

【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20年5月1日(2008.5.1)

【公表番号】特表2007-532555(P2007-532555A)

【公表日】平成19年11月15日(2007.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-044

【出願番号】特願2007-507467(P2007-507467)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/44 (2006.01)
C 0 7 D 405/06 (2006.01)
C 0 7 D 409/06 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/06 (2006.01)
C 0 7 D 413/06 (2006.01)
C 0 7 D 401/10 (2006.01)
C 0 7 D 401/06 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 0 7 D 215/58 (2006.01)
C 0 7 D 495/04 (2006.01)
C 0 7 D 491/048 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
C 0 7 D 498/04 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/10 (2006.01)
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
A 6 1 K 31/47 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/4365 (2006.01)
A 6 1 K 31/4355 (2006.01)
A 6 1 K 31/437 (2006.01)
A 6 1 K 31/4375 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/538 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 27/16 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 17/04 (2006.01)
A 6 1 P 17/10 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 5/14 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/08 (2006.01)
A 6 1 P 1/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/44	
C 0 7 D 405/06	C S P
C 0 7 D 409/06	
C 0 7 D 417/14	
C 0 7 D 417/06	
C 0 7 D 413/06	
C 0 7 D 401/10	
C 0 7 D 401/06	
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 215/58	
C 0 7 D 495/04	1 0 5 A
C 0 7 D 491/048	
C 0 7 D 471/04	1 0 6 C
C 0 7 D 471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D 471/04	1 1 2 Z
C 0 7 D 498/04	1 0 5
C 0 7 D 471/04	1 0 1
C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 417/10	
A 6 1 K 31/4709	
A 6 1 K 31/47	
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/4365	
A 6 1 K 31/4355	
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/4375	
A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/538	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 27/16	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 17/04	
A 6 1 P 17/10	
A 6 1 P 37/02	

A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/08
 A 6 1 P 9/10 1 0 1
 A 6 1 P 1/18

【手続補正書】

【提出日】平成20年3月13日(2008.3.13)

【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

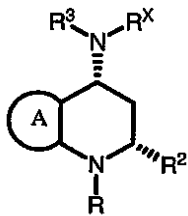
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の化学式 I - A の化合物、

【化1】



I-A

またはその薬学的に受容可能な塩であって、式中：

環 A は、任意に置換された単環式芳香族であり、

R は - X₁ - R¹ であり、

R^X は - X₂ - R⁴ であり、

X₁ および X₂ は、それぞれ独立して - S (O)₂ - 、 - C (O) - 、または - C (O) NH - であり、

R¹ は、

A) 非芳香族複素環、芳香族環、または芳香族複素環が任意に置換された単環式非芳香族複素環または単環式芳香族環または単環式芳香族複素環に縮合した、5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基、または

B) 下記の R² で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって任意には更に置換されている、5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基であって、

i) T¹ - V - T - R^Y、

ii) T¹ - V - T - M - R^Y、または

iii) R⁹ が、任意に置換された非芳香族炭素環基または非芳香族複素環基である V - R⁹ によって置換された、5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基であり、

各 R² は、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、- OR⁰、- O (ハロアルキル)、- SR⁰、- NO₂、- CN、- N (R ')₂、- NR' CO₂ R⁰、- NR' C (O) R⁰

、 $-NR'NR'CO_2R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')_2$ 、 $-NR'NR'CO_2NR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')_2$ 、および $-C(=NH)-N(R')_2$ から独立して選択され、

各 R' は、独立して、水素、アルキル、 $-C(O)OR^0$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、または $-C(O)R^0$ であり、

各 R^0 は、独立して、水素基もしくはアルキル基非芳香族複素環基、または芳香族基であるが、その R^0 で表されるアルキル基、非芳香族複素環基、および芳香族基が、以下の $R^\#$ で表される基から独立して選択された1個以上の基で任意に置換されており、

各 $R^\#$ は、 R^+ 、 $-OR^+$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^+$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^+)_2$ 、 $-NHCO_2R^+$ 、 $-NHC(O)R^+$ 、 $-NHNHC(O)R^+$ 、 $-NHC(O)N(R^+)_2$ 、 $-NHNHC(O)N(R^+)_2$ 、 $-NHNHCO_2R^+$ 、 $-C(O)C(O)R^+$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^+$ 、 $-CO_2R^+$ 、 $-C(O)R^+$ 、 $-C(O)N(R^+)_2$ 、 $-OC(O)R^+$ 、 $-OC(O)N(R^+)_2$ 、 $-S(O)_2R^+$ 、 $-SO_2N(R^+)_2$ 、 $-S(O)R^+$ 、 $-NHCO_2N(R^+)_2$ 、 $-NHCO_2R^+$ 、 $-C(=S)N(R^+)_2$ 、または $-C(=NH)-N(R^+)_2$ であり、

R^+ は、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基、単環式ヘテロアリール基、非芳香族複素環基、または、任意にはアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、アミン、アルキルアミン、もしくはジアルキルアミンで置換されたフェニル基であるか；または、第二級環アミンを含む、 R^+ および $-N(R^+)_2$ で表される非芳香族複素環基が、任意にはアシル化またはアルキル化されているならば、 $-N(R^+)_2$ は非芳香族複素環基であり、

V は、共有結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-N(R')-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(O)NR^5-$ 、 $-NR^5C(O)-$ 、 $-S(O)_2NR^5-$ 、 $-NR^5S(O)_2-$ 、または $-S(O)_2-$ であり、

T は、 C_{1-10} の直鎖アルキレンであり、

T^1 は、共有結合、または C_{1-10} の直鎖アルキレンであって、 T および T^1 で合わせて10炭素原子以下を含み、かつ、 T および T^1 が、任意の1個以上の置換可能な炭素原子を、ハロゲン、アルキル、gemジアルキル、gemジハロ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、スピロシクロアルキル、任意でN-置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、O-含有スピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、アルコキシ、またはヒドロキシルで任意かつ独立して置換されており、

M は、単環式芳香族基、複素環式芳香族基、単環式非芳香族炭素環基、または複素環基から選択される任意に置換された基であり、

R^Y は、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-OC(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-NR^5C(O)R^5$ 、 $-NR^5C(O)OR^5$ 、 $-S(O)_2R^5$ 、 $-S(O)_2COR^5$ 、 $-S(O)_2N(R^5)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $S(O)_2OR^5$ 、 $-S(O)OR^5$ 、 $-S(O)R^5$ 、 $-SR^5$ 、 $-C(O)-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-CN-$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OC(O)N(R^5)_2$ 、 $-N(R^5)_2$ 、 $-OR^5$ 、任意に置換された非芳香族複素環基、または任意に置換されたヘテロアリール基であり、

V が共有結合であるときに T が C_{2-10} であり、 V が、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-N(R')-$ であり、 R^Y が、 $-CN$ 、 $-OH-$ 、 $-SH-$ 、 $-N(R^5)_2$ であるときに T が C_{2-10} であれば、

各 R^5 は、独立して $-H$ 、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、 $-C(O)OCH_2C_6H_5$ 、 $-S(O)_2CH_3$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OMe$ 、 $-C(O)OEt$ 、 $-C(O)NH_2$ 、ベンジル、ピロリジニル、モルホリニル、または、 $-N(R^5)_2$ が窒素含有非芳香族複素環基であり、

R² は、C₁₋₃ アルキルであり、

R³ は、芳香族、複素芳香族、非芳香族炭素環、または非芳香族複素環から選択される、任意に置換された単環式基または二環式基であり、

R⁴ は、任意に置換された C₁₋₆ アルキル、C₁₋₄ アルキル、または任意に置換された C₃₋₆ シクロアルキルであるが、

ただし、化学式 I - A の化合物は以下：

(±) - シス - N - [1 - (1 H - インドール - 2 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [1 - (ベンゾフラン - 2 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス { 4 - [2 - メチル - 4 - (フェニル - プロピオニル - アミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェノキシ } - 酢酸エチルエステル ; (±) - シス - { 4 - [2 - メチル - 4 - (フェニル - プロピオニル - アミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェノキシ } - 酢酸 ; (±) - シス - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [1 - (4 - カルバモイルメトキシ - ベンゾイル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - { 1 - [4 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - プロポキシ) - ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [1 - (4 - ジメチルカルバモイルメトキシ - ベンゾイル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [1 - (ベンゾ [b] チオフェン - 3 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - アセトアミド ; (±) - シス - N - [1 - (ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - { 4 - [4 - (アセチル - フェニル - アミノ) - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェニルアミノ } - 酢酸 ; (±) - シス - N - [1 - (1 - イソプロピル - 1 H - ベンゾトリアゾール - 5 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - 4 - { 4 - [2 - メチル - 4 - (フェニル - プロピオニル - アミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェニル } - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル ; (±) - シス - N - [2 - メチル - 1 - (4 - ピペリジン - 4 - イル - ベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - { 1 - [4 - (1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イル) - ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - { 1 - [4 - (1 - エチル - ピペリジン - 4 - イル) - ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [2 - メチル - 1 - (4 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [2 - メチル - 1 - (4 - モルホリン 4 - イル - ベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - N - [2 - メチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イル - ベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド ; (±) - シス - 2 - { 4 - [4 - (アセチル - フェニル - アミノ) - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェニルアミノ } - プ

