

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成22年11月4日(2010.11.4)

【公表番号】特表2010-501589(P2010-501589A)

【公表日】平成22年1月21日(2010.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2010-003

【出願番号】特願2009-525773(P2009-525773)

【国際特許分類】

C 07 C 57/50 (2006.01)
C 07 C 57/62 (2006.01)
C 07 C 59/56 (2006.01)
C 07 C 59/76 (2006.01)
C 07 C 59/125 (2006.01)
C 07 C 255/57 (2006.01)
C 07 C 59/88 (2006.01)
C 07 C 59/72 (2006.01)
C 07 C 311/51 (2006.01)
C 07 C 69/712 (2006.01)
C 07 C 59/54 (2006.01)
C 07 C 233/52 (2006.01)
C 07 C 255/47 (2006.01)
C 07 C 233/11 (2006.01)
C 07 C 235/34 (2006.01)
C 07 C 311/46 (2006.01)
C 07 C 255/29 (2006.01)
C 07 D 319/06 (2006.01)
C 07 D 257/04 (2006.01)
C 07 D 205/04 (2006.01)
C 07 D 493/08 (2006.01)
C 07 D 317/72 (2006.01)
C 07 D 403/04 (2006.01)
C 07 D 413/04 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
C 07 D 203/08 (2006.01)
C 07 D 263/06 (2006.01)
C 07 D 471/08 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
C 07 D 207/06 (2006.01)
C 07 D 211/58 (2006.01)
C 07 D 277/28 (2006.01)
C 07 D 213/72 (2006.01)
C 07 D 241/20 (2006.01)
C 07 D 277/20 (2006.01)
C 07 D 277/46 (2006.01)
C 07 D 285/135 (2006.01)
C 07 D 277/64 (2006.01)
C 07 D 233/64 (2006.01)
C 07 D 277/62 (2006.01)

A 6 1 K	31/19	(2006.01)
A 6 1 K	31/194	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	31/397	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/396	(2006.01)
A 6 1 K	31/421	(2006.01)
A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/4427	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
A 6 1 K	31/497	(2006.01)
A 6 1 K	31/433	(2006.01)
A 6 1 K	31/428	(2006.01)
A 6 1 K	31/417	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C	57/50	C S P
C 0 7 C	57/62	
C 0 7 C	59/56	
C 0 7 C	59/76	
C 0 7 C	59/125	A
C 0 7 C	255/57	
C 0 7 C	59/125	Z
C 0 7 C	59/88	
C 0 7 C	59/72	
C 0 7 C	311/51	
C 0 7 C	69/712	
C 0 7 C	59/54	
C 0 7 C	233/52	
C 0 7 C	255/47	
C 0 7 C	233/11	
C 0 7 C	235/34	
C 0 7 C	311/46	
C 0 7 C	255/29	
C 0 7 D	319/06	

C 0 7 D 257/04	A
C 0 7 D 205/04	
C 0 7 D 493/08	B
C 0 7 D 317/72	
C 0 7 D 403/04	
C 0 7 D 413/04	
C 0 7 D 471/04	1 0 1
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 203/08	
C 0 7 D 263/06	
C 0 7 D 471/08	
C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 207/06	
C 0 7 D 211/58	
C 0 7 D 277/28	
C 0 7 D 213/72	
C 0 7 D 241/20	
C 0 7 D 277/46	
C 0 7 D 285/12	F
C 0 7 D 277/64	
C 0 7 D 233/64	1 0 5
C 0 7 D 277/62	
A 6 1 K 31/19	
A 6 1 K 31/194	
A 6 1 K 31/357	
A 6 1 K 31/41	
A 6 1 K 31/397	
A 6 1 K 31/18	
A 6 1 K 31/4245	
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/396	
A 6 1 K 31/421	
A 6 1 K 31/5375	
A 6 1 K 31/4427	
A 6 1 K 31/40	
A 6 1 K 31/445	
A 6 1 K 31/426	
A 6 1 K 31/495	
A 6 1 K 31/497	
A 6 1 K 31/433	
A 6 1 K 31/428	
A 6 1 K 31/417	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 27/06	

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月15日(2010.9.15)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

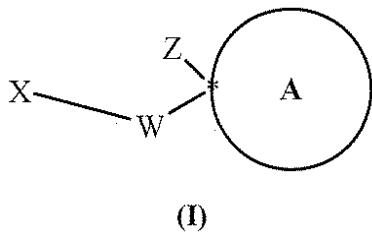
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I) :

【化1】



[式中、

Aは、N、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される1～3個のヘテロ原子を適宜含む、5～20員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1個以上のR₄で適宜置換されていてもよく；

Xは、-C(=O)OH、-C(=O)COH、-C(=O)NRR₉、テトラゾリル、または-C(=O)NHS(O)₂R₉であり；

Wは、存在しないか、または、(-C_{R₈a}R_{8b}-)_m、(-C_{R₈a}R_{8b}-)_m-O-、(-C_{R₈a}R_{8b}-)_m-N(R₁₄)-、C₃₋₆シクロアルキル、アルケニルまたはアルキニルであり、該シクロアルキルまたはアルケニルは1個以上のR_{8a}で適宜置換されていてもよく；

mは、1～3であり；

Zは、-CN、C₃₋₁₀アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、いずれも1個以上のR₄で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

ただし、WおよびZ、またはWが存在しないときのXおよびZは、環A上の同一炭素に結合し；

R₄は、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O)₂R₈から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは1個以上のR₅で適宜置換されていてもよく；

R₅は、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アル

キニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈から選択され；

R₈は、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a}は、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8b}は、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀、-C(=O)R₁₀または-C(=O)NR₉R₉であり、該アルキルは1個以上のR_{9a}で適宜置換されていてもよい；または

R_{8a}およびR_{8b}は、それらが結合している炭素と一緒にになって、3～7員環(N、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0～3個のR_{9a}で適宜置換されていてもよい)を形成し；

R₉は、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～5個のR_{9a}で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含むか；または

2個のR₉は、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9a}は、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-C(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-NHC(=NR₁₄)NR₁₄R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-OS(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₁₀、-NR₁₄S(O₂)R₈、-C(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく；

R₁₀は、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

R_{10a}は、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁

4、 - OCF₃、 - OR_{1~4}、 - OH、 - SH、 - SR_{1~4}、 - C(=O)NR_{1~4}R₁
 4、 - NR_{1~4}R_{1~4}、 - S(O)₂NR_{1~4}R_{1~4}、 - NR_{1~4}S(O)₂CF₃、 -
 C(=O)NR_{1~4}S(O)₂R_{1~4}、 - S(O)₂NR_{1~4}C(=O)OR_{1~4}、 - S
 (O)₂NR_{1~4}C(=O)NR_{1~4}R_{1~4}、 - C(=O)NR_{1~4}S(O)₂CF₃、
 - C(=O)R_{1~4}、 - NR_{1~4}C(=O)R_{1~4}、 - OC(=O)R_{1~4}、 - C(=N
 R_{1~4})NR_{1~4}R_{1~4}、 - NH C(=NR_{1~4})NR_{1~4}R_{1~4}、 - S(=O)R_{1~4}
 、 - S(O)₂R_{1~4}、 - NR_{1~4}C(=O)OR₈、 - NR_{1~4}S(O₂)R₈ または
 アリールアルキルから選択され；

R_{1~4} は、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0~3個のR_{1~4}_aで適宜置換されていてもよく；

R_{1~4}_a は、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、 - NH₂、 - CN、 - NO₂、 - C(=O)OH、 - C(=O)OR₁
 5、 - OCF₃、 - OR_{1~5}、 - OH、 - SH、 - SR_{1~5}、 - C(=O)NR_{1~5}R₁
 5、 - NR_{1~5}R_{1~5}、 - S(O)₂NR_{1~5}R_{1~5}、 - NR_{1~5}S(O)₂CF₃、 -
 C(=O)NR_{1~5}S(O)₂R_{1~5}、 - S(O)₂NR_{1~5}C(=O)OR_{1~5}、 - S
 (O)₂NR_{1~5}C(=O)NR_{1~5}R_{1~5}、 - C(=O)NR_{1~5}S(O)₂CF₃、
 - C(=O)R_{1~5}、 - NR_{1~5}C(=O)R_{1~5}、 - OC(=O)R_{1~5}、 - C(=N
 R_{1~5})NR_{1~5}R_{1~5}、 - NH C(=NR_{1~5})NR_{1~5}R_{1~5}、 - S(=O)R_{1~5}
 、 - S(O)₂R_{1~5}、 - NR_{1~5}C(=O)OR₈、 - NR_{1~5}S(O₂)R₈ または
 アリールアルキルから選択され；

R_{1~5} は、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される；

ただし：

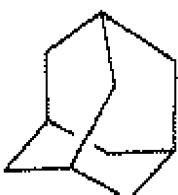
(i) Wが存在しないとき、Zはフェニルであり、Xは - C(=O)OH、低級アルキルまたはテトラゾリルであり、Aはビシクロ(2,2,1)ヘプタニル、ビシクロ(2,2,1)ヘプテニル、ビシクロ(2,2,2)オクタニル、またはビシクロ(2,2,2)オクテニルでなく；

(ii) Wが存在しないとき、Zは適宜置換されたフェニル、またはヘテロサイクリルであり、Xは - C(=O)OHまたは - C(=O)NR₉R₉であり、かつR₉は水素または低級アルキルであり、Aは8-アザビシクロ(3.2.1)オクタニルでなく；

(iii) 該化合物はトランス- - デカリン-2-ベンジル-2-酢酸でなく；

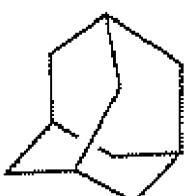
(iv) Aが

【化2】



のとき、
 該

【化3】



は、水素以外の R_4 の少なくとも 1 つで置換されている]

の化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、溶媒和物、もしくは塩。

【請求項 2】

A が、N、O、S、S(O) および $S(O)_2$ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含む、5 ~ 20 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であって、少なくとも 1 個の R_4 で置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A が、N、O、S、S(O) および $S(O)_2$ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含む、6 ~ 15 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1 個以上の R_4 で適宜置換されていてもよく；

X が、-C(=O)OH、-C(=O)COH、-C(=O)NR₉R₉、またはテトラゾリルであり；

W が、存在しないか、または(-C_{8a}R_{8b}-)_m、(-C_{8a}R_{8b}-)_m-O-、(-C_{8a}R_{8b}-)_m-N(R₁₄)₋、もしくはアルケニルであり、該アルケニルは 1 個以上の R_{8a} で適宜置換されていてもよく；

m が、1 ~ 3 であり；

Z が、CN、C₃₋₁₀ アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、いずれも 1 個以上の R_4 で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルは N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

ただし、 W および Z 、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R_4 が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈ から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは 1 個以上の R_5 で適宜置換されていてもよく；

R_5 が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈ から選択され；

R_8 が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a} が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8b} が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀、-C(=O)R₁₀ または -C(=O)NR₉R₉ であり、該アルキルは 1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていてもよい；または

R_{8a} および R_{8b} が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3 ~ 7 員環 (N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0 ~ 3 個の

R_{9a} で適宜置換されていてもよい)を形成し;

R_9 が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0~5個の R_{9a} で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1~4個のヘテロ原子を含むか; または

2個の R_9 が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2~10個の炭素原子およびN、O、S、S(O) およびS(O)₂ から選択される0~4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上の R_{9a} で適宜置換されていても、または1個以上の R_{9a} と適宜縮合してもよく;

R_{9a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)O R₁₄、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄ R₁₄、-NR₁₄S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-OS(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₁₀、-NR₁₄S(O₂)R₈、-C(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄ またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0~3個のR_{10a} で適宜置換されていてもよく;

R_{10} が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0~3個のR_{10a} で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1~4個のヘテロ原子を含み;

R_{10a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈ またはアリールアルキルから選択され;

R_{14} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0~3個のR_{14a} で適宜置換されていてもよく;

R_{14a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₅、-OCF₃、-OR₁₅、-OH、-SH、-SR₁₅、-C(=O)NR₁₅R₁₅、-NR₁₅S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₅S(O)₂R₁₅、-S(O)₂NR₁₅C(=O)OR₁₅、-S(O)₂NR₁₅C(=O)NR₁₅R₁₅、-C(=O)NR₁₅S(O)₂CF₃、

- C (= O) R₁₋₅、- N R₁₋₅ C (= O) R₁₋₅、- O C (= O) R₁₋₅、- S (= O) R₁₋₅、- S (O)₂ R₁₋₅、- N R₁₋₅ C (= O) O R₈、- N R₁₋₅ S (O₂) R₈ またはアリールアルキルから選択され；および

R₁₋₅ が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

A が、N、O、S、S (O) および S (O)₂ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含む、7 ~ 14 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく；

X が、- C (= O) OH、- C (= O) N R₉ R₉、またはテトラゾリルであり；

W が、存在しないか、または (- C R_{8-a} R_{8-b} -)_m、(- C R_{8-a} R_{8-b} -)_m - O - もしくはアルケニルであり、該アルケニルは 1 個以上の R_{8-a} で適宜置換されていてもよく；

m が、1 または 2 であり；

Z が、CN、C₃₋₁₀ アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、いずれも 1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルは N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

ただし、W および Z、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R₄ が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、= O、- NH₂、- CN、- NO₂、- C (= O) OH、- C (= O) OR₁₋₀、- OR₁₋₀、- OH、- OCF₃、- SH、- SR₁₋₀、- C (= O) NR₉ R₉、- NR₉ R₉、- S (O)₂ NR₉ R₉、- NR₉ S (O)₂ CF₃、- C (= O) NR₉ S (O)₂ R₉、- S (O)₂ NR₉ C (= O) OR₉、- S (O)₂ NR₉ C (= O) NR₉ R₉、- C (= O) NR₉ S (O)₂ CF₃、- C (= O) R₁₋₀、- NR₉ C (= O) R₁₋₀、- OC (= O) R₁₋₀、- S (= O) R₁₋₀、- S (O)₂ R₁₋₀、- O - S (O)₂ R₁₋₀、- NR₉ C (= O) OR₈、または - NR₉ S (O₂) R₈ から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは 1 個以上の R₅ で適宜置換されていてもよく；

R₅ が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、- NH₂、- CN、- NO₂、- C (= O) OH、- C (= O) OR₁₋₀、- OCF₃、- OR₁₋₀、- OH、- SH、- SR₁₋₀、- C (= O) NR₉ R₉、- NR₉ R₉、- S (O)₂ NR₉ R₉、- NR₉ S (O)₂ CF₃、- C (= O) NR₉ S (O)₂ R₉、- S (O)₂ NR₉ C (= O) OR₉、- S (O)₂ NR₉ C (= O) NR₉ R₉、- C (= O) NR₉ S (O)₂ CF₃、- C (= O) R₁₋₀、- NR₉ C (= O) R₁₋₀、- OC (= O) R₁₋₀、- S (= O) R₁₋₀、- S (O)₂ R₁₋₀、- O - S (O)₂ R₁₋₀、- NR₉ C (= O) OR₈、または - NR₉ S (O₂) R₈ から選択され；

R₈ が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8-a} が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8-b} が、各々独立して、水素、- C (= O) OH、アルキル、- OH、ハロ、- CN、- OR₁₋₀、- C (= O) R₁₋₀ または - C (= O) NR₉ R₉ であり、該アルキルは 1 個以上の R_{9-a} で適宜置換されていてもよい；または

R_{8-a} および R_{8-b} が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3 ~ 7 員環 (N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0 ~ 3 個の R_{9-a} で適宜置換されていてもよい) を形成し；

R₉ が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、ア

リールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～5個のR_{9,a}で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含むか；または

2個のR_{9,a}が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9,a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9,a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9,a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR_{1,4}、-OCF₃、-OR_{1,0}、-OH、-SH、-SR_{1,4}、-C(=O)NR_{1,4}R_{1,4}、-NR_{1,4}R_{1,4}、-S(O)₂NR_{1,4}R_{1,4}、-NR_{1,4}S(O)₂CF₃、-C(=O)NR_{1,4}S(O)₂R_{1,0}、-S(O)₂NR_{1,4}C(=O)OR_{1,0}、-S(O)₂NR_{1,4}C(=O)NR_{1,4}R_{1,4}、-C(=O)NR_{1,4}S(O)₂R_{1,4}、-C(=O)R_{1,4}、-NR_{1,4}C(=O)R_{1,4}、-OC(=O)R_{1,4}、-S(O)=O)R_{1,4}、-S(O)₂R_{1,4}、-OS(O)₂R_{1,4}、-NR_{1,4}C(=O)OR_{1,0}、-NR_{1,4}S(O₂)R₈、-C(=O)R_{1,0}、-OC(=O)NR_{1,4}R_{1,4}、-NR_{1,4}C(=O)NR_{1,4}R_{1,4}またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{1,0,a}で適宜置換されていてもよく；

R_{1,0}が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{1,0,a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

R_{1,0,a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR_{1,4}、-OCF₃、-OR_{1,4}、-OH、-SH、-SR_{1,4}、-C(=O)NR_{1,4}R_{1,4}、-NR_{1,4}R_{1,4}、-S(O)₂NR_{1,4}R_{1,4}、-NR_{1,4}S(O)₂CF₃、-C(=O)NR_{1,4}S(O)₂R_{1,4}、-S(O)₂NR_{1,4}C(=O)NR_{1,4}R_{1,4}、-C(=O)NR_{1,4}S(O)₂CF₃、-C(=O)R_{1,4}、-NR_{1,4}C(=O)R_{1,4}、-OC(=O)R_{1,4}、-S(O)=O)R_{1,4}、-S(O)₂R_{1,4}、-NR_{1,4}C(=O)OR₈、-NR_{1,4}S(O₂)R₈またはアリールアルキルから選択され；

R_{1,4}が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0～3個のR_{1,4,a}で適宜置換されていてもよく；

R_{1,4,a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR_{1,5}、-OCF₃、-OR_{1,5}、-OH、-SH、-SR_{1,5}、-C(=O)NR_{1,5}R_{1,5}、-NR_{1,5}R_{1,5}、-S(O)₂NR_{1,5}R_{1,5}、-NR_{1,5}S(O)₂CF₃、-C(=O)NR_{1,5}S(O)₂R_{1,5}、-S(O)₂NR_{1,5}C(=O)NR_{1,5}R_{1,5}、-C(=O)NR_{1,5}S(O)₂CF₃、-C(=O)R_{1,5}、-NR_{1,5}C(=O)R_{1,5}、-OC(=O)R_{1,5}、-S(O)=O)R_{1,5}、-S(O)₂R_{1,5}、-NR_{1,5}C(=O)OR₈、-NR_{1,5}S(O₂)R₈

⁸ またはアリールアルキルから選択され；および

R_{1-5} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

A が、 N 、 O 、 S 、 $S(O)$ および $S(O)_2$ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含む、7 ~ 14 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1 個以上の R_4 で適宜置換されていてもよく；

