

【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21年10月15日(2009.10.15)

【公表番号】特表2009-507034(P2009-507034A)

【公表日】平成21年2月19日(2009.2.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-007

【出願番号】特願2008-529336(P2008-529336)

【国際特許分類】

C 07 D 223/16	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 15/08	(2006.01)
A 61 P 15/10	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/30	(2006.01)

【F I】

C 07 D 223/16	C S P Z
A 61 K 31/55	
C 07 D 417/12	
C 07 D 413/12	
C 07 D 401/12	
C 07 D 417/14	
C 07 D 403/12	
C 07 D 409/12	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 3/04	
A 61 P 15/08	
A 61 P 15/10	
A 61 P 25/02	1 0 3
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/18	
A 61 P 25/20	

A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/30

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月24日(2009.8.24)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

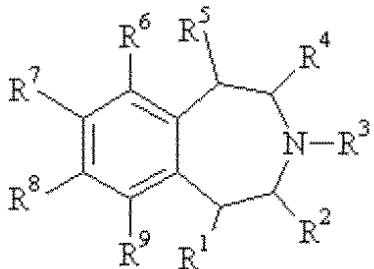
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



(I)

で示される化合物又はその薬理学的に許容できる塩:

[式中、

R¹は水素であり；R²、R³及びR⁴は各々独立に水素であり；R⁵は水素であり；R⁶は-NR¹⁰R¹¹であり；R⁷は水素、ハロ、シアノ、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁～C₆)アルキル基、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₂～C₆)アルケニル基、1～4個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₃～C₇)シクロアルキル基、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁～C₆)アルコキシ基、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁～C₆)アルキルチオ基、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいPh¹-(C₀～C₃)アルキル基、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいPh¹-(C₀～C₃)アルキル-O-基、又は1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいPh¹-(C₀～C₃)アルキル-S-基であり；R⁸は水素であり；R⁹は水素であり；R¹⁰はPh²-(C₁～C₃)～n～アルキル又はAr¹-(C₁～C₃)～n～アルキルであり、n～アルキル部分は(C₁～C₃)アルキル基、ジメチル基、gem-エタノ基又は1～2個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよく；R¹¹は水素、1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁～C₃)アルキル基、又はアリルであり；Ph¹は1～5個の独立に選択されたハロ置換基によって、又はハロ、シアノ、-SCF₃、1～6のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい(C₁～C₆)アルキル基、及び1～6のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい(C₁～C₆)アルコキシ基か

らなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基によって任意に置換されてもよいフェニル基であり；

P h²は R¹²で置換され、ハロ、シアノ、- S C F₃、メチル、- C F₃、メトキシ、- O C F₃、ニトロ基及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 1 又は 2 個の置換基で更に任意に置換されてもよい、フェニル基であり；

A r¹はハロ、シアノ、メチル、- C F₃、ヒドロキシ及びメトキシ基からなる群から独立に選択される 1 又は 2 個の置換基で更に任意に置換されてもよい、5 - R¹³ - ピリジン - 2 - イル基又は 6 - R¹³ - ピリジン - 3 - イル基であり；

R¹²は以下からなる群から選択される置換基であり：

- a) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい H e t¹ - (C₀ - C₃) アルキル基、
- b) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい H e t² - (C₀ - C₃) アルキル基、
- c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい H e t³ - (C₀ - C₃) アルキル基、
- d) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい A r² - (C₀ - C₃) アルキル基、
- e) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁴) - 基、
- f) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (R¹⁴)₂ C = C [(C₁ - C₆) アルキル] - 基、
- g) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁵) - 基、
- h) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(R¹⁵) C H = C [(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル] - 基、
- i) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C C - 基、
- j) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C C - 基、
- k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、P h¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- m) ハロ、(C₁ - C₃) アルキル、(C₁ - C₃) アルコキシ、- C F₃、- O - C F₃、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - O - (C₁ - C₃) アルキル - C (O) - 基、
- o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアル

