【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24年11月29日(2012.11.29)

【公表番号】特表2012-505920(P2012-505920A)
【公表日】平成24年3月8日(2012.3.8)
【年通号数】公開・登録公報2012-010
【出願番号】特願2011-532293(P2011-532293)
【国際特許分類】
*Ｃ０７Ｃ 237/04 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 403/06 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 233/64 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 409/14 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 417/12 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 249/08 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 403/14 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 295/14 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 35/02 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4192 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4164 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/427 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4196 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4178 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/167 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 333/24 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/341 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 307/68 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/498 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 241/44 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 333/38 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/404 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 209/42 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 209/18 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/277 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/4406 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/44 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 213/56 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 213/81 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/47 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/415 (2006.01)*
*Ａ６１Ｋ 31/502 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 215/50 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 215/48 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 237/28 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 231/14 (2006.01)*
*Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)*
*Ｃ０７Ｄ 307/54 (2006.01)*

*C07D 207/452 (2006.01)*
*C07D 213/82 (2006.01)*
*A61K 31/4015 (2006.01)*
*A61K 31/455 (2006.01)*
*C07D 209/08 (2006.01)*
*C07D 307/24 (2006.01)*
*C07D 405/06 (2006.01)*
*A61K 31/4025 (2006.01)*
*C07D 413/06 (2006.01)*
*A61K 31/422 (2006.01)*
*C07D 207/16 (2006.01)*
*A61K 31/495 (2006.01)*
*A61K 31/506 (2006.01)*
*C07D 239/42 (2006.01)*
*A61K 31/454 (2006.01)*
*C07D 211/58 (2006.01)*
*C07D 211/14 (2006.01)*
*A61K 31/421 (2006.01)*
*C07D 263/32 (2006.01)*
*C07D 215/06 (2006.01)*
*A61K 31/4184 (2006.01)*
*C07D 403/12 (2006.01)*

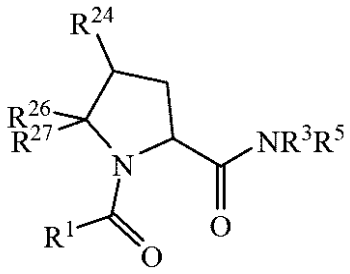
【ＦＩ】

C07C 237/04 CSPA
C07D 403/06
C07D 233/64 106
C07D 409/14
C07D 417/12
C07D 249/08 530
C07D 233/64 104
C07D 403/14
C07D 295/14 A
C07D 295/14 Z
A61P 35/00
A61P 35/02
A61K 31/4192
A61K 31/4164
A61K 31/427
A61K 31/4196
A61K 31/4178
A61K 31/496
A61K 31/167
A61K 31/381
C07D 333/24
A61K 31/341
C07D 307/68
A61K 31/498
C07D 241/44
C07D 333/38
A61K 31/404

Ｃ０７Ｄ 209/42
Ｃ０７Ｄ 209/18
Ａ６１Ｋ 31/277
Ａ６１Ｋ 31/4406
Ａ６１Ｋ 31/44
Ｃ０７Ｄ 213/56
Ｃ０７Ｄ 213/81
Ａ６１Ｋ 31/47
Ａ６１Ｋ 31/415
Ａ６１Ｋ 31/502
Ｃ０７Ｄ 215/50
Ｃ０７Ｄ 215/48
Ｃ０７Ｄ 237/28
Ｃ０７Ｄ 231/14
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ｃ０７Ｄ 307/54
Ｃ０７Ｄ 207/452
Ｃ０７Ｄ 213/82
Ａ６１Ｋ 31/4015
Ａ６１Ｋ 31/455
Ｃ０７Ｄ 209/08
Ｃ０７Ｄ 307/24
Ｃ０７Ｄ 405/06
Ａ６１Ｋ 31/4025
Ｃ０７Ｄ 413/06
Ａ６１Ｋ 31/422
Ｃ０７Ｄ 207/16
Ａ６１Ｋ 31/495
Ａ６１Ｋ 31/506
Ｃ０７Ｄ 239/42 Ｚ
Ａ６１Ｋ 31/454
Ｃ０７Ｄ 211/58
Ｃ０７Ｄ 211/14
Ａ６１Ｋ 31/421
Ｃ０７Ｄ 263/32
Ｃ０７Ｄ 215/06
Ａ６１Ｋ 31/4184
Ｃ０７Ｄ 403/12

【手続補正書】
【提出日】平成24年10月9日(2012.10.9)
【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ＩＶ：

【化６７】



ＩＶ

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、
式中、
$R^1$はアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、$-X^1OR^7$、$-X^1C(O)OR^7$、$-X^1C(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)OR^7$、$-X^1OC(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)NR^7R^7$、$-X^1S(O)_{n1}OR^7$、$-X^1S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7R^7$、$-X^1C(O)R^7$、$-X^1OC(O)R^8$、$-X^1NR^7C(O)R^8$、$-X^1S(O)_{n1}R^8$、$-X^1OS(O)_{n1}R^8$または$-X^1NR^7S(O)_{n1}R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^8$は（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、または、
$R^1$は、$-X^2CR^9R^9R^{11}$、$-X^2OR^{11}$、$-X^2C(O)OR^{11}$、$-X^2C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)OR^{11}$、$-X^2OC(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}OR^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}R^{11}$、$-X^2C(O)R^{11}$、$-X^2OC(O)R^{11}$、$-X^2NR^9C(O)R^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}R^{11}$、$-X^2OS(O)_{n2}R^{11}$または$-R^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^9$は各出現時に独立してハロであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{11}$は$-X^3R^{12}$であり、ここで、$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、
$R^{12}$は、$-X^4CR^{13}R^{13}R^{15}$、$-X^4OR^{15}$、$-X^4C(O)OR^{15}$、$-X^4C(O)NR^{14}R^{15}$、$-X^4NR^{14}C(O)OR^{15}$、$-X^4OC(O)NR^{14}R^{15}$、$-X^4NR^{14}C(O)NR^{14}R^{15}$、$-X^4S(O)_{n3}OR^{15}$、$-X^4S(O)_{n3}NR^{14}R^{15}$、$-X^4NR^{14}S(O)_{n3}NR^{14}R^{15}$、$-X^4NR^{14}R^{15}$、$-X^4C(O)R^{15}$、$-X^4OC(O)R^{15}$、$-X^4NR^{13}C(O)R^{15}$、$-X^4S(O)_{n3}R^{15}$、$-X^4OS(O)_{n3}R^{15}$または$-R^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、$X^4$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{13}$は各出現時に独立してハロであり、$R^{14}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、かつ、$R^{15}$は$-X^5R^{16}$であり、ここで、$X^5$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、
$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$C_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$C_{1-4}$）アルキ

ル、（$C_{2-4}$）アルケニル、－$X^6OR^{17}$、－$X^6C(O)OR^{17}$、－$X^6C(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^6NR^{17}C(O)OR^{17}$、－$X^6OC(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^6NR^{17}C(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^6S(O)_{n4}OR^{17}$、－$X^6S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、－$X^6NR^{17}S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、－$X^6NR^{17}R^{17}$、－$X^6C(O)R^{17}$、－$X^6OC(O)R^{18}$、－$X^6NR^{17}C(O)R^{18}$、－$X^6S(O)_{n4}R^{18}$、－$X^6OS(O)_{n4}R^{18}$および－$X^6NR^{17}S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^6$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；

$R^{24}$は－$X^9OR^{29}$、－$X^9NR^{28}C(O)OR^{29}$、－$X^9NR^{28}R^{29}$、－$X^9C(O)OR^{29}$または－$R^{29}$であり、ここで、$X^9$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{28}$は水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{29}$は－$X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^{30}$は、（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、