ロピオン酸メチルエステル；(±) - シス - 2 - { 4 - [4 - (アセチル - フェニル - アミノ) - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル] - フェニルアミノ } - プロピオンアミド；(±) - シス - N - [1 - (2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシ - 6 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド；(±) - シス - N - [1 - (ベンゾ [c] イソオキサゾール - 3 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - N - フェニル - プロピオンアミド；(±) - シス - 4 - (4 - { 4 - [(4 - クロロ - フェニル) - プロピノイル - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 酪酸エチルエステル；(±) - シス - 4 - (4 - { 4 - [(4 - クロロ - フェニル) - プロピオニル - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 酪酸；(±) - シス - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イルメトキシ) - ベイゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - プロピオンアミド；(±) - シス - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - { 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチル - プロボキシ) - ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - アセトアミド；(±) - シス - 3 - (4 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 2 , 2 - ジメチル - プロピオン酸メチルエステル；(±) - シス - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - [1 - (4 - シクロペンチルオキシ - ベンゾイル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - アセトアミド；(±) - シス - N - { 1 - [4 - (4 - アセチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - (4 - クロロ - フェニル) - アセトアミド；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - [2 - メチル - 1 - (4 - モルホリン - 4 - イル - ベイゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - アセトアミド；(2 S , 4 R) - 4 - (4 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 酪酸；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - [2 - メチル - 1 - (6 - モルホリン - 4 - イル - ピリジン - 3 - カルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - アセトアミド；(2 S , 4 R) - 4 - (4 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - アセトアミド；(2 S , 4 R) - (4 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 酢酸；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イルメトキシ) - ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - アセトアミド；(2 S , 4 R) - N - 1 - { 4 - (1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イルオキシ) - ベンゾイル] - 2 - メトキシ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - N - { 4 - クロロ - フェニル) - アセトアミド；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - { 2 - メチル - 1 - [4 - (ピリジン - 4 - イルメトキシ) - ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル } - アセトアミド；(2 S , 4 R) - 4 - (3 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェノキシ) - 酪酸；(2 S , 4 R) - 4 - (4 - { 4 - [アセチル - (4 - クロロ - フェニル) - アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - カルボニル } - フェニル) - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル；(2 S , 4 R) - N - (4 - クロロ - フェニル) - N - [2 - メチル - 1 - (4 - ピロリジン - 1 - イル - ベンゾイル) - 1 , 2

シ) ブタン酸エチル; 4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル (4 - クロロフェニル) アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] カルボニル } フェノキシ) - N - ヒドロキシブタンアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - (3 - シアノプロポキシ) ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - { 4 - [3 - { 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) プロポキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; 3 - (4 - { [{ 2 S , 4 R) - 4 - [アセチル (4 - クロロフェニル) アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] カルボニル } フェノキシ) プロパンアミド ; N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - (3 - アミノプロポキシ) ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } - N - (4 - クロロフェニル) アセトアミド ; N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - (2 - アミノ - 2 - オキソエトキシ) ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } - N - (4 - クロロフェニル) アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - { 4 - [2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエトキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル) アセトアミド ; 2 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル (4 - クロロフェニル) アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] カルボニル } フェノキシ) - N , N - ジメチルアセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソエトキシ) ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - { 4 - [2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) エトキシ] ベンゾイル } } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 1 - { 4 - [2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) エトキシ] ベンゾイル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (2 - ピロリジン - 1 - イル) エトキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - [(2 S , 4 R) - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル) カルボニル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (3 - ピロリジン - 1 - イル) プロポキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - [(2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (3 - モルホリン - 4 - イル) プロポキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - [(2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - { 4 - [(4 - オキソペンチル) オキシ] ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - [(2 S , 4 R) - 1 - [4 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルプトキシ) ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 1 - { 4 - [(4 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンチル) オキシ] ベンゾイル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル) アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 1 - { 4 - [(1 - エチルピペリジン - 4 - イル) メトキシ] ベンゾイル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル) アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 1 - { 4 - [3 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) プロポキシ] ベンゾイル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル) アセトアミド ; (2 S , 4 R) - N - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - メチル - 1 - (4 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] アセトアミド ; N

- (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [(4 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 6 - イル)カルボニル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル)ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - イル)ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } - N - (4 - クロロフェニル)アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 1 - [4 - { 4 - グリコイルピペラジン - 1 - イル)ベンゾイル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - { 4 - クロロフェニル } - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (3 - モルホリン - 4 - イルプロブ - 1 - イン - 1 - イル)ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; 4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェニル) - 3 - プチン酸 ; N - [(2 S , 4 R) - 1 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルカルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] - N - (4 - クロロフェニル)アセトアミド ; N - [(2 S , 4 R) - 1 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イルカルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] - N - (4 - クロロフェニル)アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [(1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - イル)カルボニル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - { 4 - クロロフェニル } - N - { (2 S , 4 R) - 1 - [(1 - イソプロピル - 1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル)カルボニル] - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; [4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェニル)ピペラジン - 1 - イル]酢酸 ; N - ((2 S , 4 R) - 1 - { 4 - [4 - (2 - アミノ - 2 - オキシエチル)ピペラジン - 1 - イル]ベンゾイル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル) - N - (4 - クロロフェニル)アセトアミド ; 3 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ)プロパン酸 ; 4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ} - 2 , 2 - ジメチルブタン酸 ; { 1 - [(4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ}メチル]シクロプロピル}酢酸 ; (2 E) - 4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ) - 2 - プテン酸 ; 3 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ) - 2 , 2 - ジメチルプロパン酸 ; (2 E) - 4 - (4 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル}フェノキシ) - 2 - メチル 2 - プテン酸 ; N - { 4 - クロロフェニル } - N - { (2 S , 4 R) - 2 - メチル - 1 - [4 - (3 - { [(トリフルオロメチル)スルホニル]アミノ}プロボキシ)ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; N - (4 - クロロフェニル) - N - ((2 S , 4 R) - 1 - { [1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール 5 - イル]カルボニル } - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル } アセトアミド ; 5 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル(4 - クロロフェニル)アミノ - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル]カルボニル } - 2 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾ

ール - 1 - イル) 酢酸 ; 3 - (5 - { [(2 S , 4 R) - 4 - [アセチル (4 - クロロフェニル) アミノ] - 2 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] カルボニル } - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) プロパン酸 ; (2 S , 4 R) - N - (4 - クロロフェニル) - N - [1 - (1 - イソプロピル - 1 H - インドゾール - 5 - カルボニル) - 2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル] - アセトアミド ; または (2 S , 4 R) - (N - (4 - クロロフェニル) - N - (2 - メチル - 1 - { 4 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - プロボキシ] - ベンゾイル } - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イル) - アセトアミド以外の化合物である、化合物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、

環 A は、任意に置換された単環式芳香族であり、

R は、 $-X_1 - R^1$ であり、

R^X は、 $-X_2 - R^4$ であり、

X_1 および X_2 は、それぞれ独立して $-S(O)_2 -$ 、 $-C(O) -$ 、または $-C(O)NH -$ であり、

R^1 は、

A) R^1 で表される芳香族基または複素環式芳香族基が、下記の R^2 で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって任意には更に置換されている、5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基であって、

i) $T^1 - V - T - R^Y$ 、

ii) $T^1 - V - T - M - R^Y$ 、または

iii) R^9 が、任意に置換された非芳香族炭素環基または非芳香族複素環基である $V - R^9$ によって置換された 5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基であるか、または

B) 非芳香族複素環または芳香族環が任意に置換された単環式非芳香族複素環または単環式芳香族複素環に縮合した、5 ~ 6 個の環原子を有する芳香族基または複素環式芳香族基であり、

各 R^2 は、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^0$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R')$ ₂、 $-NR'CO_2R^0$ 、 $-NR'C(O)R^0$ 、 $-NR'NR'C(O)R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ ₂、 $-NR'NR'CO_2NR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)$ ₂、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)$ ₂、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')$ ₂、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ ₂、 $NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')$ ₂、および $-C(=NH) - N(R')$ ₂ から独立して選択され、

各 R' は、独立して、水素、アルキル、 $-C(O)OR^0$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、または $-C(O)R^0$ であり、

各 R^0 は、独立して、水素基もしくはアルキル基非芳香族複素環基、または芳香族基であるが、その R^0 で表されるアルキル基、非芳香族複素環基、および芳香族基が、以下の $R^\#$ で表される基から独立して選択された 1 個以上の基で任意に置換されており、

