

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年6月22日(2006.6.22)

【公表番号】特表2005-530753(P2005-530753A)

【公表日】平成17年10月13日(2005.10.13)

【年通号数】公開・登録公報2005-040

【出願番号】特願2004-501384(P2004-501384)

【国際特許分類】

C 0 7 D 241/50 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 15/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 241/50

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 15/06

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/06 C S P

C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 403/06
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 409/12
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月28日(2006.4.28)

【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

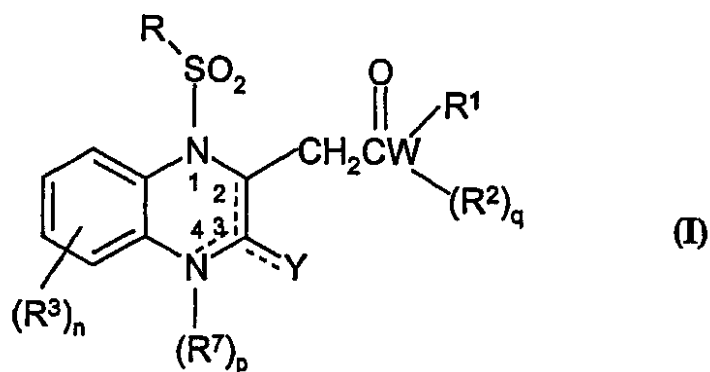
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下：

【化1】



の式Iの化合物およびその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、

【化2】

==

によって表される結合の1つが二重結合であり、他の2つが単結合であり；

n は、0 ~ 4 の整数であり；

p は、0 または 1 であり；

q は、0 または 1 であり；

Y は、= O、= S、- OR⁸、- NHR⁸、= NR⁸、- SR⁸ からなる群から選択され、Y が - NHR⁸ または = NR⁸ である場合には、R⁷ および R⁸ は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式、または置換された不飽和複素環式を形成し得；

但し、

Y が、= O、= S、または = NR⁸ である場合には、2, 3 位間および 3, 4 位間の

【化 3】

==

によって表される結合が、単一の共有結合であり、 p は 1 であり；

Y が $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、または $-NHR^8$ であり、 p が 0 である場合には、3，4 位間の

【化 4】

==

によって表される結合が、二重結合であり；または

Y が $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、または $-NHR^8$ であり、 $p = 1$ であり、 R^7 が水素以外である場合には、2，3 位間の

【化 5】

==

によって表される結合が、二重結合であり；

W は、O、S、および N からなる群から選択され、ここで、

W が O または S である場合には、 q は 0 であり；そして W が N である場合には、 q は 1 であり；

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R^1 および R^2 は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、あるいは R^1 および R^2 がそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、または置換された複素環式を形成し、

各 R^3 は、独立して、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アミノ、置換されたアミノ、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アルコキシ、置換されたアルコキシ、アリール、置換されたアリール、アリールオキシ、置換されたアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、置換されたヘテロアリールオキシ、複素環式、置換された複素環式、ヘテロシクリルオキシ、置換されたヘテロシクリルオキシ、アシル、アシルオキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $-C(O)OR^{10}$ （ここで、 R^{10} は、アルキル、置換されたアルキル、アリール、または置換されたアリールである）、および $-C(O)NR^{11}R^{12}$ （ここで、 R^{11} および R^{12} は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、または R^{11} および R^{12} はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式基を形成する）からなる群から選択され；

あるいは、2 個以上の R^3 がそれらが結合する炭素原子と一緒にあって、縮合環シクロアルケニル、置換されたシクロアルケニル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^7 は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

あるいは、 R^7 は、少なくとも 1 個の R^3 、ならびにそれらが結合する窒素原子および

炭素原子と一緒にあって、縮合環ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^8 は、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

但し、 $W = N$ かつ $Y = O$ である場合には、少なくとも R^1 および/または R^2 は、以下の I ~ X V I からなる群から選択され；

I - アルキレン - $C(=O)R^a$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^a は、ヒドロキシル、 $-NR^bR^b$ 、 $-OR^b$ 、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロシクリル、置換されたヘテロシクリル（ここで、各 R^b は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択される）からなる群から選択され；

II - アルキレン - X^a であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 X^a は、 $-OH$ 、シアノ、および $-NR^bR^b$ （ここで、各 R^b は、独立して、上で定義される通りである）からなる群から選択され；

III - NHR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

IV - OR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

V - アルキレン - $het^a - C(=O) - CH(R^b)NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、 het^a 基の環窒素原子を介して $-C(O)-$ 基に結合した窒素含有ヘテロシクリル基であり、各 R^b は、上で定義される通りであり；

VI - アルキレン - $het^a - C(=O) - het^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、上で定義された通りであり、 het^b は、ヘテロシクリルであり；

VII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=NR^b)NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は、上で定義された通りであり、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

VIII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=O) - NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は上で定義される通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

IX - アルキレン - $R^c - \text{アルキレン} - C(=O)R^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^b および R^c は上で定義される通りであり；

X - アルキレン - $R^c - C(=O) - \text{アルキレン} - (X^b)_n$ 、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、 X^b は、 OH 、ハロ、シアノ、および $-NR^bR^b$ からなる群から選択され、 n は、 X^b がハロであり n が1~3であり得る場合を除いて、1であり；さらに、各 R^b が独立して上で定義された通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

XI - アルキレン - $R^c - C(=O) - R^d$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され、 R^d は、独立して、置換されたアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環式およびシクロアルキルからなる群から選択され；

XII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=O)R^e$ であり、ここで、アルキレンは

必要に応じて置換され、 R^b および R^c は、上で定義された通りであり、 R^e は、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたヘテロアリールであり；

X I I I - アルキニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；

X I V あるいは、 R^1 および R^2 が、それらに結合する窒素原子と一緒に結合して、置換されたアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換された、窒素含有ヘテロシクリルを形成し；

X V - アルケニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；
および

X V I - アルキレン - R^c - $N R^b$ - $C(=N R^b) R^b$ であり、ここでアルキレンは必要に応じて置換され、 R^b および R^c の各々は、上で定義された通りであり；

さらに、但し、

A . W が N であり、 R^1 は水素であり、 R^2 がベンジルであり、 R^7 はメチルであり、 n は 0 であり、 p は 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルではなく；

B . W が N であり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - (ピリド - 4 - イル) エチル - 1 - イルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 1 - メチルピラゾル - 4 - イルではなく；

C . W が N であり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

D . W が N であり、 R^1 、 R^2 および R^7 が水素であり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

E . W が N であり、 R^1 が水素であり、 R^2 および R^7 が 3 - クロロベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニルではなく；

F . W が N であり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はフェニルではなく；

G . W が N であり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はキノリン - 8 - イルではなく；
および

H . W が N であり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はチエン - 2 - イルではなく；
および

以下の公知の化合物が除かれる：

I . R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - メトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 4 - メチルフェニルではなく；
および

J . R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - エトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 4 - メチルフェニルではない、