$R^{26}$および$R^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

$R^3$は$R^{31}$により置換されたフェニルであり、ここで、$R^{31}$は－$OR^{33}$、－$SR^{33}$または－$CH_2R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル、フェニルまたは五もしくは六員ヘテロアリールであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは－$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；

$R^4$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、

$R^5$は水素またはアルキルであり、式ＩＶの化合物は、任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。

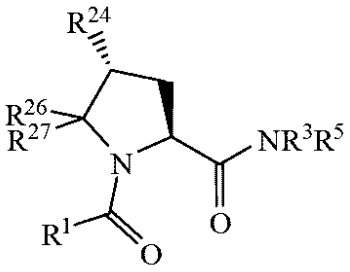
【請求項２】

$R^1$が、アルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、－$X^1OR^7$、－$X^1C(O)OR^7$、－$X^1C(O)NR^7R^7$、－$X^1NR^7C(O)OR^7$、－$X^1OC(O)NR^7R^7$、－$X^1NR^7C(O)NR^7R^7$、－$X^1S(O)_{n1}OR^7$、－$X^1S(O)_{n1}NR^7R^7$、－$X^1NR^7S(O)_{n1}NR^7R^7$、－$X^1NR^7R^7$、－$X^1C(O)R^7$、－$X^1OC(O)R^8$、－$X^1NR^7C(O)R^8$、－$X^1S(O)_{n1}R^8$、－$X^1OS(O)_{n1}R^8$または－$X^1NR^7S(O)_{n1}R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^8$は（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、または

$R^1$が、－$X^2CR^9R^9R^{11}$、－$X^2OR^{11}$、－$X^2C(O)OR^{11}$、－$X^2C(O)NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}C(O)OR^{11}$、－$X^2OC(O)NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}C(O)NR^{10}R^{11}$、－$X^2S(O)_{n2}OR^{11}$、－$X^2S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}R^{11}$、－$X^2C(O)R^{11}$、－$X^2OC(O)R^{11}$、－$X^2NR^9C(O)R^{11}$、－$X^2S(O)_{n2}R^{11}$、－$X^2OS(O)_{n2}R^{11}$または－$R^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^9$は各出現時に独立してハロであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{11}$は－$X^3R^{12}$であり、ここで、$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル

、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、
$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$C_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{2-4}$）アルケニル、$-X^6OR^{17}$、$-X^6C(O)OR^{17}$、$-X^6C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}C(O)OR^{17}$、$-X^6OC(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6S(O)_{n4}OR^{17}$、$-X^6S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}R^{17}$、$-X^6C(O)R^{17}$、$-X^6OC(O)R^{18}$、$-X^6NR^{17}C(O)R^{18}$、$-X^6S(O)_{n4}R^{18}$、$-X^6OS(O)_{n4}R^{18}$および$-X^6NR^{17}S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^6$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；
$R^{24}$が$-X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$はメチレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；
$R^{26}$および$R^{27}$がどちらも水素であり；
$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは$-OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；
$R^5$が水素であり、式ＩＶの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、請求項１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項３】
$R^1$がアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ニトロ置換アルキル、シアノ置換アルキル、$-X^1OR^7$、$-X^1C(O)OR^7$、$-X^1C(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7R^7$、$-X^1C(O)R^7$、$-X^1S(O)_{n1}R^8$または$-X^1OC(O)R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^8$は（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、または
$R^1$が、$-X^2NR^{10}R^{11}$、$-X^2OR^{11}$、$-X^2C(O)R^{11}$、$-X^2NR^9C(O)R^{11}$または$-R^{11}$であり、ここで、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、アルキルまたはハロ置換アルキルであり、$R^{11}$は$-X^3R^{12}$であり、ここで、$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールは、独立して、（$C_{1-3}$）アルキル、ハロ、ニトロ、ハロ置換（$C_{1-3}$）アルキル、$-X^6OR^{17}$、$-X^6C(O)OR^{17}$、$-X^6NR^{17}R^{17}$、$-X^6C(O)R^{17}$、$-X^6C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6OC(O)R^{18}$および$-X^6S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、$X^6$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；
$R^{24}$が$-X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$はメチレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチ

ルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；
Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$がどちらも水素であり；
Ｒ$^{3}$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、Ｒ$^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、ハロまたはＯＲ$^{35}$で置換されていてもよく、ここで、Ｒ$^{35}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；また、
Ｒ$^{5}$が水素である、式ＩＶの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、請求項２に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項４】
式ＩＶ（ａ）：
【化６８】



ＩＶ（ａ）

の化合物である、請求項１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項５】
Ｒ$^{1}$が五員ヘテロアリールであり、Ｒ$^{3}$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、Ｒ$^{5}$が水素であり、Ｒ$^{24}$が－Ｘ$^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、Ｘ$^{11}$はメチレンであり、かつ、Ｒ$^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；そして、Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$がどちらも水素である、請求項４に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項６】
Ｒ$^{1}$が２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イルメチル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチルまたは１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イルであり；Ｒ$^{3}$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、Ｒ$^{5}$は水素であり、Ｒ$^{24}$は－Ｘ$^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、Ｘ$^{11}$はメチレンであり、かつ、Ｒ$^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはブロモ、クロロおよびフルオロから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$がどちらも水素である、請求項５に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項７】
（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－ベンジル－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジ

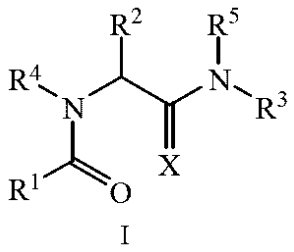
ン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－ベンジル－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－（トリフルオロメチル）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（チオフェン－３－イルメチル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－５－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（４－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（３－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メトキシベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メトキシベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（（５－クロロチエン－２－イル

）メチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（（５－クロロチエン－２－イル）メチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－チエン－２－イルメチルピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）酢酸および（２Ｓ，４Ｒ）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；および（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミドからなる群から選択される、請求項６に記載の化合物および上記化合物のいずれかの薬学的に許容される塩。

【請求項８】

式Ｉ：

【化６９】



I

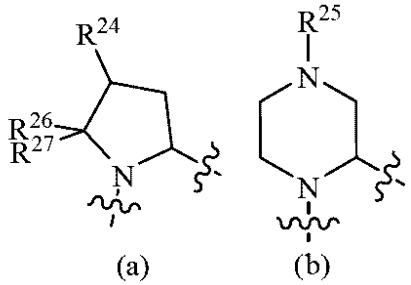
の化合物またはその薬学的に許容される塩であって、
式中、
ＸはＯまたはＮＲ$^{6}$であり；
Ｒ$^{1}$はアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、－Ｘ$^{1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＯＳ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$または－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、Ｘ$^{1}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{7}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{8}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、または、
Ｒ$^{1}$は、－Ｘ$^{2}$ＣＲ$^{9}$Ｒ$^{9}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{9}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＳ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$または－Ｒ$^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、Ｘ$^{2}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{9}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{10}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{11}$は－Ｘ$^{3}$Ｒ$^{12}$であり、ここで、Ｘ$^{3}$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、Ｒ$^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、
Ｒ$^{12}$は、－Ｘ$^{4}$ＣＲ$^{13}$Ｒ$^{13}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＮＲ$^{14}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＮＲ$^{13}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＳ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$または－Ｒ$^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、Ｘ$^{4}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{13}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{14}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{15}$は－Ｘ$^{5}$Ｒ$^{16}$であり、ここで、Ｘ$^{5}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中：
Ｒ$^{1}$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、（Ｃ$_{2-4}$）アルケニル、－Ｘ$^{6}$ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｃ（Ｏ

