリール)、 - Z((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、 - Z(NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z(CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z(NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z(NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - Z(NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z(COR<sup>5</sup>)、または - Z(Q) 基であり；または

Qは、1 ~ 2個のR<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、-N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>2</sub> または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル基であり；

各R<sup>5</sup> は、独立して、水素、-OH、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、アリール、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、-N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキルまたは(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル基であり；

Dは、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D' は、-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Zは、D(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>、-D'(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>、(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> Dまたは(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> 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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup> およびR<sup>6</sup> 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<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO<sub>2</sub>)、-Z(SH)、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アシロキシ、-(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、-S-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> -アリール、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> -SO<sub>2</sub> NH-アリール、-S-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-Z(NR<sup>9</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>)、-Z(CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>)、-Z(N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>9</sup> CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>9</sup> (CO) R<sup>9</sup>)、-Z(NR<sup>9</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>)、-Z(COR<sup>9</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub> R<sup>9</sup>) または -Z(Q) により任意に置換されており、ここで各R<sup>9</sup> は、独立して、水素または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup> または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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)<sub>2</sub> またはOであり；

R<sup>1</sup> は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ)、

- Z ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )、 - Z ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - Z ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> ) または - Z ( Q ) 基であり ;

R<sup>2</sup> は水素、ハロ、 - O H、 - N O<sub>2</sub>、 - C F<sub>3</sub>、 - O C F<sub>3</sub>、 ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、 ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル、 - Z ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - Z ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - Z ( C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - Z ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - Z ( N R<sup>1 0</sup> C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - Z ( N R<sup>1 0</sup> ( C O ) R<sup>5</sup> )、 - Z ( N R<sup>1 0</sup> C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - Z ( S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup> ) または - Z ( Q ) 基であり ; ただし、 R<sup>2</sup> 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<sup>3</sup> は ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル、 ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、 - ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) O H、 ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) -、 - ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) S ( O )<sub>p</sub> ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル )、 - ( C H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O H、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> O H、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> ) O H、 - ( C H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( C H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> ) N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C O R<sup>5</sup> )、 - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) ( C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) ( C O R<sup>5</sup> )、 - D' ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - D' ( アリーロキシ )、 - D' ( アリール )、 - D' ( ヘテロアリール )、 - D' ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - D' ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - D' ( C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - D' ( N R<sup>1 0</sup> C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - D' ( N R<sup>1 0</sup> ( C O ) R<sup>5</sup> )、 - D' ( N R<sup>1 0</sup> C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - D' ( Q )、 - D ( アリーロキシ )、 - D ( アリール )、 - D ( ヘテロアリール )、 - D ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - D ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - D ( C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - D ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - D ( N R<sup>1 0</sup> C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - D ( N R<sup>1 0</sup> ( C O ) R<sup>5</sup> )、 - D ( N R<sup>1 0</sup> C O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 または - ( N R<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub> - D - Q 基であり ; ただし、 R<sup>3</sup> は - S O<sub>2</sub> N H<sub>2</sub> でなく ;

X は - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) アリーロキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル ) S ( O )<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルコキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> ) アリーロキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル ) ( C H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( S ( O )<sub>q</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( アリール )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( アリール )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( ヘテロアリール )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( ヘテロアリール )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ) シクロアルキル )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( N R<sup>1 0</sup> S O<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D ( C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - ( N R<sup>1 0</sup> ) D' ( C O N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )

、 $-(NR^{10})D(CO_2R^5)$ 、 $-(NR^{10})D'(CO_2R^5)$ 、 $-(NR^{10})D(N(R^5)_2)$ 、 $-N(R^5)_2$ 、 $-(NR^{10})D'(N(R^5)_2)$ 、 $-(NR^{10})D(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-(NR^{10})D'(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-(NR^{10})D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-(NR^{10})D'(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-(NR^{10})D(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-(NR^{10})D'(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-(NR^{10})D(COR^5)$ 、 $-(NR^{10})D'(COR^5)$ 、 $-(NR^{10})D-Q$ 、 $-(NR^{10})D'-Q$ 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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ 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、 $D(NR^{10})_k$ 、 $-D'(NR^{10})_k$ 、 $(NR^{10})_kD$ または $(NR^{10})_kD'$ 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、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 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4)$ アシロキシ、 $-(C_3 \sim C_6)$ 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) $_k$ - $SO_2NH$ -アリール、アリーロキシ、アリール、 $-NR^9SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON(R^9)_2$ 、 $-NR^9(CO)R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$ 、 $-S(O)_2(C_1 \sim C_4)$ 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、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、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ または $(C_1 \sim C_4)$ 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13】 YはNであり；AはSまたはOであり；

$R^1$ は水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ -シクロプロピルまたは $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $N(R^{10})_2$ 基であり；

$R^2$ は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ)、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(CON(R^5)_2)$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(N(R^5)_2)$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(S(O)_pR^5)$ または $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ -Q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<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) -、 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) OH、 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (COR<sup>5</sup>)、 - D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) 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<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>) または - (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> - D - Q 基であり; 但し R<sup>3</sup> は - SO<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> でない;

X は - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル) アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (アリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D' (アリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (ヘテロアリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D' (ヘテロアリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (NR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D (COR<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D - Q、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)) - D' - Q または Q 基であり;

ここで、各 R<sup>10</sup> は、独立して水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル基であり;

Q は、1 ~ 2 個の R<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、- OH、八口、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)、- N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル基であり;

各 R<sup>5</sup> は、独立して、水素、- OH、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)、- N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub>、または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル基であり;

D は、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D' は、- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>k</sub> - であり;

Z は、(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> D、または (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> 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アル、ヘテロアリアル、シクロアルキル、 $Q$ 、またはアリーロキシ部分は、1 ~ 2 個の八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$  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  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル基であり、および