$R^\#$ は、 R^+ 、 $-OR^+$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^+$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R^+)$ ₂、 $-NHCO_2R^+$ 、 $-NHC(O)R^+$ 、 $-NHNHC(O)R^+$ 、 $-NHC(O)N(R^+)$ ₂、 $-NHNHC(O)N(R^+)$ ₂、 $-NHNHCO_2R^+$ 、 $-C(O)C(O)R^+$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^+$ 、 $-CO_2R^+$ 、 $-C(O)R^+$ 、 $-C(O)N(R^+)$ ₂、 $-OC(O)R^+$ 、 $-OC(O)N(R^+)$ ₂、 $-S(O)_2R^+$ 、 $-SO_2N(R^+)$ ₂、 $-S(O)R^+$ 、 $-NHHSO_2N(R^+)$ ₂、 $-NHHSO_2R^+$ 、 $-C(=S)N(R^+)$ ₂、または $-C(=NH) - N(R^+)$ ₂ であり、

R^+ は、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_3$ アルキル基、単環式ヘテロアリール基、非芳香族複素環基、または、任意にはアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ハロ、 $-C$

N、 $-\text{NO}_2$ 、アミン、アルキルアミン、もしくはジアルキルアミンで置換されたフェニル基であるか；または、第二級環アミンを含む、 R^+ および $-\text{N}(\text{R}^+)_2$ で表される非芳香族複素環基が、任意にはアシル化またはアルキル化されているならば、 $-\text{N}(\text{R}^+)_2$ は非芳香族複素環基であり、

R^Y は、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{COR}^5$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^5$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $-\text{SR}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2\text{R}^5$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{OR}^5$ 、任意に置換された非芳香族複素環基、または任意に置換されたヘテロアリール基であり、

V は、共有結合、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{N}(\text{R}')-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^5-$ 、 $-\text{NR}^5\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^5-$ 、 $-\text{NR}^5\text{S}(\text{O})_2-$ 、または $-\text{S}(\text{O})_2-$ であり、

T は、 C_{1-10} の直鎖アルキレンであるが、ただし、V が共有結合の場合に T は C_{2-10} であり、V が $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、または $-\text{N}(\text{R}')-$ であって、 R^Y が $-\text{CN}-$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)_2$ である場合に T が C_{2-10} であり、

T^1 は、共有結合、または C_{1-10} の直鎖アルキレンであって、T および T^1 で合わせて 10 炭素原子以下を含み、かつ、T および T^1 が、任意の 1 個以上の置換可能な炭素原子を、ハロゲン、アルキル、gem ジアルキル、gem ジハロ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、スピロシクロアルキル、任意で N-置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、またはヒドロキシルで任意かつ独立して置換されており、

各 R^5 は、独立して $-\text{H}$ 、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OMe}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OEt}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、ベンジル、ピロリジニル、モルホリニル、または、 $-\text{N}(\text{R}^5)_2$ が窒素含有非芳香族複素環基であり、

M は、任意に置換された単環式芳香族基、複素環式芳香族基、または任意に置換された単環式非芳香族炭素環基、または複素環基であり、

R^2 は、 C_{1-3} アルキルであり、

R^3 は、5 ~ 6 個の環原子を有する、任意に置換された芳香族基であり、

R^4 は、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ヒドロキシアルキルである化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、

環 A が、任意に置換されたフェニル基であり、

R^2 が、メチルまたはエチルであり、

R^3 が、任意に置換されたフェニル基であり、

R^4 が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、またはイソプロピルであり、かつ、

X_1 および X_2 が、 $-\text{C}(\text{O})-$ である化合物。

【請求項 4】

請求項 2 に記載の化合物であって、

環 A が、任意に置換されたフェニル基であり、

R^2 が、メチルまたはエチルであり、

R^3 が、任意に置換されたフェニル基であり、

R^4 が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル、またはヒドロキシエチルであり、かつ、

X_1 および X_2 が、 $-\text{C}(\text{O})-$ である化合物。

【請求項 5】

請求項 3 に記載の化合物であって、

R^1 が、 $V - T - R^Y$ で置換されたフェニル環、であり、そして任意には、 R^2 で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって更に置換されており、

V が共有結合、 $-O-$ 、または $-N(R')$ - であり、

T が、任意の 1 個以上の置換可能な炭素原子において、ハロゲン、アルキル、gem ジアルキル、gem ジハロ、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、任意で N - 置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、O - 含有スピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、アルコキシ、またはヒドロキシルで任意に置換された、 C_{1-6} の直鎖アルキレンである化合物。

【請求項 6】

請求項 4 に記載の化合物であって、

R^1 が、 $V - T - R^Y$ で置換されたフェニル環、であり、そして任意には R^2 で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって任意には更に置換されており、

V は共有結合、 $-O-$ 、または $-N(R')$ - であり、かつ

T が、任意の 1 個以上の置換可能な炭素原子において、ハロゲン、アルキル、gem ジアルキル、gem ジハロ、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、任意で N - 置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、またはヒドロキシルで任意に置換された、 C_{1-6} の直鎖アルキレンである化合物。

【請求項 7】

請求項 5 または 6 に記載の化合物であって、

R^Y が、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-NR^5C(O)R^5$ 、 $-NR^5C(O)OR^5$ 、 $-S(O)_2N(R^5)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-OR^5$ 、 $-CN-$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-N(R^5)_2$ 、 R^7 で表される、任意に置換された非芳香族複素環基、または R^8 で表される、任意に置換されたヘテロアリアル基であって、

R^7 が、ピペリジニル、オキサゾリジニル、オキサゾリジノニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、チアゾリジニル、テトラヒドロチオフェン、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ジオキサニル、ジオキサラニル、ジチオラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ペラジニル、またはピペリジニルから選択される任意に置換された基であり、

R^8 が、フラニル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジル、チアゾリル、チエニル、またはイミダゾリルから選択される任意に置換された基である化合物。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の化合物であって、

R^3 が、 R^{11} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{11} が、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^0$ 、3, 4 - メチレン - ジオキシ、3, 4 - エチレン - ジオキシ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R')$ 、 $-NR'CO_2R^0$ 、 $-NR'C(O)R^0$ 、 $-NR'NR'C(O)R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ 、 $-NR'NR'C(O)N(R')$ 、 $-NR'NR'CO_2NR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ 、 $-NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^0$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^0)_2$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^0)_2$ 、または $-C(=NH)-N(R')$ から独立して選択される化合物。

【請求項 9】

請求項 7 に記載の化合物であって、

R^3 が、 R^{11} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{11} が、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^0$ 、3, 4 - メチレン - ジオキシ、3, 4 - エチレン - ジオキシ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R^0$ 、 $-NR'C(O)R^0$ 、 $-NR'NR'C(O)R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')_2$ 、 $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ 、 $-NR'NR'CO_2NR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')_2$ 、または $-C(=NH) - N(R')_2$ から独立して選択される化合物。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の化合物であって、

R^Y が、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-NR^5C(O)R^5$ 、 $-NR^5C(O)OR^5$ 、 $-S(O)_2N(R^5)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OH$ 、 R^7 で表される、任意に置換された非芳香族複素環基、または R^8 で表される、任意に置換されたヘテロアリアル基であって、

各 R^5 が、独立して H またはアルキルまたは $N(R^5)_2$ は窒素を含む非芳香族複素環基であり、

R^7 が、ピペリジノニル、モルホリニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、またはピペリジニルから選択される任意に置換された基であり、

R^8 が、テトラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、ピリジニル、またはイミダゾリルから選択される任意に置換された基であり、

V が、共有結合または $-O-$ であり、かつ、

T が、 R^Y に隣接する炭素原子において、ハロゲン、アルキル、gem ジアルキル、gem ジハロ、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、任意で N - 置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、アミン、ジアルキルアミン、アルコキシ、またはヒドロキシルで任意に置換された、 C_{1-5} の直鎖アルキレンである化合物。

【請求項 11】

V が $-O-$ である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 12】

V が共有結合であり、T が、 R^Y に隣接する炭素原子で、アルキル、gem ジアルキル、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、または任意で N - 置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基で置換された C_{1-5} の直鎖アルキレンである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 13】

請求項 10 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R^{14} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{14} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^0$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R^0$ 、 $-NR'C(O)R^0$ 、 $-NR'NR'C(O)R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')_2$ 、 $-NR'NR'C(O)N(R')_2$ 、 $-NR'NR'CO_2NR^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)_2$ 、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')_2$ 、および $-C(=NH) - N(R')_2$ 、 $-(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH$

2) $n \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ 、または $-\text{O}(\text{CH}_2)_n \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ であり、
 n が 1 ~ 4 の整数であり、

R^1 が、メタ位またはパラ位で $\text{V}-\text{T}-\text{R}^y$ によって置換されたフェニル環であって、
 R^z で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって任意には更に置換されており、