化合物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで R が、フェニル；ナフト - 1 - イル；5 - ジメチルアミノ - ナフト - 1 - イル；2 - フルオロフェニル；2 - クロロフェニル；2 - シアノフェニル；2 - メチルフェニル；2 - ニトロフェニル；2 - トリフルオロメチルフェニル；3 - クロロフェニル；4 - メチルフェニル（トリル）；2 , 5 - ジブromo - フェニル；4 - ブromo - 2 - エチルフェニル；4 - ブromo - 2 - トリフルオロメトキシフェニル；2 , 3 - ジクロロフェニル；2 , 4 - ジクロロフェニル；3 , 4 - ジクロロフェニル；2 , 5 - ジクロロフェニル；3 , 5 - ジクロロフェニル；2 , 6 - ジクロロフェニル；2

- クロロ - 4 - シアノフェニル ; 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ; 3 - クロロ - 2 - メチルフェニル ; 2 - クロロ - 6 - メチル - フェニル ; 5 - クロロ - 2 - メトキシフェニル ; 2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル ; 2 , 4 - ジフルオロフェニル ; 5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル ; 2 , 5 - ジメトキシフェニル ; 2 - メトキシ - 4 - メチルフェニル ; 2 - メトキシ - 5 - ブロモフェニル ; 2 - メトキシ - 5 - メチルフェニル ; 2 , 5 - ジメチルフェニル ; 2 - メチル - 5 - ニトロフェニル ; 3 , 5 - ジ (トリフルオロメチル) フェニル ; 4 - ブロモ - 2 , 5 - ジフルオロフェニル ; 2 , 3 , 4 - トリクロロフェニル ; 2 , 4 , 5 - トリクロロフェニル ; 2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル ; 2 , 4 - ジクロロ - 5 - メチルフェニル ; 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニル ; 2 , 4 , 6 - トリ (イソ) プロピルフェニル ; 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル ; 2 , 3 , 5 - トリメチル - 4 - クロロフェニル ; 2 , 3 , 6 - トリメチル - 4 - メトキシフェニル ; 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタメチルフェニル ; 5 - クロロ - 1 , 3 - ジメチルピラゾル - 4 - イル ; 2 - メトキシカルボニル - チオフェン - 3 - イル ; 2 , 3 - ジメチルイミダゾル - 5 イル ; 2 - メチルカルボニルアミノ - 4 - メチル - チアゾル - 5 - イル ; キノリン - 8 - イル ; チオフェン - 2 - イル ; 1 - メチルイミジアゾル - 4 - イル ; 3 , 5 - ジメチルイソキサゾル - 4 - イル ; および N - モルホリノからなる群から選択される、化合物。

【請求項 3】

R が 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニルである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

請求項 1、2 または 3 のいずれかに記載の化合物であって、
ここで、R¹ は、以下：

2 - [(4 - アミジノ) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル、
アミノ、
2 - [N - (- アミノアセチル) ピペリド - 4 - イル] エト - 1 - イル、
2 - [4 - (アミノエチレンアミジノ) フェニル] エト - 1 - イル、
2 - [N - (1 - アミノ - 1 - メチルエチルカルボニル) ピペリド - 4 - イル] エト - 1 - イル、
1 - (S) - カルボキサミド - 2 - (インドール - 3 - イル) エト - 1 - イル、
カルボキサミドメチル、
1 - カルボキサミド - 2 - (S) - メチル - ブト - 1 - イル、
1 - (S) - カルボキサミド - 2 - (フェニル) エト - 1 - イル、
1 - (R) - カルボキサミド - 2 - (フェニル) エト - 1 - イル、
シアノメチル、
2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル、
2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル、
2 - (N - シクロプロピルピペリジン - 4 - イル) - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル、
1 - (R) - 1 , 3 - ジ (ベンジルオキシカルボニル) プロブ - 1 - イル、
1 - (S) - 1 , 3 - ジカルボキサミドプロブ - 1 - イル、
(2 - ジメチルアミノ) エト - 1 - イル、
3 - (ジメチルアミノ) プロブ - 1 - イル、
1 - (S) - エトキシカルボニルエト - 1 - イル、
1 - (R) - (1 - N - エチルアミノ - カルボニル) - 4 - アミノ - n - ブチル、
1 - (S) - (1 - N - エチルアミノ - カルボニル) - 4 - アミノ - n - ブチル、
1 - (R) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - (t - ブトキシカルボニルアミノ) - ペント - 5 - イル、
1 - (S) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - (t - ブトキシカルボニルア

ミノ) - ペント - 5 - イル、
 1 - (R) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 4 - (N ' - t - ブトキシカルボ
 ニルアミノ) - n - ブト - 1 - イル、
 1 - (S) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 4 - (N ' - t - ブトキシカルボ
 ニルアミノ) - n - ブト - 1 - イル、
 1 - (R) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - グアナジノ - n - ペント - 5
 - イル、
 1 - (S) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - グアナジノ - n - ペント - 5
 - イル、
 1 - R , S - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 4 - (N ' - t - ブトキシカルボ
 ニル) - グアナジノ - n - ブト - 1 - イル、
 1 - (R) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - (N ' - t - ブトキシカルボ
 ニルアミノ) - n - ペント - 5 - イル、
 1 - (S) - (1 - N - エチルアミノカルボニル) - 5 - (N ' - t - ブトキシカルボ
 ニルアミノ) - n - ペント - 5 - イル、
 2 - ヒドロキシエト - 1 - イル、
 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - (S) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イ
 ル、
 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - (S) - (イソプロポキシカルボニル) エト -
 1 - イル、
 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1 - (R) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イ
 ル、
 2 - (N - ヒドロキシピリド - 4 - イル) エト - 1 - イル、
 2 - (イミダゾル - 4 - イル) エト - 1 - イル、
 2 - [4 - (イミダゾリン - 2 - イル) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - 1 -
 イルカルボニル) エト - 1 - イル、
 2 - (インドール - 3 - イル) エト - 1 - イル、
 2 - (インドール - 3 - イル) - 1 - (S) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル
 、
 2 - (インドール - 3 - イル) - 1 - (R) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル
 、
 1 - (R) - (イソプロポキシカルボニル) - 2 - (フェニル) エト - 1 - イル、
 メトキシ、
 1 - (R) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル、
 メトキシカルボニルメチル、
 メトキシカルボニルフェニルメチル、
 2 - メトキシエト - 1 - イル、
 1 - (R) - (メトキシカルボニル) - 2 - (N - メチルピペリジン - 4 - イル) エト
 - 1 - イル、
 1 - (R) - (メトキシカルボニル) - 2 - (N - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒ
 ドロピリド - 4 - イル) エト - 1 - イル、
 1 - (R) - (メトキシカルボニル) - 2 - ピリド - 4 - イル) エト - 1 - イル、
 1 - (R) - (N - メチル - N - エチルカルバモイル) - 3 - (グアナジノ) プロプ -
 1 - イル、
 2 - (N - メチルピペリジン - 4 - イル) - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカル
 ボニル) エト - 1 - イル、
 2 - (N - メチル - 1 , 2 , 5 , 6 - テトラヒドロピリド - 4 - イル) - 1 - (R) -
 (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル、
 3 - (2 - メチルチアゾル - 4 - イル) - ピラゾル - 5 - イル、
 1 - (R) - 2 - フェニル - 1 - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル、