但し、 $A$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $R^1$ 、 $R^2$  および  $R^3$  中のアリアル、ヘテロアリアル、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 ;

$R^1$  は、プロモ、クロロ、フルオロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、シクロプロピル、 $-NH_2$  または  $-NH((C_1 \sim C_2)$  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) $_k$   $(CH_2)_m OH$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m OH$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m OH$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $S(O)_p R^5$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(CO_2 R^5)$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(COR^5)$ 、 $-D'$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D'$  (アリーロキシ)、 $-D'$  (アリアル)、 $-D'$  (ヘテロアリアル)、 $-D'$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)、 $-D'$  ( $Q$ )、 $-D$  (アリーロキシ)、 $-D$  (アリアル)、 $-D$  (ヘテロアリアル)、 $-D$  ( $NR^{10}SO_2R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^{10}(CO)R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CO_2R^5$ ) または  $-(NR^{10})_k$   $-D-Q$  基であり ; 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アル環であり ;

ここで、各  $R^{10}$  は、独立して水素または  $(C_1 \sim C_2)$  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アル環であり ; ここで、各  $R^8$  は独立して、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  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、 $(NR^{10})_kD$ 、または $(NR^{10})_kD'$ 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個の八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$  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、 $R^1$ 、 $R^2$  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 $C(R^6)$ であり；AはS、 $S(O)_2$  またはOであり；

$R^6$ は水素、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  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) $_2$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキルまたは $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル基であり；

$R^1$ は、水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$  アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル、 $-Z((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-Z((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、または $-Z(Q)$ 基であり；

$R^2$ は水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$  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)、 $-Z(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$  または  $-Z(Q)$ 基であり；但し、 $R_2$ 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はない；

$R^3$ は $(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $(C_3 \sim C_8)$  アルキル、 $-(C_1 \sim C_8)$  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) $(CH_2)_m$ 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) $_k(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $_k(CH_2)_mS(O)_pR^5$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m(CO_2R^5)$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $(CH_2)_m(COR^5)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル) $(CO_2R^5)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル) $(COR$



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

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) $_k$  ( $CH_2$ )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、 $-(NR^{10}) D(S(O)_q R^5)$ 、 $-(NR^{10}) D'(S(O)_q R^5)$ 、 $-(NR^{10}) D$  (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

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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ 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、 $D(NR^{10})_k$ 、 $D'(NR^{10})_k$ 、 $(NR^{10})_k D$ 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0～4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、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  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 $-C$

$F_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4)$ アシロキシ、 $-(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-S-(C_1 \sim C_4)$ アルキル) $_k$ -アリーール、 $-(C_1 \sim C_4)$ アルキル) $_k$ - $SO_2NH$ -アリーール、アリーロキシ、アリーール、 $-NR^9SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON(R^9)_2$ 、 $-NR^9(CO)R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$ 、 $-S(O)_2(C_1 \sim C_4)$ 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、そのようなアリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキルおよびQ置換基は、1~2個の八口、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ または $(C_1 \sim C_4)$ 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 $R^3$ 中のアリーール、ヘテロアリーール、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 $C(R^6)$ であり；AはSまたはOであり

$R^6$ は水素、 $-OH$ 、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ 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 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル基であり；

$R^1$ は、水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ シクロプロピルまたは $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $N(R^{10})_2$ 基であり；

$R^2$ は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ)、 $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(CON(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(N(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ - $(S(O)_pR^5)$ または $-(NR^{10})_k(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$ -Q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) $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  $(CH_2)_mOH$ 、 $-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、

$-(CH_2)(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mN(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k(CH_2)N(R^5)_2$ 、

$-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_mS(O)_pR^5$ 、 $-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(CO_2R^5)$ 、 $-(CH_2)_m(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $(CH_2)_m(COR^5)$ 、

$-D'(S(O)_qR^5)$ 、 $-D'(アリーロキシ)$ 、 $-D'(アリーール)$ 、 $-D'(ヘテロアリーール)$ 、 $-D'(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル、 $-D'(Q)$ 、 $-D(アリーロキシ)$ 、 $-D(アリーール)$ 、 $-D(ヘテロアリーール)$ 、 $-D(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-D(CON(R^5))_2$ 、 $-D(S(O)_qR^5)$ 、 $-D(NR^{10}CON(R^5))_2$ 、 $-D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-D(NR^{10}CO_2R^5)$ または $-(NR^{10}$

)<sub>k</sub> - D - Q 基であり ; 但し R<sup>3</sup> は - SO<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> でない ;

X は - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) アリ - ロキシ、  
 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )  
 )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> ) ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( C  
 H<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、 -  
 ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル ) ( C  
 H<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( CH<sub>2</sub>  
 )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> ) アリーロキシ、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C  
 4 ) アルキル ) ) - ( CH<sub>2</sub> ) ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリー  
 ロキシ、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロア  
 ルキル ) ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> アリーロキシ、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( アリー  
 ル )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D' ( アリール )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>  
 ) アルキル ) ) - D ( ヘテロアリール )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( N  
 R<sup>1 0</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、  
 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アル  
 キル ) ) - D ( N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 - N ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )、 -  
 N ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub>、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( NR<sup>1 0</sup> CON ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> )  
 、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( NR<sup>1 0</sup> ( CO ) R<sup>5</sup> )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub>  
 ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D ( NR<sup>1 0</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup> )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) )  
 ) - D ( COR<sup>5</sup> )、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D - Q、 - ( N ( ( C<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> ) アルキル ) ) - D' - Q または Q 基

ここで、各 R<sup>1 0</sup> は、独立して水素または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル 基であり ; または

Q は、1 ~ 2 個の R<sup>8</sup> 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 R<sup>8</sup> は独立して、- OH、ハロ、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、( C  
 1 ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )、- N ( ( C<sub>1</sub> ~  
 C<sub>4</sub> ) アルキル )<sub>2</sub> または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル 基であり ;