X が、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、またはテトラゾリルであり；

W が、存在しないか、または $(-CR_{8-a}R_{8-b}-)_m$ 、 $(-CR_{8-a}R_{8-b})_m-O$ - もしくはアルケニルであり、該アルケニルは 1 個以上の R_{8-a} で適宜置換されていてもよく；

m が、1 または 2 であり；

Z が、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、いずれも 1 個以上の R_4 で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルは N 、 O 、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

ただし、 W および Z 、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R_4 が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、 $=O$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{1-0}$ 、 $-OR_{1-0}$ 、 $-OH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{1-0}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2$ CF_3 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)R_{1-0}$ 、 $-NR_9C(=O)R_{1-0}$ 、 $-OC(=O)R_{1-0}$ 、 $-S(=O)R_{1-0}$ 、 $-S(O)_2R_{1-0}$ 、 $-O-S(O)_2R_{1-0}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 、または $-NR_9S(O)_2R_8$ から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは 1 個以上の R_5 で適宜置換されていてもよく；

R_5 が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{1-0}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{1-0}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{1-0}$ 、 $-C(=O)NR_9R_9$ 、 $-NR_9R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9R_9$ 、 $-NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2R_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)OR_9$ 、 $-S(O)_2NR_9C(=O)NR_9R_9$ 、 $-C(=O)NR_9S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)R_{1-0}$ 、 $-NR_9C(=O)R_{1-0}$ 、 $-OC(=O)R_{1-0}$ 、 $-S(=O)R_{1-0}$ 、 $-S(O)_2R_{1-0}$ 、 $-O-S(O)_2R_{1-0}$ 、 $-NR_9C(=O)OR_8$ 、または $-NR_9S(O)_2R_8$ から選択され；

R_8 が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8-a} が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8-b} が、各々独立して、水素、 $-C(=O)OH$ 、アルキル、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-OR_{1-0}$ 、 $-C(=O)R_{1-0}$ または $-C(=O)NR_9R_9$ であり、該アルキルは 1 個以上の R_{9-a} で適宜置換されていてもよい；または

R_{8-a} および R_{8-b} が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3 ~ 7 員環 (N 、 O 、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0 ~ 3 個の R_{9-a} で適宜置換されていてもよい) を形成し；

R_9 が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイク

リルアルキルは0～5個のR_{9-a}で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含むか；または

2個のR_{9-a}が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9-a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9-a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9-a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₋₄、-OCF₃、-OR₁₋₀、-OH、-SH、-SR₁₋₄、-C(=O)NR₁₋₄、-NR₁₋₄R₁₋₄、-S(O)₂NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₋₄S(O)₂R₁₋₀、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)OR₁₋₀、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)NR₁₋₄R₁₋₄、-C(=O)NR₁₋₄S(O)₂R₁₋₄、-C(=O)R₁₋₄、-NR₁₋₄C(=O)R₁₋₄、-OC(=O)R₁₋₄、-S(O)=O)R₁₋₄、-S(O)₂R₁₋₄、-OS(O)₂R₁₋₄、-NR₁₋₄C(=O)OR₁₋₀、-NR₁₋₄S(O₂)R₈、-C(=O)R₁₋₀、-OC(=O)NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄C(=O)NR₁₋₄R₁₋₄またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{1-0-a}で適宜置換されていてもよく；

R₁₋₀が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{1-0-a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

R_{1-0-a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₋₄、-OCF₃、-OR₁₋₄、-OH、-SH、-SR₁₋₄、-C(=O)NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄R₁₋₄、-S(O)₂NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₋₄S(O)₂R₁₋₄、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)OR₁₋₄、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)NR₁₋₄R₁₋₄、-C(=O)NR₁₋₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₋₄、-NR₁₋₄C(=O)R₁₋₄、-OC(=O)R₁₋₄、-S(O)=O)R₁₋₄、-S(O)₂R₁₋₄、-NR₁₋₄C(=O)OR₈、-NR₁₋₄S(O₂)R₈またはアリールアルキルから選択され；

R₁₋₄が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0～3個のR_{1-4-a}で適宜置換されていてもよく；

R_{1-4-a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₋₅、-OCF₃、-OR₁₋₅、-OH、-SH、-SR₁₋₅、-C(=O)NR₁₋₅R₁₋₅、-NR₁₋₅R₁₋₅、-S(O)₂NR₁₋₅R₁₋₅、-NR₁₋₅S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₋₅S(O)₂R₁₋₅、-S(O)₂NR₁₋₅C(=O)NR₁₋₅R₁₋₅、-C(=O)NR₁₋₅S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₋₅、-NR₁₋₅C(=O)R₁₋₅、-OC(=O)R₁₋₅、-S(O)=O)R₁₋₅、-S(O)₂R₁₋₅、-NR₁₋₅C(=O)OR₈、-NR₁₋₅S(O₂)R₈またはアリールアルキルから選択され；および

R₁₋₅が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリール

アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

A が、N、O、S、S(O) および S(O)₂ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含む、7 ~ 14 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく；

X が、-C(=O)OH、-C(=O)NR₉R₉、またはテトラゾリルであり；

W が、存在しないか、または(-CR_{8a}R_{8b}-)_m、(-CR_{8a}R_{8b})_m-O- もしくはアルケニルであり、該アルケニルは 1 個以上の R_{8a} で適宜置換されていてもよく；

m が、1 または 2 であり；

Z が、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルキルであり、いずれも 1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリカルキルは N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

ただし、W および Z、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R₄ が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉R₉、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O)₂R₈ から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは 1 個以上の R₅ で適宜置換されていてもよく；

R₅ が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリカルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉R₉、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O)₂R₈ から選択され；

R₈ が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a} が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8b} が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀、-C(=O)R₁₀ または -C(=O)NR₉R₉ であり、該アルキルは 1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていてもよい；または

R_{8a} および R_{8b} が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3 ~ 7 員環 (N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0 ~ 3 個の R_{9a} で適宜置換されていてもよい) を形成し；

R₉ が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルキルは 0 ~ 5 個の R_{9a} で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルキルは N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ

原子を含むか；または

2個のR₉が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)O R₁₄、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄ R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-OS(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₁₀、-NR₁₄S(O₂)R₈、-C(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく；

R₁₀が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

R_{10a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₈、-NR₁₄S(O₂)R₈またはアリールアルキルから選択され；

R₁₄が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0～3個のR_{14a}で適宜置換されていてもよく；

R_{14a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₅、-OCF₃、-OR₁₅、-OH、-SH、-SR₁₅、-C(=O)NR₁₅R₁₅、-NR₁₅S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₅S(O)₂R₁₅、-S(O)₂NR₁₅C(=O)OR₁₅、-S(O)₂NR₁₅C(=O)NR₁₅R₁₅、-C(=O)NR₁₅S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₅、-NR₁₅C(=O)R₁₅、-OC(=O)R₁₅、-S(=O)R₁₅、-S(O)₂R₁₅、-NR₁₅C(=O)OR₈、-NR₁₅S(O₂)R₈またはアリールアルキルから選択され；および

R₁₅が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

Aが、N、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される1～3個のヘテロ原子を適宜含む、7～14員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1個以上のR₄で適宜置換されていてもよく；

Xが、-C(=O)OH、-C(=O)NR₉R₉、またはテトラゾリルであり；

Wが、存在しないか、または(-CR_{8a}R_{8b}-)_m、-(CR_{8a}R_{8b})_m-O-またはアルケニルであり、該アルケニルは1個以上のR_{8a}で適宜置換されていてもよく；

mが、1または2であり；

Zが、アリール、アリールアルキルまたはヘテロサイクリカルアルキルであり、いずれも1個以上のR₄で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリカルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

ただし、WおよびZ、またはWが存在しないときのXおよびZは、環A上の同一炭素に結合し；

R₄が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O)₂R₈から選択され、該アルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは1個以上のR₅で適宜置換されていてもよく；

R₅が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリカルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O)₂R₈から選択され；

R₈が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a}が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8b}が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀、-C(=O)R₁₀または-C(=O)NR₉R₉であり、該アルキルは1個以上のR_{9a}で適宜置換されていてもよい；または

R_{8a}およびR_{8b}が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3～7員環(N、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0～3個のR_{9a}で適宜置換されていてもよい)を形成し；

R₉が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルアルキルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルアルキルは0～5個のR_{9a}で適宜置換されていてもよく、および該ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリカルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含むか；または

2個のR₉が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、 $=O$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-O$
 CF_3 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-N$
 $R_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)$
 $)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2$
 $NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-C(=O)$
 OR_{14} 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$
 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-OS(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-NR_{14}$
 $S(O_2)R_8$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}$
 $C(=O)NR_{14}R_{14}$ またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0~3個の R_{10a} で適宜置換されていてもよく；

R_{10} が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0~3個の R_{10a} で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1~4個のヘテロ原子を含み；

R_{10a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF$
 3 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O_2)R_8$ またはアリールアルキルから選択され；

R_{14} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0~3個の R_{14a} で適宜置換されていてもよく；

R_{14a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{15}$ 、 $-OCF$
 3 、 $-OR_{15}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}R_{15}$ 、 $-NR_{15}R_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}R_{15}$ 、 $-NR_{15}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{15}S(O)_2R_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}C(=O)OR_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}R_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}S(O)_2CF_3$ 、 $-C(=O)NR_{15}R_{15}$ 、 $-NR_{15}C(=O)R_{15}$ 、 $-OC(=O)R_{15}$ 、 $-S(=O)R_{15}$ 、 $-NR_{15}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{15}S(O_2)R_8$ またはアリールアルキルから選択され；および

R_{15} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

Aが、N、O、S、 $S(O)$ および $S(O)_2$ から選択される1~3個のヘテロ原子を適宜含む、7~14員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1個以上の R_4 で適宜置換されていてもよく；

Xが、 $-C(=O)OH$ 、または $-C(=O)NR_9R_9$ であり；

Wが、存在しないか、または $(-CR_{8a}R_{8b}-)_m$ 、 $(-CR_{8a}R_{8b})_m-O$

- もしくはアルケニルであり、該アルケニルは1個以上のR_{8-a}で適宜置換されてもよく；

m が、 1 または 2 であり；

Z が、アリール、アリールアルキルまたはヘテロサイクリアルキルであり、いずれも 1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリアルキルは N、O、および S から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

ただし、W および Z、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R_4 が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈から選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキルまたはヘテロサイクリルは1個以上のR₅で適宜置換されていてもよく；

R_5 が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₉、または-NR₉S(O)₂R₉から選択され；

R₃が、各自独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり、

R₈ が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_8 が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀、-C(=O)R₁₀ または -C(=O)NR₉R₉ であり、該アルキルは 1 個以上の R_9 で適宜置換されていてもよい。または

R_{8a} および R_{8b} が、それらが結合している炭素と一緒にになって、3～7員環（N、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を適宜含んでいてもよく、0～3個の R_{8c} で適宜置換されていてよい）を形成し、

R_9^a が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、またはヘテロサイクリルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキルまたはヘテロサイクリルは 0 ~ 5 個の R_9^a で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルは、N、O、およびS から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含むか；または

2 個の R_9 が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2 ~ 10 個の炭素原子および N、O、S、S(O) および S(O)₂ から選択される 0 ~ 4 個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていても、または 1 個以上の R_{9b} と適宜縮合していてもよく；

R₉ a が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、=O、-N
H₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₋₄、-OCF₃、-O
R₁₋₀、-OH、-SH、-SR₁₋₄、-C(=O)NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄R₁₋₄
、-S(O)₂NR₁₋₄R₁₋₄、-NR₁₋₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₋₄S
(O)₂R₁₋₀、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)OR₁₋₀、-S(O)₂NR₁₋₄C(=O)OR₁₋₀

= O) N R _{1~4} R _{1~4}、 - C (= O) N R _{1~4} S (O) ₂ R _{1~4}、 - C (= O) R _{1~4}、 - N R _{1~4} C (= O) R _{1~4}、 - O C (= O) R _{1~4}、 - S (= O) R _{1~4}、 - S (O) ₂ R _{1~4}、 - O S (O) ₂ R _{1~4}、 - N R _{1~4} C (= O) O R _{1~0}、 - N R _{1~4} S (O ₂) R ₈、 - C (= O) R _{1~0}、 - O C (= O) N R _{1~4} R _{1~4}、 - N R _{1~4} C (= O) N R _{1~4} R _{1~4} またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、およびヘテロサイクリルアルキルは0~3個のR _{1~0}_aで適宜置換されていてもよく；

R _{1~0}が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0~3個のR _{1~0}_aで適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1~4個のヘテロ原子を含み；

R _{1~0}_aが、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-N H ₂、-C N、-N O ₂、-C (= O) O H、-C (= O) O R _{1~4}、-O C F ₃、-O R _{1~4}、-O H、-S H、-S R _{1~4}、-C (= O) N R _{1~4} R _{1~4}、-N R _{1~4} R _{1~4}、-S (O) ₂ N R _{1~4} R _{1~4}、-N R _{1~4} S (O) ₂ C F ₃、-C (= O) N R _{1~4} S (O) ₂ R _{1~4}、-S (O) ₂ N R _{1~4} C (= O) O R _{1~4}、-S (O) ₂ N R _{1~4} C (= O) N R _{1~4} R _{1~4}、-C (= O) N R _{1~4} S (O) ₂ C F ₃、-C (= O) R _{1~4}、-N R _{1~4} C (= O) R _{1~4}、-O C (= O) R _{1~4}、-S (= O) R _{1~4}、-S (O) ₂ R _{1~4}、-N R _{1~4} C (= O) O R ₈、-N R _{1~4} S (O ₂) R ₈ またはアリールアルキルから選択され；

R _{1~4}が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルは0~3個のR _{1~4}_aで適宜置換されていてもよく；

R _{1~4}_aが、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ヘテロサイクリルアルキル、ハロ、-N H ₂、-C N、-N O ₂、-C (= O) O H、-C (= O) O R _{1~5}、-O C F ₃、-O R _{1~5}、-O H、-S H、-S R _{1~5}、-C (= O) N R _{1~5} R _{1~5}、-N R _{1~5} R _{1~5}、-S (O) ₂ N R _{1~5} R _{1~5}、-N R _{1~5} S (O) ₂ C F ₃、-C (= O) N R _{1~5} S (O) ₂ R _{1~5}、-S (O) ₂ N R _{1~5} C (= O) O R _{1~5}、-S (O) ₂ N R _{1~5} C (= O) N R _{1~5} R _{1~5}、-C (= O) N R _{1~5} S (O) ₂ C F ₃、-C (= O) R _{1~5}、-N R _{1~5} C (= O) R _{1~5}、-O C (= O) R _{1~5}、-S (= O) R _{1~5}、-S (O) ₂ R _{1~5}、-N R _{1~5} C (= O) O R ₈、-N R _{1~5} S (O ₂) R ₈ またはアリールアルキルから選択され；および

R _{1~5}が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはアリールアルキルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

Aが、N、O、S、S (O) およびS (O) ₂から選択される1~3個のヘテロ原子を適宜含む、7~14員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり、1個以上のR ₄で適宜置換されていてもよく；

Xが、-C (= O) O H、または-C (= O) N R ₉ R ₉であり；

Wが、存在しないか、または(-C R _{8~a} R _{8~b}-)_mもしくは-(C R _{8~a} R _{8~b})_m-O-であり；

mが、1または2であり；

Zが、アリールまたはアリールアルキルであり、それらは1個以上のR ₄で適宜置換されていてもよく；

ただし、WおよびZ、またはWが存在しないときのXおよびZは、環A上の同一炭素に結合し；

R ₄が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリ

ル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈から選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは1個以上のR₅で適宜置換されていてもよく；

R₅が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈から選択され；

R₈が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a}が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールであり；

R_{8b}が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN、-OR₁₀または-C(=O)NR₉R₉であり、該アルキルは1個以上のR_{9a}で適宜置換されていてもよく；

R₉が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロサイクリルは0～5個のR_{9a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルは、N、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含むか；または

2個のR₉が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2～10個の炭素原子およびN、O、S、S(O)およびS(O)₂から選択される0～4個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1個以上のR_{9a}で適宜置換されていても、または1個以上のR_{9a}と適宜縮合していてもよく；

R_{9a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₀、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、-S(=O)R₁₄、-S(O)₂R₁₄、-NR₁₄C(=O)OR₁₀、-NR₁₄S(O₂)R₈、-C(=O)R₁₀、-OC(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルおよびヘテロサイクリルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく；

R₁₀が、各々独立して、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロサイクリルまたはヘテロサイクリルアルキルは0～3個のR_{10a}で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルおよびヘテロサイクリルアルキルはN、O、およびSから選択される1～4個のヘテロ原子を含み；

R_{10a}が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または-NR₉S(O₂)R₈から選択され；

= O) O H 、 - C (= O) O R _{1~4} 、 - O C F ₃ 、 - O R _{1~4} 、 - O H 、 - S H 、 - S R _{1~4} 、 - C (= O) N R _{1~4} R _{1~4} 、 - N R _{1~4} R _{1~4} 、 - S (O) ₂ N R _{1~4} R _{1~4} 、 - N R _{1~4} S (O) ₂ C F ₃ 、 - C (= O) N R _{1~4} S (O) ₂ R _{1~4} 、 - S (O) ₂ N R _{1~4} C (= O) O R _{1~4} 、 - S (O) ₂ N R _{1~4} C (= O) N R _{1~4} R _{1~4} 、 - C (= O) N R _{1~4} S (O) ₂ C F ₃ 、 - C (= O) R _{1~4} 、 - N R _{1~4} C (= O) R _{1~4} 、 - O C (= O) R _{1~4} 、 - S (= O) R _{1~4} 、 - S (O) ₂ R _{1~4} 、 - N R _{1~4} C (= O) O R ₈ 、 - N R _{1~4} S (O ₂) R ₈ またはアリールアルキルから選択され；

R _{1~4} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、またはアリールから選択され、該アルキル、シクロアルキルまたはアリールは、0~3個のR _{1~4} a で適宜置換されていてもよく；

R _{1~4} a が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、- NH ₂ 、- CN 、- NO ₂ 、- C (= O) O H 、- C (= O) O R _{1~5} 、- O C F ₃ 、- O R _{1~5} 、- O H 、- S H 、- S R _{1~5} 、- C (= O) N R _{1~5} R _{1~5} 、- N R _{1~5} R _{1~5} 、- S (O) ₂ N R _{1~5} R _{1~5} 、- N R _{1~5} S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) N R _{1~5} S (O) ₂ R _{1~5} 、- S (O) ₂ N R _{1~5} C (= O) N R _{1~5} R _{1~5} 、- C (= O) N R _{1~5} S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) R _{1~5} 、- N R _{1~5} C (= O) R _{1~5} 、- O C (= O) R _{1~5} 、- S (= O) R _{1~5} 、- S (O) ₂ R _{1~5} 、- N R _{1~5} C (= O) O R ₈ 、- N R _{1~5} S (O ₂) R ₈ またはアリールアルキルから選択され；および

R _{1~5} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキルまたはアリールから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

Aが、N、O、S、S (O) およびS (O) ₂ から選択される1~3個のヘテロ原子を適宜含み、1個以上のR ₄ で置換されている、7~12員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり；