キル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

p) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

q) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

r) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

s) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

t) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

v) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

w) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

y) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

z) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

a a) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

a b) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

a c) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

a d) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロア

ルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₀～C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁～C₃)アルキル-SO₂-基、

a e) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀～C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁～C₃)アルキル-SO₂-基、

a f) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸-NC(O)-(C₁～C₅)アルキル基、

a g) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸-NC(S)-(C₁～C₅)アルキル基、

a h) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₀～C₃)アルキル-S-基、

a i) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃～C₇)シクロアルキル-(C₀～C₃)アルキル-S-(C₁～C₅)アルキル基、

a j) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁～C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀～C₃)アルキル-S-(C₁～C₅)アルキル基、

a k) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁～C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³-(C₀～C₃)アルキル-S-(C₁～C₅)アルキル基、

a l) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁～C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、Ar³-(C₀～C₃)アルキル-O-(C₁～C₅)アルキル基、

a m) Het¹がHet¹の任意の炭素原子を介して結合し、(C₀～C₅)アルキル部分が任意に1～6個のフルオロ置換基で置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Het¹-(C₀～C₃)アルキル-S-(C₀～C₅)アルキル基、

a n) Het¹がHet¹の任意の炭素原子を介して結合し、(C₀～C₅)アルキル部分が任意に1～6個のフルオロ置換基で置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Het¹-(C₀～C₃)アルキル-O-(C₀～C₅)アルキル基、

a o) 1～6個のフルオロ置換基で(C₀～C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で-(C₀～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Het²-(C₀～C₃)アルキル-S-(C₀～C₅)アルキル基、

a p) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁶R¹⁹-N-C(O)-S-(C₀～C₅)アルキル基、

a q) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁶R¹⁹-N-C(O)-O-(C₀～C₅)アルキル基、

a r) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁶R¹⁹-N-C(O)-NR¹⁶-(C₀～C₅)アルキル基、

a s) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁～C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に1～4個のフルオロ置換基で(C₁～C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁～C₆)アルキル-C(O)-(C₁～C₃)アルキル-S-基、

a t) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁～C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁～C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁～C₆)アルキル-SO₂-(C₁～C₃)アルキル-S-基、

a u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₃) アルキル - O - 基、

a v) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₃) アルキル - O - 基、

a w) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

a x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

a y) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₃) アルキル - O - 基、

a z) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

b a) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

b b) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 R¹⁷R¹⁸N - C (O) - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

b c) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 R¹⁷R¹⁸N - C (S) - (C₁ - C₃) アルキル - S - 基、

b d) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 R¹⁷R¹⁸N - C (S) - (C₁ - C₃) アルキル - O - 基、

b e) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、 更に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₅) アルキル基、

b f) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₅) アルキル基、

b g) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 Ar³ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₁ - C₅) アルキル基、

b h) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 Het² - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

b i) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 R¹⁷R¹⁸N - (C₁ - C₃) アルキル基、

b j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 (C₁ - C₆) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、P h¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、A r³ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、P h¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b q) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、A r³ - (C₀ - C₃) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b r) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₆) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - O - N = C (C H₃) - 基、

b s) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₆) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₀ - C₃) アルキル - O - N = C [(C₁ - C₆) アルキル] - 基、

b t) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、H O - N = C [(C₀ - C₁) アルキル - (C₃ - C₇) シクロアルキル] - 基、

b u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、C H₃ - O - N = C [(C₀ - C₁) アルキル - (C₃ - C₇) シクロアルキル] - 基；

R¹³ は以下からなる群から選択され：

a) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、H e t² - (C₀ - C₃) アルキル基、

b) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、H e t³ - (C₀ - C₃) アルキル基、

c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、A r² - (C₀ - C₃) アルキル基、

d) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁴) - 基、

e) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、(R¹⁴)

$_2\text{C} = \text{C} [(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル}] - \text{基}$ 、

f) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{C}(\text{R}^{14}) = \text{C}(\text{R}^{15})$ - 基、

g) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $(\text{R}^{15})\text{CH} = \text{C} [(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル}] - \text{基}$ 、

h) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{C}(\text{C})$ - 基、

i) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - $(\text{C}_0 - \text{C}_1)$ アルキル - C - 基、

j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、更に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ar}^3 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

n) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Het}^2 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、更に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{C}(\text{O}) - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{C}(\text{O}) - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

q) ハロ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキル基、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルコキシ基、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{O}-\text{C}\text{F}_3$ 、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{C}(\text{O}) - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

r) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{C}(\text{O}) - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキル - O - 基、

s) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分

のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

t) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

u) ハロ、(C₁ - C₃)アルキル基、(C₁ - C₃)アルコキシ基、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

v) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

w) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - C(S) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - S - 基、

y) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

z) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a a) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a b) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a d) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a e) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a f) ハロ、(C₁ - C₃)アルキル基、(C₁ - C₃)アルコキシ基、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a g) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a h) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - C(S) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a i) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

a j) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

a k) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

a l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

a m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Hett² - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

a n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸-N-C(O) - (C₁ - C₅) アルキル基、

a o) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸-N-C(S) - (C₁ - C₅) アルキル基、

a p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - (C₁ - C₃) アルキル基、

a q) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C(O) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a r) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C(O) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a s) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a t) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a u) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C(S) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a v) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C(S) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a w) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(S) - N(R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

a x) 任意に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃) アルキル部分にて置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換され