各 R<sup>5</sup> は独立して、水素、- OH、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH ( ( C  
 1 ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )、- N ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )<sub>2</sub> または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アル  
 キル ) 基であり ;

D は、- ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> ( ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル )<sub>k</sub> ( CH<sub>2</sub> )<sub>m</sub> - であり、D  
 ' は、- ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル )<sub>k</sub> - であり ;

Z は、D ( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub> D または ( NR<sup>1 0</sup> )<sub>k</sub> 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、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、- OR<sup>9</sup>、  
 - SR<sup>9</sup>、- NO<sub>2</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキル、- ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アシロキシ、NR<sup>9</sup> S  
 O<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、CON ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、N ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub>、NR<sup>9</sup> CON ( R<sup>9</sup> )<sub>2</sub>、N  
 R<sup>9</sup> ( CO ) R<sup>9</sup> )、NR<sup>9</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、COR<sup>9</sup>、- S ( O )<sub>2</sub> ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキ  
 ルで任意に置換され、ここで、各 R<sup>9</sup> は、独立して、水素または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) アルキ  
 ル 基であり ;

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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 ( R<sup>6</sup> ) であり ; A は S または O であり ;

R<sup>6</sup> は水素、- OH、クロロ、フルオロ、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ) アル  
 コキシまたは ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> ) アルキル 基であり ;

R<sup>1</sup> はプロモ、クロロ、フルオロ、- OH、- NO<sub>2</sub>、- NHOH、- CF<sub>3</sub>、- OC

$F_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  - シクロプロピル、 $-NH_2$  または  $-NH$  ( $(C_1 \sim C_2)$ 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) $_k$   $(CH_2)_m$  OH、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$  OH、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$  OH、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_2)$ アルコキシ、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$   $(CH_2)_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $S(O)_p R^5$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(CO_2 R^5)$ 、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_5 \sim C_6)$ シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(COR^5)$ 、 $-D'$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D'$  (アリーロキシ)、 $-D'$  (アリール)、 $-D'$  (ヘテロアリール)、 $-D'$  ( $(C_3 \sim C_6)$ 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)、 $-D$  ( $NR^{10} SO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10} CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^{10} (CO) R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10} CO_2 R^5$ ) または  $-(NR^{10})_k - D - Q$  基であり；但し  $R^3$  は  $-SO_2 NH_2$  でない；

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  $R^{10}$  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、 $(NR^{10})_k D$ 、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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>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-ピロリニル)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CRF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；嗜癮；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；うっ血性心不全；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。

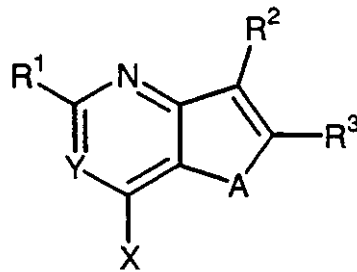
【請求項 31】 請求項 1 ~ 18 に記載の化合物を含む、炎症性病または疾患を予防または治療するための医薬組成物。

【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；嗜癮；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；うっ血性心不全；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( $R^6$ )であり；AはO、S、S(O)、S(O)<sub>2</sub>、N-H、N- $R^4$ またはC $R^4R^7$ であり；

$R^6$ は水素、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-Z(アリール)、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり；

$R^1$ およびXは、各々独立して、水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)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あって、1~2個のR<sup>8</sup>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；

$R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)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；

$R^4$ は水素、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり；

各 $R^5$ および $R^7$ は、各々独立して、水素、-OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、アリール、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキルまたは(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル基であり；

Qは、1~2個のR<sup>8</sup>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<sup>8</sup>は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>または(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル基であり；

Zは、D(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>、-D'(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>、(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>Dまたは(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>D'であり；

Dは、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-であり、D'は、-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup> および R<sup>8</sup> 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<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-Z(COOH)、-Z(OH)、-Z(NO<sub>2</sub>)、-Z(SH)、-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アシロキシ、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-S-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-アリール、-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-SO<sub>2</sub>NH-アリール、-S-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>)、-Z(CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>)、-Z(N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>)、-Z(NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>)、-Z(COR<sup>9</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>9</sup>)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R<sup>9</sup>は、独立して、水素または(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>または(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキルで任意に置換されており ; および

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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(R<sup>6</sup>)であり ; AはO、S、S(O)、S(O)<sub>2</sub>、N-H、N-R<sup>4</sup>またはCR<sup>4</sup>R<sup>7</sup>であり ;

R<sup>6</sup>は水素、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ、アリール、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキルまたは-Z(Q)基であり ;

R<sup>1</sup>は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり ;

R<sup>2</sup>は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または-Z(Q)基であり ; ただし、R<sup>2</sup>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<sup>3</sup>は(C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル、  
(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、  
-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)OH、  
(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)-、  
-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、  
-((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル)、  
-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、  
-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub>~C<sub>10</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、



- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)OH、  
 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、  
 - D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、  
 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - D' (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (COR<sup>5</sup>)、  
 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、 - D (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (COR<sup>5</sup>)、 - D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (COR<sup>5</sup>)、または - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> - D - Q基であり；

R<sup>4</sup> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル、- Z ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、- Z (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、- Z (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - Z (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、- Z (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、- Z (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - Z (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、- Z (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、- Z (COR<sup>5</sup>)、  
 - Z (S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>)または - Z (Q)基であり；

Xは (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>k</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル) S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> D (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)アリーロキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>アリーロキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>アリーロキシ、  
 - Z (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (アリール)、 - Z (ヘテロアリール)、 - Z ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、  
 - Z (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、  
 - Z (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、  
 - Z (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (COR<sup>5</sup>)、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あって、1 ~ 2個のR<sup>8</sup>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R<sup>8</sup>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<sup>8</sup>は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、