Xが、- C (= O) N R ₉ R ₉ であり；

Wが、存在しないか、または(- C R _{8~a} R _{8~b} -) _m であり；

mが、1または2であり；

Zが、アリールまたはアリールアルキルであり、それらは1個以上のR ₄ で適宜置換されていてもよく；

ただし、WおよびZ、またはWが存在しないときのXおよびZは、環A上の同一炭素に結合し；

R ₄ が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、= O 、- NH ₂ 、- CN 、- NO ₂ 、- C (= O) O H 、- C (= O) O R _{1~0} 、- O R _{1~0} 、- O H 、- O C F ₃ 、- S H 、- S R _{1~0} 、- C (= O) N R ₉ R ₉ 、- N R ₉ R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ R ₉ 、- N R ₉ S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) N R ₉ S (O) ₂ R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ C (= O) O R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ C (= O) N R ₉ R ₉ 、- C (= O) N R ₉ S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) R _{1~0} 、- N R ₉ C (= O) R _{1~0} 、- O - S (O) ₂ R _{1~0} 、- N R ₉ C (= O) O R ₈ 、または- N R ₉ S (O ₂) R ₈ から選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキル、またはヘテロサイクリルは1個以上のR ₅ で適宜置換されていてもよく；

R ₅ が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、- NH ₂ 、- CN 、- NO ₂ 、- C (= O) O H 、- C (= O) O R _{1~0} 、- O C F ₃ 、- O R _{1~0} 、- O H 、- S H 、- S R _{1~0} 、- C (= O) N R ₉ R ₉ 、- N R ₉ R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ R ₉ 、- N R ₉ S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) N R ₉ S (O) ₂ R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ C (= O) O R ₉ 、- S (O) ₂ N R ₉ C (= O) N R ₉ R ₉ 、- C (= O) N R ₉ S (O) ₂ C F ₃ 、- C (= O) R _{1~0} 、- N R ₉ C (= O) R _{1~0} 、- O C (= O) R _{1~0} 、- S (= O) R _{1~0} 、- S (O) ₂ R _{1~0} 、- O - S (O) ₂ R _{1~0} 、- N R ₉ C (= O) O R ₈ 、または- N R ₉ S (O ₂)

R_8 から選択され；

R_8 が、各々独立して、アルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり；

R_{8a} が、各々独立して、水素またはアルキルであり；

R_{8b} が、各々独立して、水素、 $-C(=O)OH$ 、アルキル、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-OR_{10}$ または $-C(=O)NR_9R_9$ であり、該アルキルは 1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていてもよく；

R_9 が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリールまたはヘテロサイクリルであり、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロサイクリルは 0 ~ 5 個の R_{9a} で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルは、N、O、およびS から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含むか；または

2 個の R_9 が、それらが結合している窒素と一緒にになって、2 ~ 10 個の炭素原子およびN、O、S、S(O) およびS(O)₂ から選択される 0 ~ 4 個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていても、または 1 個以上の R_{9a} と適宜縮合しててもよく；

R_{9a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{10}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-C(=O)NCF_3$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-OS(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_{10}$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ 、 $-C(=O)R_{10}$ 、 $-OC(=O)NR_{14}R_{14}$ またはアリールアルキルから選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキルおよびヘテロサイクリルは 0 ~ 3 個の R_{10a} で適宜置換されていてもよく；

R_{10} が、各々独立して、アルキル、アリール、アリールアルキルまたはヘテロサイクリルから選択され、該アルキル、アリール、アリールアルキルまたはヘテロサイクリルは 0 ~ 3 個の R_{10a} で適宜置換されていてもよく、該ヘテロサイクリルは、N、O、およびS から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み；

R_{10a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{14}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{14}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-NR_{14}R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2R_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2C(=O)OR_{14}$ 、 $-S(O)_2NR_{14}C(=O)NR_{14}R_{14}$ 、 $-C(=O)NR_{14}S(O)_2C(=O)F_3$ 、 $-C(=O)R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)R_{14}$ 、 $-OC(=O)R_{14}$ 、 $-S(=O)R_{14}$ 、 $-S(O)_2R_{14}$ 、 $-NR_{14}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{14}S(O)_2R_8$ またはアリールアルキルから選択され；

R_{14} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキルまたはアリールから選択され、該アルキル、シクロアルキルまたはアリールは、0 ~ 3 個の R_{14a} で適宜置換されていてもよく；

R_{14a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OR_{15}$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR_{15}$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SR_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}R_{15}$ 、 $-NR_{15}R_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}R_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}S(O)_2R_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}C(=O)NR_{15}R_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}S(O)_2C(=O)OR_{15}$ 、 $-S(O)_2NR_{15}C(=O)NR_{15}R_{15}$ 、 $-C(=O)NR_{15}S(O)_2C(=O)F_3$ 、 $-C(=O)R_{15}$ 、 $-NR_{15}C(=O)R_{15}$ 、 $-OC(=O)R_{15}$ 、 $-S(=O)R_{15}$ 、 $-S(O)_2R_{15}$ 、 $-NR_{15}C(=O)OR_8$ 、 $-NR_{15}S(O)_2R_8$ またはアリールアルキルから選択され；

R_8 またはアリールアルキルから選択され；および
 R_{15} が、各々独立して、水素、アルキル、シクロアルキルまたはアリールから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

A が、N、O、S、S(O) および S(O)₂ から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を適宜含み、1 個以上の R₄ で置換されている 7 ~ 10 員非芳香族の二環、三環または多環式環系であり；

X が、-C(=O)NR₉R₉ であり；

W が、存在しないか、または (-C R_{8a}R_{8b}-)_m であり；

m が、1 であり；

Z が、アリールまたはアリールアルキルであり、それらは 1 個以上の R₄ で適宜置換されていてもよく；

ただし、W および Z、または W が存在しないときの X および Z は、環 A 上の同一炭素に結合し；

R₄ が、各々独立して、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁、-OR₁₀、-OH、-OCF₃、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または -NR₉S(O)₂R₈ から選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキルまたはヘテロサイクリルは 1 個以上の R₅ で適宜置換されていてもよく；

R₅ が、各々独立して、水素、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₀、-OCF₃、-OR₁₀、-OH、-SH、-SR₁₀、-C(=O)NR₉R₉、-NR₉R₉、-S(O)₂NR₉R₉、-NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)NR₉S(O)₂R₉、-S(O)₂NR₉C(=O)OR₉、-S(O)₂NR₉C(=O)NR₉R₉、-C(=O)NR₉S(O)₂CF₃、-C(=O)R₁₀、-NR₉C(=O)R₁₀、-OC(=O)R₁₀、-S(=O)R₁₀、-S(O)₂R₁₀、-O-S(O)₂R₁₀、-NR₉C(=O)OR₈、または -NR₉S(O)₂R₈ から選択され；

R₈ が、各々独立してアルキルまたはアリールであり；

R_{8a} が、各々独立して、水素またはアルキルであり；

R_{8b} が、各々独立して、水素、-C(=O)OH、アルキル、-OH、ハロ、-CN または -OR₁₀ であり；

R₉ が、各々独立して、水素、アルキル、アルコキシまたはアリールであり、該アルキルまたはアリールは 0 ~ 5 個の R_{9a} で適宜置換されていてもよい；または

2 個の R₉ が、それらが結合している窒素と一緒になって、2 ~ 10 個の炭素原子および N、O、S、S(O) および S(O)₂ から選択される 0 ~ 4 個のさらなるヘテロ原子を含む、不飽和、飽和または部分飽和環式環系を形成し、該環系は、1 個以上の R_{9a} で適宜置換されていても、または 1 個以上の R_{9a} と適宜縮合しててもよく；

R_{9a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、=O、-NH₂、-CN、-NO₂、-C(=O)OH、-C(=O)OR₁₄、-OCF₃、-OR₁₄、-OH、-SH、-SR₁₄、-C(=O)NR₁₄R₁₄、-NR₁₄R₁₄、-S(O)₂NR₁₄R₁₄、-NR₁₄S(O)₂R₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)OR₁₄、-S(O)₂NR₁₄C(=O)NR₁₄R₁₄、-C(=O)NR₁₄S(O)₂R₁₄、-C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-NR₁₄C(=O)R₁₄、-OC(=O)R₁₄、

- S (= O) R_{1~4}、 - S (O)₂ R_{1~4}、 - OS (O)₂ R_{1~4}、 - NR_{1~4} C (= O) OR_{1~0}、 - NR_{1~4} S (O₂) R₈、 - C (= O) R_{1~0}、 - OC (= O) NR_{1~4} R_{1~4}、または - NR_{1~4} C (= O) NR_{1~4} R_{1~4} から選択され、該アルキル、アリール、シクロアルキルおよびヘテロサイクリルは 0 ~ 3 個の R_{1~0a} で適宜置換されていてもよく；

R_{1~0} が、各々独立して、アルキルまたはアリールから選択され、該アルキルまたはアリールは 0 ~ 3 個の R_{1~0a} で適宜置換されていてもよく；

R_{1~0a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、 - NH₂、 - CN、 - NO₂、 - C (= O) OH、 - C (= O) OR_{1~4}、 - OCF₃、 - OR_{1~4}、 - OH、 - SH、 - SR_{1~4}、 - C (= O) NR_{1~4} R_{1~4}、 - NR_{1~4} R_{1~4}、 - S (O)₂ NR_{1~4} R_{1~4}、 - NR_{1~4} S (O)₂ CF₃、 - C (= O) NR_{1~4} S (O)₂ R_{1~4}、 - S (O)₂ NR_{1~4} C (= O) OR_{1~4}、 - S (O)₂ NR_{1~4} C (= O) NR_{1~4} R_{1~4}、 - C (= O) NR_{1~4} S (O)₂ CF₃、 - C (= O) R_{1~4}、 - NR_{1~4} C (= O) R_{1~4}、 - OC (= O) R_{1~4}、 - S (= O) R_{1~4}、 - S (O)₂ R_{1~4}、 - NR_{1~4} C (= O) OR₈、または - NR_{1~4} S (O₂) R₈ から選択され；

R_{1~4} が、各々独立して、水素、アルキルまたはアリールから選択され、該アルキルまたはアリールは 0 ~ 3 個の R_{1~4a} で適宜置換されていてもよく；

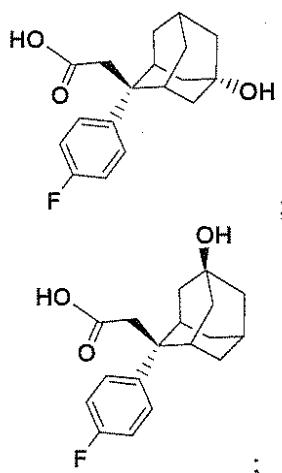
R_{1~4a} が、各々独立して、アルキル、ハロアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロサイクリル、ハロ、 - NH₂、 - CN、 - NO₂、 - C (= O) OH、 - C (= O) OR_{1~5}、 - OCF₃、 - OR_{1~5}、 - OH、 - SH、 - SR_{1~5}、 - C (= O) NR_{1~5} R_{1~5}、 - NR_{1~5} R_{1~5}、 - S (O)₂ NR_{1~5} R_{1~5}、 - NR_{1~5} S (O)₂ CF₃、 - C (= O) NR_{1~5} S (O)₂ R_{1~5}、 - S (O)₂ NR_{1~5} C (= O) OR_{1~5}、 - S (O)₂ NR_{1~5} C (= O) NR_{1~5} R_{1~5}、 - C (= O) NR_{1~5} S (O)₂ CF₃、 - C (= O) R_{1~5}、 - NR_{1~5} C (= O) R_{1~5}、 - OC (= O) R_{1~5}、 - S (= O) R_{1~5}、 - S (O)₂ R_{1~5}、 - NR_{1~5} C (= O) OR₈、または - NR_{1~5} S (O₂) R₈ から選択され；および