）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$ＯＳ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$および－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$から独立して選択される１～３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、Ｘ$^{6}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{17}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{18}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^{2}$は－Ｘ$^{7}$ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ$^{19}$、－Ｘ$^{7}$ＮＲ$^{20}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＣＲ$^{21}$Ｒ$^{21}$Ｒ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$ＯＲ$^{22}$または－Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、Ｘ$^{7}$は（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{19}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{20}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{21}$はハロであり、Ｒ$^{22}$は－Ｘ$^{8}$Ｒ$^{23}$であり、ここで、Ｘ$^{8}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{23}$はフェニルであり、ここで、Ｒ$^{23}$は、ハロ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、または

Ｒ$^{2}$は、Ｒ$^{4}$およびＲ$^{2}$とＲ$^{4}$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７０】

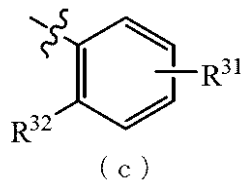



の五または六員環を形成して、

式中、Ｒ$^{24}$は－Ｘ$^{9}$ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、Ｒ$^{25}$は－Ｘ$^{10}$ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、ここで、Ｘ$^{9}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｘ$^{10}$は（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{28}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{29}$は－Ｘ$^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、Ｘ$^{11}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、Ｒ$^{30}$は、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、（Ｃ$_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

Ｒ$^{3}$は－Ｒ$^{31}$によって置換されたフェニル、または、Ｒ$^{3}$は、式（ｃ）：

【化７１】




（ｃ）

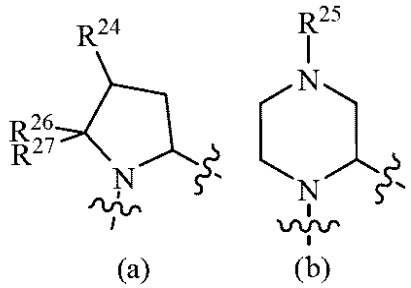
の基であって、
式中、$R^{31}$は－$OR^{33}$、－$SR^{33}$または－$CH_2R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、フェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、$R^{32}$は$R^6$と一緒に結合を形成し、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；
$R^4$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり；
$R^5$は水素またはアルキルであり、式Ｉの化合物は、任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。
【請求項９】
ＸがＯであり；
$R^1$がアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、－$X^1OR^7$、－$X^1C$（Ｏ）$OR^7$、－$X^1C$（Ｏ）$NR^7R^7$、－$X^1NR^7C$（Ｏ）$OR^7$、－$X^1OC$（Ｏ）$NR^7R^7$、－$X^1NR^7C$（Ｏ）$NR^7R^7$、－$X^1S$（Ｏ）$_{n1}OR^7$、－$X^1S$（Ｏ）$_{n1}NR^7R^7$、－$X^1NR^7S$（Ｏ）$_{n1}NR^7R^7$、－$X^1NR^7R^7$、－$X^1C$（Ｏ）$R^7$、－$X^1OC$（Ｏ）$R^8$、－$X^1NR^7C$（Ｏ）$R^8$、－$X^1S$（Ｏ）$_{n1}R^8$、－$X^1OS$（Ｏ）$_{n1}R^8$または－$X^1NR^7S$（Ｏ）$_{n1}R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^8$は（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、または
$R^1$は、－$X^2CR^9R^9R^{11}$、－$X^2OR^{11}$、－$X^2C$（Ｏ）$OR^{11}$、－$X^2C$（Ｏ）$NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}C$（Ｏ）$OR^{11}$、－$X^2OC$（Ｏ）$NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}C$（Ｏ）$NR^{10}R^{11}$、－$X^2S$（Ｏ）$_{n2}OR^{11}$、－$X^2S$（Ｏ）$_{n2}NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}S$（Ｏ）$_{n2}NR^{10}R^{11}$、－$X^2NR^{10}R^{11}$、－$X^2C$（Ｏ）$R^{11}$、－$X^2OC$（Ｏ）$R^{11}$、－$X^2NR^9C$（Ｏ）$R^{11}$、－$X^2S$（Ｏ）$_{n2}R^{11}$、－$X^2OS$（Ｏ）$_{n2}R^{11}$または－$R^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^9$は各出現時に独立してハロであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{11}$は－$X^3R^{12}$であり、ただし$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中：
$R^{12}$は、－$X^4CR^{13}R^{13}R^{15}$、－$X^4OR^{15}$、－$X^4C$（Ｏ）$OR^{15}$、－$X^4C$（Ｏ）$NR^{14}R^{15}$、－$X^4NR^{14}C$（Ｏ）$OR^{15}$、－$X^4OC$（Ｏ）$NR^{14}R^{15}$、－$X^4NR^{14}C$（Ｏ）$NR^{14}R^{15}$、－$X^4S$（Ｏ）$_{n3}OR^{15}$、－$X^4S$（Ｏ）$_{n3}NR^{14}R^{15}$、－$X^4NR^{14}S$（Ｏ）$_{n3}NR^{14}R^{15}$、－$X^4NR^{14}R^{15}$、－$X^4C$（Ｏ）$R^{15}$、－$X^4OC$（Ｏ）$R^{15}$、－$X^4NR^{13}C$（Ｏ）$R^{15}$、－$X^4S$（Ｏ）$_{n3}R^{15}$、－$X^4OS$（Ｏ）$_{n3}R^{15}$または－$R^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、$X^4$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{13}$は各出現時に独立してハロであり、$R^{14}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{15}$は－$X^5R^{16}$であり、ここで、$X^5$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、
$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$C_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{2-4}$）アルケニル、－$X^6OR^{17}$、－$X^6C$（Ｏ）$OR^{17}$、－$X^6C$（Ｏ

）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＯＲ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{17}$、－Ｘ$^{6}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$、－Ｘ$^{6}$ＯＳ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$および－Ｘ$^{6}$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$から独立して選択される１～３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、Ｘ$^{6}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{17}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{18}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^{2}$は－Ｘ$^{7}$ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ$^{19}$、－Ｘ$^{7}$ＮＲ$^{20}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＣＲ$^{21}$Ｒ$^{21}$Ｒ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$ＯＲ$^{22}$または－Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、Ｘ$^{7}$は（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{19}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{20}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{21}$はハロであり、Ｒ$^{22}$は－Ｘ$^{8}$Ｒ$^{23}$であり、ここで、Ｘ$^{8}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{23}$はフェニルであり、または

Ｒ$^{2}$は、Ｒ$^{4}$およびＲ$^{2}$とＲ$^{4}$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７２】




の五または六員環を形成して、

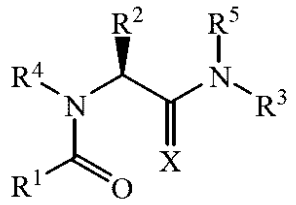
式中、Ｒ$^{24}$は－Ｘ$^{9}$ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、Ｒ$^{25}$は－Ｘ$^{10}$ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－Ｘ$^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－Ｘ$^{9}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、ここで、Ｘ$^{9}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｘ$^{10}$は（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{28}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{29}$は－Ｘ$^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、Ｘ$^{11}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、Ｒ$^{30}$は、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、（Ｃ$_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

Ｒ$^{3}$は－Ｒ$^{31}$で置換されたフェニルであり、ここで、Ｒ$^{31}$は－ＯＲ$^{33}$、－ＳＲ$^{33}$または－ＣＨ$_{2}$Ｒ$^{33}$であり、ここで、Ｒ$^{33}$は－Ｘ$^{12}$Ｒ$^{34}$であり、ここで、Ｘ$^{12}$は結合またはメチレンであり、Ｒ$^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、またはフェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、ここで、Ｒ$^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、ハロまたは－ＯＲ$^{35}$で置換されていてもよく、ここで、Ｒ$^{35}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^{4}$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、