( $C_1 \sim C_8$ ) 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；および

各  $q$  は独立して 1 または 2 であり；および

ここで、 $X$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  のいずれかの各アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、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八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  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) $_k$  -アリーール、 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル) $_k$  - $SO_2NH$ -アリーール、 $-S-(C_1 \sim C_8)$  アルキル、 $-Z((C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-Z$ (アリーロキシ)、 $-Z$ (アリーール)、 $-Z$ (ヘテロアリーール)、 $-Z((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^9SO_2R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9(CO)R^9)$ 、 $-Z(NR^9CO_2R^9)$ 、 $-Z(COR^9)$ 、 $-Z(S(O)_pR^9)$  または  $-Z(Q)$  の基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 ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル基であり、およびここでそのようなアリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキルおよび  $Q$  部分は、1個またはそれ以上の八口、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルで任意に置換されている、請求項 34 に記載の 医薬組成物。

【請求項 36】  $Y$  は  $N$  または  $C(R^6)$  であり； $A$  は  $O$ 、 $S$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、 $N-H$ 、 $N-R^4$  または  $CR^4R^7$  であり；

$R^6$  は水素、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、アリーール、 $-NH_2$ 、 $-NH$ ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル)、 $-N$ ( ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル) $_2$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル、( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキルまたは  $-Z(Q)$  基であり；

$R^1$  は水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) 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)、 $-Z$ (アリーール)、 $-Z$ (ヘテロアリーール)、 $-Z((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^5CO_2R^5)$ 、 $-Z(COR^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$  または  $-Z(Q)$  基であり；

$R^2$  は水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) 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)、 $-Z$ (アリーール)、 $-Z$ (ヘテロアリーール)、 $-Z((C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^5CO_2R^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$  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ールまたはヘテロアリーール基でなく；

$R^3$  は ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル、

(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、  
 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) OH、  
 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) -、  
 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、  
 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) S(O)<sub>p</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、  
 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> OH、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) OH、  
 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、  
 - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、  
 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (COR<sup>5</sup>)、  
 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、  
 - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) (COR<sup>5</sup>)、  
 - D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、  
 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、  
 - D' (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、  
 - D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、 - D (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、または - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> - D - Q 基であり；  
 R<sup>4</sup> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、 (C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、 - Z ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、 - Z (NR<sup>5</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (NR<sup>5</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - Z (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - Z (NR<sup>5</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - Z (COR<sup>5</sup>)、  
 - Z (S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>) または - Z (Q) 基であり；  
 X は - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル) S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (NR<sup>5</sup>) D (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、 - (NR<sup>5</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) アリーロキシ、 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、  
 - (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - Z (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - 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)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^5CO_2R^5)$ 、 $-Z(COR^5)$ 、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あって、1～2個の $R^8$ 基で任意に置換されている5員乃至10員単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 $R^8$ 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、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$ 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、 $D(NR^5)_k$ 、 $-D'(NR^5)_k$ 、 $(NR^5)_kD$ または $(NR^5)_kD'$ 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、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ および $R^7$ 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 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$ 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) $_k-SO_2NH$ -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)、 $-Z(NR^9SO_2R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9(CO)R^9)$ 、 $-Z(NR^9CO_2R^9)$ 、 $-Z(COR^9)$ 、 $-Z(S(O)_pR^9)$ または $-Z(Q)$ の基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 $(C_1 \sim C_8)$ 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、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ または $(C_1 \sim C_8)$ 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、 $S(O)_2$ 、 $N-H$ 、 $N-R^4$ または $CHR^4$ であり；

$R^1$ は水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-Z((C_1 \sim C_8)$ アルコキシ)、 $-Z((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $-Z(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、または $-Z(Q)$ 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)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$ 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  $(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル、  
 $(C_3 \sim C_8)$  アルキル、  
 $-(C_1 \sim C_8)$  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)  $(CH_2)_m$  OH、  
 $(CH_2)_m$   $(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)  $k$   $(CH_2)$  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)  $(CH_2)_m$   $(C_1 \sim C_8)$  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、  
 $(CH_2)$   $(C_3 \sim C_{10})$  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)  $k$   $(CH_2)$   $N(R^5)_2$ 、  
 $(CH_2)_m$   $(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $S(O)_p R^5$ 、  
 $(CH_2)_m$   $(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m$   $(COR^5)$ 、  
 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル)  $(COR^5)$ 、  
 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル)  $(COR^5)$ 、  
 $-D'$   $(S(O)_q R^5)$ 、  
 $-D'$  (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、  
 $-D'$   $(NR^{10} SO_2 R^5)$ 、  
 $-D'$   $(CON(R^5)_2)$ 、  
 $-D'$   $(NR^{10} CON(R^5)_2)$ 、  
 $-D'$   $(NR^5 (CO) R^5)$ 、  
 $-D'$   $(NR^{10} CO_2 R^5)$ 、  
 $-D'$  (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)、  
 $-D$   $(NR^{10} SO_2 R^5)$ 、  
 $-D$   $(CON(R^5)_2)$ 、  
 $-D$   $(S(O)_q R^5)$ 、  
 $-D$   $(NR^{10} CON(R^5)_2)$ 、  
 $-D$   $(NR^{10} (CO) R^5)$ 、  
 $-D$   $(NR^{10} CO_2 R^5)$ 、  
 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、  
 $-(NR^{10}) S(O)_p R^5$ 、  
 $-(NR^{10})$   $(C_1 \sim C_8)$  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)  $k$   $(CH_2)$  アリーロキシ

- (NR<sup>1 0</sup>) (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ

- (NR<sup>1 0</sup>) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ

- (NR<sup>1 0</sup>) D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (アリール)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (アリール)、 - (NR<sup>1 0</sup>) (ヘテロアリール)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (ヘテロアリール)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (NR<sup>1 0</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (NR<sup>1 0</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (NR<sup>1 0</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (NR<sup>1 0</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (NR<sup>1 0</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (NR<sup>1 0</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (NR<sup>1 0</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (NR<sup>1 0</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D (COR<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' (COR<sup>5</sup>)、 - (NR<sup>1 0</sup>) D - Q、 - (NR<sup>1 0</sup>) D' - Q または Q 基であり；