各 R^z が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-\text{R}^0$ 、 $-\text{OR}^0$ 、 $-\text{O}$ (ハロアルキル)、 $-\text{CO}_2\text{R}^0$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ 、および $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ から独立して選択され、

各 R^{11} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-\text{OR}^0$ 、 $-\text{O}$ (ハロアルキル)、3, 4 - メチレン - ジオキシ、3, 4 - エチレン - ジオキシ、 CO_2R^0 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}^0$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^0)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ 、または $-\text{OC}(\text{O})(\text{R}^0)_2$ から選択された置換基であり、

各 R' が、独立して H またはアルキルであり、かつ、

各 R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、またはアルキル基である化合物。

【請求項 14】

請求項 13 に記載の化合物であって、

R^y が、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $-\text{OH}$ 、N - モルホリニル、2 - モルホリニル、3 - モルホリニル、N - 置換された 2 - モルホリニル、N - 置換された 3 - モルホリニル、N - イミダゾリジニル、2 - イミダゾリジニル、4 - イミダゾリジニル、5 - イミダゾリジニル、N - 置換された 2 - イミダゾリジニル、N' - 置換された N - イミダゾリジニル、N - 置換された 4 - イミダゾリジニル、N - 置換された 5 - イミダゾリジニル、N - イミダゾリジノイル、4 - イミダゾリジノイル、5 - イミダゾリジノイル、N - 置換された 4 - イミダゾリジノイル、N - 置換された 5 - イミダゾリジノイル、N - ピロリジニル、2 - ピロリジニル、3 - ピロリジニル、N - 置換された 2 - ピロリジニル、N - 置換された 3 - ピロリジニル、N - ピロリジン - 2 - オニル (only)、3 - ピロリジン - 2 - オニル、4 - ピロリジン - 2 - オニル、5 - ピロリジン - 2 - オニル、N - 置換された 3 - ピロリジン - 2 - オニル、N - 置換された 4 - ピロリジン - 2 - オニル、N - 置換された 5 - ピロリジン - 2 - オニル、N - ピロリジン - 3 - オニル、2 - ピロリジン - 3 - オニル、4 - ピロリジン - 3 - オニル、5 - ピロリジン - 3 - オニル、N - 置換された 2 - ピロリジン - 3 - オニル、N - 置換された 4 - ピロリジン - 3 - オニル、N - 置換された 5 - ピロリジン - 3 - オニル、N - ピペリジニル、2 - ピペリジニル、3 - ピペリジニル、4 - ピペリジニル、N - 置換された 2 - ピペリジニル、N - 置換された 3 - ピペリジニル、N - 置換された 4 - ピペリジニル、N - ピペリジン - 2 - オニル、3 - ピペリジン - 2 - オニル、4 - ピペリジン - 2 - オニル、5 - ピペリジン - 2 - オニル、6 - ピペリジン - 2 - オニル、N - 置換された 3 - ピペリジン - 2 - オニル、N - 置換された 4 - ピペリジン - 2 - オニル、N - 置換された 5 - ピペリジン - 2 - オニル、N - 置換された 6 - ピペリジン - 2 - オニル、N - ピペリジン - 3 - オニル、2 - ピペリジン - 3 - オニル、4 - ピペリジン - 3 - オニル、5 - ピペリジン - 3 - オニル、6 - ピペリジン - 3 - オニル、N - 置換された 2 - ピペリジン - 3 - オニル、N - 置換された 4 - ピペリジン - 3 - オニル、N - 置換された 5 - ピペリジン - 3 - オニル、N - 置換された 6 - ピペリジン - 3 - オニル、N - ピペリジン - 4 - オニル、2 - ピペリジン - 4 - オニル、3 - ピペリジン - 4 - オニル、5 - ピペリジン - 4 - オニル、6 - ピペリジン - 4 - オニル、N - 置換された 2 - ピペリジン - 4 - オニル、N - 置換された 3 - ピペリジン - 4 - オニル、N - 置換された 5 - ピペリジン - 4 - オニル、N - 置換された 6 - ピペリジン - 4 - オニル、N - ピペラジニル、2 - ピペラジニル、N' - 置換された N - ピペラジニル、N - 置換された 2 - ピペラジニル、フラニル、N - テトラゾリル、5 - テトラゾリル、N - 置換された 5 - テトラゾリル、4 - (1, 2, 3) オキサジアゾリル、5 - (1, 2, 3) オキサジアゾリル、3 - (1, 2, 4) オキサジアゾリル、5 - (1, 2, 4) オキサジアゾリル、3 - (1, 2, 5) オキサジアゾリル、4 - (1, 2, 5) オキサジアゾリル、2 - (1, 3, 4) オキサジアゾリル、5 - (1, 3, 4) オキサジア

ゾリル、N - ピロリル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、N - 置換された2 - ピロリル、N - 置換された3 - ピロリル、N - ピラゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、N - 置換された3 - ピラゾリル、N - 置換された4 - ピラゾリル、N - 置換された5 - ピラゾリル、2 - プリジニル、3 - プリジニル、4 - プリジニル、N - イミダゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、5 - イミダゾリル；N - 置換された2 - イミダゾリル、N - 置換された4 - イミダゾリル、またはN - 置換された5 - イミダゾリルであり、

V が - O - であり、かつ

T が、R^Y に隣接する炭素原子において、フルオロ、メチル、gemジメチル、gemジフルオロ、フルオロメチル、スピロシクロプロピル、スピロシクロブチル、任意でN - 置換されたスピロアゼチジニル、任意でN - 置換されたスピロアジリジニル、任意でN - 置換されたスピロピロリジニル、任意でN - 置換されたスピロペリジニル、アミン、メチルアミン、ジメチルアミン、またはヒドロキシルによって置換されたC₁₋₃直鎖アルキレンである化合物。

【請求項15】

請求項14に記載の化合物であって、

各R^Z が、ハロゲン、ハロアルキル、-R⁰、-OR⁰、-O（ハロアルキル）から独立して選択され、

R³ が、メタ位またはパラ位で、R¹⁻¹ で表される、独立して選択された1個以上の基によって任意で置換されているフェニル基であり、

各R¹⁻¹ が、ハロゲン、ハロアルキル、-R⁰、-OR⁰、-N(R')₂、-NR'SO₂R⁰、および-O（ハロアルキル）から独立して選択される置換基である化合物。

【請求項16】

請求項15に記載の化合物であって、

R^Y が、-C(O)OR⁵、-C(O)N(R⁵)₂、-OH、N - テトラゾリル、5 - テトラゾリル、N - 置換された5 - テトラゾリル、N - イミダゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、5 - イミダゾリル；N - 置換された2 - イミダゾリル、N - 置換された4 - イミダゾリル、またはN - 置換された5 - イミダゾリルであり、かつ、

R⁵ が、-H、メチル、またはエチルである化合物。

【請求項17】

請求項16に記載の化合物であって、

環Aが、6つおよび7つの位置でR¹⁻⁴ によって任意に置換されたフェニル基であり、

各R¹⁻⁴ が、独立して、ハロゲン、R⁰、-OR⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-(CH₂)_nCO₂R⁰、-O(CH₂)_nCO₂R⁰、-NH(SO₂R⁰)、-NHCOR⁰、-CN、-NHC(O)N(R⁰)₂、-(CH₂)_nOH、-O(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂、または-O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂であり、

R¹ が、パラ位でV - T - R^Y によって置換され、任意には更にメタ位でR^Z によって置換されているフェニル環であり、

R^Z が、クロリド、フルオリド、ブロミド、-OR⁰、または-R⁰であり、

R³ が、パラ位でR¹⁻¹ によって任意に置換されたフェニル基であり、

R¹⁻¹ が、クロリド、フルオリド、ブロミド、-OR⁰、-N(R')₂、-NR'SO₂R⁰、または-R⁰であり、

R' が、独立してハロゲンまたはC₁₋₃アルキル基であり、かつ、

R⁰ が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、またはC₁₋₃アルキル基である化合物。

【請求項18】

請求項3に記載の化合物であって、

R¹ が、R⁹ が、任意に置換された非芳香族炭素環基または非芳香族複素環基であって、任意には、R² で表される 1 ~ 2 個の独立して選択された基によって更に置換されている V - R⁹ によって置換されている化合物。

【請求項 19】

請求項 18 に記載の化合物であって、

R³ が、R¹¹ で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R¹¹ が、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、3,4-メチレン-ジオキシ、3,4-エチレン-ジオキシ、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、-(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、または -C(=NH)-N(R')₂ から独立して選択される化合物。

【請求項 20】

請求項 18 に記載の化合物であって、

R³ が、R¹¹ で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R¹¹ が、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、3,4-メチレン-ジオキシ、3,4-エチレン-ジオキシ、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、または -C(=NH)-N(R')₂ から独立して選択される化合物。