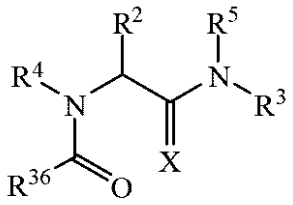
Ｒ$^{5}$は水素またはアルキルであり、式Ｉの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、請求項８に記載の化合物およびその薬学的に許容される塩。

【請求項１０】
式Ｉ（ａ）：
【化７３】



Ｉ（ａ）

の化合物である請求項９に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項１１】
ＸがＯであり；Ｒ$^{1}$が五員ヘテロアリールメチルであり；Ｒ$^{2}$が－Ｘ$^{7}$ＯＲ$^{22}$または－Ｘ$^{7}$Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、Ｘ$^{7}$はアルキレンであり、Ｒ$^{23}$がフェニルであり、ここで、Ｒ$^{23}$は１または２個のハロで置換されていてもよく；Ｒ$^{3}$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、Ｒ$^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、ハロまたはＯＲ$^{35}$で置換されていてもよく、ここで、Ｒ$^{35}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；また、Ｒ$^{4}$およびＲ$^{5}$が水素である、請求項１０に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項１２】
Ｒ$^{1}$が２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イルメチル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチルまたは１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イルであり；Ｒ$^{2}$が－Ｘ$^{7}$ＯＲ$^{22}$または－Ｘ$^{7}$Ｒ$^{22}$であり、ここで、Ｘ$^{7}$はアルキレンであり、Ｒ$^{23}$がフェニルであり、ここで、Ｒ$^{23}$は１個のハロで置換されていてもよく；Ｒ$^{3}$が４－（４－フルオロフェノキシ）である、請求項１１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項１３】
式ＩＩＩ：
【化７４】



ＩＩＩ

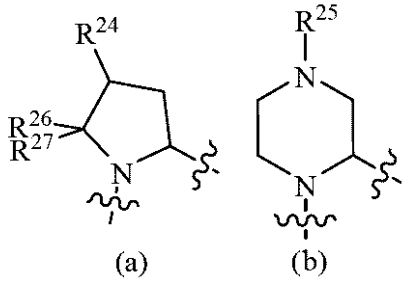
の化合物およびその薬学的に許容される塩であって、
式中、
ＸはＯまたはＮＲ$^{6}$であり；
Ｒ$^{36}$は１－（４－クロロベンジル）－５－オキソピロリジン－３－イル、２－フルオロベンジル、１Ｈ－イミダゾール－４－イルメチル、１Ｈ－インドール－４－イル、２－メチルチオピリド－３－イル、１Ｒ－ヒドロキシ－２－フェニルエチル、２－ヒドロキシフェノキシメチル、１Ｓ－アセチルオキシエチル、（Ｒ）－２－クロロフェニル（ヒドロキシ）メチル、テトラヒドロフル－２Ｒ－イル、３－メチルオキサゾール－５－イル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－シクロプロピルカルボニルエチル、２－ブロモ－５フルオロフェニル、インドール－４－イル、インドール－５－イル、インドール－６－イル、インダン－２－イル、３－メチル－２－ニトロフェニル、メチルスルホニルメチル、５－メチルピリド－３－イル、４－アセチルオキシフェニル、３－ヒドロキシフェニル（ヒ

ドロキシル）メチル、５－（２，５－ジオキソ－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－１－イル）ペンチル、フル－２－イルカルボニル、２Ｒ－メチル－２－フェニルエチル、３－クロロ－２－フルオロベンジル、５－クロロ－２－フルオロベンジル、３－クロロ－２－フルオロベンジル、１－アセチルピロリジン－２－イル、Ｎ－ベンゾイル－Ｎ－メチルアミノメチル、１Ｈ－イミダゾール（ｉｍｄａｚｏｌ）－４－イルメチル、１Ｈ－テトラゾール－１－イルメチル、１－メチルイミダゾール－４－イル、２－フルオロベンジル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチル、チエン－２－イルメチル、２，５－ジクロロベンジル、（（１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）メチルアミノ）メチルまたは２，５－ジオキソイミダゾリジン－４－イルメチルであり；

$R^2$は－$X^7$ＮＨＣ（Ｏ）$R^{19}$，－$X^7$$NR^{20}$Ｃ（Ｏ）$OR^{22}$、－$X^7$$CR^{21}R^{21}R^{22}$、－$X^7$$OR^{22}$、－$X^7$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$$OR^{22}$または－$R^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１または２であり、$X^7$は（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{19}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{20}$は水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{21}$はハロであり、$R^{22}$は－$X^8$$R^{23}$であり、ここで、$X^8$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{23}$はフェニルであり、ここで、$R^{23}$は、ハロ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、または、

$R^2$は$R^4$および$R^2$と$R^4$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７５】

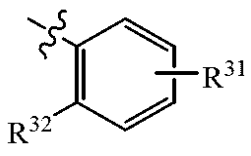



の五または六員環を形成して、

式中、$R^{24}$は－$X^9$$OR^{29}$、－$X^9$$NR^{28}$Ｃ（Ｏ）$OR^{29}$、－$X^9$$NR^{28}R^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）$OR^{29}$または－$R^{29}$であり、$R^{25}$は－$X^{10}$$OR^{29}$、－$X^{10}$$NR^{28}$Ｃ（Ｏ）$OR^{29}$、－$X^{10}$$NR^{28}R^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）$OR^{29}$または－$R^{29}$であり、ここで、$X^9$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$X^{10}$は（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{28}$は水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{29}$は－$X^{11}$$R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^{30}$は、（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、$R^{26}$および$R^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

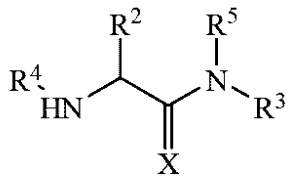
$R^3$は$R^{31}$によって置換されたフェニルであり、または、$R^3$は式（ｃ）：

【化７６】



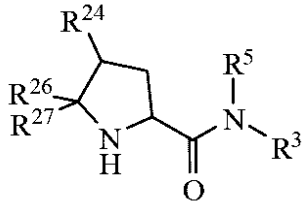

（ｃ）

の基であって、
式中、$R^{31}$は－$OR^{33}$，－$SR^{33}$または－$CH_2R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、またはフェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、$R^{32}$は$R^6$と一緒に結合を形成し、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；
$R^4$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、
$R^5$は水素またはアルキルであり、式ＩＩＩの化合物は、個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。
【請求項１４】
式Ｖ：
【化７７】



Ｖ

の化合物を式$R^1$ＣＯＯＨの化合物と反応させることを含む、請求項８に記載の化合物を調製する方法。
【請求項１５】
式Ｖ（ｂ）：
【化７８】



Ｖ（ｂ）

の化合物を式$R^1$ＣＯＯＨの化合物と反応させることを含む、請求項１に記載の化合物を調製する方法。
【請求項１６】
１種または複数の適切な賦形剤との混合物中に、請求項１に記載の化合物、またはその化合物の、個々の異性体もしくは異性体の混合物、または薬学的に許容される塩を含む医薬品組成物。
【請求項１７】
１種または複数の適切な賦形剤との混合物中に、請求項８に記載の化合物、またはその化合物の、個々の異性体もしくは異性体の混合物、または薬学的に許容される塩を含む医薬品組成物。
【請求項１８】
癌を有する患者において癌を治療するための組成物であって、該組成物は、請求項１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の治療上有効な量を含み、該組成物は、単独で、または、１種または複数の他の抗癌剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。
【請求項１９】

癌を有する患者において癌を治療する方法であって、該組成物は、請求項８に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の治療上有効な量を含み、該組成物は、単独で、または、１種または複数の他の抗癌剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項２０】