てもよい、 $A r^3 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(S) - N(R^{16}) - (C_0 - C_5)$ アルキル基；

R^{14} は水素、又は1～5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_2$)アルキル基であり；

R^{15} は水素、又は1～3個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいメチル基であり；

R^{16} は水素、又は1～5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_3$)アルキル基であり；

R^{17} は1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_6$)アルキル基、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい $P h^1 - (C_1 - C_3)$ アルキル基、又は独立にメチル基及びフルオロ基から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい($C_3 - C_7$)シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル基であり；

R^{18} は水素又は($C_1 - C_3$)アルキルであるか、又は R^{17} 及び R^{18} はそれらが結合する窒素原子と一緒にになって1又は2のメチル置換基で任意に置換されてもよい $H e t^1$ 、イミダゾリジン - 2 - オニル基、イミダゾリジン - 2, 4 - ジオニル基又はテトラヒドロピリミジン - 2 - オニル基を形成し；

R^{19} は1～5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_3$)アルキル基であり；

$A r^2$ はピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリミジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、チオフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、当該ヘテロ環は $H_2N -$ 、 $R^{15}R^{17}N -$ 、 $R^{17}NH - C(O) -$ 、 $R^{17}C(O)NH -$ 、 $R^{17}O - C(O)NH -$ 、 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $C(O) -$ 、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) -$ 、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル、N - 結合 $H e t^1$ 及びN - 結合 $H e t^1 - C(O) -$ からなる群から選択される置換基で置換され、それらはメチル、シアノ、ハロ及びトリフルオロメチル基からなる群から選択される置換基で更に任意に置換されてもよく；

$A r^3$ はピロリル、フラニル、チオフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル及びピリジル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、いずれも独立にハロ、($C_1 - C_3$)アルキル、($C_1 - C_3$)アルコキシ、- $C F_3$ 、- $O - C F_3$ 、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく；

$H e t^1$ はピロリジニル、ピペリジニル、ホモピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ホモモルホリニル及びホモチオモルホリニル基からなる群から選択される、飽和窒素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも($C_1 - C_6$)アルキル基又は2つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

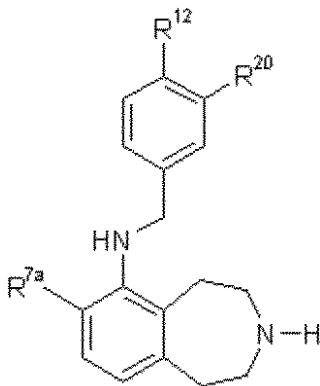
$H e t^2$ はテトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニル基からなる群から選択される、飽和酸素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも($C_1 - C_6$)アルキル基又は2つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

$H e t^3$ はピロリジン - 2 - オニル、ピペリジン - 2 - オニル、オキサゾリジン - 2 - オニル、ピロリン - 2 - オニル及びジヒドロピリジン - 2 - オニル基からなる群から選択される、窒素含有ヘテロ環である]。

【請求項2】

式(Ia)：

【化2】



Ia

(Ia)

[式中、

R^{7a}はハロゲンであり；R¹²は以下からなる群から選択される置換基であり：a) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよいH e t¹-(C₀-C₃)アルキル基、b) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよいH e t²-(C₀-C₃)アルキル基、c) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよいH e t³-(C₀-C₃)アルキル基、d) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよいA r²-(C₀-C₃)アルキル基、e) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい(C₁-C₆)アルキル-C(R¹⁴)=C(R¹⁴)-基、f) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい(R¹⁴)₂C=C[(C₁-C₆)アルキル]-基、g) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-C(R¹⁴)=C(R¹⁵)-基、h) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(R¹⁵)CH=C[(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル]-基、i) 1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい(C₁-C₆)アルキル-C-C-基、j) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-C-C-基、k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-C(O)-(C₁-C₅)アルキル基、l) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-C(O)-(C₁-C₅)アルキル基、m) ハロ、(C₁-C₃)アルキル、(C₁-C₃)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、

ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から独立に選択される1～3個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル-(C₀-C₃)アルキル-C(O)-(C₁-C₅)アルキル基、

n) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

p) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

q) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

r) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

s) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

t) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

v) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-NR¹⁶-(C₁-C₃)アルキル-C(O)-基、

w) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

y) 1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹-(C₀-C₃)アルキル-O-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

z) 1～6個のフルオロ置換基で(C₁-C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基で(C₁-C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁-C₆)アルキル-S-(C₁-C₃)アルキル-SO₂-基、

a a) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1～4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1～4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃-C₇)シクロアルキル-(C

$\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル - S - ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル - SO_2 - 基、

a b) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - S - ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル - SO_2 - 基、

a c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_1 - \text{C}_6$) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、($\text{C}_1 - \text{C}_6$) アルキル - NR^{16} - ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル - SO_2 - 基、

a d) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、($\text{C}_3 - \text{C}_7$) シクロアルキル - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル - NR^{16} - ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル - SO_2 - 基、

a e) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - NR^{16} - ($\text{C}_1 - \text{C}_3$) アルキル - SO_2 - 基、

a f) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{R}^{17}\text{R}^{18} - \text{NC(O)} - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

a g) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{R}^{17}\text{R}^{18} - \text{NC(S)} - (\text{C}_1 - \text{C}_5)$ アルキル基、

a h) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、($\text{C}_3 - \text{C}_7$) シクロアルキル - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル - S - 基、

a i) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、($\text{C}_3 - \text{C}_7$) シクロアルキル - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル - S - ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル基、

a j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - S - ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル基、

a k) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{Ar}^3 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - S - ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル基、

a l) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{Ar}^3 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - O - ($\text{C}_1 - \text{C}_5$) アルキル基、

a m) He^t が He^t の任意の炭素原子を介して結合し、($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル部分が任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{He}^t - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - S - ($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル基、

a n) He^t が He^t の任意の炭素原子を介して結合し、($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル部分が任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{He}^t - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - O - ($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル基、

a o) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で - ($\text{C}_0 - \text{C}_3$) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $\text{He}^t - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - S - ($\text{C}_0 - \text{C}_5$) アルキル基、

a p) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{R}^{16}\text{R}^{19} - \text{N} - \text{C(O)} - \text{S} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

a q) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $\text{R}^{16}\text{R}^{19} - \text{N} - \text{C(O)} - \text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、

a r) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{16}R^{19}-N-C(O)-NR^{16}- (C_0-C_5)$ アルキル基、

a s) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1-C_6) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_1-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $(C_1-C_6)Alkyl-C(O)-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

a t) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1-C_6) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_1-C_3) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $(C_1-C_6)Alkyl-SO_2-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

a u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $(C_3-C_7)Cycloalkyl-(C_0-C_3)Alkyl-C(O)-(C_1-C_3)Alkyl-O-$ 基、

a v) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $(C_3-C_7)Cycloalkyl-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_3)Alkyl-O-$ 基、

a w) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $(C_3-C_7)Cycloalkyl-(C_0-C_3)Alkyl-C(O)-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

a x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $(C_3-C_7)Cycloalkyl-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

a y) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_3)Alkyl-O-$ 基、

a z) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)Alkyl-C(O)-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

b a) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

b b) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}N-C(O)-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

b c) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}N-C(S)-(C_1-C_3)Alkyl-S-$ 基、

b d) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}N-C(S)-(C_1-C_3)Alkyl-O-$ 基、

b e) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(C_0-C_3)Alkyl$ 部分にて独立に任意に置換されてもよく、更に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1-C_5)Alkyl$ 部分にて任意に置換されてもよい、 $(C_3-C_7)Cycloalkyl-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_5)Alkyl$ 基、

b f) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(C_0-C_3)Alkyl$ 部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1-C_5)Alkyl$ 部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_5)Alkyl$ 基、

b g) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で $(C_0-C_3)Alkyl$ 部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1-C_5)Alkyl$ 部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ar^3-(C_0-C_3)Alkyl-SO_2-(C_1-C_5)Alkyl$ 基、

b h) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、H e t² - (C₀ - C₃) アルキル - S O₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

b i) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸N - (C₁ - C₃) アルキル基、

b j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、P h¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、A r³ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、P h¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b q) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、A r³ - (C₀ - C₃) アルキル - C (S) - N (R¹⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基、

b r) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆) アルキル - O - N = C (C H₃) - 基、

b s) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₀ - C₃) アルキル - O - N = C [(C₁ - C₆) アルキル] - 基、

b t) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、H O - N = C [(C₀ - C₁) アルキル - (C₃ - C₇) シクロアルキル] - 基、

b u) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、独立に 1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、C H₃ - O - N = C [(C₀ - C₁) アルキル - (C₃ - C₇) シクロアルキル] - 基；