1 - (S) - 2 - フェニル - 1 - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル、
 2 - (フェニル) - 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル
 、 (ピペリジン - 1 - イル) カルボニルメチル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - アミジノ) フェニル -
 エト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - アミジノ) フェニル -
 エト - 1 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - アミノ - n - ペント - 1 - イ
 ル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - アミノ - n - ペント - 1 - イ
 ル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - ビフェニル) エト - 1
 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - ビフェニル) エト - 1
 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル - 2 - (4 - ヨードフェニル) エト -
 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル - 2 - (4 - ヨードフェニル) エト -
 1 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - カルボニル) - 4 - (t - ブトキシカルボニルアミノ
) - n - ブト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - カルボニル) - 4 - (t - ブトキシカルボニルアミノ
) - n - ブト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (2 - イミダゾリン -
 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、
 2 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル - 3 - フェニルプロプ - 2 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチルピペリジ
 ン - 2 - イル) エト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチルピペリジ
 ン - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - メチル - 1 , 2 , 5 ,
 6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル) - フェン - 4 - イル)] エト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - メチル - 1 , 2 , 5 ,
 6 - テトラヒドロピリジン - 4 - イル) - フェン - 4 - イル)] エト - 1 - イル
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピペリジン - 2 - イ
 ル) - シクロヘキシル)] エト - 1 - イル、
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピペリジン - 2 - イ
 ル) - シクロヘキシル)] エト - 1 - イル、
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - (フェニル) - ピペリ
 ジン - 4 - イル)] エト - 1 - イル
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - (フェニル) - ピペリ
 ジン - 4 - イル)] エト - 1 - イル
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - (ピリジン - 4 - イル
) - ピペリジン - 4 - イル)] エト - 1 - イル
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [N - (ピリジン - 4 - イル
) - ピペリジン - 4 - イル)] エト - 1 - イル
 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリジン - 4 - イル
) フェニル)] エト - 1 - イル
 1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリジン - 4 - イル
) フェニル)] エト - 1 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリド - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリド - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリミジン - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (ピリミジン - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - t - ブトキシカルボニルピロール - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル

1 - (S) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - t - ブトキシカルボニルピロール - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル

1 - (S) - (t - ブトキシカルボニル) - 2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エト - 1 - イル、

3 - t - ブトキシカルボニル - 1 - メトキシカルボニルプロブ - 1 - イル、

1 - (S) - (t - ブトキシカルボニル) - 3 - メチルプロブ - 1 - イル、

1 - (R) - (t - ブトキシカルボニル) - 3 - メチルプロブ - 1 - イル、

1 - (R) - (t - ブトキシカルボニル) - 2 - (フェニル) エト - 1 - イル、

1 - (R) - 1 - ピロリジン - N - イルカルボニル - 2 - フェニルエト - 1 - イル

2 - フェニル - 1 - (R) - カルボキシ - エト - 1 - イル

2 - [N - (、 ジメチルグリシン) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - { 4 - (エチルアミノ - アミジノ) フェニル } エト - 1 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 3 - (グアナジノ) - ブト - 1 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - (N ' - t - ブトキシカルボニル) - グアナジノ - n - ブト - 1 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - (N ' - t - ブトキシカルボニルアミノ) - n - ペント - 5 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - アミノ - n - ブチル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - グアナジノ - ブト - 4 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチル - 1 , 2 , 3 , 6 - テトラヒドロピリジン - 6 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - t - ブトキシカルボニルピロール - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル、

4 - N - [(N ' 、 N ' - ジメチルアミノカルボニル) アミノ - フェン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (N ' - モルホリノ - カルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - { N - [(2 - (チオフエン - 2 - イル) メチレンカルボニル) - ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (3 , 5 - ジメチルオキサゾル - 4 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (フラン - 2 - イルカルボニル) - ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (オキサゾル - 5 - イル - カルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (5 - メチルピラゾル - 3 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (1 - メチル - 3 - t - ブチルピラゾル - 5 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

2 - [N - (4 - メチルチアジアゾル - 5 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル

- 2 - [N - (クロロメチレン - カルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (ベンジルカルボニル) - ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (2 - フェニルエテニル - カルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (メトキシメチレン - カルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (ピラジン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (イソキノリン - 3 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (ピロリジン - 5 - オン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (N' - アセチルピロリジン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 2 - [N - (ジクロロメチレンカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 4 - [N - (ピラジン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (イソキノリン 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (N' - アセチルピロリジン - 2 - イルカルボニル) アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (1 , 2 - ベンゾチアジアゾル - 5 - イルカルボニル) アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (ベンゾフラン - 5 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (3 - メチルイソキサゾル - 5 - イルカルボニル) アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (メトキシフェン - 3 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (チオフエン - 2 - イルメチレンカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (3 , 5 - ジメチル - イソキサゾル - 4 - イルカルボニル) - アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (2 - (ピリド - 3 - イル) エチルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (フラン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (イソキサゾル - 5 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (3 - メチルピラゾル - 5 - イル - 5 - イルカルボニル) アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (1 - メチル - 3 - t - ブチル - ピラゾル - 5 - イルカルボニル) - アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (4 - メチル - 1 , 2 , 3 - チアジアゾル - 5 - イルカルボニル) - アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (クロロメチレン - カルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (クロロフェン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (フェニルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (ピリド - 2 - イルカルボニル) - アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (2 - フェニルエテニル - カルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (2 - フェニルエテニル - カルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (フルオロフェン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (メトキシメチレンカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (ジクロロメチレン - カルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
- 4 - [N - (メチレンジオキシ - フェン - 4 - イルカルボニル) アミノ] - フェネト - 1 - イル
- 1 - [(R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル)] - 2 - [N - メチルピリド - 2 - イル) フェン - 4 - イル] エト - 1 - イル
- 1 - [(R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル)] - 2 - [(N - メチルピリド -

4 - イル) フェン - 4 - イル] エト - 1 - イル

1 - [(R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル)] - 2 - [(N - メチルピリド - 4 - イル) フェン - 4 - イル] エト - 1 - イル

1 - [(R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル)] - 2 - [1 - (ピペリジン - 2 - イル) フェン - 4 - イル] エト - 1 - イル

1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチルピリド - 4 - イル) - フェン - 1 - イル) エト - 1 - イル

4 - (ピリジン - 2 - イル) - ブト - 3 - イン - 1 - イル

(ベンゾイミダゾル - 2 - イルアミノ) エト - 1 - イル、

からなる群から選択される、化合物。

【請求項 5】

R^2 が水素、メチル、エチル、イソ - プロピル、2 - メトキシエト - 1 - イル、およびピリド - 3 - イルメチルからなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