ここで、各 R<sup>1 0</sup> は独立して水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) 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、1 ~ 2 個の R<sup>8</sup> 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ヘテロ環式環を形成し；

Q は、1 ~ 2 個の R<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)、-N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>2</sub> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル基であり；

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

D は、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D' は、- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Z は、D (NR<sup>1 0</sup>)<sub>k</sub>、- D' (NR<sup>1 0</sup>)<sub>k</sub>、(NR<sup>1 0</sup>)<sub>k</sub> D または (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> 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<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> 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 -CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>、-NO<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アシロキシ、-(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) シクロアルキル、-S-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>k</sub> -アリール、-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキル)<sub>k</sub> -SO<sub>2</sub>NH-アリール、アリーロキシ、アリール、-NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>、-NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>9</sup>、-S(O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルまたは Q で任意に置換されており；ここで各 R<sup>9</sup> は、独立して、水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) 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、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>9</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) アルキルで任意に置換されており；および

但し、A、X、Y、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> 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-R<sup>4</sup> であり；

$R^1$  は水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  - シクロプロピルまたは  $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $N(R^{10})_2$  基であり；

$R^2$  は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $(CON(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $(N(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $(S(O)_p R^5)$  または  $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$ アルキル) $_k$  -  $Q$  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)  $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ )  $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ )  $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$   $S(O)_p R^5$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $CO_2 R^5$ )、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $COR^5$ )、 $-D'$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D'$  (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)、 $-D'$  ( $Q$ )、 $-D$  (アリーロキシ)、 $-D$  (アリール)、 $-D$  (ヘテロアリール)、 $-D$  ( $N(R^{10}) SO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D$  ( $N(R^{10}) CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $N(R^{10}) (CO) R^5$ )、 $-D$  ( $N(R^{10}) CO_2 R^5$ ) 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)) -  $(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ )アルコキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) アリーロキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  アリーロキシ、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  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)) -  $D$  ( $N(R^{10}) SO_2 R^5$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $CO_2 R^5$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $N(R^5)_2$ )、 $-N(R^5)_2$ 、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $N(R^5)_2$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $N(R^{10}) CON(R^5)_2$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $N(R^{10}) (CO) R^5$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $N(R^{10}) CO_2 R^5$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ アルキル)) -  $D$  ( $COR^5$ )、 $-(N((C_1 \sim C_4)$ 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  $R^{10}$  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 の場合、隣接炭素原子と一緒にあって、1 ~ 2 個の  $R^8$  基で任意に置換されている 5 員乃至 10 員単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アル環であり；ここで、各  $R^8$  は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH(( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル)、-N(( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル)<sub>2</sub> 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<sub>2</sub>、-NH(( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル)、-N(( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル)<sub>2</sub>、または ( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル基であり；

D は、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D' は、-(( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Z は、(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> D、または (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> 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アル、ヘテロアリアル、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<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>、-NO<sub>2</sub>、-( $C_1 \sim C_4$ ) アルキル、-( $C_1 \sim C_4$ ) アシロキシ、-NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>、-NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>9</sup> または -S(O)<sub>2</sub>( $C_1 \sim C_4$ ) 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  $R^3$  中のアリアル、ヘテロアリアル、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 37 に記載の 医薬組成物。

【請求項 39】 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、-NO<sub>2</sub>、-NHOH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、( $C_1 \sim C_2$ ) アルキル、( $C_1 \sim C_2$ ) アルコキシ、-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>(( $C_1 \sim C_2$ ) アルキル)<sub>k</sub> - シクロプロピル、-NH<sub>2</sub> または -NH(( $C_1 \sim C_2$ ) アルキル) 基であり；

$R^2$  は水素、クロロ、フルオロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、( $C_1 \sim C_2$ ) アルキル、または ( $C_1 \sim C_2$ ) アルコキシ基；

$R^3$  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<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(( $C_5 \sim C_6$ ) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリアル)、-D'(ヘテロアリアル)、-D'(( $C_3 \sim C_6$ ) シクロアルキル)、-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリアル)、-D(ヘテロアリアル)、-D(NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)



、 $-D(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-D(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-D(NR^{10}CO_2R^5)$ または $-(NR^{10})_k-D-Q$ 基であり；

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 $R^{10}$ は、独立して水素または $(C_1 \sim C_2)$ 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あって、1～2個の $R^8$ 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 $R^8$ 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、 $(NR^{10})_kD$ 、または $(NR^{10})_kD'$ 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、 $R^1$ 、 $R^2$ 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38に記載の医薬組成物。

【請求項40】 Yは $C(R^6)$ であり；AはO、S、 $S(O)_2$ 、N-H、 $N-R^4$ または $CHR^4$ であり；

$R^6$ は水素、 $-OH$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ 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) $_2$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルまたは $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル基であり；

$R^1$ は、水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $-Z((C_1 \sim C_8)$ アルコキシ)、 $-Z((C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル)、 $-Z(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、または $-Z(Q)$ 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)、 $-Z(NR^{10}SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^{10}CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^{10}(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^{10}CO_2R^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$ または $-Z(Q)$ 基であり；但し、 $R^2$ 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はない；