R_{1~5} が、各々独立して、水素またはアルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

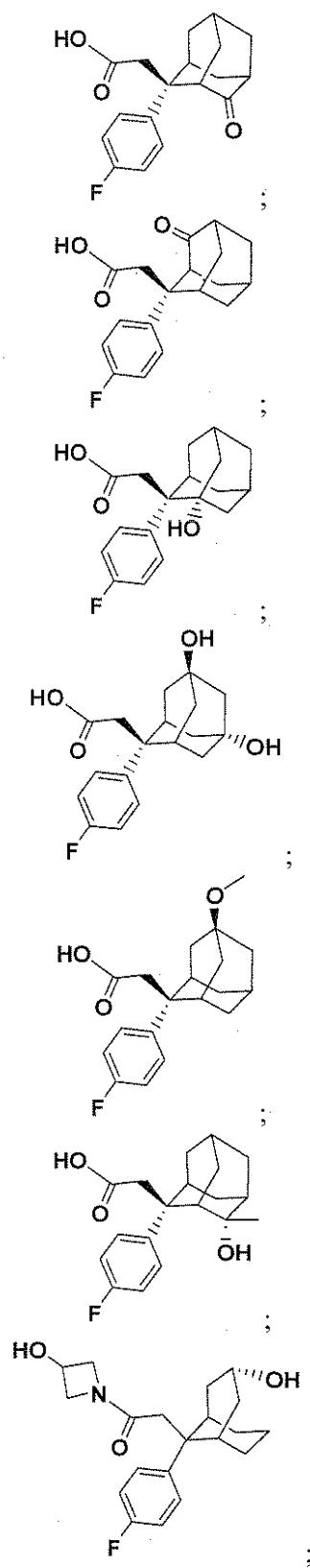
【請求項 12】

下式の化合物からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

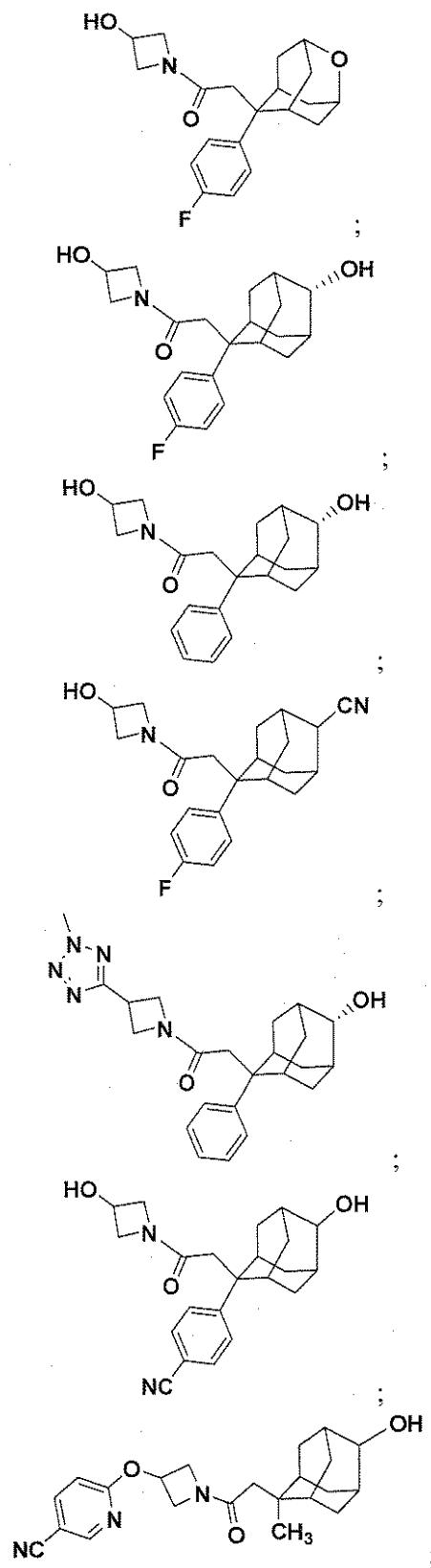
【化 4】



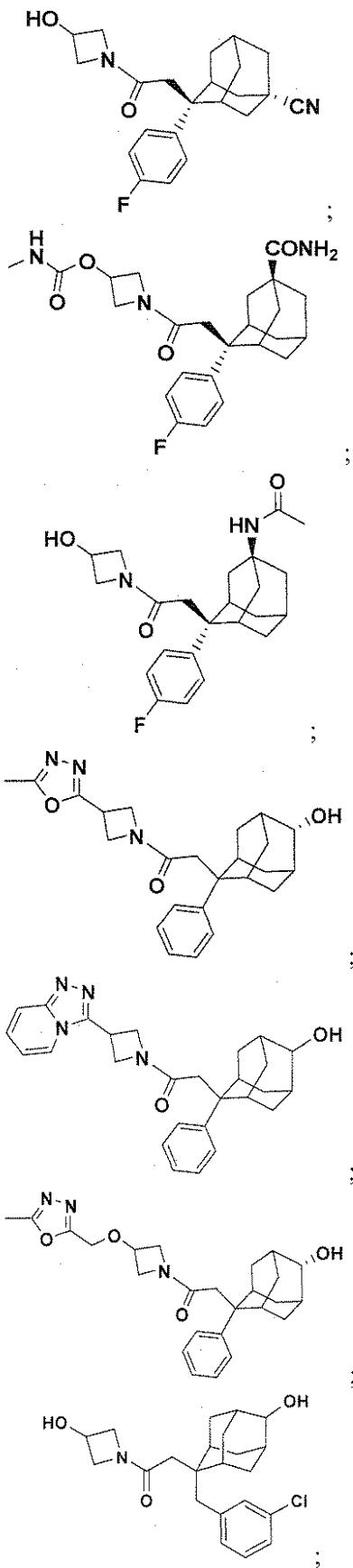
【化 5】



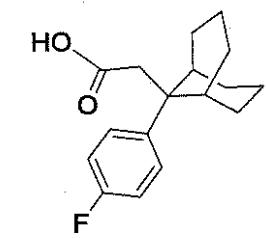
【化 6】



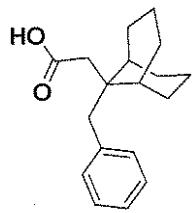
【化 7】



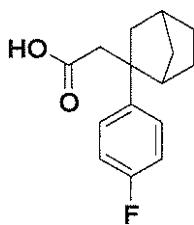
【化 8】



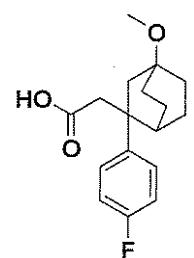
；



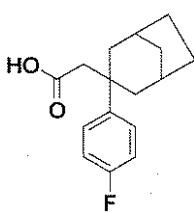
；



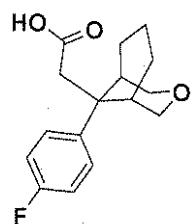
；



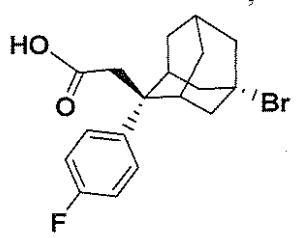
；



；

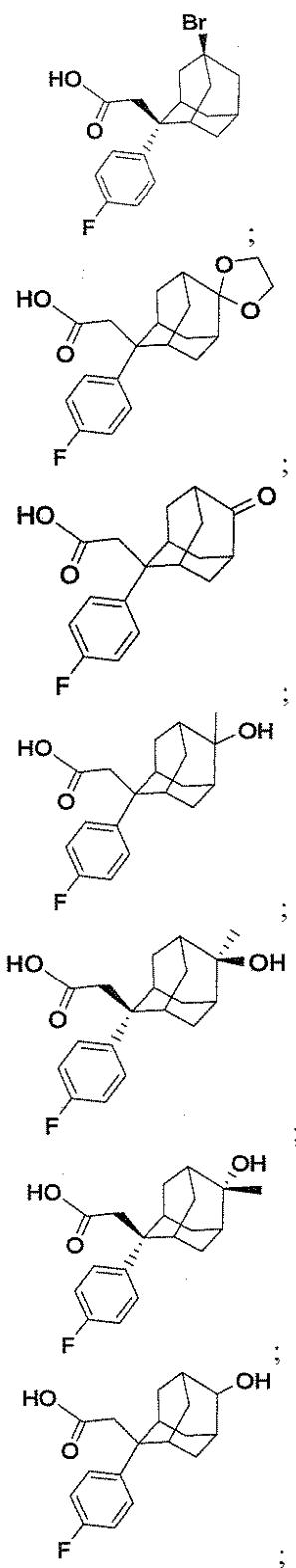


；

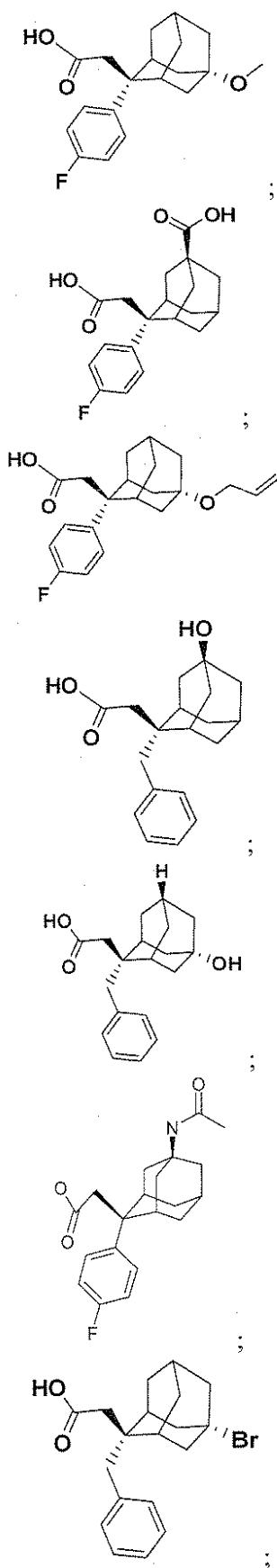


；

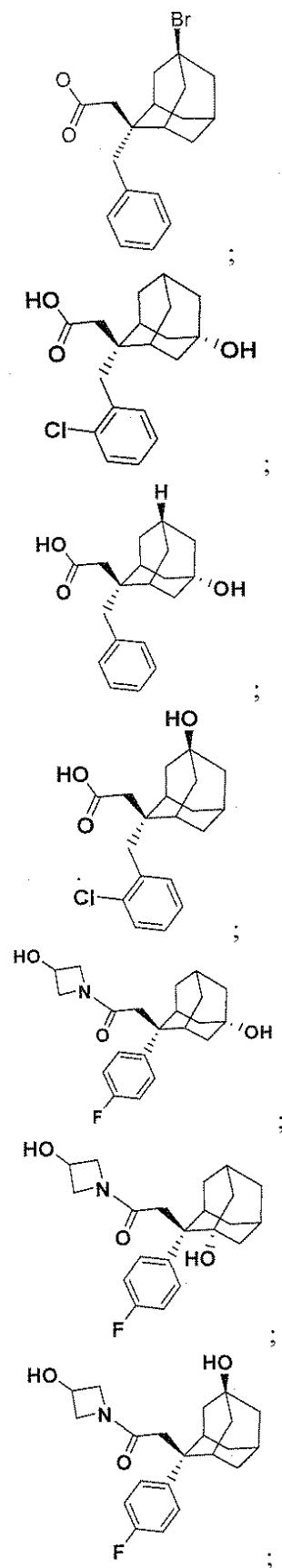
【化 9】



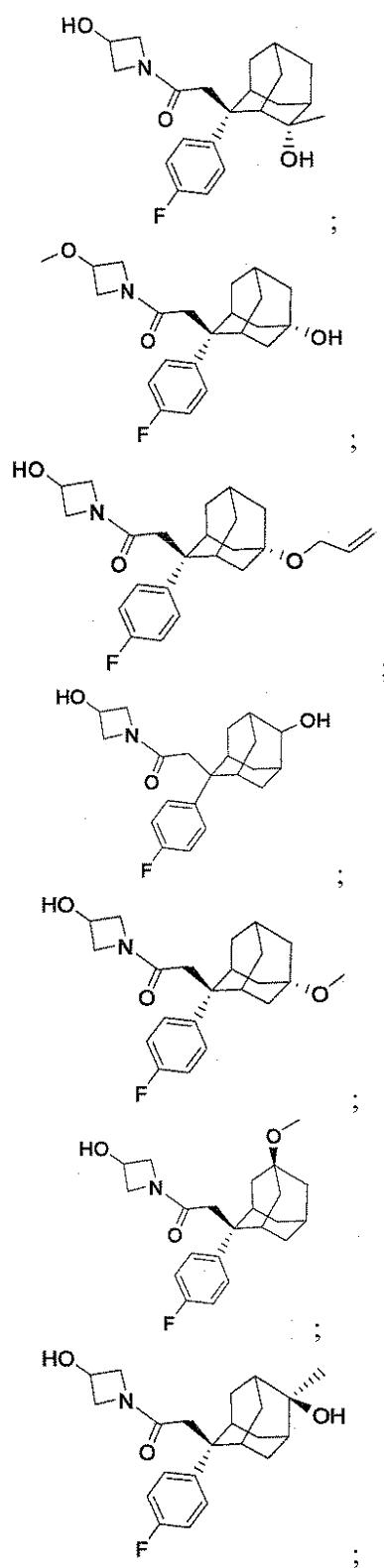
【化 1 0】



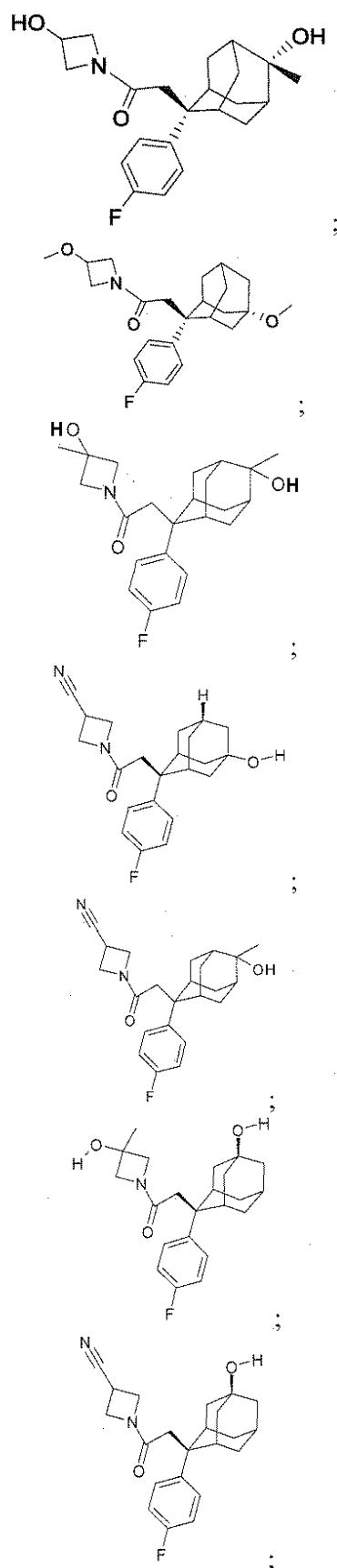
【化 11】



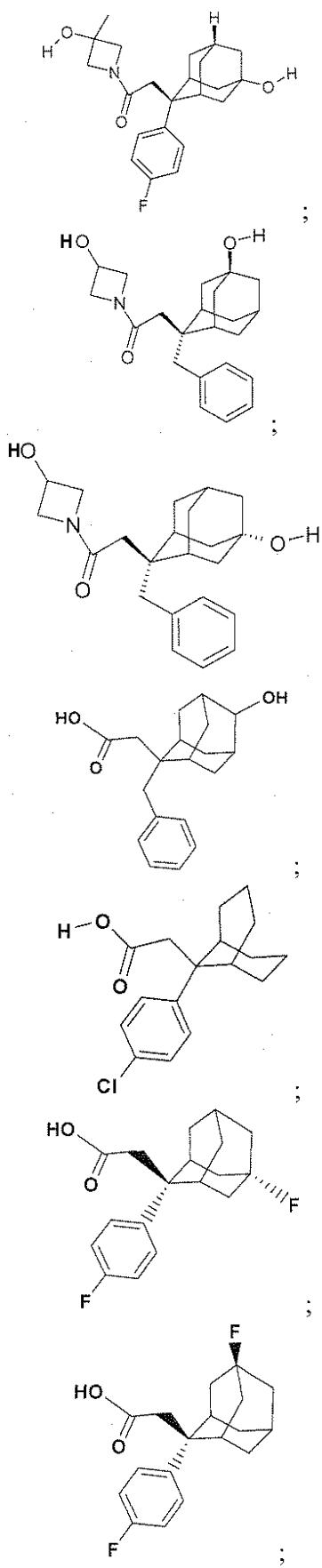
【化 12】



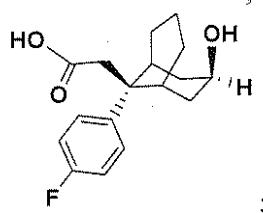
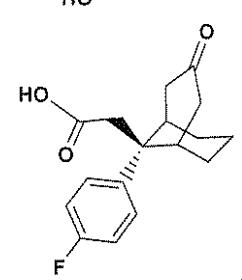
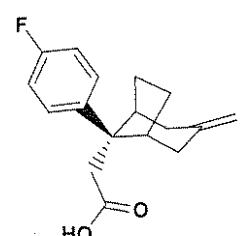
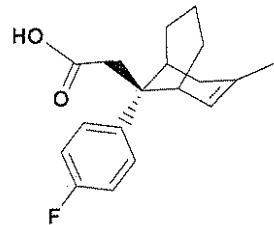
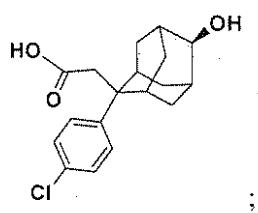
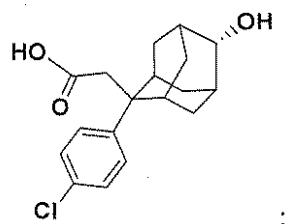
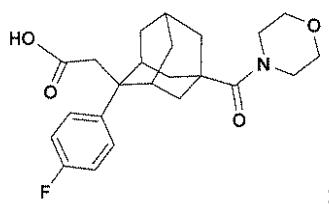
【化 1 3】