請求項 4 に記載の化合物であって、ここで R^2 が、水素、メチル、エチル、イソ - プロピル、2 - メトキシエト - 1 - イル、およびピリド - 3 - イルメチルからなる群から選択される、化合物。

【請求項 7】

請求項 1、2 または 3 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、

ここで、 R^1 および R^2 が、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、4 - (2 - アミノエチル) ピペリジン - 1 - イル；4 - [2 - (N - t - ブトキシカルボニルアミノ) エチル] - ピペリジン - 1 - イル；および 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピペラジン - 4 - イルからなる群から選択される、必要に応じて置換された複素環式を形成する、化合物。

【請求項 8】

請求項 4 に記載の化合物であって、

ここで、 R^1 および R^2 が、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、4 - (2 - アミノエチル) ピペリジン - 1 - イル；4 - [2 - (N - t - ブトキシカルボニルアミノ) エチル] - ピペリジン - 1 - イル；および 1 - (ピリジン - 2 - イル) ピペラジン - 4 - イルからなる群から選択される、必要に応じて置換された複素環式を形成する、化合物。

【請求項 9】

R^2 が水素である、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^2 が水素である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 11】

n が 0 である、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 12】

n が 0 である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 13】

n が 1 または 2 である、請求項 1、2 または 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

n が 1 または 2 である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 15】

R^3 が、クロロ、フルオロおよびメチルからなる群から選択される、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 16】

R^3 が、クロロ、フルオロおよびメチルからなる群から選択される、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 17】

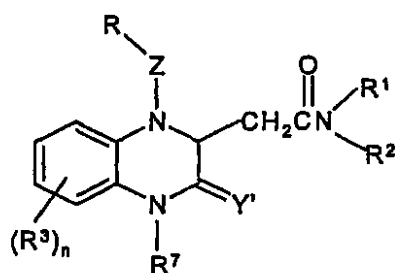
p が 1 であり、 R^7 が水素、メチル、ベンジルおよび t - ブトキシカルボニルメチルか

らなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

以下：

【化 6】



IA

の式 I A の化合物およびその薬学的に受容可能な塩であって、

n は、0 ~ 4 の整数であり；

Y は、= O または = S であり；

Z は、- S O₂ - であり；

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R¹ および R² は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、あるいは R¹ および R² がそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、または置換された複素環式を形成し、

各 R³ は、独立して、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アミノ、置換されたアミノ、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アルコキシ、置換されたアルコキシ、アリール、置換されたアリール、アリールオキシ、置換されたアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、置換されたヘテロアリールオキシ、複素環式、置換された複素環式、ヘテロシクリルオキシ、置換されたヘテロシクリルオキシ、アシル、アシルオキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、- C (O) O R^{1 0} (ここで、R^{1 0} は、アルキル、置換されたアルキル、アリール、または置換されたアリールである)、および - C (O) N R^{1 1} R^{1 2} (ここで、R^{1 1} および R^{1 2} は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、または R^{1 1} および R^{1 2} はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式基を形成する) から選択され；

あるいは、2 個以上の R³ がそれらが結合する炭素原子と一緒にあって、縮合環シクロアルケニル、置換されたシクロアルケニル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R⁷ は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

あるいは、R⁷ は、少なくとも 1 個の R³、ならびにそれらが結合する窒素原子および

炭素原子と一緒にあって、縮合環ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^8 は、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

但し、 $Y' = O$ かつ $Z = -SO_2-$ である場合には、少なくとも R^1 および/または R^2 は、以下の I ~ XVI からなる群から選択され；

I - アルキレン - $C(=O)R^a$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^a は、ヒドロキシル、 $-NR^bR^b$ 、 $-OR^b$ 、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロシクリル、置換されたヘテロシクリル（ここで、各 R^b は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択される）からなる群から選択され；

II - アルキレン - X^a であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 X^a は、 $-OH$ 、シアノ、および $-NR^bR^b$ （ここで、各 R^b は、独立して、上で定義される通りである）からなる群から選択され；

III - NHR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

IV - OR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

V - アルキレン - $het^a - C(=O) - CH(R^b)NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、 het^a 基の環窒素原子を介して $-C(O)-$ 基に結合した窒素含有ヘテロシクリル基であり、各 R^b は、上で定義される通りであり；

VI - アルキレン - $het^a - C(=O) - het^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、上で定義された通りであり、 het^b は、ヘテロシクリルであり；

VII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=NR^b)NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は、上で定義された通りであり、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

VIII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=O) - NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は上で定義される通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

IX - アルキレン - $R^c - \text{アルキレン} - C(=O)R^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^b および R^c は上で定義される通りであり；

X - アルキレン - $R^c - C(=O) - \text{アルキレン} - (X^b)_n$ 、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、 X^b は、 OH 、ハロ、シアノ、および $-NR^bR^b$ からなる群から選択され、 n は、 X^b がハロであり n が1~3であり得る場合を除いて、1であり；さらに、各 R^b が独立して上で定義された通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

XI - アルキレン - $R^c - C(=O) - R^d$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され、 R^d は、置換されたアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環式およびシクロアルキルからなる群から選択され；

XII - アルキレン - $R^c - NR^bC(=O)R^e$ であり、ここで、アルキレンは

必要に応じて置換され、 R^b および R^c は、上で定義された通りであり、 R^e は、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたヘテロアリールであり；

X I I I - アルキニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；

X I V あるいは、 R^1 および R^2 が、それらに結合する窒素原子と一緒に結合して、置換されたアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換された、窒素含有ヘテロシクリルを形成し；

X V - アルケニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；
および

X V I - アルキレン - R^c - $N R^b$ - $C(=N R^b) R^b$ であり、ここでアルキレンは必要に応じて置換され、 R^b および R^c の各々は、上で定義された通りであり；

さらに、但し、

A . R が 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルであり、 R^1 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 R^7 がメチルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合、 Z は SO_2 ではなく；

B . R が 1 - メチルピラゾル - 4 - イルであり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - (ピリド - 4 - イル) エチル - 1 - イルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；

C . R が 2 , 4 - ジフルオロフェニルであり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；

D . R が 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルであり、 R^1 、 R^2 および R^7 が水素であり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合、 Z は SO_2 ではなく；

E . R が 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニルであり、 R^1 が水素であり、 R^2 および R^7 が 3 - クロロベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；

F . R がフェニルであり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；

G . R がキノリン - 8 - イルであり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；および

H . R がチエン - 2 - イルであり、 R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y が = O である場合には、 Z は SO_2 ではなく；および

以下の公知の化合物が除かれる：

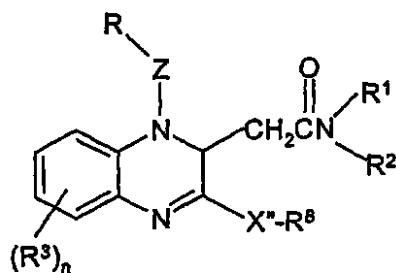
I . R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - メトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y' が = O である場合には、 R は 4 - メチルフェニルではなく；
および