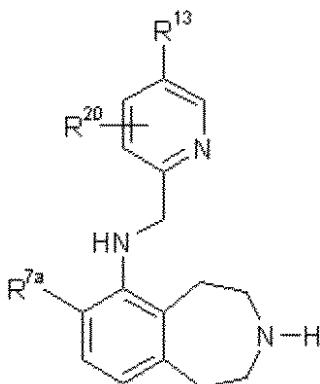
R²⁰はハロ、ヒドロキシ又はシアノ基である]

で示される化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 3】

式 (I b) :

【化 3】



Ib

(I b)

[式中、

R^{7a} はハロゲンであり；R¹³ は以下からなる群から選択される置換基であり：a) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい H e t² - (C₀ - C₃) アルキル基、b) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい H e t³ - (C₀ - C₃) アルキル基、c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい A r² - (C₀ - C₃) アルキル基、d) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁴) - 基、e) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (R¹⁴)₂ C = C [(C₁ - C₆) アルキル] - 基、f) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁵) - 基、g) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(R¹⁵) CH = C [(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル] - 基、h) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C C - 基、i) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₁) アルキル - C C - 基、j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₁ - C₅) アルキル基、k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、さらに 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1) 1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_0 - C_5$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル-O-($C_0 - C_5$)アルキル基、

m) 1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_0 - C_5$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ar^3 - (C_0 - C_3)$ アルキル-O-($C_0 - C_5$)アルキル基、

n) 1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_0 - C_5$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $He^2 - (C_0 - C_3)$ アルキル-O-($C_0 - C_5$)アルキル基、

o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、さらに1~6個のフルオロ置換基で($C_1 - C_5$)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、($C_3 - C_7$)シクロアルキル-($C_0 - C_3$)アルキル-C(O)-($C_1 - C_5$)アルキル基、

p) 1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_1 - C_5$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル-C(O)-($C_1 - C_5$)アルキル基、

q) ハロ、($C_1 - C_3$)アルキル、($C_1 - C_3$)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される1~3個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_1 - C_5$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル-($C_0 - C_3$)アルキル-C(O)-($C_1 - C_5$)アルキル基、

r) 1~6個のフルオロ置換基で($C_1 - C_6$)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で($C_1 - C_3$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、($C_1 - C_6$)アルキル-C(O)-($C_1 - C_3$)アルキル-O-基、

s) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、($C_3 - C_7$)シクロアルキル-($C_0 - C_3$)アルキル-C(O)-($C_1 - C_3$)アルキル-O-基、

t) 1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル-C(O)-($C_1 - C_3$)アルキル-O-基、

u) ハロ、($C_1 - C_3$)アルキル、($C_1 - C_3$)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される1~3個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル-($C_0 - C_3$)アルキル-C(O)-($C_1 - C_3$)アルキル-O-基、

v) 1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{1-7}R^{1-8}N - C(O) - (C_1 - C_3)$ アルキル-O-基、

w) 1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{1-7}R^{1-8}N - C(S) - (C_1 - C_3)$ アルキル-O-基、

x) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて置換され、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、($C_3 - C_7$)シクロアルキル-($C_0 - C_3$)アルキル-S-基、

y) 1~6個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、($C_1 - C_6$)アルキル-S-($C_1 - C_5$)アルキル基、

z) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で($C_0 - C_3$)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で($C_1 - C_5$)

アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a a) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a b) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a c) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a d) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a e) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a f) ハロ、(C₁ - C₃)アルキル、(C₁ - C₃)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される1 ~ 3 個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a g) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸ - NC(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a h) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸ - NC(S) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a i) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅)アルキル基、

a j) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅)アルキル基、

a k) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅)アルキル基、

a l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅)アルキル基、

a m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Het² - (C₀ - C₃)アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅)アルキル基、

a n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸ - N - C(O) - (C₁ - C₅)アルキル基、

a o) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸ - N - C(S) - (C₁ - C₅)アルキル基、

a p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で(C₁ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよい、R¹⁷R¹⁸ - N - (C₁ - C₃)アルキル基、

a q) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換さ

れてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(O) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a r) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - C(O) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a s) 1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a t) 1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a u) 1~6個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(S) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a v) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - C(S) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a w) 1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(S) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基、

a x) 1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₀ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - C(S) - N(R¹⁻⁶) - (C₀ - C₅)アルキル基；

R¹⁻⁴は水素、又は1~5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁ - C₂)アルキルであり；

R¹⁻⁵は水素、又は1~3個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいメチルであり；

R¹⁻⁶は水素、又は1~5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁ - C₃)アルキルであり；

R¹⁷は1~6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁ - C₆)アルキル基、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよいPh¹ - (C₁ - C₃)アルキル基、又は独立にメチル基及びフルオロ基から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル基であり；

R¹⁸は水素又は(C₁ - C₃)アルキルであるか、又はR¹⁷及びR¹⁸はそれらが結合する窒素原子と一緒にになって1又は2のメチル置換基で任意に置換されてもよいH¹et¹、イミダゾリジン-2-オニル基、イミダゾリジン-2,4-ジオニル基又はテトラヒドロピリミジン-2-オニル基を形成し；

R¹⁹は1~5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい(C₁ - C₃)アルキル基であり；

Ar²はピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリミジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、チオフェニル、チアゾリル、イソ

チアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、当該ヘテロ環は $H_2N -$ 、 $R^{15}R^{17}N -$ 、 $R^{17}NH -$ 、 $C(O) -$ 、 $R^{17}C(O)NH -$ 、 $R^{17}O - C(O)NH -$ 、 $(C_1 - C_6)Alkyl - C(O) -$ 、 $(C_3 - C_7)SikuroAlkyl - (C_0 - C_3)Alkyl -$ 、 $(C_3 - C_7)SikuroAlkyl - (C_0 - C_3)Alkyl -$ 、 $N - \text{結合} H et^1$ 及び $N - \text{結合} H et^1 - C(O) -$ からなる群から選択される置換基で置換され、それらはメチル、シアノ、ハロ及びトリフルオロメチル基からなる群から選択される置換基で更に任意に置換されてもよく；

$A r^3$ はピロリル、フラニル、チオフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル及びピリジル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、いずれも独立にハロ、 $(C_1 - C_3)Alkyl$ 、 $(C_1 - C_3)AlkylO$ 、 $-CF_3$ 、 $-O - CF_3$ 、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から選択される1 ~ 3個の置換基で任意に置換されてもよく；

$H et^1$ はピロリジニル、ピペリジニル、ホモピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ホモモルホリニル及びホモチオモルホリニル基からなる群から選択される、飽和窒素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも $(C_1 - C_6)Alkyl$ 基又は2つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

$H et^2$ はテトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニル基からなる群から選択される、飽和酸素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも $(C_1 - C_6)Alkyl$ 基又は2つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

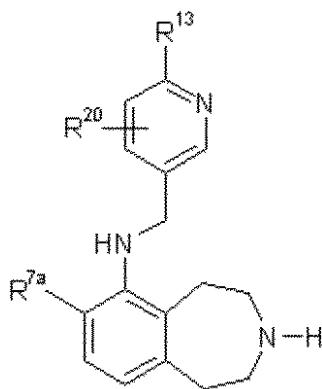
$H et^3$ はピロリジン-2-オニル、ピペリジン-2-オニル、オキサゾリジン-2-オニル、ピロリン-2-オニル及びジヒドロピリジン-2-オニル基からなる群から選択される、窒素含有ヘテロ環である】

で示される化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項4】

式(Ic)：

【化4】



Ic

(Ic)

〔式中、

R^{7a} はハロゲンであり；

R^{13} は以下からなる群から選択される置換基であり：

a) 1 ~ 6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい $H et^2 - (C_0 - C_3)Alkyl$ 基、

b) 1 ~ 6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい $H et^3 - (C_0 - C_3)Alkyl$ 基、

c) 1 ~ 6個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい $A r^2 - (C_0 - C_3)Alkyl$ 基、