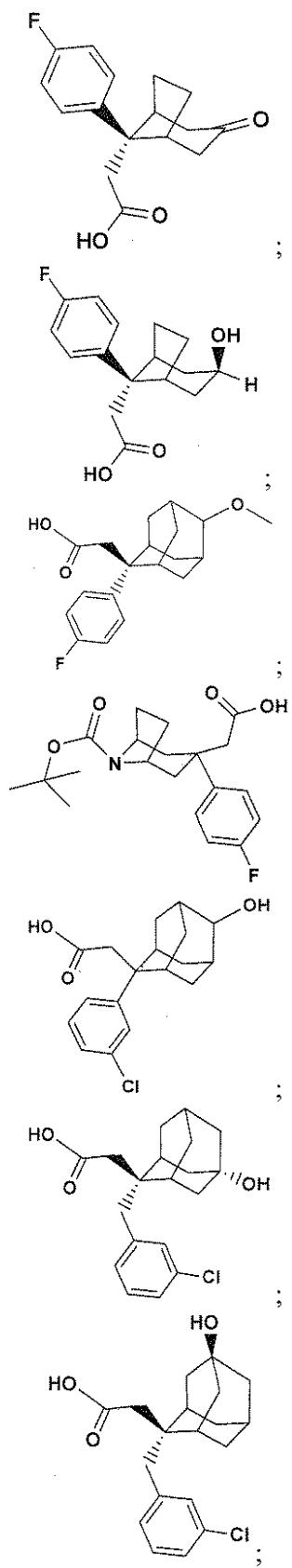
【化 1 4】



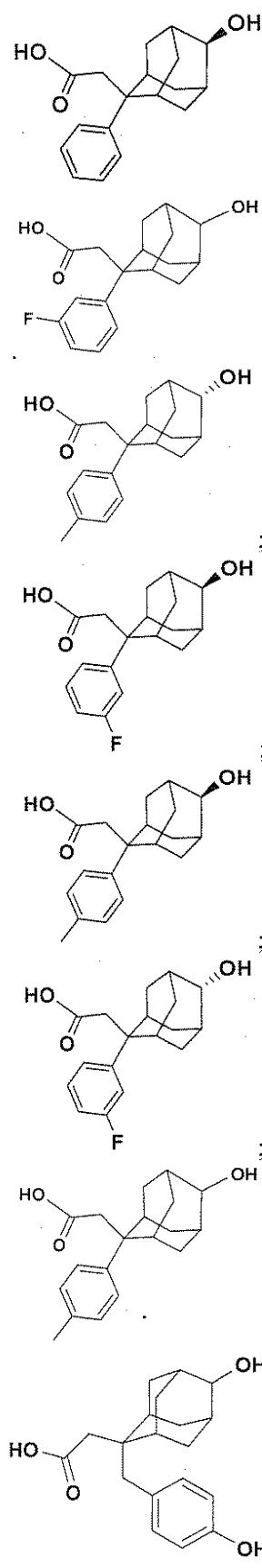
【化 1 5】



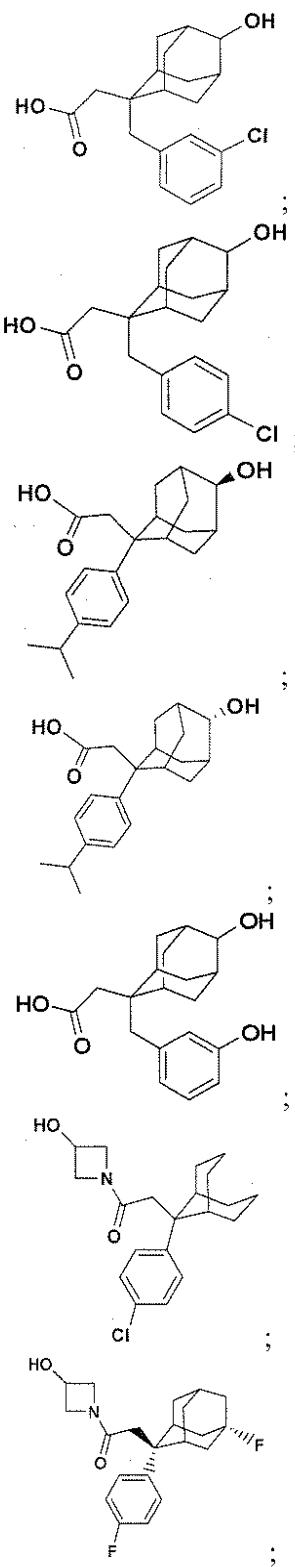
【化 1 6】



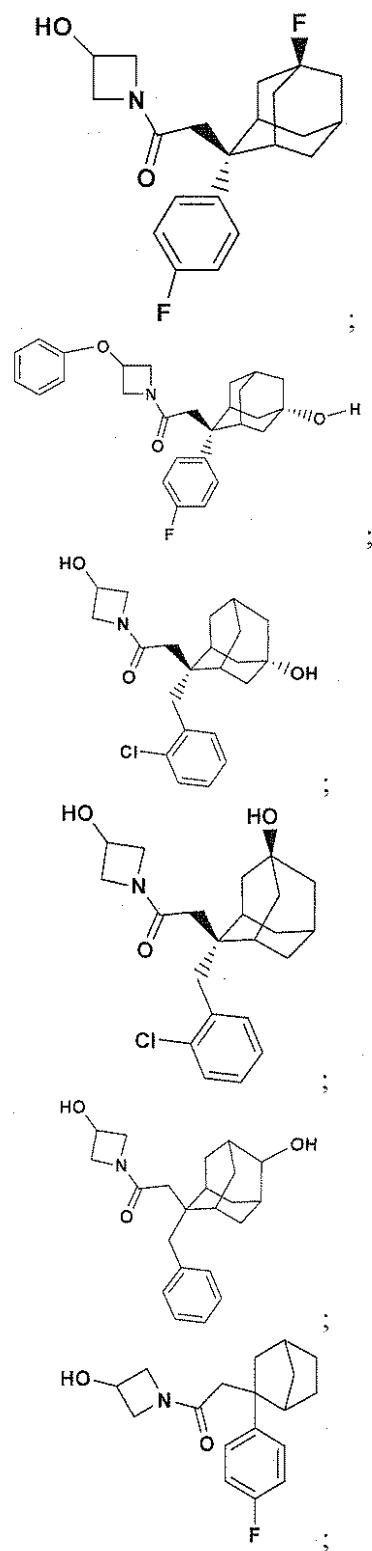
【化 17】



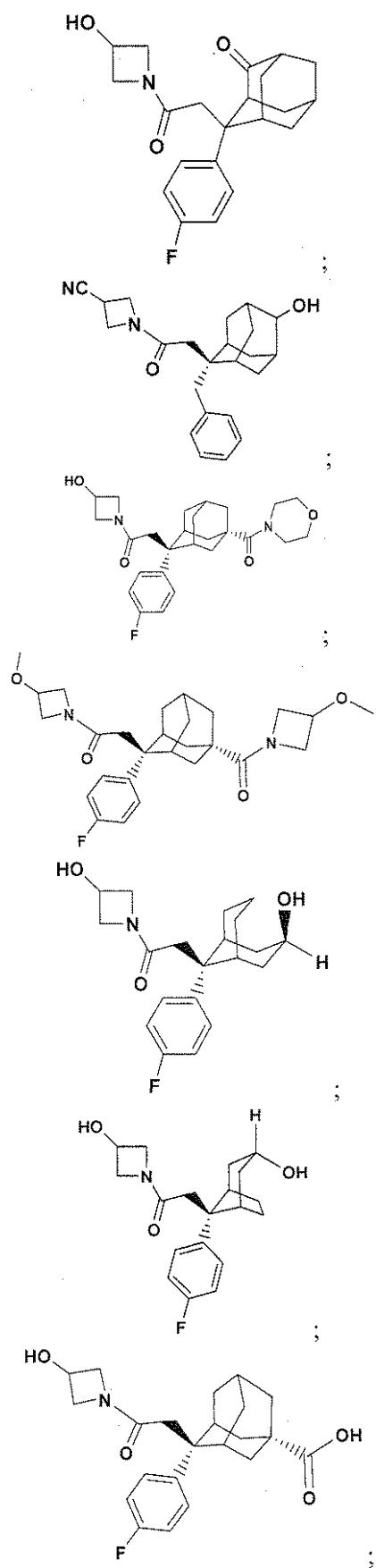
【化 1 8】



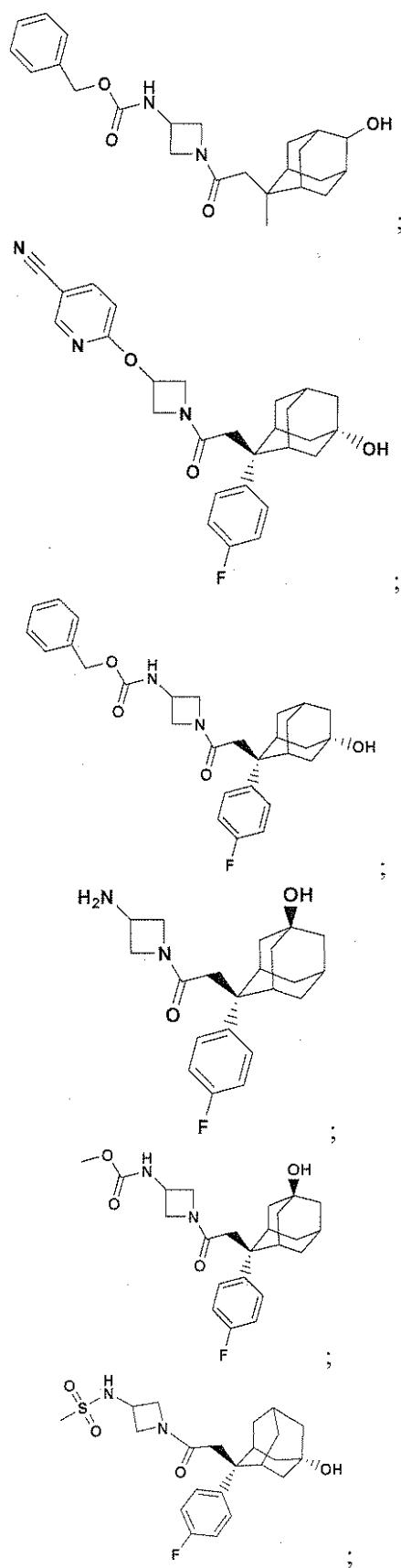
【化 19】



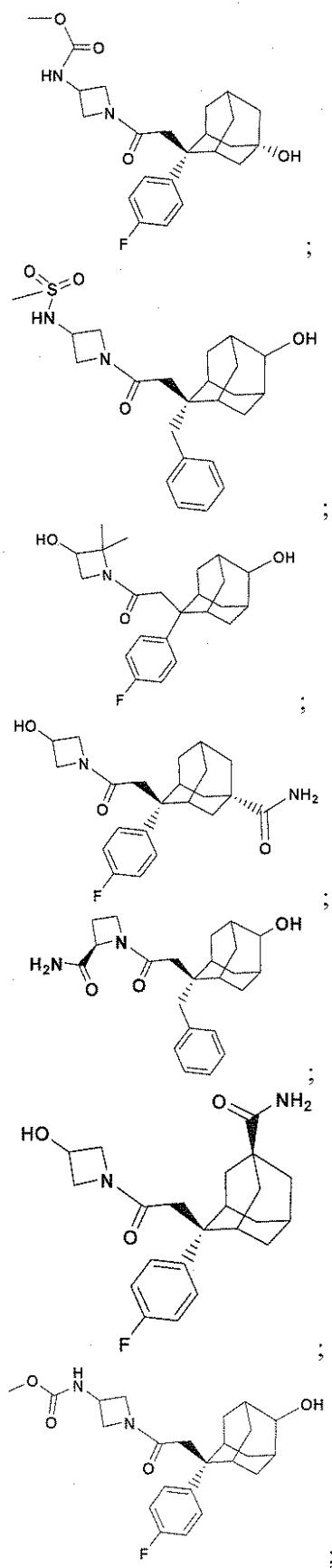
【化 2 0】



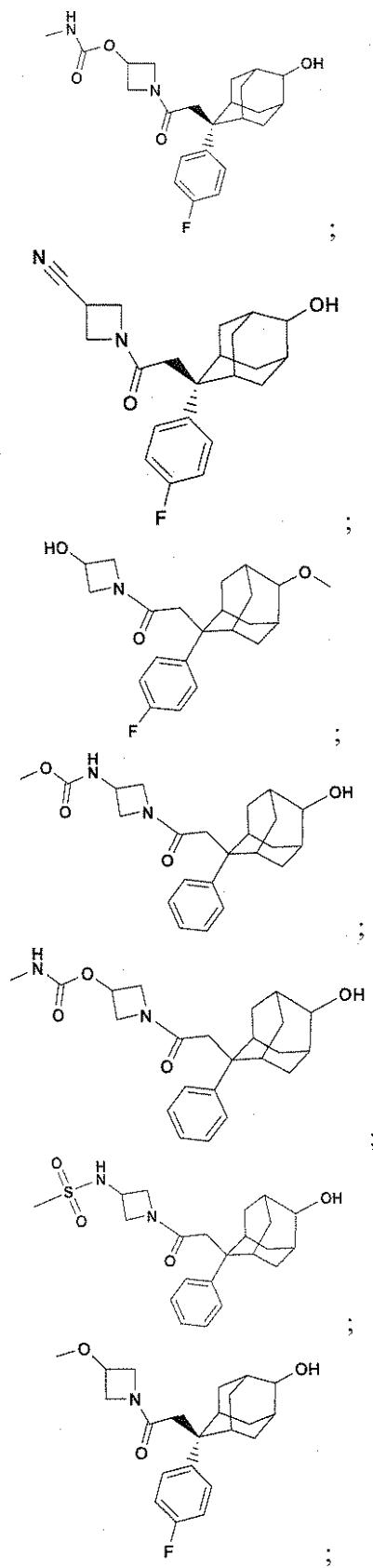
【化 2 1】



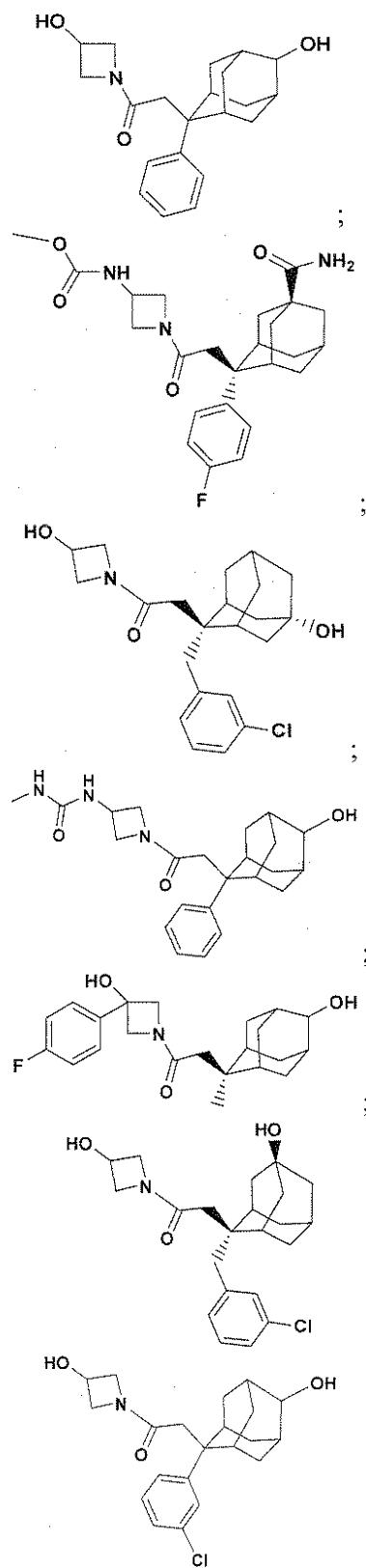
【化 2 2】



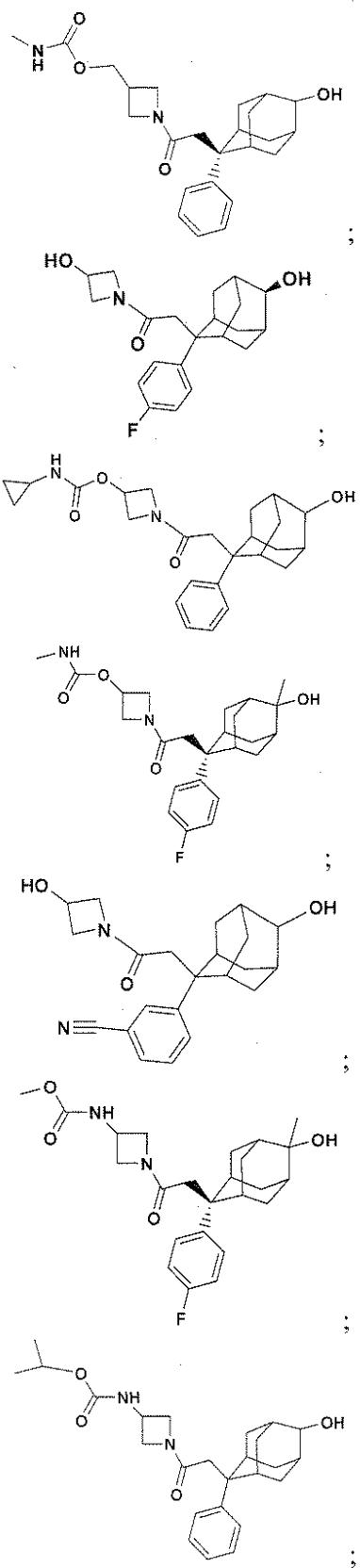
【化 2 3】



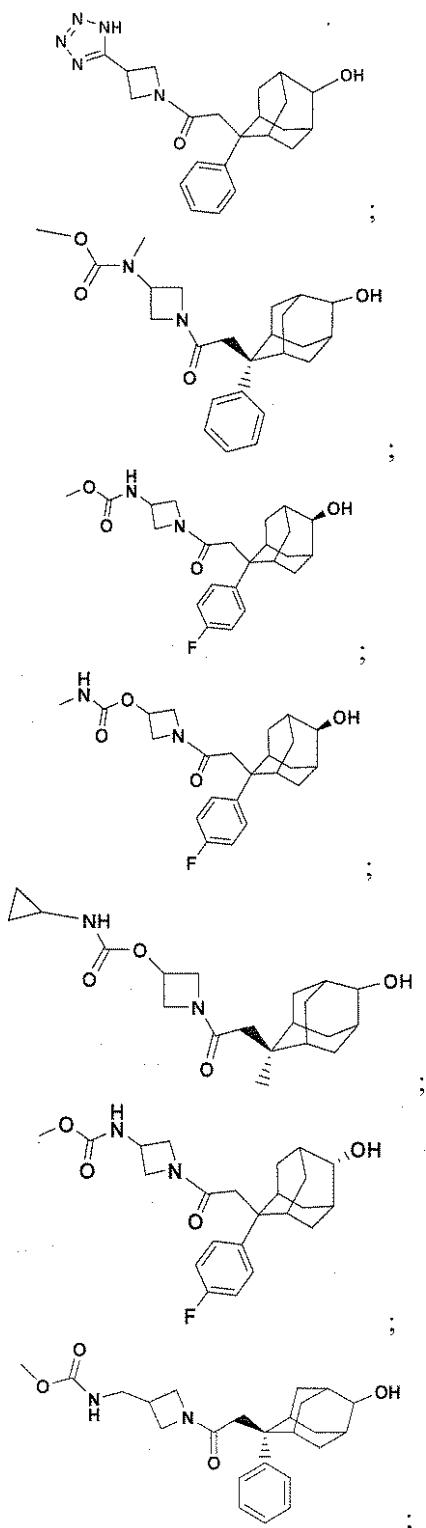
【化 2 4】



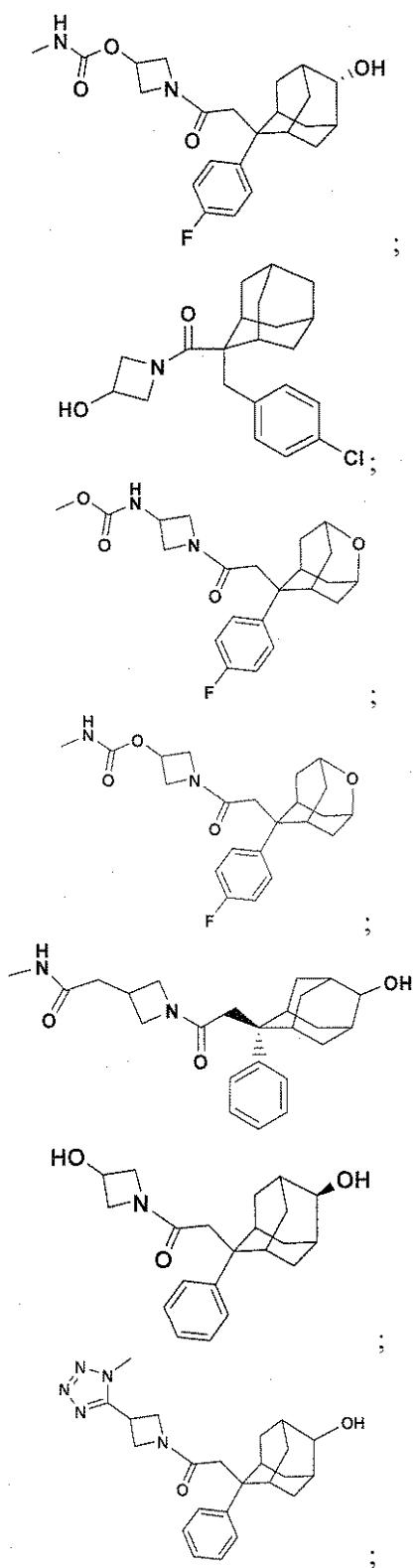
【化 2 5】



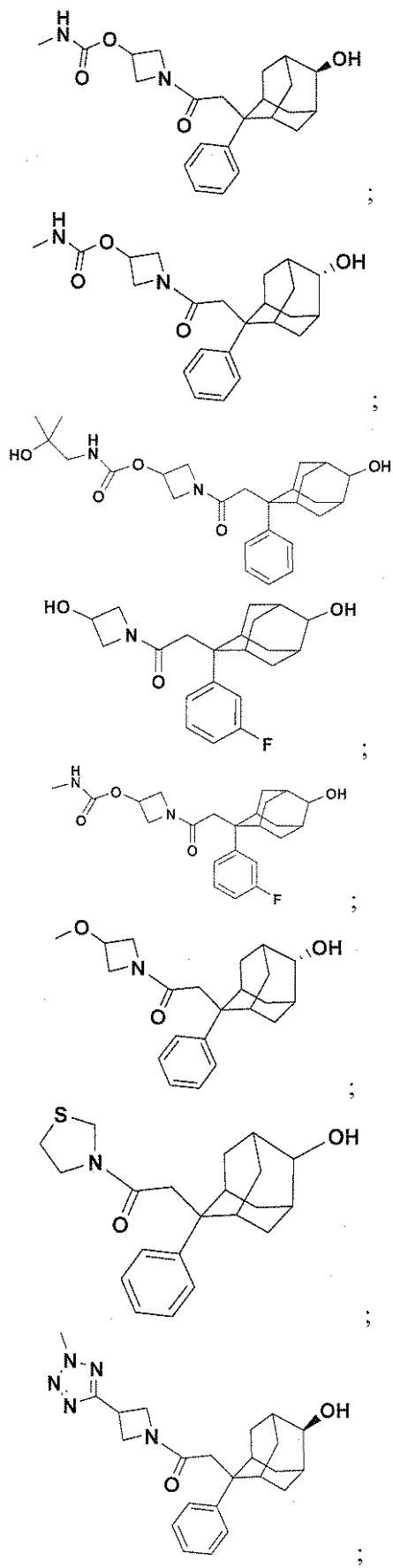
【化 2 6】



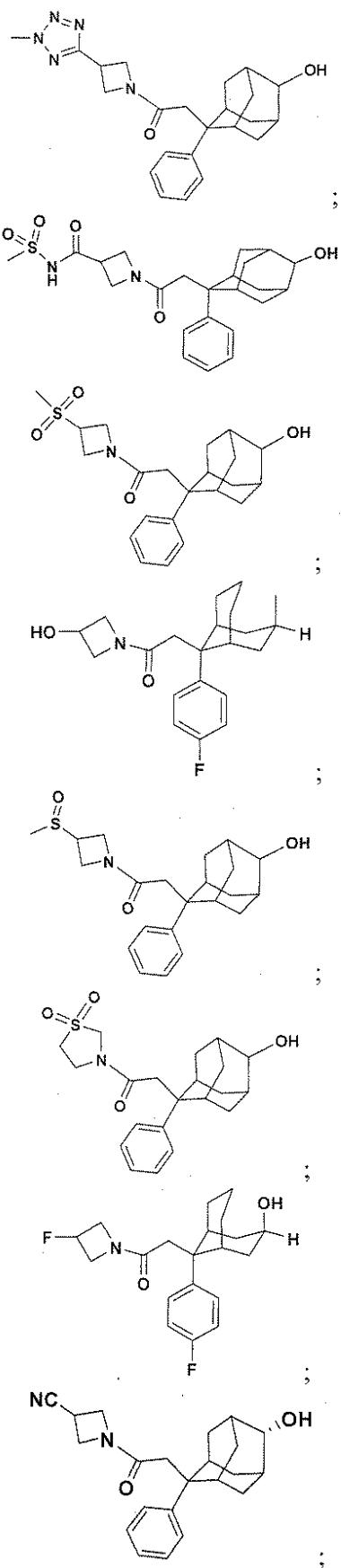
【化 2 7】



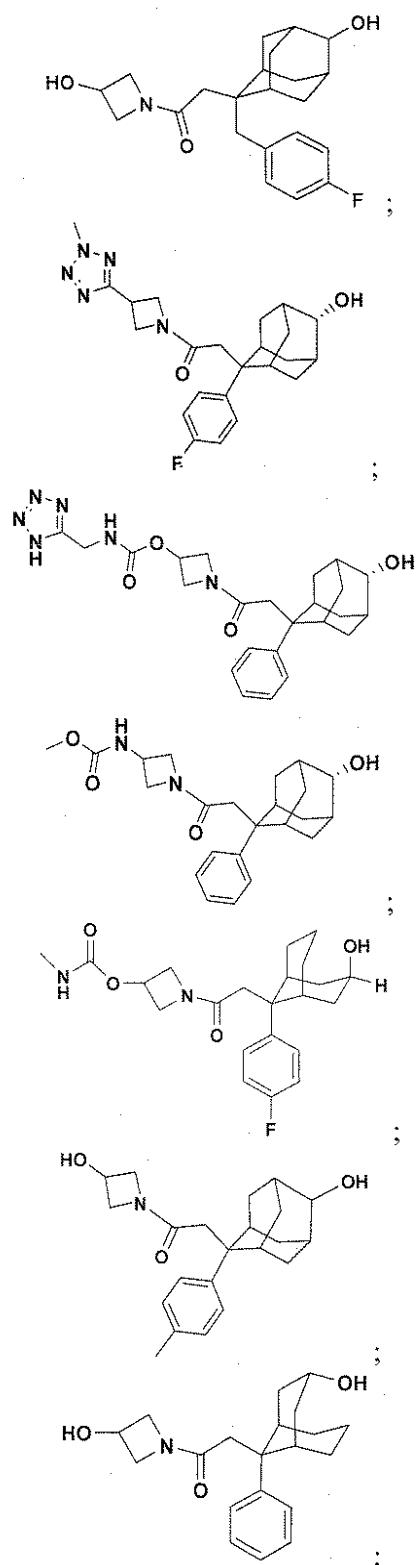
【化 2 8】



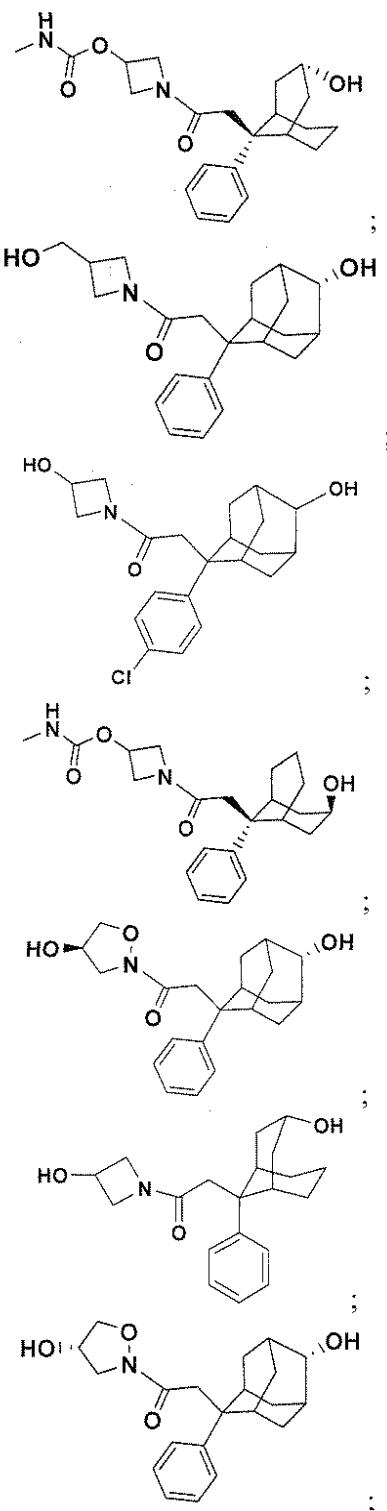
【化 2 9】



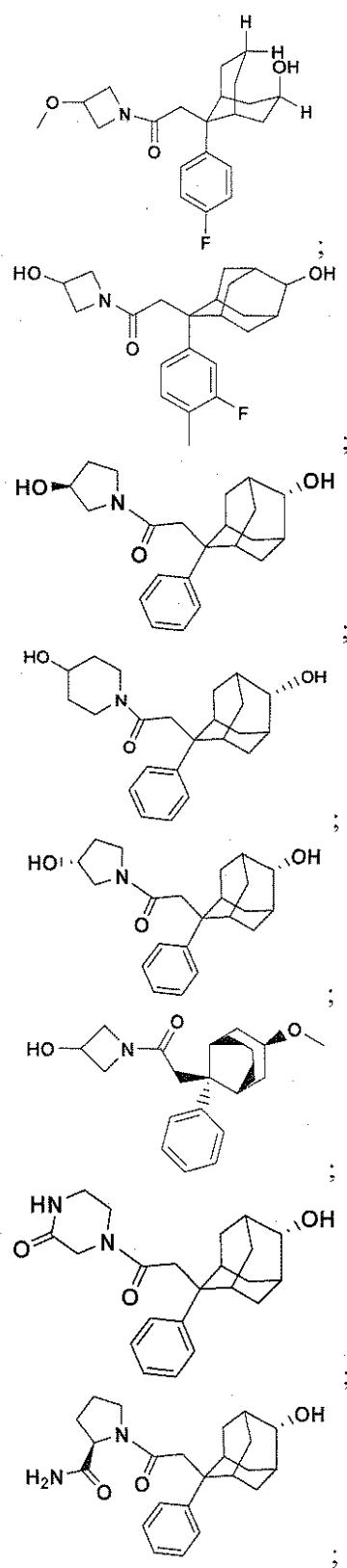
【化 3 0】



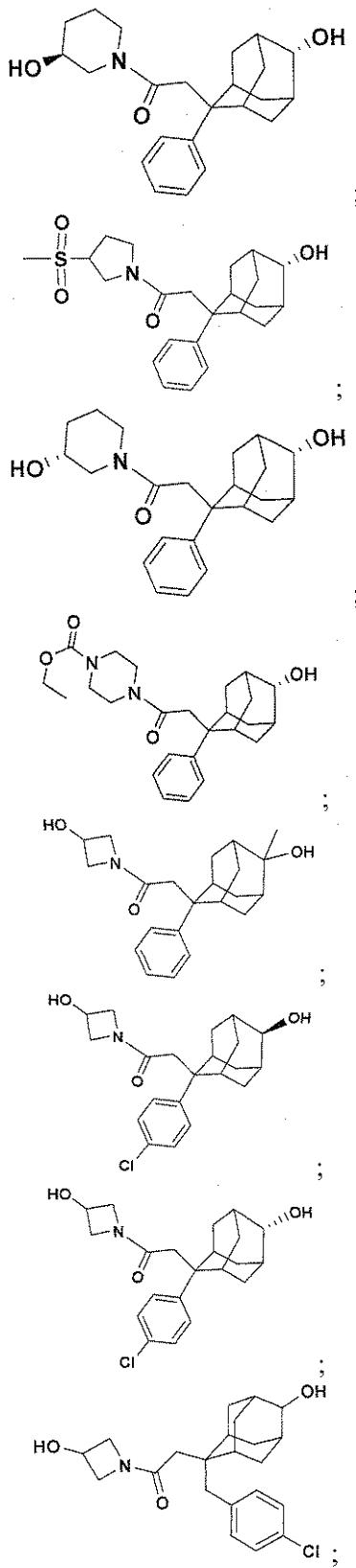
【化 3 1】



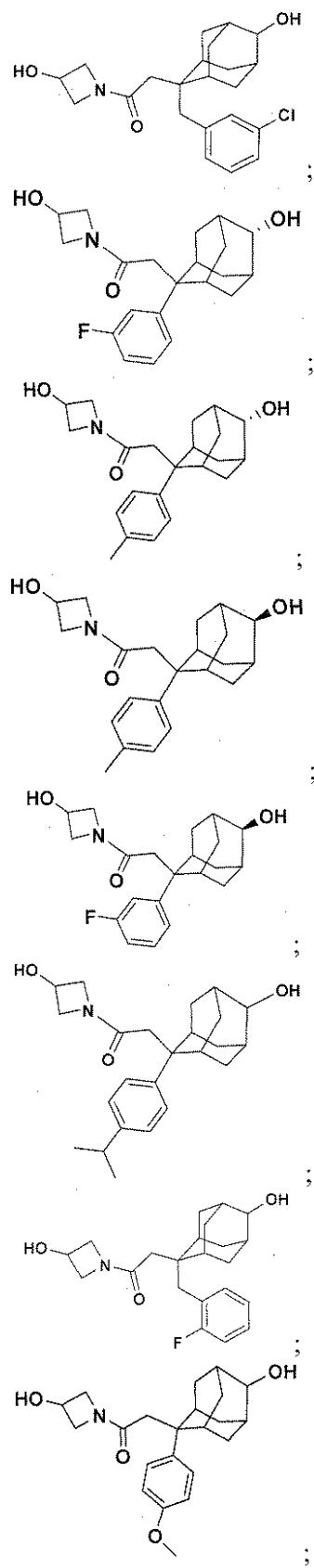
【化 3 2】



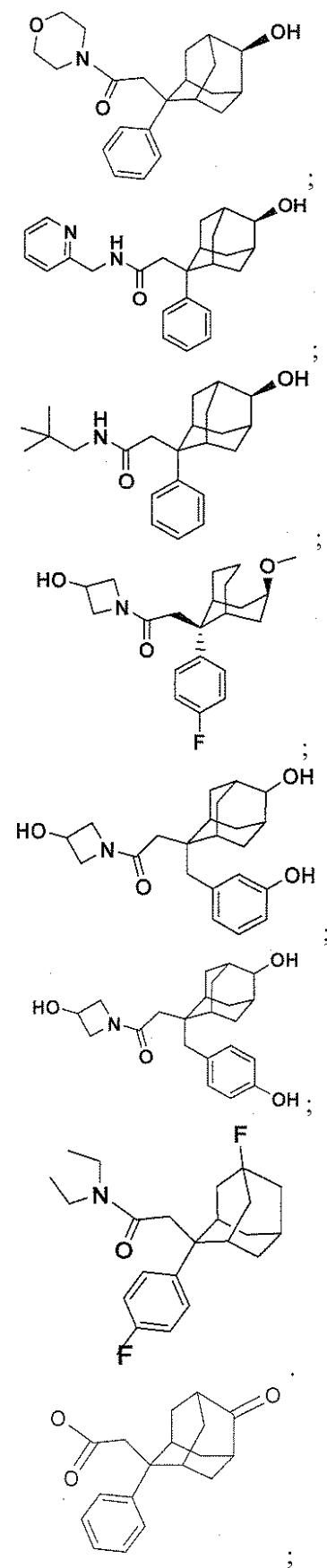
【化 3 3】