J . R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - エトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、かつ Y' が = O である場合には、 R は 4 - メチルフェニルではない、化合物。

【請求項 19】

以下：

【化 7】



IB

の式 I B の化合物およびその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、

n は、0 ~ 4 の整数であり；

X^n は、- O - または - S - であり；

Z は、- S O₂ - であり；

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R^1 および R^2 は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、あるいは R^1 および R^2 がそれらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、または置換された複素環式を形成し、

各 R^3 は、独立して、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アミノ、置換されたアミノ、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アルコキシ、置換されたアルコキシ、アリール、置換されたアリール、アリールオキシ、置換されたアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、置換されたヘテロアリールオキシ、複素環式、置換された複素環式、ヘテロシクリルオキシ、置換されたヘテロシクリルオキシ、アシル、アシルオキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、- C (O) O R^{10} (ここで、 R^{10} は、アルキル、置換されたアルキル、アリール、または置換されたアリールである)、および - C (O) N R^{11} R^{12} (ここで、 R^{11} および R^{12} は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、または R^{11} および R^{12} はそれらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式基を形成する) からなる群から選択され；

あるいは、2 個以上の R^3 がそれらが結合する炭素原子と一緒に、縮合環シクロアルケニル、置換されたシクロアルケニル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^7 は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

あるいは、 R^7 は、それらが結合する少なくとも 1 個の R^3 、ならびに窒素原子および炭素原子と一緒に、縮合環ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

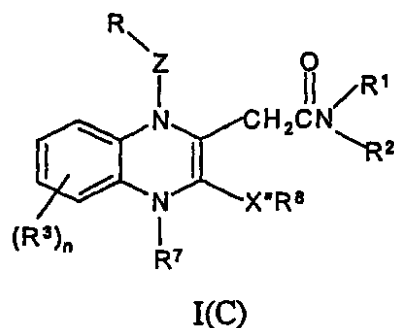
R^8 は、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキ

ニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択される、化合物。

【請求項 20】

以下：

【化 8】



の式 I (C) の化合物およびその薬学的に受容可能な塩であって、

ここで、

n は、0 ~ 4 の整数であり；

Xⁿ は、- O - または - S - であり；

Z は、- S O₂ - であり；

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R¹ および R² は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、あるいは R¹ および R² がそれらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、または置換された複素環式を形成し、

各 R³ は、独立して、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アミノ、置換されたアミノ、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アルコキシ、置換されたアルコキシ、アリール、置換されたアリール、アリールオキシ、置換されたアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、置換されたヘテロアリールオキシ、複素環式、置換された複素環式、ヘテロシクリルオキシ、置換されたヘテロシクリルオキシ、アシル、アシルオキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、- C (O) O R^{1 0} (ここで、R^{1 0} は、アルキル、置換されたアルキル、アリール、または置換されたアリールである)、および - C (O) N R^{1 1} R^{1 2} (ここで、R^{1 1} および R^{1 2} は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、または R^{1 1} および R^{1 2} はそれらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式基を形成する) からなる群から選択され；

あるいは、2 個以上の R³ がそれらが結合する炭素原子と一緒に、縮合環シクロアルケニル、置換されたシクロアルケニル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R⁷ は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、

アルキニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

あるいは、 R^7 は、少なくとも 1 個の R^3 、ならびにそれらが結合する窒素原子および炭素原子と一緒に、縮合環ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

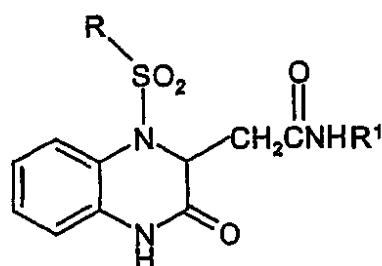
R^8 は、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択される、

化合物。

【請求項 21】

以下：

【化 9】



II

の式 I I の化合物およびその薬学的に受容可能な塩であって、
ここで、

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R^1 は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され、

但し、 R^1 は、以下の I ~ XV からなる群から選択され：

I - アルキレン - $C(=O)R^a$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^a は、ヒドロキシル、 $-NR^bR^b$ 、 $-OR^b$ 、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロシクリル、置換されたヘテロシクリル（ここで、各 R^b は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択される）からなる群から選択され；

II - アルキレン - X^a であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 X^a は、 $-OH$ 、シアノ、および $-NR^bR^b$ （ここで、各 R^b は、独立して、上で定義される通りである）からなる群から選択され；

III - NHR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

IV - OR^b であり、ここで、 R^b は、上で定義される通りであり；

V - アルキレン - $het^a - C(=O) - CH(R^b)NR^bR^b$ であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、 het^a 基の環窒素原子を介して $-C(O)-$ 基に結合した窒素含有ヘテロシクリル基であり、各 R^b は、上で定義さ

れる通りであり；

V I - アルキレン - het^a - $\text{C}(=\text{O})$ - het^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 het^a は、上で定義された通りであり、 het^b は、ヘテロシクリルであり；

V I I - アルキレン - R^c - NR^b $\text{C}(=\text{NR}^b)$ NR^b R^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は、上で定義された通りであり、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

V I I I - アルキレン - R^c - NR^b $\text{C}(=\text{O})$ - NR^b R^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は上で定義される通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

I X - アルキレン - R^c - アルキレン - $\text{C}(=\text{O})$ R^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^b および R^c は上で定義される通りであり；

X - アルキレン - R^c - $\text{C}(=\text{O})$ - アルキレン - $(\text{X}^b)_{n'}$ であり、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、 X^b は、OH、ハロ、シアノ、および NR^b R^b からなる群から選択され、 n' は、 X^b がハロであり n' が 1 ~ 3 であり得る場合を除いて、1 であり；さらに、各 R^b が独立して上で定義された通りであり、 R^c は上で定義された通りであり；

X I - アルキレン - R^c - $\text{C}(=\text{O})$ - R^d であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、 R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され、 R^d は、置換されたアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環式およびシクロアルキルからなる群から選択され；

X I I - アルキレン - R^c - NR^b $\text{C}(=\text{O})$ R^e であり、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、 R^b および R^c は、上で定義された通りであり、 R^e は、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたヘテロアリールであり；

X I I I - アルキニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；

X I V - アルキニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；

そして

X V - アルキレン - R^c - NR^b - $\text{C}(=\text{NR}^b)$ R^b であり、ここでアルキレンは必要に応じて置換され、 R^b および R^c の各々は、上で定義された通りであり；

さらに、但し、

A . R^1 がベンジルである場合には、 R は 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルではなく；

B . R^1 が 2 - (ピリド - 4 - イル) エチル - 1 - イルである場合には、 R は 1 - メチルピラゾル - 4 - イルではなく；

C . R^1 がベンジルである場合には、 R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

D . R^1 が水素である場合には、 R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

E . R^1 が 3 - クロロベンジルである場合、 R は 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニルではなく；