前記癌が、非小細胞肺癌、乳癌、前立腺癌、卵巣癌、頭頸部癌、胃腺腫、リンパ腫、白血病、多発性骨髄腫、精巣癌、横紋筋肉腫、ウィルムス腫、および神経芽細胞腫から選択される、請求項１９に記載の組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００３０

【補正方法】変更

【補正の内容】

【００３０】

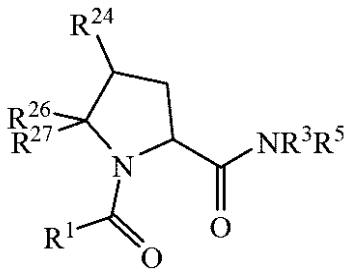
本発明の一態様は、癌を治療する方法であって、式式Ｉ、Ｉ（ａ）、ＩＩ、ＩＩ（ａ）、ＩＩＩ、ＩＩＩ（ａ）、ＩＶもしくはＩＶ（ａ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩を単独で、または１種もしくは複数の他の抗癌剤と組み合わせて、治療上有効な量を疾患を有する患者に投与することを含む。

本発明は、例えば、以下を提供する：

（項目１）

式ＩＶ：

【化６７】



ＩＶ

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、

式中、

$R^1$はアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、$-X^1OR^7$、$-X^1C(O)OR^7$、$-X^1C(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)OR^7$、$-X^1OC(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)NR^7R^7$、$-X^1S(O)_{n1}OR^7$、$-X^1S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7R^7$、$-X^1C(O)R^7$、$-X^1OC(O)R^8$、$-X^1NR^7C(O)R^8$、$-X^1S(O)_{n1}R^8$、$-X^1OS(O)_{n1}R^8$または$-X^1NR^7S(O)_{n1}R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、$(C_{1-4})$アルキル、アルコキシ置換$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、$R^8$は$(C_{1-4})$アルキル、アルコキシ置換$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、または、

$R^1$は、$-X^2CR^9R^9R^{11}$、$-X^2OR^{11}$、$-X^2C(O)OR^{11}$、$-X^2C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)OR^{11}$、$-X^2OC(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}OR^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}R^{11}$、$-X^2C(O)R^{11}$、$-X^2OC(O)R^{11}$、$-X^2NR^9C(O)R$

$^{11}$、－$X^{2}S(O)_{n2}R^{11}$、－$X^{2}OS(O)_{n2}R^{11}$または－$R^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、$X^{2}$は結合またはアルキレンであり、$R^{9}$は各出現時に独立してハロであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{11}$は－$X^{3}R^{12}$であり、ここで、$X^{3}$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、

$R^{12}$は、－$X^{4}CR^{13}R^{13}R^{15}$、－$X^{4}OR^{15}$、－$X^{4}C(O)OR^{15}$、－$X^{4}C(O)NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}NR^{14}C(O)OR^{15}$、－$X^{4}OC(O)NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}NR^{14}C(O)NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}S(O)_{n3}OR^{15}$、－$X^{4}S(O)_{n3}NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}NR^{14}S(O)_{n3}NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}NR^{14}R^{15}$、－$X^{4}C(O)R^{15}$、－$X^{4}OC(O)R^{15}$、－$X^{4}NR^{13}C(O)R^{15}$、－$X^{4}S(O)_{n3}R^{15}$、－$X^{4}OS(O)_{n3}R^{15}$または－$R^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、$X^{4}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{13}$は各出現時に独立してハロであり、$R^{14}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、かつ、$R^{15}$は－$X^{5}R^{16}$であり、ここで、$X^{5}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、

$R^{1}$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$C_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{2-4}$）アルケニル、－$X^{6}OR^{17}$、－$X^{6}C(O)OR^{17}$、－$X^{6}C(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}NR^{17}C(O)OR^{17}$、－$X^{6}OC(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}NR^{17}C(O)NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}S(O)_{n4}OR^{17}$、－$X^{6}S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}NR^{17}S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}NR^{17}R^{17}$、－$X^{6}C(O)R^{17}$、－$X^{6}OC(O)R^{18}$、－$X^{6}NR^{17}C(O)R^{18}$、－$X^{6}S(O)_{n4}R^{18}$、－$X^{6}OS(O)_{n4}R^{18}$および－$X^{6}NR^{17}S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^{6}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；

$R^{24}$は－$X^{9}OR^{29}$、－$X^{9}NR^{28}C(O)OR^{29}$、－$X^{9}NR^{28}R^{29}$、－$X^{9}C(O)OR^{29}$または－$R^{29}$であり、ここで、$X^{9}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{28}$は水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{29}$は－$X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^{30}$は、（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、

$R^{26}$および$R^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

$R^{3}$は$R^{31}$により置換されたフェニルであり、ここで、$R^{31}$は－$OR^{33}$、－$SR^{33}$または－$CH_{2}R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル、フェニルまたは五もしくは六員ヘテロアリールであり、ここで、$R^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは－$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；

$R^{4}$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、

$R^{5}$は水素またはアルキルであり、式ＩＶの化合物は、任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。

（項目２）

$R^1$が、アルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、$-X^1OR^7$、$-X^1C(O)OR^7$、$-X^1C(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)OR^7$、$-X^1OC(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7C(O)NR^7R^7$、$-X^1S(O)_{n1}OR^7$、$-X^1S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7S(O)_{n1}NR^7R^7$、$-X^1NR^7R^7$、$-X^1C(O)R^7$、$-X^1OC(O)R^8$、$-X^1NR^7C(O)R^8$、$-X^1S(O)_{n1}R^8$、$-X^1OS(O)_{n1}R^8$または$-X^1NR^7S(O)_{n1}R^8$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、$(C_{1-4})$アルキル、アルコキシ置換$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、$R^8$は$(C_{1-4})$アルキル、アルコキシ置換$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、または

$R^1$が、$-X^2CR^9R^9R^{11}$、$-X^2OR^{11}$、$-X^2C(O)OR^{11}$、$-X^2C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)OR^{11}$、$-X^2OC(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}C(O)NR^{10}R^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}OR^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}S(O)_{n2}NR^{10}R^{11}$、$-X^2NR^{10}R^{11}$、$-X^2C(O)R^{11}$、$-X^2OC(O)R^{11}$、$-X^2NR^9C(O)R^{11}$、$-X^2S(O)_{n2}R^{11}$、$-X^2OS(O)_{n2}R^{11}$または$-R^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^9$は各出現時に独立してハロであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、$R^{11}$は$-X^3R^{12}$であり、ここで、$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、

$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、$(C_{1-4})$アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換$(C_{1-4})$アルキル、ニトロ置換$(C_{1-4})$アルキル、$(C_{2-4})$アルケニル、$-X^6OR^{17}$、$-X^6C(O)OR^{17}$、$-X^6C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}C(O)OR^{17}$、$-X^6OC(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6S(O)_{n4}OR^{17}$、$-X^6S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}S(O)_{n4}NR^{17}R^{17}$、$-X^6NR^{17}R^{17}$、$-X^6C(O)R^{17}$、$-X^6OC(O)R^{18}$、$-X^6NR^{17}C(O)R^{18}$、$-X^6S(O)_{n4}R^{18}$、$-X^6OS(O)_{n4}R^{18}$および$-X^6NR^{17}S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^6$は結合または$(C_{1-3})$アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、$R^{18}$は$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり；

$R^{24}$が$-X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$はメチレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；

$R^{26}$および$R^{27}$がどちらも水素であり；

$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、$(C_{1-4})$アルキル、ハロまたは$-OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は$(C_{1-4})$アルキルであり；

$R^5$が水素であり、式ＩＶの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、項目１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

（項目３）

$R^1$がアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ニトロ置換アルキル、シアノ置換アルキル、$-X^1OR^7$、$-X^1C(O)OR^7$、$-X^1C(O)NR^7R^7$、$-X^1NR^7R^7$、$-X^1C(O)R^7$、$-X^1S(O)_{n1}R^8$または$-X^1OC(O)R^8$であ