$R^3$ は $(C_3 \sim C_{10})$ シクロアルキル)、 $(C_3 \sim C_8)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_8)$ 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 ) (  $CH_2$  )  $m$  OH、 - (  $CH_2$  )  $m$  ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル )  $k$  (  $CH_2$  ) 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 ) (  $CH_2$  )  $m$  (  $C_1 \sim C_8$  ) 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、 - (  $CH_2$  ) ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) 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 )  $k$  (  $CH_2$  )  $N(R^5)_2$ 、 - (  $CH_2$  )  $m$  ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) シクロアルキル ) (  $CH_2$  )  $m$   $S(O)_p R^5$ 、 - (  $CH_2$  )  $m$  ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) 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 ) (  $COR^5$  )、 -  $D'$  (  $S(O)_q R^5$  )、 -  $D'$  ( 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 )、 -  $D$  (  $NR^5 SO_2 R^5$  )、 -  $D$  (  $CON(R^5)_2$  )、 -  $D$  (  $S(O)_q R^5$  )、 -  $D$  (  $NR^{10} CON(R^5)_2$  )、 -  $D$  (  $NR^{10} (CO) R^5$  )、 -  $D$  (  $NR^{10} CO_2 R^5$  )、または - (  $NR^{10}$  )  $k$  -  $D$  -  $Q$  基であり；

$R^4$  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、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  ) ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) 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、 - (  $NR^{10}$  ) (  $CH_2$  ) ( (  $C_3 \sim C_{10}$  ) 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、 - (  $NR^{10}$  )  $D(S(O)_q R^5)$ 、 - (  $NR^{10}$  )  $D'(S(O)_q R^5)$ 、 - (  $NR^{10}$  )  $D$  ( 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あって、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

ロアリアル環であり；ここで、各  $R^8$  は独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  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、 $D(NR^{10})_k$ 、 $D'(NR^{10})_k$ 、 $(NR^{10})_k D$  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 ~ 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

$X$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  のいずれかのアリアル、ヘテロアリアル、シクロアリアル、 $Q$  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  $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $-(C_1 \sim C_4)$  アシロキシ、 $-(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル、 $-S-((C_1 \sim C_4)$  アルキル) $_k$ -アリアル、 $-(C_1 \sim C_4)$  アルキル) $_k-SO_2NH$ -アリアル、アリーロキシ、アリアル、 $-NR^9SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON(R^9)_2$ 、 $-NR^9(CO)R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$ 、 $-S(O)_2(C_1 \sim C_4)$  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、およびここでそのようなアリアル、ヘテロアリアル、シクロアルキルおよび  $Q$  置換基は、1 ~ 2 個のハロ、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または  $(C_1 \sim C_4)$  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  $R^3$  中のアリアル、ヘテロアリアル、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 41】  $Y$  は  $C(R^6)$  であり； $A$  は  $O$ 、 $S$ 、 $N-H$  または  $N-R^4$  であり

$R^6$  は水素、 $-OH$ 、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  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  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル基であり；

$R^1$  は、水素、ハロ、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$  シクロプロピルまたは  $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k-N(R^{10})_2$  基であり；

$R^2$  は水素、クロロ、フルオロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ - $(C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ - $(CON(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ - $(N(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ - $(S(O)_pR^5)$  または  $-(NR^{10})_k((C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ - $(Q)$  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) $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k(CH_2)_mOH$ 、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $(CH_2)_mOH$

、 $-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k(CH_2)_mOH$ 、

$-(CH_2)_m((C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k(CH_2)_m(C_1 \sim C_4)$  アルコキシ、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、

- (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (COR<sup>5</sup>)、

- D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、 - D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)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<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)

、 - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)または - (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> - D - Q基であり；

R<sup>4</sup> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル基であり；

Xは - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)アリ - ロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> アリーロキシ、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (アリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D' (アリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (ヘテロアリール)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル))、 - D' (ヘテロアリール)、 - D (NR<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D (COR<sup>5</sup>)、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D - Q、 - (N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)) - D' - QまたはQ基であり；

ここで、各R<sup>10</sup>は、独立して水素または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)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、1 ~ 2個のR<sup>8</sup>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ヘテロ環式部分を形成し；

Qは、1 ~ 2個のR<sup>8</sup>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<sup>8</sup>は独立して、-OH、八口、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>2</sub>または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル基であり；

各R<sup>5</sup>は独立して、水素、-OH、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>2</sub>または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)基であり；

Dは、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、D'は、- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Zは、D (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> Dまたは(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> 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、 $R^2$  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 個の八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-NO_2$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $-(C_1 \sim C_4)$  アシロキシ、 $-NR^9$ 、 $SO_2R^9$ 、 $-CON(R^9)_2$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-NR^9CON(R^9)_2$ 、 $-NR^9(CO)R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$ 、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  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル基であり ;

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 40 に記載の 医薬組成物。

【請求項 42】 Y は  $C(R^6)$  であり ; A は O、S または N-H であり ;

$R^6$  は水素、 $-OH$ 、クロ口、フルオ口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシまたは  $(C_1 \sim C_2)$  アルキル基であり ;

$R^1$  はプロモ、クロ口、フルオ口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、シクロプロピル、 $-NH_2$  または  $-NH((C_1 \sim C_2)$  アルキル)基であり ;

$R^2$  は水素、クロ口、フルオ口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  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( $R^5$ ) $_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  OH、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  OH、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) OH、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) ( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  N( $R^5$ ) $_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  N( $R^5$ ) $_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) N( $R^5$ ) $_2$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  S(O) $_p$   $R^5$ 、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $CO_2R^5$ )、 $-(CH_2)$  $_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) ( $CH_2$ ) $_m$  ( $COR^5$ )、 $-D'$  ( $S(O)_qR^5$ )、 $-D'$  (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)、 $-D$  ( $NR^{10}SO_2R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_qR^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^{10}(CO)R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10}CO_2R^5$ ) または  $-(NR^{10})_k$  - D - Q 基であり ;

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  $R^{10}$  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

X および A は、A が N の場合、隣接炭素原子と一緒にあって、1 ~ 2 個の  $R^8$  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  $R^8$  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 ; 各  $R^8$  は独立して、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_2)$  アルコキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH((C_1 \sim C_2)$  アルキル)、 $-N((C_1 \sim C$