F . R^1 がベンジルである場合には、 R はフェニルではなく；

G . R^1 がフェニルである場合には、 R はキノリン - 8 - イルではなく；および

H . R^1 がベンジルである場合、 R はチエン - 2 - イルではなく；および

以下の公知の化合物が除かれる：

I . R^1 が 2 - メトキシフェニルである場合には、 R は 4 - メチルフェニルではなく；および

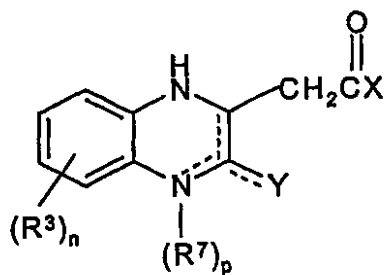
J . R^1 が 2 - エトキシフェニルである場合には、 R は 4 - メチルフェニルではない、

化合物。

【請求項 2 2】

以下：

【化 1 0】



III

の式 I I I に記載の化合物であって、

ここで、

R^3 、 R^7 、 n 、 p 、 Y および

【化 1 1】

==

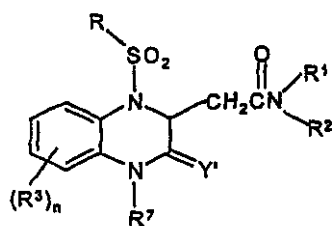
の結合線は、請求項 1 で定義された通りであり、 X は、 $-NR^1R^2$ （ここで、 R^1 および R^2 は、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、置換されたアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルからなる群から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換された、窒素含有ヘテロシクリルである）からなる群から選択されるか、または X は $-OR^{10}$ （ここで、 R^{10} は、水素または低級アルキルである）である、

化合物。

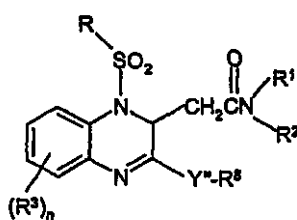
【請求項 2 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、前記化合物は、以下の式 I (a) ~ I (i) からなる群から選択され、

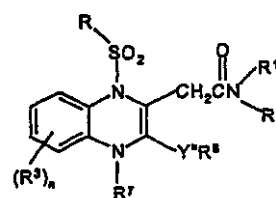
【化 1 2】



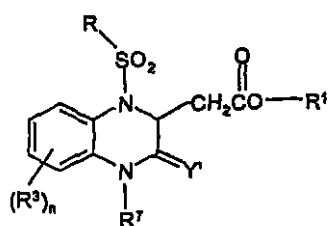
I(a)



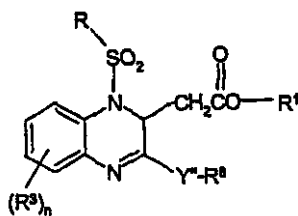
I(b)



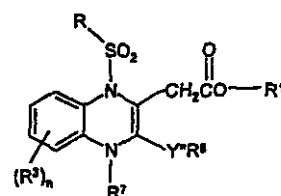
I(c)



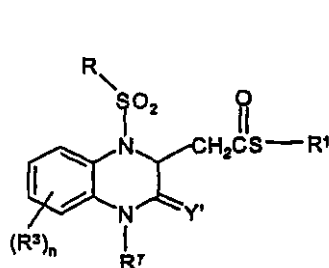
I(d)



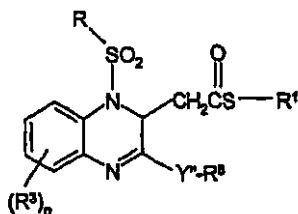
I(e)



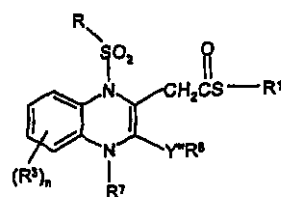
I(f)



I(g)



I(h)



I(i)

ここで、 Y' は $=O$ または $=S$ であり、 Y'' は $-O-$ または $-S-$ であり、 R^7 は請求項 1 に定義される通りであるが、式 I (c) において、 R^7 は水素ではなく、 n 、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^8 は、請求項 1 に定義される通りであり、

但し、式 I (a) において、

A. R^1 は水素であり、 R^2 がベンジルであり、 R^7 はメチルであり、 n は 0 であり、 p は 1 であり、および Y' が $=O$ である場合には、 R は 2, 4, 6 - トリメチルフェニルではなく；

B. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - (ピリド - 4 - イル) エチル - 1 - イルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が $=O$ である場合には、 R は 1 - メチルピラゾル - 4 - イルではなく；

C. R^1 および R^7 が水素、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が $=O$ である場合には、 R は 2, 4 - ジフルオロフェニルではなく；

D. R^1 、 R^2 および R^7 が水素であり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が $=O$ である場合には、 R は 2, 4 - ジフルオロフェニルではなく；

E. R^1 が水素であり、 R^2 および R^7 が 3 - クロロベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R は 4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルフェニルではなく；

F. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R はフェニルではなく；

G. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R はキノリン - 8 - イルではなく；および

H. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 がベンジルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R はチエン - 2 - イルではなく；および

以下の公知の化合物が除かれる：

I. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - メトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R は 4 - メチルフェニルではなく；および

J. R^1 および R^7 が水素であり、 R^2 が 2 - エトキシフェニルであり、 n が 0 であり、 p が 1 であり、および Y' が = O である場合には、 R は 4 - メチルフェニルではない、

化合物。

【請求項 24】

以下：

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - 1 - ピロリジン - N - イルカルボニル - 2 - フェニルエト - 1 イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [(ピペリジン - 1 - イル) カルボニルメチル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - (2 - ヒドロキシエト - 1 - イル) アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - 2 - フェニル - 1 - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - 2 - フェニル - 1 - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [(2 - ジメチルアミノ) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (メトキシカルボニル) - 2 - (N - メチルピペリジン - 4 - イル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - 1, 3 - ジ (ベンジルオキシカルボニル) プロポ - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (イソプロポキシカルボニル) - 2 - (フェニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R, S) - 1 - (4 - クロロ - 2, 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) -
3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (S
) - 1 , 3 - ジカルボキサミドプロプ - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [2 - フェ