り、ここで、ｎ１は０、１または２であり、$X^1$は結合またはアルキレンであり、$R^7$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^8$は（$C_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、または

$R^1$が、$-X^2NR^{10}R^{11}$、$-X^2OR^{11}$、$-X^2C(O)R^{11}$、$-X^2NR^9C(O)R^{11}$または$-R^{11}$であり、ここで、$X^2$は結合またはアルキレンであり、$R^{10}$は各出現時に独立して水素、アルキルまたはハロ置換アルキルであり、$R^{11}$は$-X^3R^{12}$であり、ここで、$X^3$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、$R^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールは、独立して、（$C_{1-3}$）アルキル、ハロ、ニトロ、ハロ置換（$C_{1-3}$）アルキル、$-X^6OR^{17}$、$-X^6C(O)OR^{17}$、$-X^6NR^{17}R^{17}$、$-X^6C(O)R^{17}$、$-X^6C(O)NR^{17}R^{17}$、$-X^6OC(O)R^{18}$および$-X^6S(O)_{n4}R^{18}$から独立して選択される１から３個の基で置換されていてもよく、ここで、$X^6$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、$R^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；

$R^{24}$が$-X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$はメチレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；

$R^{26}$および$R^{27}$がどちらも水素であり；

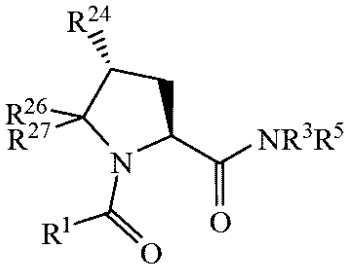
$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；また、

$R^5$が水素である、式ＩＶの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、項目２に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

（項目４）

式ＩＶ（ａ）：

【化６８】




ＩＶ（ａ）

の化合物である、項目１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

（項目５）

$R^1$が五員ヘテロアリールであり、$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、$R^5$が水素であり、$R^{24}$が$-X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$はメチレンであり、かつ、$R^{30}$はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはクロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；そして、$R^{26}$および$R^{27}$がどちらも水素である、項目４に記載の化合物またはその薬

学的に許容される塩。
（項目６）
Ｒ[1]が２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イルメチル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチルまたは１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イルであり；Ｒ[3]が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、Ｒ[5]は水素であり、Ｒ[24]は－Ｘ[11]Ｒ[30]であり、ここで、Ｘ[11]はメチレンであり、かつ、Ｒ[30]はフェニルまたはチエニルであり、ここで、前記フェニルは、クロロ、フルオロ、メトキシ、メチルおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、前記チエニルはブロモ、クロロおよびフルオロから選択される１個の置換基で置換されていてもよく；Ｒ[26]およびＲ[27]がどちらも水素である、項目５に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
（項目７）
（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－ベンジル－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－ベンジル－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－（トリフルオロメチル）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（チオフェン－３－イルメチル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カル

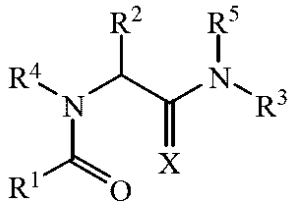
ボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－５－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（４－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（３－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－フルオロ－２－メチルベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メトキシベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メトキシベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（（５－クロロチエン－２－イル）メチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（（５－クロロチエン－２－イル）メチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｓ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－チエン－２－イルメチルピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－クロロ－４－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）酢酸および（２Ｓ，４Ｒ）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（２－フルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（３－メチルベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－４－（４－クロロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（４－クロロベンジル）－Ｎ－（４

－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）－４－（２，４，６－トリフルオロベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド；および（２Ｓ，４Ｒ）－１－（２－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）アセチル）－４－（３，４－ジフルオロベンジル）－Ｎ－（４－（４－フルオロフェノキシ）フェニル）ピロリジン－２－カルボキサミドからなる群から選択される、項目６に記載の化合物および上記化合物のいずれかの薬学的に許容される塩。

（項目８）

式Ｉ：

【化６９】



Ｉ

の化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

式中、

ＸはＯまたはＮＲ$^{6}$であり；

Ｒ$^{1}$はアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、－Ｘ$^{1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＯＳ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$または－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、Ｘ$^{1}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{7}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{8}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、または、

Ｒ$^{1}$は、－Ｘ$^{2}$ＣＲ$^{9}$Ｒ$^{9}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{9}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＳ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$または－Ｒ$^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、Ｘ$^{2}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{9}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{10}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{11}$は－Ｘ$^{3}$Ｒ$^{12}$であり、ここで、Ｘ$^{3}$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、Ｒ$^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、

Ｒ$^{12}$は、－Ｘ$^{4}$ＣＲ$^{13}$Ｒ$^{13}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、

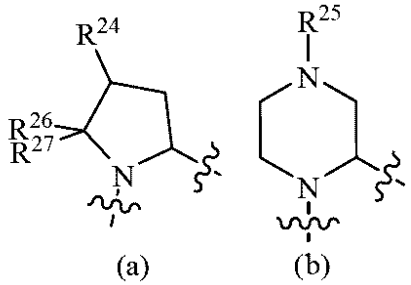
－$X^4$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、－$X^4$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＯＲ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{13}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＯＳ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$または－Ｒ$^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、$X^4$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{13}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{14}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{15}$は－$X^5$Ｒ$^{16}$であり、ここで、$X^5$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中：

Ｒ$^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$C_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{2-4}$）アルケニル、－$X^6$ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－$X^6$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$、－$X^6$ＯＳ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$および－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$から独立して選択される１～３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^6$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{17}$は各出現時に独立して水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{18}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^2$は－$X^7$ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ$^{19}$、－$X^7$ＮＲ$^{20}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{22}$、－$X^7$ＣＲ$^{21}$Ｒ$^{21}$Ｒ$^{22}$、－$X^7$ＯＲ$^{22}$、－$X^7$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$ＯＲ$^{22}$または－Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、$X^7$は（$C_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{19}$は（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{20}$は水素、（$C_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$C_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{21}$はハロであり、Ｒ$^{22}$は－$X^8$Ｒ$^{23}$であり、ここで、$X^8$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{23}$はフェニルであり、ここで、Ｒ$^{23}$は、ハロ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、または

Ｒ$^2$は、Ｒ$^4$およびＲ$^2$とＲ$^4$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７０】



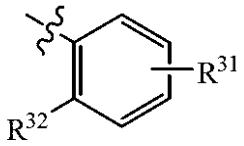

の五または六員環を形成して、

式中、Ｒ$^{24}$は－$X^9$ＯＲ$^{29}$、－$X^9$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－$X^9$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、Ｒ$^{25}$は－$X^{10}$ＯＲ$^{29}$、－$X^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－$X^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、ここで、$X^9$は結合または（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$X^{10}$は（

Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{28}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{29}$は－Ｘ$^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、Ｘ$^{11}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、Ｒ$^{30}$は、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、（Ｃ$_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、Ｒ$^{26}$およびＲ$^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

Ｒ$^{3}$は－Ｒ$^{31}$によって置換されたフェニル、または、Ｒ$^{3}$は、式（ｃ）：

【化７１】




（ｃ）

の基であって、

式中、Ｒ$^{31}$は－ＯＲ$^{33}$、－ＳＲ$^{33}$または－ＣＨ$_{2}$Ｒ$^{33}$であり、ここで、Ｒ$^{33}$は－Ｘ$^{12}$Ｒ$^{34}$であり、ここで、Ｘ$^{12}$は結合またはメチレンであり、Ｒ$^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、フェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、Ｒ$^{32}$はＲ$^{6}$と一緒に結合を形成し、ここで、Ｒ$^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、ハロまたはＯＲ$^{35}$で置換されていてもよく、ここで、Ｒ$^{35}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^{4}$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり；