【請求項 21】

請求項 19 に記載の化合物であって、

R⁹ が、任意に置換されたシクロヘキサニル、オキサゾリジニル、オキサゾリジノニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、チアゾリジニル、テトラヒドロチエニル、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ジオキサニル、ジオキサラニル、ジチオラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、イソチアゾリジニル S, S, ジオキシド、1,2,5-チアジアゾリジン S, S - ジオキシド、またはピペリジニルである化合物。

【請求項 22】

請求項 20 に記載の化合物であって、

R⁹ が、任意に置換されたシクロヘキサニル、オキサゾリジニル、オキサゾリジノニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、チアゾリジニル、テトラヒドロチエニル、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ジオキサニル、ジオキサラニル、ジチオラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、イソチアゾリジニル S, S, ジオキシド、またはピペリジニルである化合物。

【請求項 23】

請求項 18 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R^{14} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{14} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-SR^0$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(R')$ ₂、 $-NR'CO_2R^0$ 、 $-NR'C(O)R^0$ 、 $-NR'NR'C(O)R^0$ 、 $-N(R')C(O)N(R')$ ₂、 $-NR'NR'C(O)N(R')$ ₂、 $-NR'NR'CO_2R^0$ 、 $-C(O)C(O)R^0$ 、 $-C(O)CH_2C(O)R^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)$ ₂、 $-OC(O)R^0$ 、 $-OC(O)N(R^0)$ ₂、 $-S(O)_2R^0$ 、 $-SO_2N(R')$ ₂、 $-S(O)R^0$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ ₂、 $-NR'SO_2R^0$ 、 $-C(=S)N(R')$ ₂、および $-C(=NH)-N(R')$ ₂、 $-(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)$ ₂、または $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)$ ₂ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R^1 が、メタ位またはパラ位で $V-R^9$ で表される非芳香族炭素環基または非芳香族複素環基によって置換されたフェニル環であって、 R^2 で表される、独立して選択された 1 ~ 2 個の基によって任意には更に置換されており、

各 R^2 が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、 $-CO_2R^0$ 、 $-NR'SO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)$ ₂、 $-OC(O)R^0$ 、および $-OC(O)N(R^0)$ ₂ から独立して選択され、

V が、共有結合または $-O-$ であり、

R^3 が、 R^{11} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{11} が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、3, 4 - メチレン - ジオキシ、3, 4 - エチレン - ジオキシ、 $-C(O)_2R^0$ 、 $-N(R')$ ₂、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)$ ₂、 $-NR'SO_2R^0$ 、 $-OC(O)R^0$ 、および $-OC(O)N(R^0)$ ₂ から独立して選択され、

各 R' が、独立して H またはアルキルであり、かつ、

各 R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、またはアルキル基である化合物。

【請求項 24】

請求項 23 に記載の化合物であって、

R^9 が、任意には、それぞれがアルキル、ハライド、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)NR^{12}$ ₂、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})$ ₂、 $-S(O)_2OR^{12}$ 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N(R^{12})$ ₂、 $-OC(O)N(R^{12})$ ₂、 $-(CH_2)_nCO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR^0$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2CO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2C(O)NR^0$ 、または $N(R^{12})$ ₂ によって置換されたオキサゾリジニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

各 R^{12} が、独立して $-H$ 、アルキル、ハロアルキル、またはヒドロキシアルキルである化合物。

【請求項 25】

請求項 24 に記載の化合物であって、

各 R^2 が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル) から独立して選択され、

R^3 が、メタ位またはパラ位で、 R^{11} で表される、独立して選択された 1 個以上の

基によって任意で置換されているフェニル基であり、

各 R^{11} が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R^0$ 、および $-O$ (ハロアルキル) から選択される置換基である化合物。

【請求項 26】

請求項 25 に記載の化合物であって、

R^9 が、それぞれが任意に、置換可能な炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、または $-C(O)N(R^{12})_2$ によって置換された N - モルホリニル、2 - モルホリニル、3 - モルホリニル、N - 置換された 2 - モルホリニル、N - 置換された 3 - モルホリニル、N - ピロリジニル、2 - ピロリジニル、3 - ピロリジニル、N - 置換された 2 - ピロリジニル、N - 置換された 3 - ピロリジニル、N - ピペラジニル、2 - ピペラジニル、N' - 置換された N - ピペラジニル、N - 置換された 2 - ピペラジニル、N - ピペリジニル、2 - ピペリジニル、3 - ピペリジニル、4 - ピペリジニル、N - 置換された 2 - ピペリジニル、N - 置換された 3 - ピペリジニル、N - 置換された 4 - ピペリジニルであって、N - 置換基が、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-(CH_2)_nCO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR^0$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2CO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2C(O)NR^0$ 、または $-C(O)N(R^{12})_2$ であり、かつ、

n が 1 ~ 4 の整数である化合物。

【請求項 27】

請求項 26 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R^{14} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{14} が、独立して、ハロゲン、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-NHCO_2R^0$ 、 $-NHCOR^0$ 、 $-CN$ 、 $-NHC(O)N(R^0)_2$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-O(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ 、または $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R^1 が、パラ位で、 $V-R^9$ で表される非芳香族の炭素環基または非芳香族の複素環基によって置換され、任意には更にメタ位で R^2 によって置換されているフェニル環であり、

R^2 が、クロリド、フルオリド、ブロミド、 $-OR^0$ 、または $-R^0$ であり、

R^3 が、任意でパラ位で R^{11} によって置換されたフェニル基であり、

R^{11} が、クロリド、フルオリド、ブロミド、 $-OR^0$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R^0$ 、または $-R^0$ であり、

R' が、独立してハロゲンまたは C_{1-3} アルキル基であり、かつ、

R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、または C_{1-3} アルキル基である化合物。

【請求項 28】

請求項 27 に記載の化合物であって、

R^9 が、N - ピペラジニル、2 - ピペリジニル、3 - ピペリジニル、4 - ピペリジニル、N - 置換された 2 - ピペリジニル、N - 置換された 3 - ピペリジニル、N - 置換された 4 - ピペリジニル、N - ピペラジニル、2 - ピペラジニル、N' - 置換された N - ピペラジニル、または N - 置換された 2 - ピペラジニルであって、置換可能な炭素原子で、任意にクロリド、フルオリド、ブロミド、メチル、エチル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、または $C(O)NH_2$ によって置換されており、また、N - 置換基が、メチル、エチル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-(CH_2)_nCO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR^0$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2CO_2H$ 、 $-(CH_2)_nC(CH_3)_2C(O)NR^0$ 、または $-C(O)NH_2$ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

各 R^{1 2} が、独立して - H、メチル、またはエチルである化合物。

【請求項 29】

請求項 3 に記載の化合物であって、

R¹ が、R^{1 0} で表される、任意で置換された単環式非芳香族複素環、または R^{1 3} で表される単環式芳香族環に縮合したフェニル基である化合物。

【請求項 30】

請求項 29 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R^{1 4} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 4} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂R⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、および -C(=NH)-N(R')₂、(CH₂)_nCO₂R⁰、-O(CH₂)_nCO₂R⁰、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂、-O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R³ が、R^{1 1} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 1} が、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、3, 4-メチレン-ジオキシ、3, 4-エチレン-ジオキシ、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、-(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、または -C(=NH)-N(R')₂ から独立して選択される化合物。

【請求項 31】

請求項 29 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R^{1 4} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 4} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、および -C(=NH)-N(R')₂、(CH₂)_nCO₂R⁰、-O(CH₂)_nCO₂R⁰、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂、-O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R³ が、R^{1 1} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 1} が、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、3, 4-メチレン-ジオキシ、3, 4-エチレン-ジオキシ、-NO₂、-CN、-N(R')₂、-NR'CO₂R⁰、-NR'C(O)R⁰、-NR'NR'C(O)R⁰、-N(R')C(O)N(R')₂、-NR'NR'C(O)N(R')₂、-NR'NR'CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R')₂、-S(O)R⁰、-NR'SO₂N(R')₂、NR'SO₂R⁰、-C(=S)N(R')₂、または -C(=NH)-N(R')₂ から独立して選択される化合物。

【請求項 3 2】

請求項 3 1 に記載の化合物であって、

R^{1 0} が、オキサゾリジニル、オキサゾリジノニル、ジオキサソラニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロチエニル、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ピロリジニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロチエニル S, S ジオキシド、チオモルホリニル S, S ジオキシド、またはテトラヒドロチオピラニル S, S ジオキシドであって、それぞれが任意に置換されており、

R^{1 3} が、ピラゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、ピロリル、チエニル、シクロペンダジエニル、またはチエニル S, S ジオキシドであって、それぞれが任意に置換されている化合物。

【請求項 3 3】

請求項 3 2 に記載の化合物であって、

R³ が、R^{1 1} で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 1} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、-R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、3, 4-メチレン-ジオキシ、3, 4-エチレン-ジオキシ、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-N(R')₂、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-NR'SO₂R⁰、および -OC(O)N(R⁰)₂ から選択される置換基であり、