ニル - 1 - (S) - (メトキシカルボニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - (2 - フェニル - 1 - (R) - カルボキシ - エト - 1 - イル) アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (, - ジメチルグリシン) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (- アミノアセチル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [4 - (イミダゾリン - 2 - イル) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - 1 - イルカルボニル) エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [4 - (イミダゾリン - 2 - イル) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - 1 - イルカルボニル) エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [3 - (ジメチルアミノ) プロブ - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - (3 - t - ブトキシカルボニル - 1 - メトキシカルボニルプロブ - 1 - イル) アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - アミノアセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [4 - (エチルアミノアミジノ) フェニル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - メチルカルボキサミドアセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - シアノメチルアセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [(4 - イミダゾリン - 2 - イル) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [(4 - イミダゾリン - 2 - イル) フェニル] - 1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (S) - メトキシ] - N - メチルアセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - メトキシカルボニルフェニルメチル)] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - (N ' - t - ブトキシ - カルボニルアミノ) - n - ブト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - アミジノ) フェニル - エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - アミジノ) フェニル - エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - グアニジノ - ブト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - グアニジノ - ブト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S , R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - メチレンカルボニル - [4 - (2 - アミノエチル)] ピペリジン - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - (4 - ヨードフェニル) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - メチレンカルボニル - { [4 - (2 - (N - t - ブトキシカルボニル - アミノ) エチル) ピペリジン - 1 - イル] } アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - アミノ - n - ブチル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 4 - アミノ - n - ブチル] アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - (t - ブトキシ - カルボニルアミノ) - ペント - 5 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - (t - ブトキシ - カルボニルアミノ) - ペント - 5 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - メチレンカルボニル { [1 - (ピリジン - 2 - イル)] - 4 - ピペリジン - 4 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 - (R) - (ピロリジン - N - イルカルボニル) - 5 - アミノ - n - ペント - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [1 -

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 1 - (R) - [ピロリジン - N - イルカルボニル] - 2 - [4 - (ピペリジン - 2 - イル) - シクロヘキシル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 1 -

(R) - [ピロリジン - N - イルカルボニル] - 2 - [4 - (N - t - ブトキシカルボニルピロール - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 1 - (R) - [ピロリジン - N - イルカルボニル] - 2 - [4 - (N - t - ブトキシカルボニルピロール - 2 - イル) フェニル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (N ' , N ' - ジメチルアミノカルボニル) アミノフェン - 1 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (メチルカルボニルメチレン) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (2 , 3 - ジクロロベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [2 - (N ' , N ' - ジメチルアミノ) エト - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (N ' - モルホリノカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - [(チオフエン - 2 - イル) メチレンカルボニル] ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (3 , 5 - ジメチルオキサゾル - 4 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [(N - フラン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (3 , 5 - ジメチルオキサゾル - 3 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (5 - メチルピラゾル - 3 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (1 - メチル - 3 - t - ブチルピラゾル - 5 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [N - (4 - メチルチアジアゾル - 5 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 -

[N - (クロロメチレンカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } - アセト
アミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (ベンジルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } - アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (2 - フェニルエテニルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセ
トアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (メトキシメチレンカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトア
ミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (ピラジン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセト
アミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (イソキノリン - 3 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } ア
セトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (ピロリジン - 5 - オン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 -
イル } アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (N ' - アセチルピロリジン - 2 - イルカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト -
1 - イル } アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 2 - [

N - (ジクロロメチレンカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] エト - 1 - イル } アセトア
ミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [

N - (ピラジン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル } - アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [

N - (イソキノリン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル } アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [

N - (N ' - アセチルピロリジン - 2 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル }
アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [

N - (1 , 2 - ベンゾチアジアゾル - 5 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル
} アセトアミド
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
- 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [

N - (ベンゾフラン - 5 - イルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)]
 - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - { 4 - [N - (フェニルカルボニル) アミノ] フェネト - 1 - イル } アセトアミド

2 - [2 - (R または S) - 1 - (4 - クロロ、2, 5 - ジメチルベンゼンスルホンル)] - 3 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - メチル - N - { 1 - [(R) - ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチル

ピリド - 4 - イル) フェン - 1 - イル) エト - 1 - イル] } アセトアミド

2 - [2 - (S または R) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル)] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - メチル - N - { 1 - [(R) - ピロリジン - N - イルカルボニル) - 2 - [4 - (N - メチルピリド - 4 - イル) フェン - 1 - イル) エト - 1 - イル] } アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (2 , 5 - ジメチル - 4 - クロロベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [4 - (ピロリジン - 2 - イル) - 3 - ブチン - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [4 - (ピリド - 4 - イル) プト - 3 - イン - 1 - イル] アセトアミド

2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [2 - (ベンゾイミダゾル - 2 - イルアミノ) エト - 1 - イル] アセトアミド

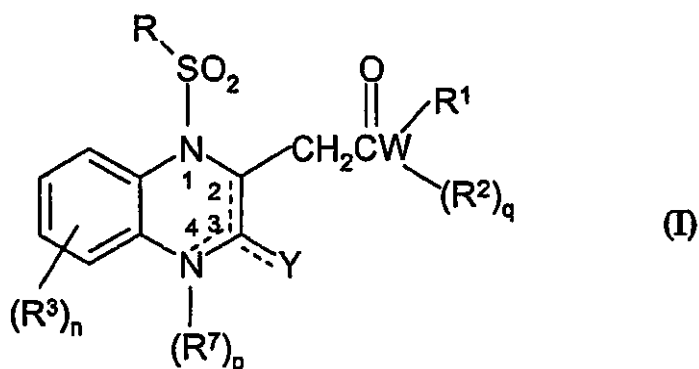
2 - [2 - (R , S) - 1 - (4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルベンゼンスルホニル) - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 2 - イル] - N - [3 - (ベンゾイミダゾル - 2 - イルアミノ) プロブ - 1 - イル] アセトアミド、

からなる群から選択される化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩。

【請求項 25】

薬学的に受容可能な希釈剤および有効量の以下：

【化 13】



の式の化合物およびその薬学的に受容可能な塩を含む薬学的組成物であって、
ここで、

【化 14】

==

によって表される結合の 1 つが二重結合であり、他の 2 つが単結合であり；

n は、0 ~ 4 の整数であり；

p は、0 または 1 であり；

q は、0 または 1 であり；

Y は、= O、= S、- OR⁸、- NHR⁸、= NR⁸、- SR⁸ からなる群から選択され、Y が - NHR⁸ または = NR⁸ である場合には、R⁷ および R⁸ は、それらが結合する窒素原子と一緒に、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式、または置換された不飽和複素環式を形成し得；

但し、

Y が、= O、= S、または = NR⁸ である場合には、2 , 3 位間および 3 , 4 位間の

【化 15】

==

によって表される結合が、単一の共有結合であり、 p は 1 であり；

Y が $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、または $-NHR^8$ であり、 p が 0 である場合には、3，4 位間の

【化 1 6】

==

によって表される結合が、二重結合であり；または

Y が $-OR^8$ 、 $-SR^8$ 、または $-NHR^8$ であり、 $p = 1$ であり、 R^7 が水素以外である場合には、2，3 位間の

【化 1 7】

==

によって表される結合が、二重結合であり；

W は、 O 、 S 、および N からなる群から選択され、ここで、

W が O または S である場合には、 q は 0 であり；そして W が N である場合には、 q は 1 であり；

R は、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

R^1 および R^2 は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、あるいは R^1 および R^2 がそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、または置換された複素環式を形成し、