$C_{10}$  シクロアルキル)  $(CH_2)_m S(O)_p R^5$ 、 $-D'$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D'$  (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)、 $-D'$  ( $NR^5 SO_2 R^5$ )、 $-D'$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D'$  ( $CO_2 R^5$ )、 $-D'$  ( $NR^5 CON(R^5)_2$ )、 $-D'$  ( $NR^5 (CO) R^5$ )、 $-D'$  ( $NR^5 CO_2 R^5$ )、 $-D'$  ( $COR^5$ )、 $-D'$  (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)、 $-D$  ( $NR^5 SO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $CO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D$  ( $NR^5 CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^5 (CO) R^5$ )、 $-D$  ( $NR^5 CO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $COR^5$ ) または  $-(NR^5)_k -D -Q$  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;

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、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_8)$  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、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  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、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  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)、 $-Z(NR^9 SO_2 R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2 R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9 CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9 (CO) R^9)$ 、 $-Z(NR^9 CO_2 R^9)$ 、 $-Z(COR^9)$ 、 $-Z(S(O)_p R^9)$  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  $R^9$  は、独立して、水素または  $(C_1 \sim C_8)$  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 部分は、1 個またはそれ以上の八口、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2 R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または  $(C_1 \sim C_8)$  アルキルで任意に置換されており;

但し、A、 $R^2$  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 44】 A は O、S、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 、N-H、 $N-R^4$  または CR

<sup>4</sup> R<sup>7</sup> 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<sub>1</sub> ~ C<sub>2</sub> アルコキシ基であり;

R<sup>2</sup> は水素、ハロ、-OH、-NO<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または -Z(Q)基であり;

R<sup>3</sup> は (C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、

(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、

-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)OH、

(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)-、

-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、

-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)S(O)<sub>p</sub>((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)、

-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、

-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、

-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、

-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、

-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、

-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、

-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、

-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、

-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、

-(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル)(COR<sup>5</sup>)、

-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、

-D'(ヘテロアリール)、-D'((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、

-D'(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、

-D'(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、

-D'(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、

-D'(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、

-D'(Q)、-D(アリーロキシ)、-D(アリール)、-D(ヘテロアリール)、-

D((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-D(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、または -(NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub>-D-Q基であり;

R<sup>4</sup> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル、-Z((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>) シクロアルキル)、-Z(NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-Z(NR<sup>5</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-Z(NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-Z(COR<sup>5</sup>)、-Z(S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>)または -Z(Q)基であり;

Qは、1 ~ 2個の R<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) 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; および

各  $q$  は独立して 1 または 2 であり; および

ここで、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^7$  のいずれかの各アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、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 個の八口、および 1 ~ 2 個の  $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-Z(COOH)$ 、 $-Z(OH)$ 、 $-Z(NO_2)$ 、 $-Z(SH)$ 、 $-(C_1 \sim C_8)$  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) $_k$  - アリーール、 $-(C_1 \sim C_8)$  アルキル) $_k$  -  $SO_2NH$  - アリーール、 $-S-(C_1 \sim C_8)$  アルキル、 $-Z(C_1 \sim C_8)$  アルコキシ)、 $-Z$ (アリーロキシ)、 $-Z$ (アリーール)、 $-Z$ (ヘテロアリーール)、 $-Z(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^9SO_2R^9)$ 、 $-Z(CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(CO_2R^9)$ 、 $-Z(N(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9CON(R^9)_2)$ 、 $-Z(NR^9(CO)R^9)$ 、 $-Z(NR^9CO_2R^9)$ 、 $-Z(COR^9)$ 、 $-Z(S(O)_pR^9)$  または  $-Z(Q)$  の基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 ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル基であり、およびここでそのようなアリーール、ヘテロアリーール、シクロアルキルおよび  $Q$  部分は、1 ~ 3 個の八口、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルで任意に置換されている、請求項 43 に記載の化合物。

【請求項 45】  $A$  は  $O$ 、 $S$ 、 $N-H$  または  $N-R^4$  であり;  $W$  は  $-CN$  または  $-C(O)L$  であり; ここで、 $L$  は八口または  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ基であり;

$R^2$  は水素、八口、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、( $C_1 \sim C_8$ ) 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)、 $-Z$ (アリーール)、 $-Z$ (ヘテロアリーール)、 $-Z(C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル)、 $-Z(NR^5SO_2R^5)$ 、 $-Z(CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(N(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5CON(R^5)_2)$ 、 $-Z(NR^5(CO)R^5)$ 、 $-Z(NR^1CO_2R^5)$ 、 $-Z(S(O)_pR^5)$  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ールまたはヘテロアリーール基でなく;

$R^3$  は ( $C_3 \sim C_{10}$ ) シクロアルキル、

( $C_3 \sim C_8$ ) アルキル、

$-(C_1 \sim C_8)$  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) $(CH_2)_m$   $OH$ 、

$-(CH_2)_m$  ( $C_3 \sim C_{10})$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ )  $OH$ 、

$-(CH_2)(C_3 \sim C_{10})$  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) $(CH_2)_m$  ( $C_1 \sim C_8$ ) アルコキシ、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルコキシ、

- (CH<sub>2</sub>) ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>) N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> S(O)<sub>p</sub> R<sup>5</sup>、 - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、

- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル) (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> (COR<sup>5</sup>)、

- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル) (CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、

- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル) (COR<sup>5</sup>)、

- D' (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (アリーロキシ)、 - D' (アリール)、

- D' (ヘテロアリール)、 - D' ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、

- D' (NR<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D' (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、

- D' (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、

- D' (NR<sup>5</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、

- D' (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、

- D' (Q)、 - D (アリーロキシ)、 - D (アリール)、 - D (ヘテロアリール)、 - D ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)、 - D (NR<sup>10</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、