各 R' が、独立して H またはアルキルであり、かつ、

各 R⁰ が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、またはアルキル基である化合物。

【請求項 3 4】

請求項 3 3 に記載の化合物であって、

R^{1 0} が、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであって、それぞれが、任意の置換可能な炭素環原子で、アルキル、ハライド、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、-C(O)OR^{1 2}、-C(O)R^{1 2}、-OC(O)R^{1 2}、-R^{1 2}C(O)OR^{1 2}、-C(O)NR^{1 2}₂、-NR^{1 2}C(O)R^{1 2}、-NR^{1 2}C(O)OR^{1 2}、-S(O)₂R^{1 2}、-S(O)₂COR^{1 2}、-S(O)₂N(R^{1 2})₂、-S(O)₂OR^{1 2}、-S(O)OR^{1 2}、-OR^{1 2}、-SR^{1 2}、-CN、-NR^{1 2}C(O)N(R^{1 2})₂、-OC(O)N(R^{1 2})₂、-N(R^{1 2})₂、-(CH₂)₁₋₄CO₂R^{1 2}、-O(CH₂)₁₋₄CO₂R^{1 2}、-(CH₂)₁₋₄CON(R^{1 2})₂、-O(CH₂)₁₋₄CON(R^{1 2})₂、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R^{1 2}、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R^{1 2}、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R^{1 2})₂、または -O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R^{1 2})₂ によって任意に置換されており、かつ、それぞれが、任意の置換可能な環の窒素原子でアルキル、ハロアルキル、ヒドロ

キシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、

R^{13} が、トリアゾリル、イミダゾリル、フラニル、ピロリル、チエニルであって、それぞれが、任意の置換可能な炭素環原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-S(O)_2OR^{12}$ 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12})_2$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ 、または $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、かつ、それぞれが、任意の置換可能な環の窒素原子でアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、また、

各 R^{12} が、独立して、H、アルキル、ハロアルキル、またはヒドロキシアルキルである化合物。

【請求項35】

請求項34に記載の化合物であって、

R^3 が、メタ位またはパラ位で、 R^{11} で表される、独立して選択された1個以上の基によって任意に置換されているフェニル基であり、

各 R^{11} が、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-NR^1$ 、 SO_2R^0 、および $-O$ (ハロアルキル)から独立して選択される置換基である化合物。

【請求項36】

請求項35に記載の化合物であって、

R^{10} が、ピペリジニル、ピペラジニル、ジオキサソラニル、テトラヒドロフラニル、またはモルホリニルであって、それぞれが、任意の置換可能な環の炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、または $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意で置換されており、それぞれが、任意の置換可能な環の窒素原子でアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、または $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、かつ

R^{13} が、トリアゾリル、イミダゾリル、またはピロリルであって、それぞれが、任意の置換可能な環の炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、または $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、かつ、それぞれが、任意の置換可能な窒素原子でアルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されている化合物。

【請求項37】

請求項36に記載の化合物であって、

環Aが、6つおよび7つの位置で R^{14} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{14} が、独立して、ハロゲン、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-NHCO_2R^0$ 、 $-NHCOR^0$ 、 $-NHC(O)N(R^0)$

$(R^0)_2$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-O(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)$
 $(R^0)_2$ 、または $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ であり、
 n が1~4の整数であり、
 R^3 が、パラ位で R^{11} によって任意に置換されたフェニル基であり、
 R^{11} が、クロリド、フルオリド、ブロミド、 $-OR^0$ 、 $-N(R^')_2$ 、 $-NR^'$ 、
 SO_2R^0 、または $-R^0$ であり、
 $R^'$ が、独立してハロゲンまたは C_{1-3} アルキル基であり、かつ、
 R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、または C_{1-3} アルキル基である化
 合物。

【請求項38】

請求項37に記載の化合物であって、

R^{10} が、ピペリジニル、ピペラジニル、またはモルホリニルであって、かつ、任意
 には、メチル、エチル、イソプロピル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)NH_2$ 、または
 $-C(O)R^{12}$ によってN-置換されており、
 R^{13} が、トリアゾリルであって、メチル、エチル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)$
 NH_2 、または $-C(O)R^{12}$ によってN-置換されており、また、
 各 R^{12} が、独立してH、メチル、またはエチルである化合物。

【請求項39】

請求項29に記載の化合物であって、

R^{10} が、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルホリニル、イミダゾ
 リジニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであ
 って、それぞれが、任意の置換可能な炭素環原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル
 、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、
 $-R^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、
 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)$
 $_2N(R^{12})_2$ 、 $-S(O)_2OR^{12}$ 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$
 $_2$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12})_2$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、
 $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、
 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、
 $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)$
 CO_2R^{12} 、 $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ 、または
 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ によって任意に置換されて
 おり、かつ、それぞれが、任意の置換可能な環の窒素原子でアルキル、ハロアルキル、ヒ
 ドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)OR^{12}$
 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意に置換されており、

各 R^{12} が、独立してH、アルキル、ハロアルキル、またはヒドロキシアルキルであ
 り、

R^{13} が、ピラゾリル、トリアゾリル、イミダゾリル、ピロリルであって、それぞれ
 が、 T^2-R^{y1} によってN-置換されており、任意では、さらに、1個以上の任意の置
 換可能な炭素環原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C$
 $(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)$
 $N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)$
 $_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-S(O)_2O$
 R^{12} 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N$
 $(R^{12})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12})_2$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{1-4}C$
 O_2R^{12} 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})$
 $_2$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)$
 CO_2R^{12} 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ 、 $-(CH_2)_{0$
 $-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ 、または $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)$
 $)_2)CON(R^{12})_2$ によって更に置換されており、

T² が、任意の 1 個以上の置換可能な炭素原子で、ハライド、アルキル、gemジアルキル、gemジハロ、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、任意でN-置換された窒素を含むスピロ非芳香族複素環基、O-含有スピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、またはヒドロキシルで任意に置換されているC₁₋₆の直鎖アルキレンであって、

R^{Y1} が、-C(O)OR⁵、-C(O)N(R⁵)₂、-NR⁵C(O)R⁵、-NR⁵C(O)OR⁵、-S(O)₂N(R⁵)₂、-NR⁵S(O)₂R⁵、-OR⁵、-CN、-NR⁵C(O)N(R⁵)₂、-N(R⁵)₂、R⁷で表される任意で置換された非芳香族複素環基、またはR⁸で表される任意で置換されたヘテロアリール基であり、

R⁷ が、任意で置換されたピペリジノニル、オキサゾリジニル、オキサゾリジノニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、チアゾリジニル、テトラヒドロチオフェン、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ジオキサニル、ジオキサラニル、ジチオラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであり、かつ、

R⁸ が、任意で置換されたフラニル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリミジル、チアゾリル、チエニル、またはイミダゾリルである化合物。

【請求項 40】

請求項 39 に記載の化合物であって、

環 A が、6 つおよび 7 つの位置で R¹⁻⁴ によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R¹⁻⁴ が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、-NO₂、-CN、-N(R['])₂、-NR[']CO₂R⁰、-NR[']C(O)R⁰、-NR[']NR[']C(O)R⁰、-N(R['])C(O)N(R['])₂、-NR[']NR[']C(O)N(R['])₂、-NR[']NR[']CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R['])₂、-S(O)R⁰、-NR[']SO₂N(R['])₂、-NR[']SO₂R⁰、-C(=S)N(R['])₂、および -C(=NH)-N(R['])₂、(CH₂)_nCO₂R⁰、-O(CH₂)_nCO₂R⁰、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nOH、-(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂、または -O(CH₂)_nC(O)N(R⁰)₂ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R³ が、R¹⁻¹ で表される、1 個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R¹⁻¹ が、ハロゲン、ハロアルキル、R⁰、-OR⁰、-O(ハロアルキル)、-SR⁰、3,4-メチレン-ジオキシ、3,4-エチレン-ジオキシ、-NO₂、-CN、-N(R['])₂、-NR[']CO₂R⁰、-NR[']C(O)R⁰、-NR[']NR[']C(O)R⁰、-N(R['])C(O)N(R['])₂、-NR[']NR[']C(O)N(R['])₂、-NR[']NR[']CO₂NR⁰、-C(O)C(O)R⁰、-C(O)CH₂C(O)R⁰、-CO₂R⁰、-C(O)R⁰、-C(O)N(R⁰)₂、-OC(O)R⁰、-OC(O)N(R⁰)₂、-S(O)₂R⁰、-SO₂N(R['])₂、-S(O)R⁰、-NR[']SO₂N(R['])₂、NR[']SO₂R⁰、-C(=S)N(R['])₂、-(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-O(CH₂)₁₋₄CO₂R⁰、-(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₁₋₄CON(R⁰)₂、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CO₂R⁰、-(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、-O(CH₂)₀₋₃(C(CH₃)₂)CON(R⁰)₂、または -C(=NH)-N(R['])₂ から独立して選択される化合物。