- d) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁴) - 基、
- e) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (R¹⁴)₂ C = C [(C₁ - C₆) アルキル] - 基、
- f) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (R¹⁴) = C (R¹⁵) - 基、
- g) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(R¹⁵) CH = C [(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル] - 基、
- h) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - C C - 基、
- i) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 2 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₁) アルキル - C C - 基、
- j) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて独立に任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₁ - C₅) アルキル基、
- k) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、さらに 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、
- l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、
- m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、
- n) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Het² - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、
- o) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、さらに 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- q) ハロ、(C₁ - C₃) アルキル、(C₁ - C₃) アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される 1 ~ 3 個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - (C₁ - C₅) アルキル基、
- r) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₃) アルキル部分にて独立に任意に置換さ

れてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、
 s)メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

t)1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、
 u)ハロ、(C₁ - C₃)アルキル、(C₁ - C₃)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される1~3個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

v)1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R^{1~7}R^{1~8}N - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

w)1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R^{1~7}R^{1~8}N - C(S) - (C₁ - C₃)アルキル - O - 基、

x)メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて置換され、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - S - 基、

y)1~6個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

z)メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a a)1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a b)1~4個のフルオロ置換基で(C₀ - C₃)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~6個のフルオロ置換基で(C₁ - C₅)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、Ar³ - (C₀ - C₃)アルキル - S - (C₁ - C₅)アルキル基、

a c)1~6個のフルオロ置換基で(C₁ - C₆)アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基で(C₁ - C₃)アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、(C₁ - C₆)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a d)メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される1~4個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、(C₃ - C₇)シクロアルキル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a e)1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に任意に置換されてもよい、Ph¹ - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a f)ハロ、(C₁ - C₃)アルキル、(C₁ - C₃)アルコキシ、-CF₃、-O-CF₃、ニトロ、シアノおよびトリフルオロメチルチオからなる群から選択される1~3個の置換基でピリジル部分にて任意に置換されてもよく、1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方に独立に任意に置換されてもよい、ピリジル - (C₀ - C₃)アルキル - C(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a g)1~4個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、R^{1~7}R^{1~8}-NC(O) - (C₁ - C₃)アルキル - S - 基、

a h) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}-NC(S)-(C_1-C_3)$ アルキル - S - 基、

a i) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、 (C_1-C_6) アルキル - $SO_2-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a j) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 (C_3-C_7) シクロアルキル - (C_0-C_3) アルキル - $SO_2-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a k) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)$ アルキル - $SO_2-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a l) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ar^3-(C_0-C_3)$ アルキル - $SO_2-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a m) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Het^2-(C_0-C_3)$ アルキル - $SO_2-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a n) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1-C_5) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}-N-C(O)-(C_1-C_5)$ アルキル基、

a o) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1-C_5) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}-N-C(S)-(C_1-C_5)$ アルキル基、

a p) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_1-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよい、 $R^{17}R^{18}-N-(C_1-C_3)$ アルキル基、

a q) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、 (C_1-C_6) アルキル - $C(O)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a r) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 (C_3-C_7) シクロアルキル - $C(O)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a s) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)$ アルキル - $C(O)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a t) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ar^3-(C_0-C_3)$ アルキル - $C(O)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a u) 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分のいずれか又は両方にて任意に置換されてもよい、 (C_1-C_6) アルキル - $C(S)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a v) メチル基及びフルオロ基からなる群から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 (C_3-C_7) シクロアルキル - $C(S)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a w) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C_0-C_3) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_0-C_5) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 $Ph^1-(C_0-C_3)$ アルキル - $C(S)-N(R^{1-6})-(C_0-C_5)$ アルキル基、

a x) 1 ~ 4 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₃) アルキル部分にて任意に置換されてもよく、 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₀ - C₅) アルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい、 Ar³ - (C₀ - C₃) アルキル - C(S) - N(R¹~⁶) - (C₀ - C₅) アルキル基；

R¹~⁴ は水素、又は 1 ~ 5 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₂) アルキルであり；

R¹~⁵ は水素、又は 1 ~ 3 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよいメチルであり；

R¹~⁶ は水素、又は 1 ~ 5 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₃) アルキルであり；

R¹⁷ は 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基、 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて任意に置換されてもよい Ph¹ - (C₁ - C₃) アルキル基、又は独立にメチル基及びフルオロ基から選択される 1 ~ 4 個の置換基でシクロアルキル部分にて任意に置換されてもよく 1 ~ 4 個のフルオロ置換基でアルキル部分にて独立に任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル基であり；