Ｒ$^{5}$は水素またはアルキルであり、式Ｉの化合物は、任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。

（項目９）

ＸがＯであり；

Ｒ$^{1}$がアルキル、アルケニル、ハロ置換アルキル、ハロ置換アルケニル、ニトロ置換アルキル、ニトロ置換アルケニル、シアノ置換アルキル、シアノ置換アルケニル、－Ｘ$^{1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＯＲ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{7}$、－Ｘ$^{1}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$、－Ｘ$^{1}$ＯＳ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$または－Ｘ$^{1}$ＮＲ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n1}$Ｒ$^{8}$であり、ここで、ｎ１は０、１または２であり、Ｘ$^{1}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{7}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{8}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキル、アルコキシ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、または

Ｒ$^{1}$は、－Ｘ$^{2}$ＣＲ$^{9}$Ｒ$^{9}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＯＲ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{10}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＮＲ$^{9}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$Ｓ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$、－Ｘ$^{2}$ＯＳ（Ｏ）$_{n2}$Ｒ$^{11}$または－Ｒ$^{11}$であり、ここで、ｎ２は０、１、または２であり、Ｘ$^{2}$は結合またはアルキレンであり、Ｒ$^{9}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{10}$は各出現時に独立して水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{11}$は－Ｘ$^{3}$Ｒ$^{12}$であり、ただしＸ$^{3}$は結合、アルキレンまたはヒドロキシ置換アルキレンであり、Ｒ$^{12}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中：

Ｒ$^{12}$は、－Ｘ$^{4}$ＣＲ$^{13}$Ｒ$^{13}$Ｒ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$ＯＲ$^{15}$、－Ｘ$^{4}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、

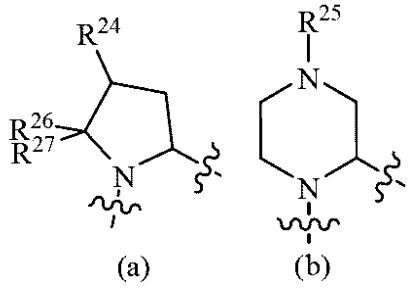
－$X^4$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{15}$、－$X^4$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＯＲ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{14}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＮＲ$^{13}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{15}$、－$X^4$Ｓ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$、－$X^4$ＯＳ（Ｏ）$_{n3}$Ｒ$^{15}$または－Ｒ$^{15}$で置換されていてもよく、ここで、ｎ３は０、１、または２であり、$X^4$は結合または（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{13}$は各出現時に独立してハロであり、Ｒ$^{14}$は各出現時に独立して水素、（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{15}$は－$X^5$Ｒ$^{16}$であり、ここで、$X^5$は結合または（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{16}$はシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリールであり、式中、

Ｒ$^1$内の任意のシクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基は、独立して、（$Ｃ_{1-4}$）アルキル、アルキリデン、アジド、シアノ、ハロ、ニトロ、オキソ、チオキソ、ハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキル、ニトロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキル、（$Ｃ_{2-4}$）アルケニル、－$X^6$ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{17}$、－$X^6$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＯＲ$^{17}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｒ$^{17}$、－$X^6$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{17}$、－$X^6$ＯＣ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｃ（Ｏ）Ｒ$^{18}$、－$X^6$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$、－$X^6$ＯＳ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$および－$X^6$ＮＲ$^{17}$Ｓ（Ｏ）$_{n4}$Ｒ$^{18}$から独立して選択される１～３個の基で置換されていてもよく、ここで、ｎ４は０、１、または２であり、$X^6$は結合または（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{17}$は各出現時に独立して水素、（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{18}$は（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり；

Ｒ$^2$は－$X^7$ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ$^{19}$、－$X^7$ＮＲ$^{20}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{22}$、－$X^7$ＣＲ$^{21}$Ｒ$^{21}$Ｒ$^{22}$、－$X^7$ＯＲ$^{22}$、－$X^7$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$ＯＲ$^{22}$または－Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、$X^7$は（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{19}$は（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{20}$は水素、（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{21}$はハロであり、Ｒ$^{22}$は－$X^8$Ｒ$^{23}$であり、ここで、$X^8$は結合または（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{23}$はフェニルであり、または

Ｒ$^2$は、Ｒ$^4$およびＲ$^2$とＲ$^4$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７２】




の五または六員環を形成して、

式中、Ｒ$^{24}$は－$X^9$ＯＲ$^{29}$、－$X^9$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－$X^9$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、Ｒ$^{25}$は－$X^{10}$ＯＲ$^{29}$、－$X^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$、－$X^{10}$ＮＲ$^{28}$Ｒ$^{29}$、－$X^9$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{29}$または－Ｒ$^{29}$であり、ここで、$X^9$は結合または（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、$X^{10}$は（$Ｃ_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{28}$は水素、（$Ｃ_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（$Ｃ_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{29}$は－$X^{11}$Ｒ$^{30}$であり、ここで、$X^{11}$は結合または

（$C_{1-3}$）アルキレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^{30}$は、（$C_{1-4}$）アルキル、（$C_{1-4}$）アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、$R^{26}$および$R^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；

$R^3$は－$R^{31}$で置換されたフェニルであり、ここで、$R^{31}$は－$OR^{33}$、－$SR^{33}$または－$CH_2R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、またはフェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたは－$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；

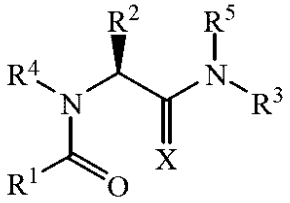
$R^4$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、

$R^5$は水素またはアルキルであり、式Ｉの化合物が任意の個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、項目８に記載の化合物およびその薬学的に許容される塩。

（項目１０）

式Ｉ（ａ）：

【化７３】



Ｉ（ａ）

の化合物である項目９に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

（項目１１）

ＸがＯであり；$R^1$が五員ヘテロアリールメチルであり；$R^2$が－$X^7OR^{22}$または－$X^7R^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１、または２であり、$X^7$はアルキレンであり、$R^{23}$がフェニルであり、ここで、$R^{23}$は１または２個のハロで置換されていてもよく；$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）フェニルであり、ここで、$R^3$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、（$C_{1-4}$）アルキル、ハロまたはＯ$R^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は（$C_{1-4}$）アルキルであり；また、$R^4$および$R^5$が水素である、項目１０に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

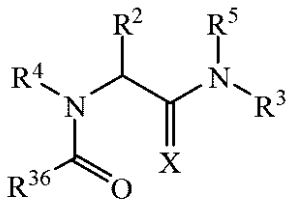
（項目１２）

$R^1$が２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イルメチル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチルまたは１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イルであり；$R^2$が－$X^7OR^{22}$または－$X^7R^{22}$であり、ここで、$X^7$はアルキレンであり、$R^{23}$がフェニルであり、ここで、$R^{23}$は１個のハロで置換されていてもよく；$R^3$が４－（４－フルオロフェノキシ）である、項目１１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