【請求項 41】

請求項 40 に記載の化合物であって、

R^3 が、 R^{11} で表される、1個以上の独立して選択された基で置換されたフェニル基であり、

各 R^{11} が、独立して、ハロゲン、ハロアルキル、 $-R^0$ 、 $-OR^0$ 、 $-O$ (ハロアルキル)、3, 4-メチレン-ジオキシ、3, 4-エチレン-ジオキシ、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-NR^1SO_2R^0$ 、および $-OC(O)N(R^0)_2$ から選択される置換基であり、

各 R^1 が、独立してHまたはアルキルであり、かつ、

各 R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、またはアルキル基である化合物。

【請求項42】

請求項41に記載の化合物であって、

R^{Y1} が、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-NR^5C(O)R^5$ 、 $-NR^5C(O)OR^5$ 、 $-S(O)_2N(R^5)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OH$ 、 R^7 で表される任意で置換された非芳香族複素環基、または R^8 で表される任意で置換されたヘテロアリール基であり、

各 R^5 が、独立して、Hまたはアルキルであり、または $N(R^5)_2$ が窒素含有非芳香族複素環基であり、

R^7 が、ピペリジノニル、モルホリニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであり、

R^8 が、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、ピリジニル、またはイミダゾリルであり、

T^2 が、 R^Y に隣接する炭素原子で、ハロゲン、アルキル、gemジアルキル、gemジハロ、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、任意でN-置換された窒素含有スピロ非芳香族複素環基、アミン、ジアルキルアミン、またはヒドロキシルによって任意で置換された、 C_{1-5} の直鎖アルキレンであり、

R^{10} で表される基が、モルホリニル、チオモルホリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリジノニル、ピロリジニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであって、それぞれが、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されており、さらに、任意には、任意の置換可能な炭素環原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-S(O)_2OR^{12}$ 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12})_2$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ 、または $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ によって更に置換されており、かつ、

R^{13} で表される基が、トリアゾリル、イミダゾリル、またはピロリルであって、それぞれが、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されており、さらに、任意では、任意の置換可能な環炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-NR^{12}C(O)OR^{12}$ 、 $-S(O)_2R^{12}$ 、 $-S(O)_2COR^{12}$ 、 $-S(O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-S(O)_2OR^{12}$ 、 $-S(O)OR^{12}$ 、 $-OR^{12}$ 、 $-SR^{12}$ 、 $-CN$ 、 $-NR^{12}C(O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(O)N(R^{12})_2$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CO_2R^{12}$ 、 $-(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-O(CH_2)_{1-4}CON(R^{12})_2$ 、 $-(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CO_2R^{12}$ 、 $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ 、または $-O(CH_2)_{0-3}(C(CH_3)_2)CON(R^{12})_2$ によって更に置換されており、かつ、

) CON(R^{1 2})₂ によって更に置換されている化合物。

【請求項 4 3】

請求項 4 2 に記載の化合物であって、

R³ が、メタ位またはパラ位で、R^{1 1} で表される、独立して選択された 1 個以上の基によって任意に置換されているフェニル基であり、

各 R^{1 1} が、ハロゲン、ハロアルキル、-R⁰、-OR⁰、-N(R')₂、-NR'SO₂R⁰、および -O(ハロアルキル) から独立して選択される置換基である化合物。

【請求項 4 4】

請求項 4 3 に記載の化合物であって、

R^{Y 1} が、-C(O)OR⁵、-C(O)N(R⁵)₂、-OH、N-モルホリニル、2-モルホリニル、3-モルホリニル、N-置換された 2-モルホリニル、N-置換された 3-モルホリニル、N-イミダゾリジニル、2-イミダゾリジニル、4-イミダゾリジニル、5-イミダゾリジニル、N-置換された 2-イミダゾリジニル、N'-置換された N-イミダゾリジニル、N-置換された 4-イミダゾリジニル、N-置換された 5-イミダゾリジニル、N-イミダゾリジノニル、4-イミダゾリジノニル、5-イミダゾリジノニル、N-置換された 4-イミダゾリジノニル、N-置換された 5-イミダゾリジノニル、N-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、N-置換された 2-ピロリジニル、N-置換された 3-ピロリジニル、N-ピロリジン-2-オニル(only)、3-ピロリジン-2-オニル、4-ピロリジン-2-オニル、5-ピロリジン-2-オニル、N-置換された 3-ピロリジン-2-オニル、N-置換された 4-ピロリジン-2-オニル、N-置換された 5-ピロリジン-2-オニル、N-ピロリジン-3-オニル、2-ピロリジン-3-オニル、4-ピロリジン-3-オニル、5-ピロリジン-3-オニル、N-置換された 2-ピロリジン-3-オニル、N-置換された 4-ピロリジン-3-オニル、N-置換された 5-ピロリジン-3-オニル、N-ピペリジニル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、N-置換された 2-ピペリジニル、N-置換された 3-ピペリジニル、N-置換された 4-ピペリジニル、N-ピペリジン-2-オニル、3-ピペリジン-2-オニル、4-ピペリジン-2-オニル、5-ピペリジン-2-オニル、6-ピペリジン-2-オニル、N-置換された 3-ピペリジン-2-オニル、N-置換された 4-ピペリジン-2-オニル、N-置換された 5-ピペリジン-2-オニル、N-置換された 6-ピペリジン-2-オニル、N-ピペリジン-3-オニル、2-ピペリジン-3-オニル、4-ピペリジン-3-オニル、5-ピペリジン-3-オニル、6-ピペリジン-3-オニル、N-置換された 2-ピペリジン-3-オニル、N-置換された 4-ピペリジン-3-オニル、N-置換された 5-ピペリジン-3-オニル、N-置換された 6-ピペリジン-3-オニル、N-ピペリジン-4-オニル、2-ピペリジン-4-オニル、3-ピペリジン-4-オニル、5-ピペリジン-4-オニル、6-ピペリジン-4-オニル、N-置換された 2-ピペリジン-4-オニル、N-置換された 3-ピペリジン-4-オニル、N-置換された 5-ピペリジン-4-オニル、N-置換された 6-ピペリジン-4-オニル、N-ピペラジニル、2-ピペラジニル、N'-置換された N-ピペラジニル、N-置換された 2-ピペラジニル、フラニル、N-テトラゾリル、5-テトラゾリル、N-置換された 5-テトラゾリル、4-(1, 2, 3)オキサジアゾリル、5-(1, 2, 3)オキサジアゾリル、3-(1, 2, 4)オキサジアゾリル、5-(1, 2, 4)オキサジアゾリル、3-(1, 2, 5)オキサジアゾリル、4-(1, 2, 5)オキサジアゾリル、2-(1, 3, 4)オキサジアゾリル、5-(1, 3, 4)オキサジアゾリル、N-ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、N-置換された 2-ピロリル、N-置換された 3-ピロリル、N-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、N-置換された 3-ピラゾリル、N-置換された 4-ピラゾリル、N-置換された 5-ピラゾリル、2-ピリジニル、3-ピリジニル、4-ピリジニル、N-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル；N-置換された 2-イミダゾリル、N-置換された 4-イミダゾリル、または N-置換された 5-イミダゾリル

であり、

T^2 が、フルオロ、メチル、gemジメチル、gemジフルオロ、フルオロメチル、スピロシクロプロピル、スピロシクロブチル、任意でN-置換されたスピロアゼチジニル、任意でN-置換されたスピロアジリジニル、任意でN-置換されたスピロピロリジニル、任意でN-置換されたスピロペリジニル、アミン、メチルアミン、ジメチルアミン、またはヒドロキシルによって置換された C_{1-4} 直鎖アルキレンであり、

R^{10} で表される基が、モルホリニル、ピロリジニル、ピペラジニル、またはピペリジニルであって、それぞれが、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されており、さらに、任意には、任意の置換可能な炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ によって更に置換されており、かつ、

R^{13} で表される基が、イミダゾリル、またはピロリルであって、それぞれが、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されており、さらに、任意では、任意の置換可能な炭素原子で、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって更に置換されており、また、任意の置換可能な窒素原子で、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-R^{12}C(O)R^{12}$ 、 $-S(O_2)OR^{12}$ 、 $S(O_2)N(R^{12})_2$ 、 $-C(O)N(R^{12})_2$ によって任意で置換されている化合物。