R¹⁸ は水素又は (C₁ - C₃) アルキルであるか、又は R¹⁷ 及び R¹⁸ はそれらが結合する窒素原子と一緒にになって 1 又は 2 のメチル置換基で任意に置換されてもよい Het¹、イミダゾリジン - 2 - オニル基、イミダゾリジン - 2, 4 - ジオニル基又はテトラヒドロピリミジン - 2 - オニル基を形成し；

R¹⁹ は 1 ~ 5 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₃) アルキル基であり；

A_r² はピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピリミジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、チオフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、当該ヘテロ環は H₂N - 、 R¹⁵R¹⁷N - 、 R¹⁷NH - C(O) - 、 R¹⁷C(O)NH - 、 R¹⁷O - C(O)NH - 、 (C₁ - C₆) アルキル - C(O) - 、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - 、 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル、N - 結合 Het¹ 及び N - 結合 Het¹ - C(O) - からなる群から選択される置換基で置換され、それらはメチル、シアノ、ハロ及びトリフルオロメチル基からなる群から選択される置換基で更に任意に置換されてもよく；

A_r³ はピロリル、フラニル、チオフェニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル及びピリジル基からなる群から選択される芳香族ヘテロ環置換基であり、いずれも独立にハロ、(C₁ - C₃) アルキル、(C₁ - C₃) アルコキシ、- CF₃、- O - CF₃、ニトロ、シアノ及びトリフルオロメチルチオ基からなる群から選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよく；

Het¹ はピロリジニル、ピペリジニル、ホモピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ホモモルホリニル及びホモチオモルホリニル基からなる群から選択される、飽和窒素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも (C₁ - C₆) アルキル基又は 2 つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

Het² はテトラヒドロフラニル及びテトラヒドロピラニル基からなる群から選択される、飽和酸素含有ヘテロ環置換基であり、いずれも (C₁ - C₆) アルキル基又は 2 つのメチル置換基で任意に置換されてもよく；

Het³ はピロリジン - 2 - オニル、ピペリジン - 2 - オニル、オキサゾリジン - 2 - オニル、ピロリン - 2 - オニル及びジヒドロピリジン - 2 - オニル基からなる群から選択される、窒素含有ヘテロ環である]

で示される化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 5】

R^{20} がフルオロ基又はクロロ基である、請求項2から4のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 6】

$7 - \text{クロロ} - 6 - [4 - (2 - \text{シクロプロピルメチルアミノ} - \text{チアゾール} - 4 - \text{イル}) \text{ベンジルアミノ}] - 2, 3, 4, 5 - \text{テトラヒドロ} - 1H - \text{ベンゾ} [d] \text{アゼピン}$ である、請求項1記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 7】

$7 - \text{クロロ} - 6 - \{ 6 - [(3, 3 - \text{ジメチル} - \text{シクロヘキシルオキシ}) \text{ピリジン} - 3 - \text{イルメチル}] \text{アミノ} \} - 2, 3, 4, 5 - \text{テトラヒドロ} - 1H - \text{ベンゾ} [d] \text{アゼピン}$ である、請求項1記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 8】

$7 - \text{クロロ} - 6 - [4 - (\text{ピペリジン} - 1 - \text{イルメチル}) \text{ベンジルアミノ}] - 2, 3, 4, 5 - \text{テトラヒドロ} - 1H - \text{ベンゾ} [d] \text{アゼピン}$ である、請求項1記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩。

【請求項 9】

有効成分として請求項1から8のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩を薬理学的に許容できる担体、希釈剤又は賦形剤とともに含む、医薬組成物。

【請求項 10】

請求項1から8のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩を1以上の薬理学的に許容できる賦形剤、担体又は希釈剤との組み合わせで含む、肥満治療用の医薬組成物。

【請求項 11】

請求項1から8のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩を1以上の薬理学的に許容できる賦形剤、担体又は希釈剤との組み合わせで含む、強迫性障害治療用の医薬組成物。

【請求項 12】

請求項1から8のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩を1以上の薬理学的に許容できる賦形剤、担体又は希釈剤との組み合わせで含む、うつ病治療用の医薬組成物。

【請求項 13】

請求項1から8のいずれか1項記載の化合物又はその薬理学的に許容できる塩を1以上の薬理学的に許容できる賦形剤、担体又は希釈剤との組み合わせで含む、不安治療用の医薬組成物。