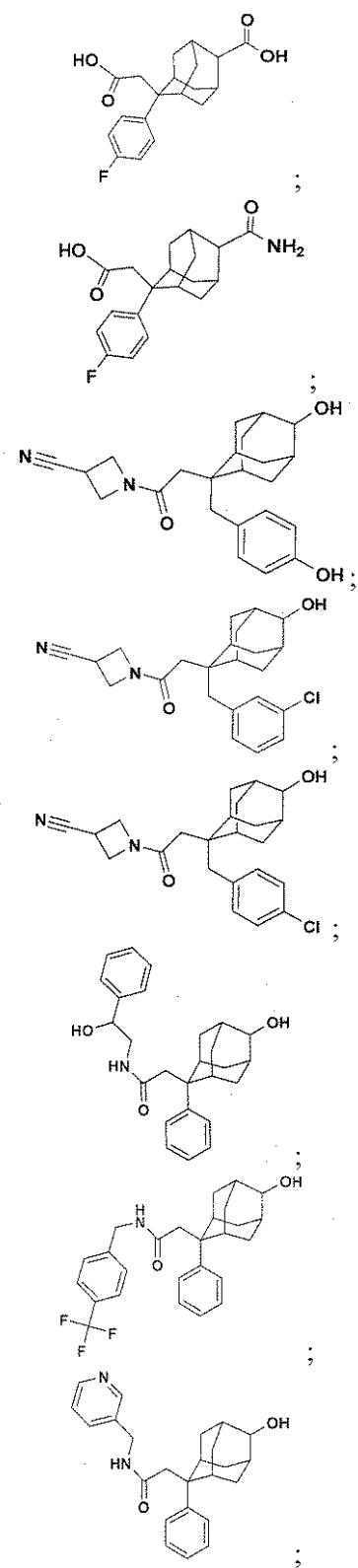
【化 3 4】



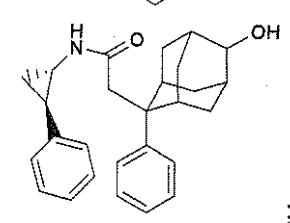
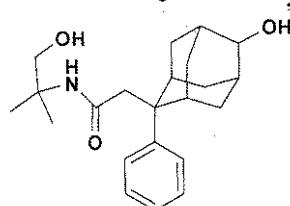
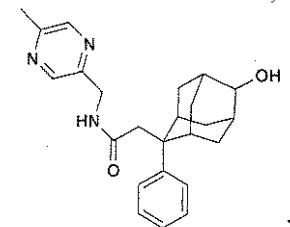
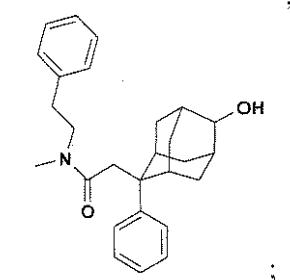
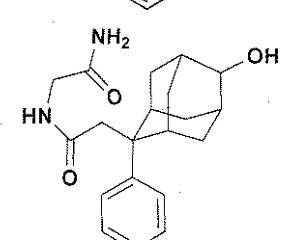
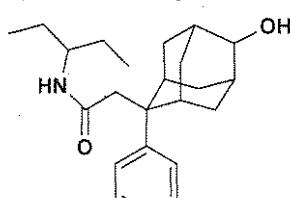
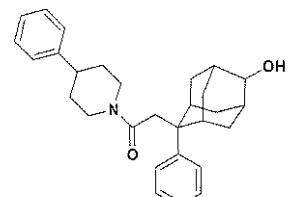
【化 3 5】



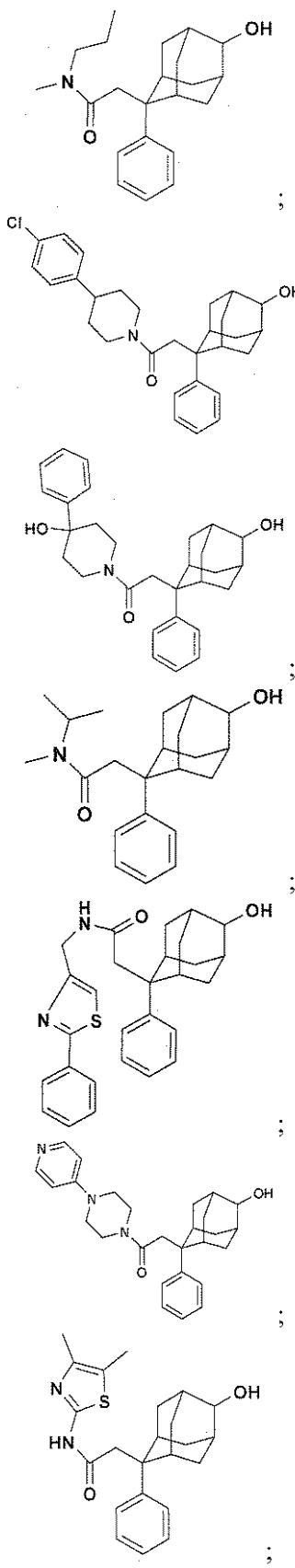
【化 3 6】



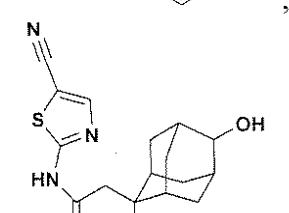
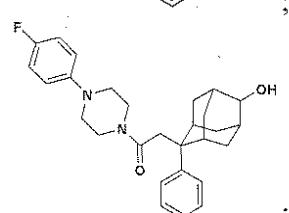
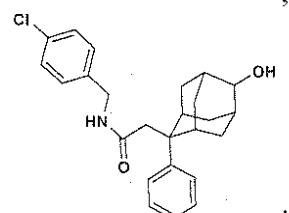
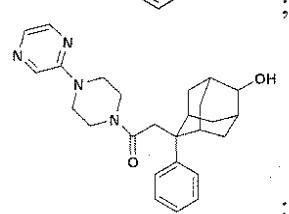
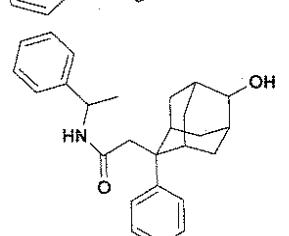
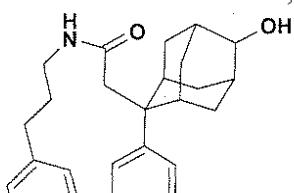
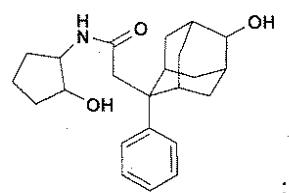
【化 3 7】



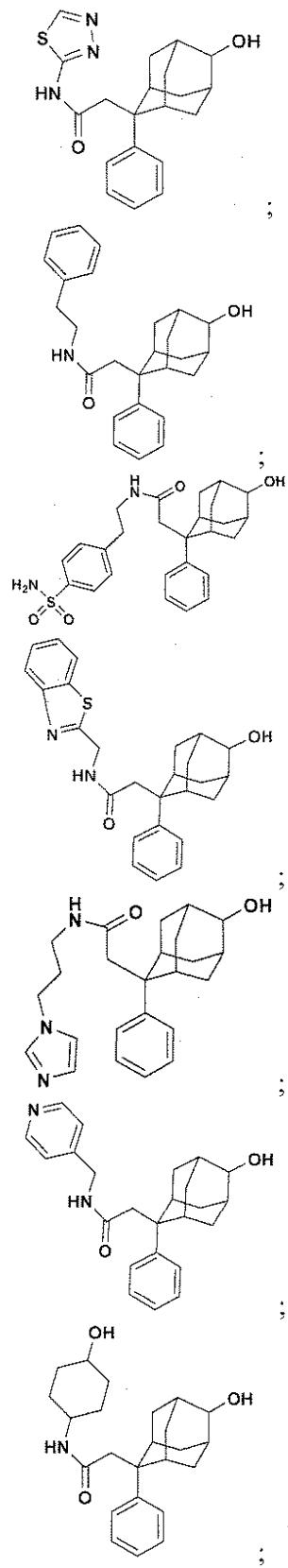
【化 3 8】



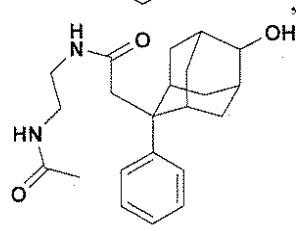
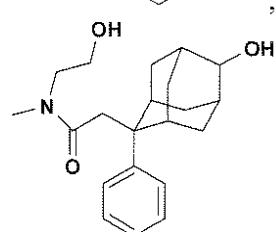
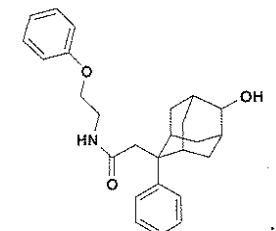
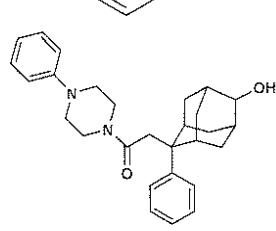
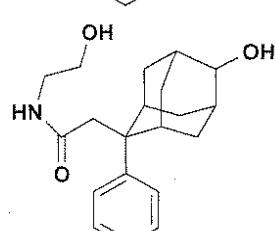
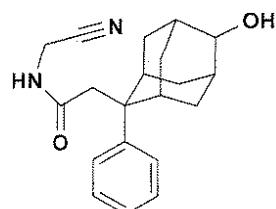
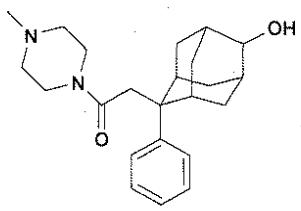
【化 3 9】