（項目１３）

式ＩＩＩ：

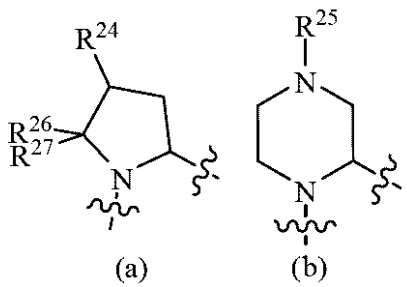
【化７４】



ＩＩＩ

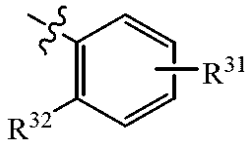
の化合物およびその薬学的に許容される塩であって、
式中、
ＸはＯまたはＮＲ$^{6}$であり；
Ｒ$^{36}$は１－（４－クロロベンジル）－５－オキソピロリジン－３－イル、２－フルオロベンジル、１Ｈ－イミダゾール－４－イルメチル、１Ｈ－インドール－４－イル、２－メチルチオピリド－３－イル、１Ｒ－ヒドロキシ－２－フェニルエチル、２－ヒドロキシフェノキシメチル、１Ｓ－アセチルオキシエチル、（Ｒ）－２－クロロフェニル（ヒドロキシ）メチル、テトラヒドロフル－２Ｒ－イル、３－メチルオキサゾール－５－イル、２，２，２－トリフルオロエチル、２－シクロプロピルカルボニルエチル、２－ブロモ－５フルオロフェニル、インドール－４－イル、インドール－５－イル、インドール－６－イル、インダン－２－イル、３－メチル－２－ニトロフェニル、メチルスルホニルメチル、５－メチルピリド－３－イル、４－アセチルオキシフェニル、３－ヒドロキシフェニル（ヒドロキシル）メチル、５－（２，５－ジオキソ－２，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロール－１－イル）ペンチル、フル－２－イルカルボニル、２Ｒ－メチル－２－フェニルエチル、３－クロロ－２－フルオロベンジル、５－クロロ－２－フルオロベンジル、３－クロロ－２－フルオロベンジル、１－アセチルピロリジン－２－イル、Ｎ－ベンゾイル－Ｎ－メチルアミノメチル、１Ｈ－イミダゾール（ｉｍｄａｚｏｌ）－４－イルメチル、１Ｈ－テトラゾール－１－イルメチル、１－メチルイミダゾール－４－イル、２－フルオロベンジル、１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－１－イルメチル、チエン－２－イルメチル、２，５－ジクロロベンジル、（（１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）メチルアミノ）メチルまたは２，５－ジオキソイミダゾリジン－４－イルメチルであり；
Ｒ$^{2}$は－Ｘ$^{7}$ＮＨＣ（Ｏ）Ｒ$^{19}$，－Ｘ$^{7}$ＮＲ$^{20}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＣＲ$^{21}$Ｒ$^{21}$Ｒ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$ＯＲ$^{22}$、－Ｘ$^{7}$Ｓ（Ｏ）$_{n5}$ＯＲ$^{22}$または－Ｒ$^{22}$であり、ここで、ｎ５は０、１または２であり、Ｘ$^{7}$は（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{19}$は（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{20}$は水素、（Ｃ$_{1-4}$）アルキルまたはハロ置換（Ｃ$_{1-4}$）アルキルであり、Ｒ$^{21}$はハロであり、Ｒ$^{22}$は－Ｘ$^{8}$Ｒ$^{23}$であり、ここで、Ｘ$^{8}$は結合または（Ｃ$_{1-3}$）アルキレンであり、Ｒ$^{23}$はフェニルであり、ここで、Ｒ$^{23}$は、ハロ、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルから独立して選択される１または２個の置換基で置換されていてもよく、または、
Ｒ$^{2}$はＲ$^{4}$およびＲ$^{2}$とＲ$^{4}$とが結合している原子と一緒になって、式（ａ）または（ｂ）：

【化７５】



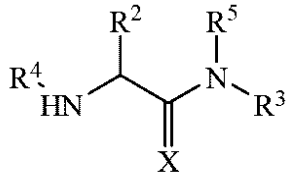
(a) (b)

の五または六員環を形成して、
式中、$R^{24}$は－$X^{9}OR^{29}$、－$X^{9}NR^{28}C(O)OR^{29}$、－$X^{9}NR^{28}R^{29}$、－$X^{9}C(O)OR^{29}$または－$R^{29}$であり、$R^{25}$は－$X^{10}OR^{29}$、－$X^{10}NR^{28}C(O)OR^{29}$、－$X^{10}NR^{28}R^{29}$、－$X^{9}C(O)OR^{29}$または－$R^{29}$であり、ここで、$X^{9}$は結合または$(C_{1-3})$アルキレンであり、$X^{10}$は$(C_{1-3})$アルキレンであり、$R^{28}$は水素、$(C_{1-4})$アルキルまたはハロ置換$(C_{1-4})$アルキルであり、$R^{29}$は－$X^{11}R^{30}$であり、ここで、$X^{11}$は結合または$(C_{1-3})$アルキレンであり、$R^{30}$はフェニルまたはヘテロアリールであり、ここで、$R^{30}$は、$(C_{1-4})$アルキル、$(C_{1-4})$アルコキシ、ハロおよびトリフルオロメチルから独立して選択される１から３個の置換基で置換されていてもよく、$R^{26}$および$R^{27}$はどちらも水素か、または一緒にオキソもしくはチオキソを形成し；
$R^{3}$は$R^{31}$によって置換されたフェニルであり、または、$R^{3}$は式（ｃ）：
【化７６】



（ｃ）

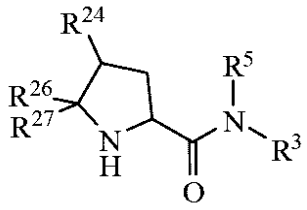
の基であって、
式中、$R^{31}$は－$OR^{33}$，－$SR^{33}$または－$CH_{2}R^{33}$であり、ここで、$R^{33}$は－$X^{12}R^{34}$であり、ここで、$X^{12}$は結合またはメチレンであり、$R^{34}$は、五もしくは六員シクロアルキルまたは五もしくは六員ヘテロシクロアルキル、またはフェニル、または五もしくは六員ヘテロアリールであり、$R^{32}$は$R^{6}$と一緒に結合を形成し、ここで、$R^{3}$内の任意の環状部分は独立して、１または２個の、$(C_{1-4})$アルキル、ハロまたは$OR^{35}$で置換されていてもよく、ここで、$R^{35}$は$(C_{1-4})$アルキルであり；
$R^{4}$は水素、アルキル、または上に定義された通りであり、
$R^{5}$は水素またはアルキルであり、式ＩＩＩの化合物は、個々の立体異性体または立体異性体の混合物の形態であってもよい、化合物。
（項目１４）
式Ｖ：
【化７７】



Ｖ

の化合物を式$R^{1}COOH$の化合物と反応させることを含む、項目８に記載の化合物を調製する方法。
（項目１５）
式Ｖ（ｂ）：

【化７８】



Ｖ（ｂ）

の化合物を式Ｒ[1]ＣＯＯＨの化合物と反応させることを含む、項目１に記載の化合物を調製する方法。

（項目１６）

１種または複数の適切な賦形剤との混合物中に、項目１に記載の化合物、またはその化合物の、個々の異性体もしくは異性体の混合物、または薬学的に許容される塩を含む医薬品組成物。

（項目１７）

１種または複数の適切な賦形剤との混合物中に、項目８に記載の化合物、またはその化合物の、個々の異性体もしくは異性体の混合物、または薬学的に許容される塩を含む医薬品組成物。

（項目１８）

項目１に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の治療上有効な量を、単独で、または、１種または複数の他の抗癌剤と組み合わせて、疾患を有する患者に投与することを含む、癌を治療する方法。

（項目１９）

癌を治療する方法であって、項目８に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の治療上有効な量を、単独で、または、１種または複数の他の抗癌剤と組み合わせて、その疾患を有する患者に投与することを含む、方法。

（項目２０）

前記癌が、非小細胞肺癌、乳癌、前立腺癌、卵巣癌、頭頸部癌、胃腺腫、リンパ腫、白血病、多発性骨髄腫、精巣癌、横紋筋肉腫、ウィルムス腫、および神経芽細胞腫から選択される、項目１９に記載の方法。