各 R^3 は、独立して、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アミノ、置換されたアミノ、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アルコキシ、置換されたアルコキシ、アリール、置換されたアリール、アリールオキシ、置換されたアリールオキシ、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、置換されたヘテロアリールオキシ、複素環式、置換された複素環式、ヘテロシクリルオキシ、置換されたヘテロシクリルオキシ、アシル、アシルオキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $-C(O)OR^{10}$ （ここで、 R^{10} は、アルキル、置換されたアルキル、アリール、または置換されたアリールである）、および $-C(O)NR^{11}R^{12}$ （ここで、 R^{11} および R^{12} は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択されるか、または R^{11} および R^{12} はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式基を形成する）からなる群から選択され；

あるいは、2 個以上の R^3 がそれらが結合する炭素原子と一緒にあって、縮合環シクロアルケニル、置換されたシクロアルケニル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^7 は、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

あるいは、 R^7 は、少なくとも 1 個の R^3 、ならびにそれらが結合する窒素原子および炭素原子と一緒にあって、縮合環ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、不飽和複素環式または置換された不飽和複素環式を形成し；

R^8 は、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、シクロ

アルキル、置換されたシクロアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式、置換された複素環式、アシルおよびアシルオキシからなる群から選択され；

I - アルキレン - C(=O)R^a であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、R^a は、ヒドロキシル、-NR^bR^b、-OR^b、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロシクリル、置換されたヘテロシクリル（ここで、各 R^b は、独立して、水素、アルキル、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アルキニル、置換されたアルキニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択される）からなる群から選択され；

II - アルキレン - X^a であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、X^a は、-OH、シアノ、および -NR^bR^b（ここで、各 R^b は、独立して、上で定義される通りである）からなる群から選択され；

III - NHR^b であり、ここで、R^b は、上で定義される通りであり；

IV - OR^b であり、ここで、R^b は、上で定義される通りであり；

V - アルキレン - het^a - C(=O) - CH(R^b)NR^bR^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、het^a は、het^a 基の環窒素原子を介して -C(O)- 基に結合した窒素含有ヘテロシクリル基であり、各 R^b は、上で定義される通りであり；

VI - アルキレン - het^a - C(=O) - het^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、het^a は、上で定義された通りであり、het^b は、ヘテロシクリルであり；

VII - アルキレン - R^c - NR^bC(=NR^b)NR^bR^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は、上で定義された通りであり、R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され；

VIII - アルキレン - R^c - NR^bC(=O) - NR^bR^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、各 R^b は上で定義される通りであり、R^c は上で定義された通りであり；

IX - アルキレン - R^c - アルキレン - C(=O)R^b であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、R^b および R^c は上で定義される通りであり；

X - アルキレン - R^c - C(=O) - アルキレン - (X^b)_{n'}、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、X^b は、OH、ハロ、シアノ、および -NR^bR^b からなる群から選択され、n' は、X^b がハロであり n' が 1 ~ 3 であり得る場合を除いて、1 であり；さらに、各 R^b が独立して上で定義された通りであり、R^c は上で定義された通りであり；

XI - アルキレン - R^c - C(=O) - R^d であり、ここで、アルキレンは、必要に応じて置換され、R^c は、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたシクロアルキル、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、複素環式および置換された複素環式からなる群から選択され、R^d は、置換されたアルキル、アリール、ヘテロアリール、複素環式およびシクロアルキルからなる群から選択され；

XII - アルキレン - R^c - NR^bC(=O)R^e であり、ここで、アルキレンは必要に応じて置換され、R^b および R^c は、上で定義された通りであり、R^e は、置換されたアルキル、アルケニル、置換されたアルケニル、アリール、置換されたアリール、シクロアルキル、置換されたヘテロアリールであり；

XIII - アルキニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；

XIV - あるいは、R¹ および R² が、それらに結合する窒素原子と一緒に結合して

、置換されたアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換された、窒素含有ヘテロシクリルを形成し；

X V - アルケニレン - R^d であり、ここで R^d は、上で定義された通りであり；
および

X V I - アルキレン - R^c - N R^b - C (= N R^b) R^b であり、ここでアルキレンは必要に応じて置換され、R^b および R^c の各々は、上で定義された通りであり；

さらに、但し、

A . W が N であり、R¹ は水素であり、R² がベンジルであり、R⁷ はメチルであり、n は 0 であり、p は 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルではなく；

B . W が N であり、R¹ および R⁷ が水素であり、R² が 2 - (ピリド - 4 - イル) エチル - 1 - イルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 1 - メチルピラゾル - 4 - イルではなく；

C . W が N であり、R¹ および R⁷ が水素、R² がベンジルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

D . W が N であり、R¹、R² および R⁷ が水素であり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 2 , 4 - ジフルオロフェニルではなく；

E . W が N であり、R¹ が水素であり、R² および R⁷ が 3 - クロロベンジルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R は 4 - クロロ - 2 , 5 - ジメチルフェニルではなく；

F . W が N であり、R¹ および R⁷ が水素であり、R² がベンジルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はフェニルではなく；

G . W が N であり、R¹ および R⁷ が水素であり、R² がフェニルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はキノリン - 8 - イルではなく；および

H . W が N であり、R¹ および R⁷ が水素であり、R² がベンジルであり、n が 0 であり、p が 1 であり、および Y が = O である場合には、R はチエン - 2 - イルではない、薬学的組成物。

【請求項 26】

症状が少なくとも一部ブラジキニンの存在によって媒介される哺乳動物における悪症状を処置または緩和するための、薬学的に受容可能なキャリアおよび治療有効量の請求項 25 に定義されるような式 I の化合物（その混合物を含む）、またはその薬学的に受容可能な塩を含む、薬学的組成物。

【請求項 27】

哺乳動物におけるブラジキニンの存在または分泌に関連した該哺乳動物における悪症状を処置または緩和するための請求項 25 に記載の薬学的組成物。

【請求項 28】

哺乳動物におけるブラジキニンの存在または分泌に関連した該哺乳動物における悪症状を処置または緩和するための請求項 26 に記載の薬学的組成物。

【請求項 29】

哺乳動物におけるブラジキニンの放出に関連した該哺乳動物における疼痛、痛覚過敏、高体温および / または水腫を処置または緩和するための請求項 25 に記載の薬学的組成物

。

【請求項 30】

哺乳動物におけるブラジキニンの放出に関連した該哺乳動物における疼痛、痛覚過敏、高体温および / または水腫を処置または緩和するための請求項 26 に記載の薬学的組成物

。

【請求項 31】

やけど、手術時の痛み、片頭痛、ショック、中枢神経系傷害、ぜん息、鼻炎、早産、炎

症性関節炎、または炎症性腸疾患に対してブラジキニンの放出に関連した哺乳動物における悪症状を処置または緩和するための請求項 2 5 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 2】

やけど、手術時の痛み、片頭痛、ショック、中枢神経系傷害、ぜん息、鼻炎、早産、炎症性関節炎、炎症性腸疾患、神経障害疼痛、脊髄損傷、または背中の疼痛に対してブラジキニンの放出に関連した哺乳動物における悪症状を処置または緩和するための請求項 2 6 に記載の薬学的組成物。