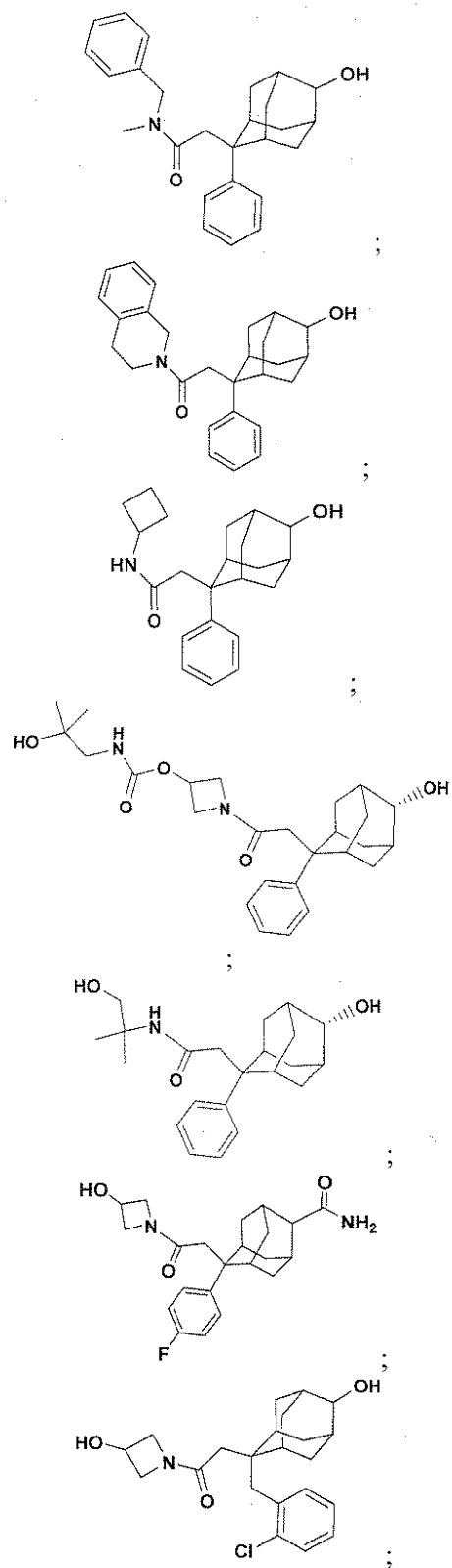
【化 4 0】



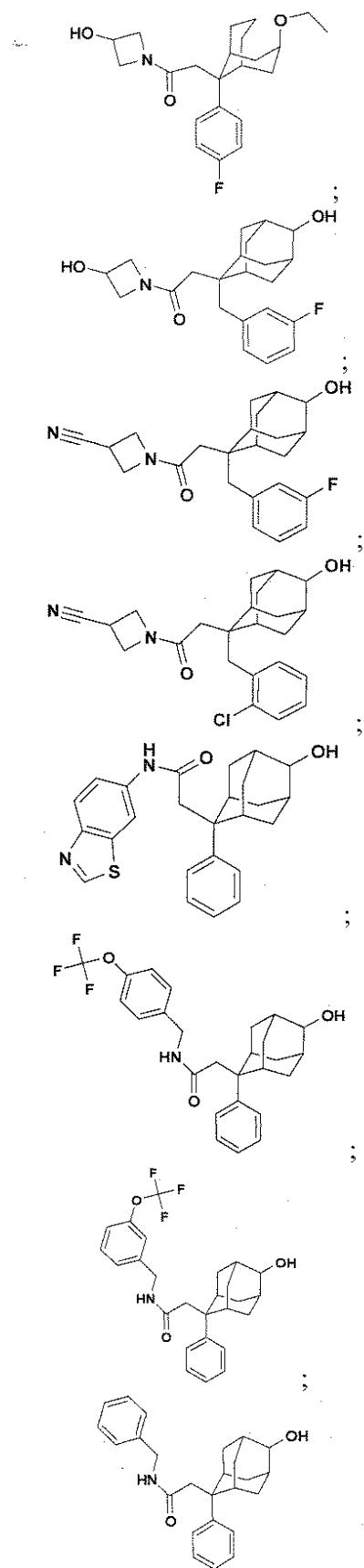
【化 4 1】



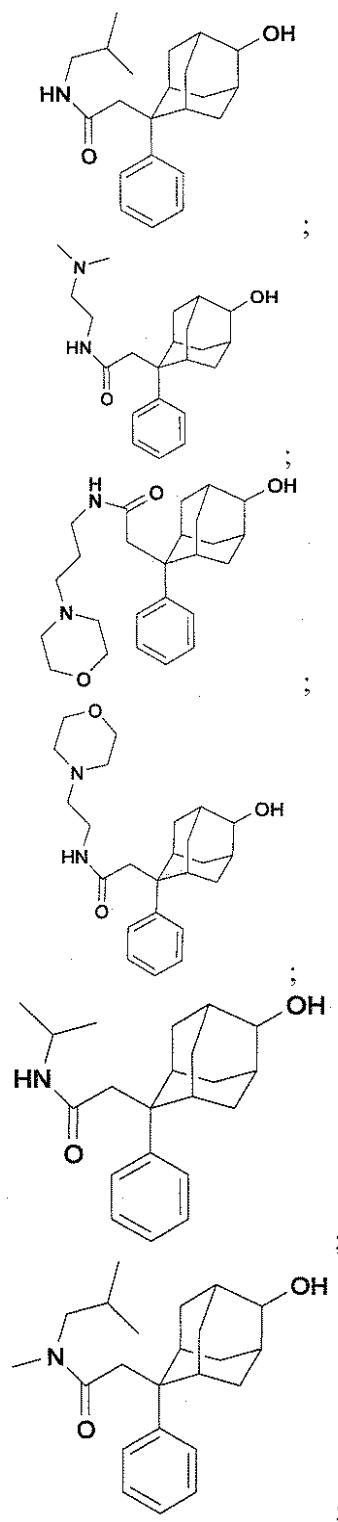
【化42】



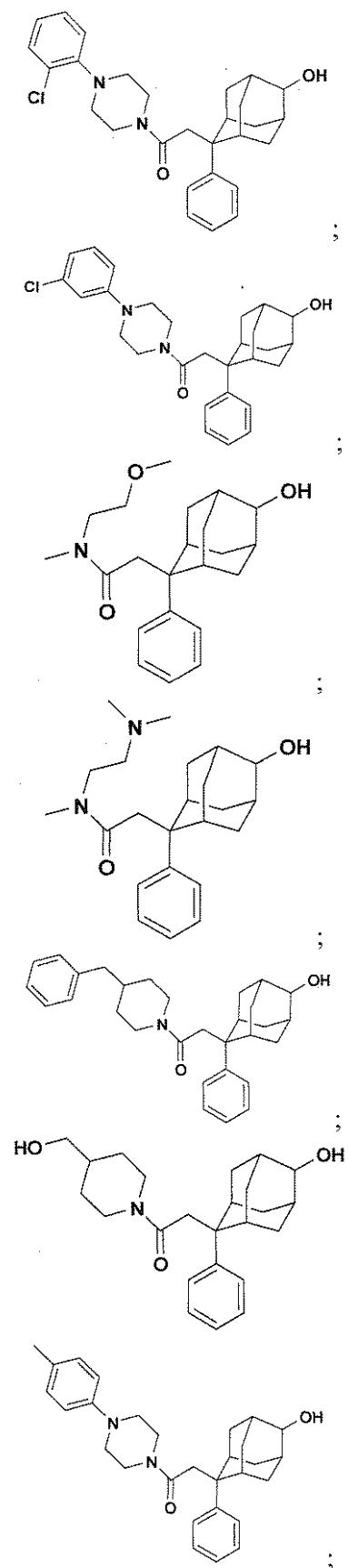
【化 4 3】



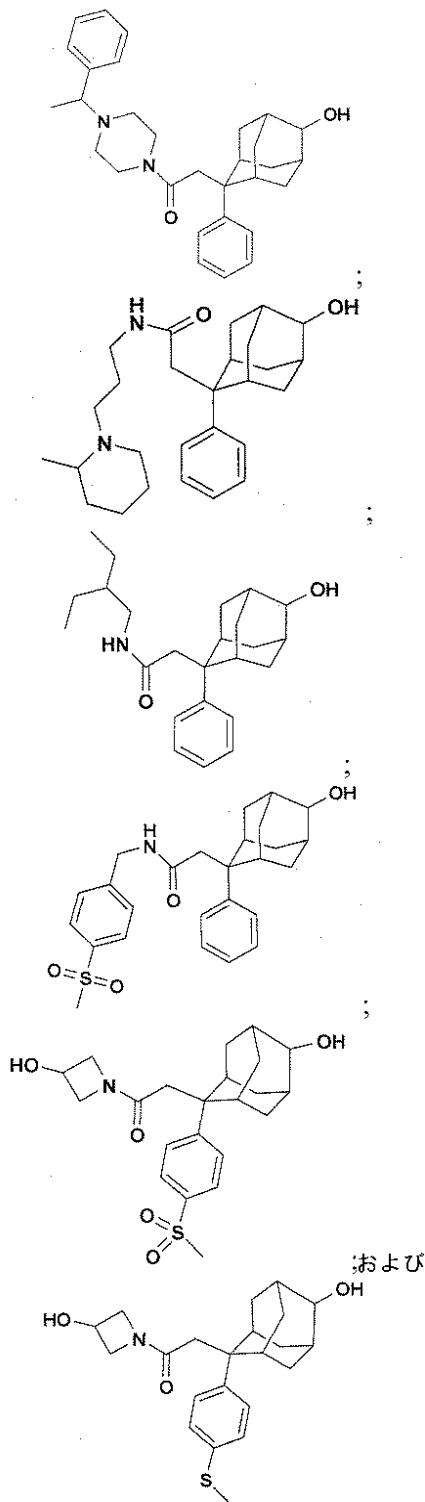
【化 4 4】



【化 4 5】



【化46】



【請求項13】

請求項1に記載の化合物、ならびに適宜、医薬的に許容される担体および／または少なくとも1個の追加の治療剤を含む、医薬組成物。

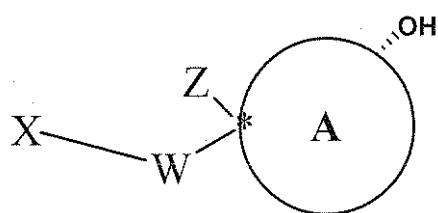
【請求項14】

糖尿病、高血糖、肥満、脂質代謝異常、高血圧、認知障害、関節リウマチ、骨関節炎、緑内障、クッシング病および代謝症候群を治療し、予防し、またはその進行を遅らせるための医薬の製造における、請求項1に記載の化合物の少なくとも1つの使用。

【請求項15】

式I-hまたはI-i：

【化 4 7】



111

または

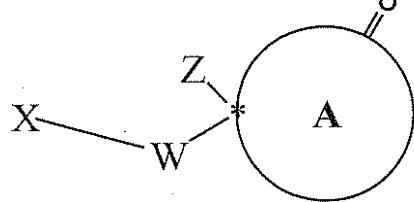
The diagram shows a large circle labeled 'A' representing a molecule. Four lines extend from the circumference of the circle to the left, representing substituents. The top-right substituent is labeled 'OH'. The other three substituents are labeled 'X', 'W', and 'Z', with 'Z' being the top-most substituent.

11

[式中、A、X、WおよびZは、請求項1に定義される]の化合物の調製方法であって、式I f:

化 4 8

11 + 8



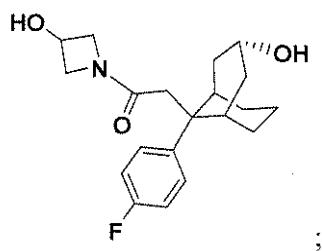
If

のラセミ化合物を、ピキア、ハンゼヌラ、カンジダまたはロドトルラからなる群から選択される微生物によって生成された酵素レダクターゼ（例えばケトレダクターゼ）で還元することを特徴とする、該方法。

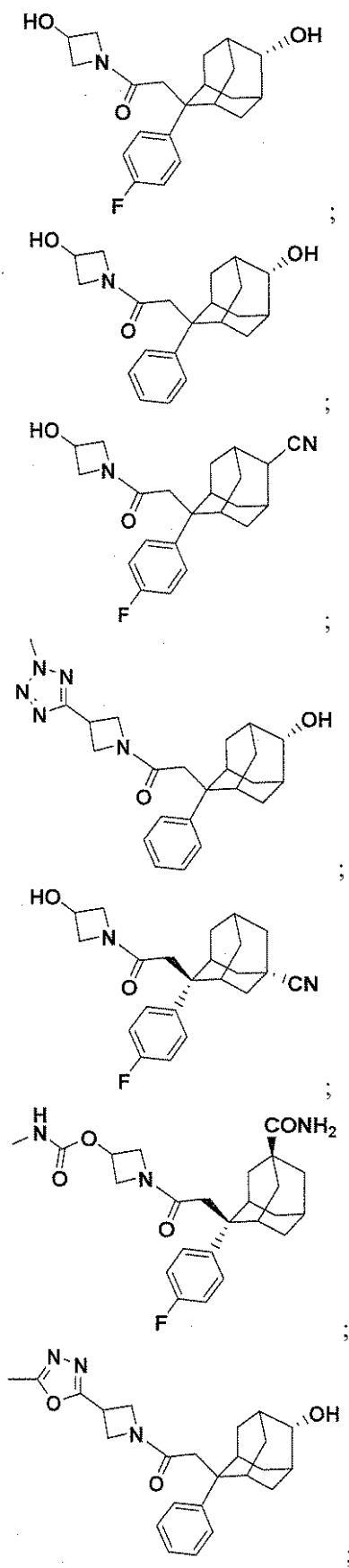
【請求項 16】

下式の化合物からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

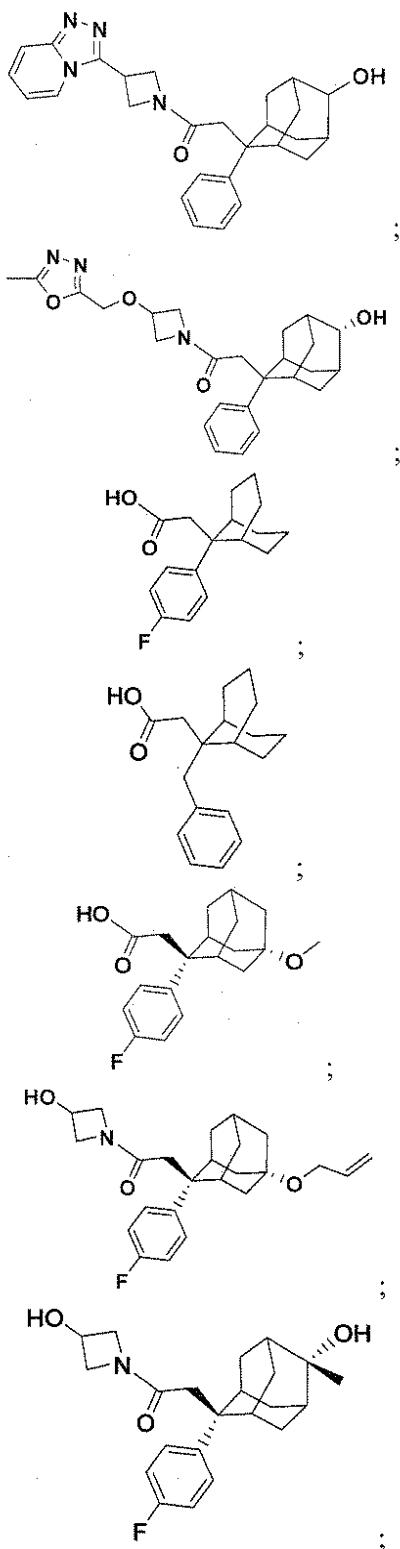
【化 4 9】



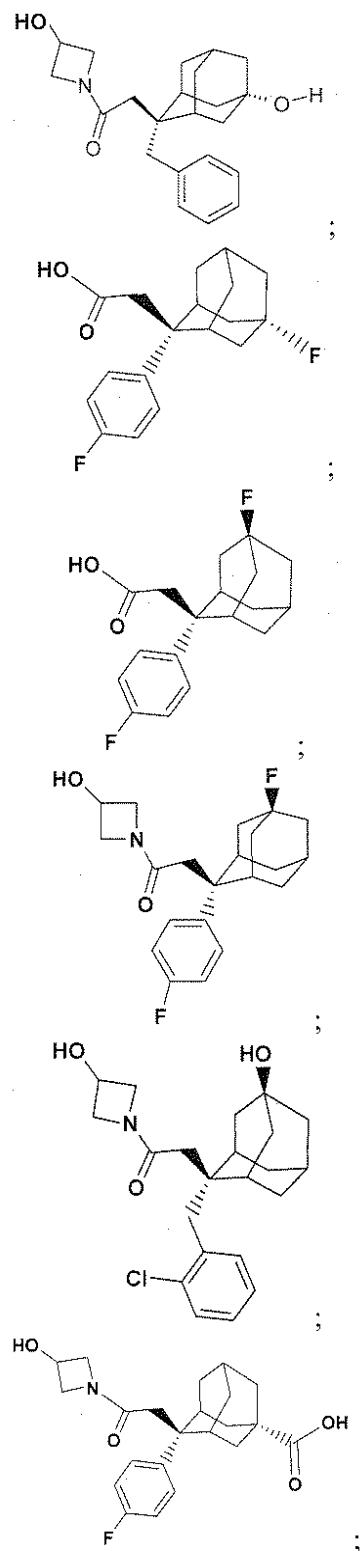
【化 5 0】



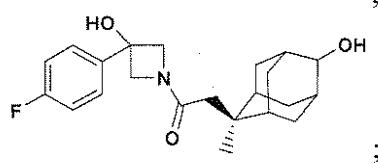
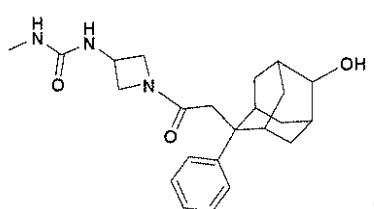
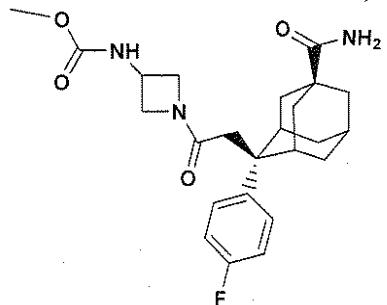
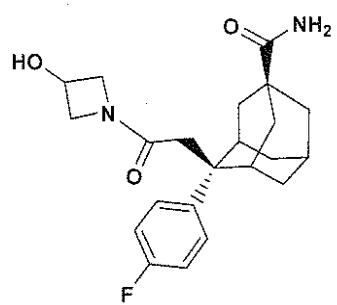
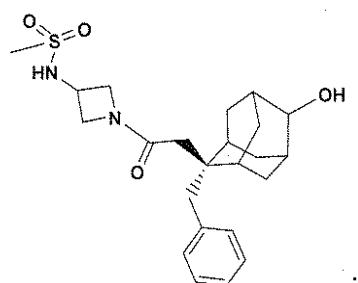
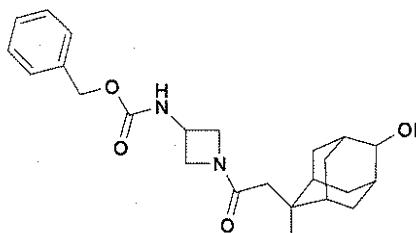
【化 5 1】