- D (S(O)<sub>q</sub> R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、 - D (NR<sup>10</sup> (CO) R<sup>5</sup>)、 - D (NR<sup>10</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>5</sup>)、または - (NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> - D - Q基であり、但し R<sup>3</sup> は - SO<sub>2</sub> NH<sub>2</sub> でない；

R<sup>4</sup> は (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル、- N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> または - Z(Q)基であり；

ここで、各 R<sup>10</sup> は独立して水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル基であり；

Qは、1 ~ 2個の R<sup>8</sup> 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<sup>8</sup> は独立して、- OH、ハロ、- CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルコキシ、- NH<sub>2</sub>、- NH((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)、- N((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>2</sub> または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル基であり；

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

Dは、- (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> ((C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - であり、

D' は、- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル)<sub>k</sub> - であり；

Zは、D(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>、- D'(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>、(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub> Dまたは (NR<sup>5</sup>)<sub>k</sub> 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、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> 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 - CF<sub>3</sub>、- OCF<sub>3</sub>、- OR<sup>9</sup>、- SR<sup>9</sup>、- NO<sub>2</sub>、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アシロキシ、- (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>)シクロアルキル、- S - ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub> - アリール、- ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub> - SO<sub>2</sub> NH - アリール、アリーロキシ、アリール、- NR<sup>9</sup> SO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>9</sup> CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>9</sup> (CO) R<sup>9</sup>、- NR<sup>9</sup> CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、- COR<sup>9</sup>、- S(O)<sub>2</sub> (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)アルキルまたはQで任意に置換されており；ここで各 R<sup>9</sup> は、独立して、水素または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>)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、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^9)_2$ 、 $-C(O)R^9$ 、 $-CO_2R^9$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$  または  $(C_1 \sim C_4)$  アルキルで任意に置換されており；および  
但し、 $A$ 、 $R^2$  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  $0 \sim 2$  である、請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 6】  $A$  は  $O$ 、 $S$ 、 $N-H$  または  $N-R^4$  であり； $W$  は  $-CN$  または  $-C(O)L$  であり；ここで、 $L$  は八口または  $C_1 \sim C_2$  アルコキシ基であり；

$R^2$  は水素、ク口口、フルオ口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、 $-(C_1 \sim C_4)$  アルコキシ)、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、 $-(CON(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、 $-(N(R^5))_2$ 、 $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、 $-(S(O)_p R^5)$  または  $-(NR^{10})_k$  ( $(C_1 \sim C_2)$  アルキル) $_k$ 、 $(Q)$  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)  $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $OH$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $C_1 \sim C_4$ ) アルコキシ、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $N(R^5)_2$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$   $S(O)_p R^5$ 、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $CO_2 R^5$ )、 $-(CH_2)$  ( $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル) $_k$  ( $CH_2$ ) $_m$  ( $COR^5$ )、 $-D'$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D'$  (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)、 $-D'$  ( $Q$ )、 $-D$  (アリーロキシ)、 $-D$  (アリール)、 $-D$  (ヘテロアリール)、 $-D$  ( $NR^{10} SO_2 R^5$ )、 $-D$  ( $CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $S(O)_q R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10} CON(R^5)_2$ )、 $-D$  ( $NR^{10} (CO)R^5$ )、 $-D$  ( $NR^{10} CO_2 R^5$ ) 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  
 $Q$  は、 $1 \sim 2$  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、 $-OH$ 、八口、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  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) $_2$ 、または  $(C_1 \sim C_4)$  アルキル基であり；

$D$  は、 $-(CH_2)_m$  ( $(C_3 \sim C_6)$  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  $0 \sim 3$  の整数であり；

各  $p$  は独立して  $0 \sim 2$  の整数であり；および

各  $q$  は独立して  $1$  または  $2$  であり；および

ここで、 $R^2$  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、 $1 \sim 2$  個の八口、の  $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^9$ 、

-SR<sup>9</sup>、-NO<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アシロキシ、-NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(CO)R<sup>9</sup>、-NR<sup>9</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>9</sup>または-S(O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキルで任意に置換されており；ここで各R<sup>9</sup>は、独立して、水素または(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル基であり、および

但し、A、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>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45に記載の化合物。

【請求項47】 AはO、SまたはN-H；Wは-CNまたは-C(O)Lであり；ここで、LはハロまたはC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルコキシ基であり；

R<sup>2</sup>は水素、クロロ、フルオロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル、または(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ基であり；

R<sup>3</sup>は(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル)OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルコキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-((C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)OH、-(CH<sub>2</sub>)((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ、-(CH<sub>2</sub>)(C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sup>5</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>(COR<sup>5</sup>)、-D'(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D'(アリーロキシ)、-D'(アリール)、-D'(ヘテロアリール)、-D'((C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)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<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)、-D(CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(S(O)<sub>q</sub>R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CON(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>)、-D(NR<sup>10</sup>(CO)R<sup>5</sup>)、-D(NR<sup>10</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>)または-(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>-D-Q基であり；但しR<sup>3</sup>は-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>でない；

ここで、各R<sup>10</sup>は、独立して水素または(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基であり；または

Qは、1~2個のR<sup>8</sup>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<sup>8</sup>は独立して、-OH、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>2</sub>または(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基であり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、水素、-OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルコキシ、-NH<sub>2</sub>、-NH((C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル)、-N((C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、または(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>)アルキル基であり；

Dは、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>((C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>)シクロアルキル)<sub>k</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-であり、D'は、-((C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル)<sub>k</sub>-であり；

Zは、(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>D、または(NR<sup>10</sup>)<sub>k</sub>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、R<sup>3</sup>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<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OR<sup>9</sup>、-SR<sup>9</sup>、-NO<sub>2</sub>、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)アシロキシ、-NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-N(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>CON(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>9</sup>(C

O)  $R^9$ 、 $-NR^9CO_2R^9$ 、 $-COR^9$  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  $(C_1 \sim C_2)$  アルキル基である、請求項 46 に記載の化合物。