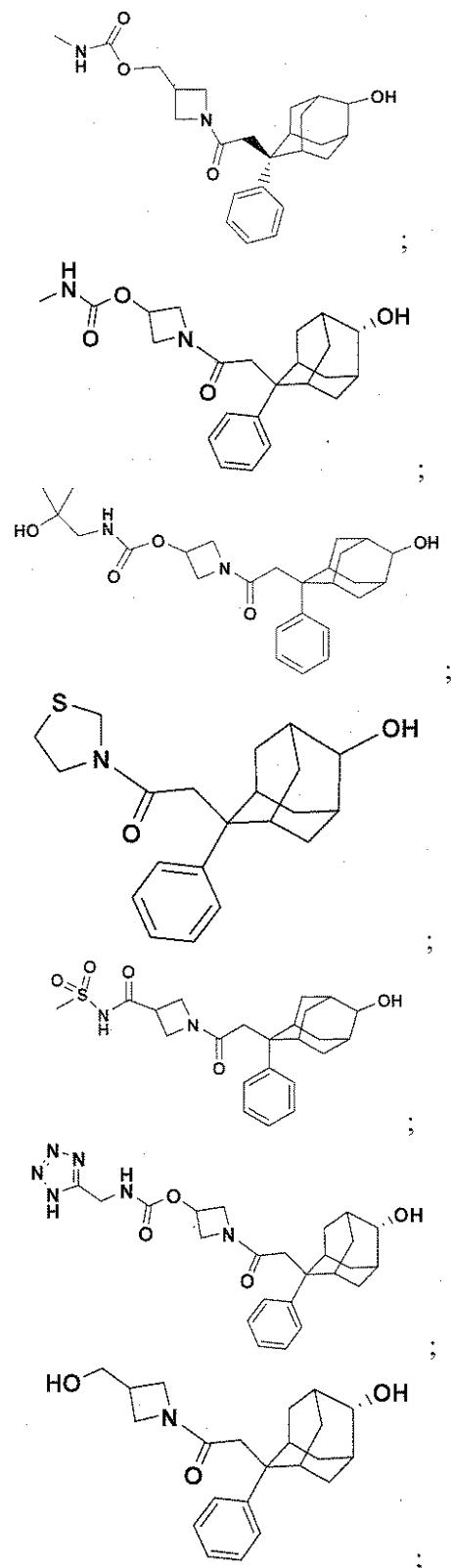
【化 5 2】



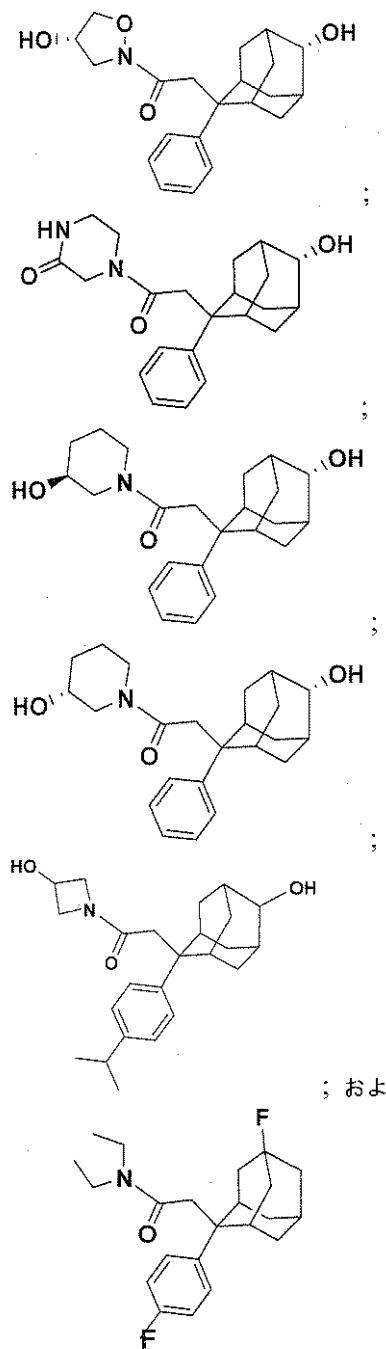
【化 5 3】



【化 5 4】



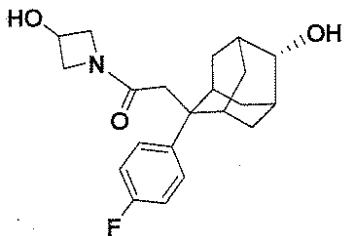
【化 5 5】



【請求項 1 7】

下式：

【化 5 6】



の化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、溶媒和物、もしくは塩。

【請求項 1 8】

請求項 1 7 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 19】

医薬的に許容される担体をさらに含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

少なくとも 1 つの追加の治療剤をさらに含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。

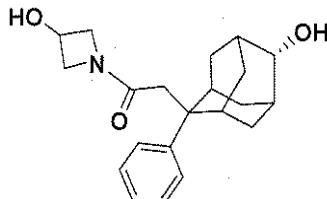
【請求項 21】

糖尿病、高血糖、肥満、脂質代謝異常、高血圧、認知障害、関節リウマチ、骨関節炎、緑内障、クッシング病および代謝症候群を治療し、予防し、またはその進行を遅らせるための医薬の製造における、請求項 17 に記載の化合物の使用。

【請求項 22】

下式：

【化 57】



の化合物、またはそのエナンチオマー、ジアステレオマー、溶媒和物、もしくは塩。

【請求項 23】

請求項 22 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 24】

医薬的に許容される担体をさらに含む、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

少なくとも 1 つの追加の治療剤をさらに含む、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

糖尿病、高血糖、肥満、脂質代謝異常、高血圧、認知障害、関節リウマチ、骨関節炎、緑内障、クッシング病および代謝症候群を治療し、予防し、またはその進行を遅らせるための医薬の製造における、請求項 22 に記載の化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0117

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0117】

略語

実施例および本明細書における他の箇所において、下記の略語を用いる：

Ph=フェニル

Bn=ベンジル

i-Bu=イソブチル

Me=メチル

Et=エチル

Pr=プロピル

Bn=ベンジル

Bu=ブチル

Cbz=カルボベンジルオキシまたはカルボベンゾキシまたはベンジルオキシカルボニル

B01=2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)-4,5-ジヒドロ-1,3-ジメチル-1H-イミダゾリウム

BOP=2-(1H-ベンゾトリアゾール-1-イル)トリス(ジメチルアミノ)ホスホニウム ヘキサフルオロホスファート

CBMIT=1,1'-カルボニルビス(3-メチルイミダゾリウム)トリフラート

CDI=1,1'-カルボニルジイミダゾール
 CMBI=2-クロロ-1,3-ジメチル-1H-ベンズイミダゾリウムヘキサフルオロホスファート
 DCC=1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド
 DCM=ジクロロメタン
 DEAD=アゾジカルボン酸ジエチル
 DIAD=アゾジカルボン酸ジイソプロピル
 DIC=1,3-ジイソプロピルカルボジイミド
 DIEA=N,N-ジイソプロピルエチルアミン
 DMA=N,N-ジメチルアセチルアミド
 DMAP=4-(ジメチルアミノ)ピリジン
 DMPU=N,N'-ジメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ-2(1H)-ピリミジノン
 DMF=N,N-ジメチルホルムアミド
 DMSO=ジメチルスルホキシド
 EtOAc=酢酸エチル
 EDC / EDCI / EDAC=3-エチル-3'-(ジメチルアミノ)プロピル-カルボジイミド塩酸塩（または1-[(3-(ジメチル)アミノ)プロピル]-3-エチルカルボジイミド塩酸塩）
 HBTU=1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-ベンゾトリアゾリウムヘキサフルオロホスファート(1-)3-オキシド
 HOAc または AcOH=酢酸
 HOAT=1-ヒドロキシ-7-アザベンゾトリアゾール
 HOBT=1-ヒドロキシベンゾトリアゾール
 HRMS=高分解能マススペクトル
 LAH=水素化アルミニウムリチウム
 LDA=リチウムジイソプロピルアミド
 LiN(TMS)₂=リチウムビス(トリメチルシリル)アミド
 mCPBA=3-クロロペルオキシ安息香酸
 MsCl=塩化メタンスルホニル
 Nf=ノナフルオロ-1-ブタンスルホニル
 Nf-F=ノナフルオロ-1-ブタンスルホニルフルオリド
 NMP=N-メチルピロリドン
 NBS=N-ブロモコハク酸イミド
 n-BuLi=n-ブチルリチウム
 Pd / C=パラジウム炭素
 PtO₂=酸化白金
 PyBOP=ベンゾトリアゾール-1-イルオキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスファート
 SOCl₂=塩化チオニル
 TBAF=フッ化テトラブチルアンモニウム
 TBS=tert-ブチルジメチルシリル
 TBTU=0-ベンゾトリアゾリルテトラメチルイソウロニウムテトラフルオロボラート
 Tf=トリフルオロメタンスルホニル
 TMS=トリメチルシリル
 TEA=トリエチルアミン
 TFA=トリフルオロ酢酸
 THF=テトラヒドロフラン
 TOSMIC=トリルメチルイソシアニド
 equiv=当量
 min=分
 h または hr = 時間
 L=リットル

mL = ミリリットル

μL = マイクロリットル

g = グラム

mg = ミリグラム

mol = モル

mmol = ミリモル

meq = ミリ当量

RT = 室温

sat または sat'd = 饱和

aq. = 水性

TLC = 薄層クロマトグラフィー

HPLC = 高速液体クロマトグラフィー

HPLC R_t = HPLC 保持時間

LC/MS = 高速液体クロマトグラフィー/質量分析

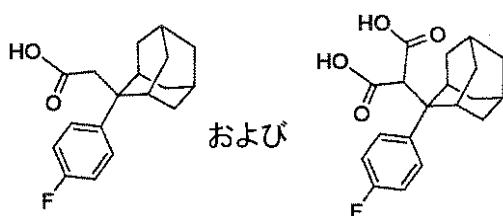
MS または Mass Spec = 質量分析

NMR = 核磁気共鳴

実施例1および2

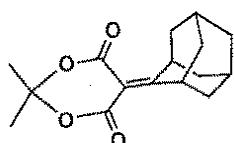
それぞれ、2-(4'-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカン-2-酢酸、および2-(4'-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカ-2-イル-プロパン二酸

【化29】



化合物1A. 5-(2-アダマンチリデン)-2,2-ジメチル-1,3-ジオキサン-4,6-ジオン

【化30】



【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0118

【補正方法】変更

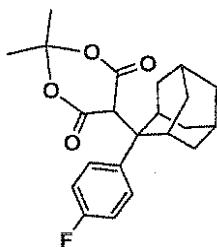
【補正の内容】

【0118】

この物質はAldrich社から市販されている。それはまた、下記の方法を用いて合成することもできる：2-アダマンタノン(1.5g、10mmol)、メルドラム酸(1.73g、12mmol)、および触媒量のピペリジン(5滴)の無水ピリジン(10mL)中溶液をアルゴン下で5日間攪拌した。この時間の後、該溶液を氷水(30mL)に注ぎ、該生じた混合物を室温で20分間攪拌した。この間の終わりに、該生じた沈殿物を濾過して集め、冷水(15mL)で洗浄した。該生じた固体を真空で乾燥して、化合物1A(2.43g、収率88%)を白色固体として得た。

化合物1B. 2,2-ジメチル-5-(2-(4'-フルオロフェニル)トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカ-2-イル)-1,3-ジオキサン-4,6-ジオン

【化31】



【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0128

【補正方法】変更

【補正の内容】

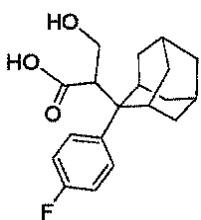
【0128】

攪拌した2-アダマンタンカルボン酸(114.5mg、0.635mmol)の無水THF(6mL)中溶液に、-40℃、アルゴン下でLDA(0.79mL、1.588mmol)、続いてDMPU(93μL、0.688mmol)をゆっくり加えた。添加が完了次第、該混合物を徐々に室温にまで放温しながら、1時間攪拌した。この時間の後、該反応混合物を0℃に冷却し、臭化ベンジル(83μL、0.699mmol)を加えた。該生じた混合物を2時間かけて室温に加温した。所定の温度となったら、HCl水溶液(1mL、1N)を加えて該反応をクエンチした。該反応混合物をEtOAc(3×5mL)で抽出し、該有機層を合わせて、乾燥し(Na₂SO₄)、その後、濃縮して、粗生成物を得た。該粗生成物をカラムクロマトグラフィー(SiO₂、2%MeOH/CH₂Cl₂(0.1%HOAc含有))によって精製し、不純物の少ない生成物を得た。この不純物の少ない生成物をさらにプレパラティブHPLCによって精製し、実施例5(29mg、収率17%)を白色固体として得た。HPLC Rt(方法A): 7.301分; ¹H NMR(400MHz, CDCl₃) ppm 7.17 - 7.26(m, 3H), 7.09 - 7.15(m, 2H), 3.08(s, 2H), 2.27(d, J=11.9Hz, 2H), 2.14(s, 2H), 1.83 - 1.98(m, 4H), 1.69 - 1.79(m, 6H).

実施例6

2-(4-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカン-2-ヒドロキシメチル-2-酢酸

【化39】



化合物6A. 2-(4-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカン-2-ベンジルオキシ-2-酢酸

【化40】



【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0134

【補正方法】変更

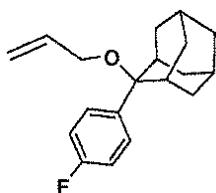
【補正の内容】

【0 1 3 4】

2-アダマンタノン(1.214g、8.081 mmol)のTHF(10mL)中溶液に室温で4-フルオロフェニルマグネシウムプロミド(4.45mL、8.89mmol、2.0M Et₂O中)をゆっくり加えた。該反応混合物を65℃に加熱しながら、それを1時間攪拌した。この時間の後、該反応混合物を室温になるまで放冷し、NH₄Cl(飽和水溶液、10mL)でクエンチし、その後、Et₂O(2×20mL)で抽出した。該有機層を合わせて、H₂Oおよび食塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥し、濾過した。該濾液を減圧下で濃縮して、化合物8A(1.59g、80%)を淡黄色固体として得た。

化合物8B. 2-アリルオキシ-2-(4-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_{3,7}]デカン

【化46】



【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 7】

実施例8を、化合物8Cおよび他の適当な試薬を利用して、実施例4に記載の方法と同様に調製した。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.38 - 7.49(m, 2 H), 6.97 - 7.16(m, 2 H), 3.59(s, 2 H), 2.63(s, 2 H), 2.23(s, 2 H), 1.94(s, 1 H), 1.56 - 1.84(m, 10 H); H R_M(ESI): C₁₈H₂₀O₃Fの計算値: 303.1396、実測値: 303.1401.

実施例9

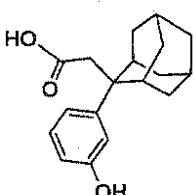
2-(3'-シアノフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_{3,7}]デカン-2-酢酸

【化48】



化合物9A. 2-(3'-ヒドロキシフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_{3,7}]デカン-2-酢酸

【化49】



【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 8

【補正方法】変更

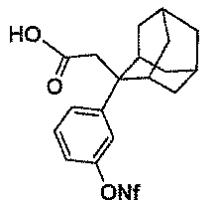
【補正の内容】

【0138】

2-(3'-メトキシフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカン-2-酢酸(199mg、0.667mmol)、実施例1に記載の方法に従って調製した)のCH₂Cl₂(5mL)中溶液に、-78°、アルゴン下でBBr₃(1.33mL、1.33mmol、1M CH₂Cl₂中溶液)を加えた。該混合物を慎重に室温に加温し、その後、室温で2時間攪拌した。この時間が完了したら、該反応混合物を飽和NaHCO₃(水溶液、1mL)でクエンチし、その後、該溶媒を蒸発乾固して、残渣を得た。該残渣をプレパラティブHPLCによって精製し、化合物9A(152.7mg、収率80%)を白色固体として得た。HPLC Rt(方法A): 5.480分; ¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) ppm 7.11(t, J=7.9 Hz, 1 H), 6.84(d, J=8.8 Hz, 1 H), 6.74 - 6.80(m, 1 H), 6.60(dd, J=7.9, 1.8 Hz, 1 H), 3.04(br. 1 H), 2.37 - 2.65(m, J=31.2 Hz, 3 H), 2.14(s, 2 H), 1.83 - 1.96(m, 3 H), 1.77(d, J=13.6 Hz, 3 H), 1.62 - 1.72(m, 4 H), 1.53(d, J=12.3 Hz, 2 H).

化合物9B.

【化50】



【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0150

【補正方法】変更

【補正の内容】

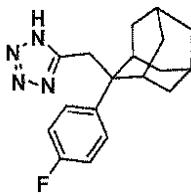
【0150】

攪拌した実施例13(14.4mg、0.047mmol)の無水THF(1.0mL)中溶液に室温、アルゴン下でメチルマグネシウムブロミド(0.4mL、0.56mmol、1.4M THF中)を加えた。添加が完了次第、該反応混合物を65°に加熱しながら、それを1時間攪拌した。この時間の後、該溶媒を減圧下で除去して、残渣を得た。該残渣をプレパラティブHPLCによって精製し、実施例18(7.2mg、収率48%)を白色固体として得た。HPLC Rt(方法B): 7.00分; HRMS(ESI): C₁₉H₂O₃Fの計算値: 317.1553、実測値: 317.1544; ¹H NMR(400 MHz, CD₃OD) ppm 7.41 - 7.56(m, 1 H), 7.19 - 7.32(m, 1 H), 6.83 - 7.04(m, 2 H), 3.11(d, J=13.6 Hz, 1 H), 2.76 - 2.91(m, 1 H), 2.39 - 2.52(m, 3 H), 2.32(d, J=13.6 Hz, 1 H), 2.19(dd, J=14.3, 2.7 Hz, 1 H), 1.81 - 2.03(m, 3 H), 1.70 - 1.81(m, 2 H), 1.57 - 1.67(m, 1 H), 1.51(s, 1 H), 1.35(s, 3 H).

実施例19

2-(4-フルオロフェニル)-2-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)アダマンタン

【化55】



化合物19A. 2-(4-フルオロフェニル)-トリシクロ[3.3.1.1_3,7]デカン-2-アセトアミド

【化 5 6】