【請求項45】

請求項44に記載の化合物であって、

環Aが、6つおよび7つの位置で R^{14} によって任意に置換されたフェニル基であり、

各 R^{14} が、独立して、ハロゲン、 R^0 、 $-OR^0$ 、 $-CO_2R^0$ 、 $-C(O)R^0$ 、 $-CN-$ 、 $-C(O)N(R^0)_2$ 、 $-OC(O)R^0$ 、 $-(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^0$ 、 $-NHCO_2R^0$ 、 $-NHCOR^0$ 、 $-NHC(O)N(R^0)_2$ 、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $-O(CH_2)_nOH$ 、 $-(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ 、または $-O(CH_2)_nC(O)N(R^0)_2$ であり、

nが1~4の整数であり、

R^3 が、パラ位で R^{11} によって任意に置換されたフェニル基であり、

R^{11} が、クロリド、フルオリド、ブロミド、 $-OR^0$ 、 $-N(R^0)_2$ 、 $-NR^0SO_2R^0$ 、または $-R^0$ であり、

R^0 が、独立してハロゲンまたは C_{1-3} アルキル基であり、かつ、

R^0 が、独立してハロゲン基、ハロアルキル基、または C_{1-3} アルキル基である化合物。

【請求項46】

請求項45に記載の化合物であって、

R^{Y1} が、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OH$ 、N-テトラゾリル、5-テトラゾリル、N-置換された5-テトラゾリル、N-イミダゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル；N-置換された2-イミダゾリル、N-置換された4-イミダゾリル、またはN-置換された5-イミダゾリルであり、

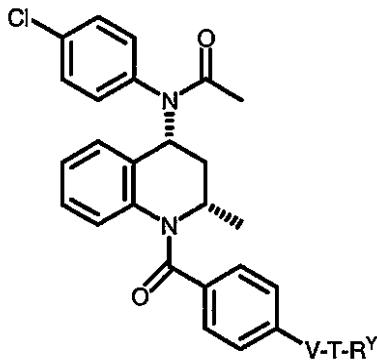
R^{10} で表される基が、ピペリジニル、ピペラジニル、またはモルホリニルであって、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されており、さらに任意には、炭素で窒素原子がメチルまたはgemジメチルによって置換されており、

R^{13} で表される基が、 $T^2 - R^{Y1}$ によってN-置換されたトリアゾリルであって、さらに任意には、炭素で窒素原子がメチルによって置換されている化合物。

【請求項47】

以下の構造式で表される化合物、

【化 2】



またはその薬学的に受容可能な塩であって、式中：

Vは、共有結合または - O - であり、

Tは、非置換の直鎖 C₁ - 1₀ アルキレンであり、

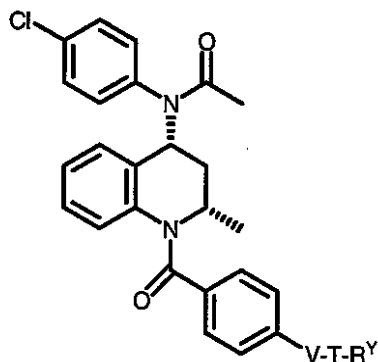
R^Yは、R^Yは、- C(O)OR⁵、- C(O)R⁵、- OC(O)R⁵、- C(O)N(R⁵)₂、- NR⁵C(O)R⁵、- NR⁵C(O)OR⁵、- S(O)₂R⁵、- S(O)₂COR⁵、- S(O)₂N(R⁵)₂、- NR⁵S(O)₂、- NR⁵S(O)₂R⁵、S(O)₂OR⁵、S(O)OR⁵、- SR⁵、- C(O)NR⁵S(O)₂R⁵、- CN、- NR⁵C(O)N(R⁵)₂、- OC(O)N(R⁵)₂、- N(R⁵)₂、- OR⁵、任意で置換された非芳香族複素環基、または任意で置換されたヘテロアリール基であり、かつ

各 R⁵ が、独立して、- H、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、- C(O)OCH₂C₆H₅、S(O)₂CH₃、- C(O)OH、- C(O)OMe、- C(O)OEt、- C(O)NH₂、ベンジル、ピロリジニル、モルホリニルであるか、または、- N(R⁵)₂ が窒素含有非芳香族複素環基である化合物。

【請求項 48】

以下の構造式で表される化合物、

【化 3】



またはその薬学的に受容可能な塩であって、式中：

Vは、共有結合または - O - であり、

Tは、アルキル、gemジアルキル、ハロアルキル、スピロシクロアルキル、または任意でN-置換された窒素含有スピロ非芳香族複素環基で置換された直鎖状 C₁ - 1₀ アルキレンであり、

R^Yは、- C(O)OR⁵、- C(O)R⁵、- OC(O)R⁵、- C(O)N(R⁵)₂、- NR⁵C(O)R⁵、- NR⁵C(O)OR⁵、- S(O)₂R⁵、- S(O)₂COR⁵、- S(O)₂N(R⁵)₂、- NR⁵S(O)₂、- NR⁵S(O)₂R⁵

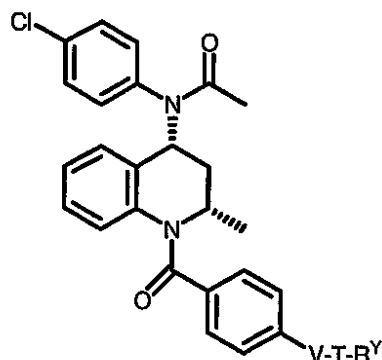
5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 $S(O)OR^5$ 、 $-SR^5$ 、 $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-CN$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OC(O)N(R^5)_2$ 、 $-N(R^5)_2$ 、 $-OR^5$ 、任意で置換された非芳香族複素環基、または任意で置換されたヘテロアリアル基であり、かつ、

各 R^5 が、独立して、 $-H$ 、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、 $C(O)OCH_2C_6H_5$ 、 $-S(O)_2CH_3$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OMe$ 、 $-C(O)OEt$ 、 $-C(O)NH_2$ 、ベンジル、ピロリジニル、モルホリニルであり、または、 $-N(R^5)_2$ が、任意で、窒素含有非芳香族複素環基である化合物。

【請求項 49】

以下の構造式で表される化合物、

【化 4】



またはその薬学的に受容可能な塩であって、式中：

V は、 $-O-$ であり、

T は、任意の 1 個以上の置換可能な炭素原子で、ハロゲン、アルキル、gem ジアルキル、gem ジハロ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、スピロシクロアルキル、任意で N - 置換された窒素含有スピロ非芳香族複素環基、アミン、アルキルアミン、ジアルキルアミン、またはヒドロキシルによって置換されている直鎖状 C_{1-10} アルキレンであり、

R^Y は、 $-C(O)OR^5$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-OC(O)R^5$ 、 $-C(O)N(R^5)_2$ 、 $-NR^5C(O)R^5$ 、 $-NR^5C(O)OR^5$ 、 $-S(O)_2R^5$ 、 $-S(O)_2COR^5$ 、 $-S(O)_2N(R^5)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2$ 、 $-NR^5S(O)_2R^5$ 、 $S(O)_2OR^5$ 、 $S(O)OR^5$ 、 $-SR^5$ 、 $-C(O)NR^5S(O)_2R^5$ 、 $-CN$ 、 $-NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $-OC(O)N(R^5)_2$ 、 $-N(R^5)_2$ 、 $-OR^5$ 、任意で置換された非芳香族複素環基、または任意で置換されたヘテロアリアル基であり、かつ、

各 R^5 が、独立して、 $-H$ 、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、カルボキシアルキル、 $C(O)OCH_2C_6H_5$ 、 $-S(O)_2CH_3$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OMe$ 、 $-C(O)OEt$ 、 $-C(O)NH_2$ 、ベンジル、ピロリジニル、モルホリニルであり、または、 $-N(R^5)_2$ が、任意で、窒素含有非芳香族複素環基である化合物。

【請求項 50】

薬学的に受容可能なキャリアまたは希釈剤、および請求項 1、2、47、48、または 49 に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 51】

治療を必要とする被験体における炎症性の疾患、状態、または症状を治療するための組成物であって、請求項 1、2、47、48、または 49 に記載の化合物で表される、有効量の化合物を含む組成物。

【請求項 5 2】

前記炎症性の疾患、状態、または症状が、アレルギー性鼻炎、慢性関節リウマチ、慢性閉塞性肺疾患、アトピー性皮膚炎、またはアレルギー性ぜんそくである、請求項 5 1 に記載の組成物。

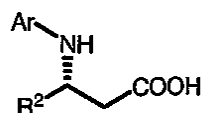
【請求項 5 3】

前記炎症性の疾患、状態、または症状が、アレルギー性鼻炎、またはアレルギー性ぜんそくである、請求項 5 1 に記載の組成物。

【請求項 5 4】

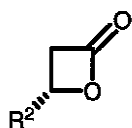
以下の構造式で表される化合物を調製する方法であって、

【化 5】



Ar - NH₂ を

【化 6】



と反応させる工程を含み、

Ar が、任意で置換された単環式芳香族基であり、R² が C₁ ~ C₃ アルキルである方法。

【請求項 5 5】

Ar が、任意で置換されたフェニル基であり、R² がメチルまたはエチルである、請求項 5 4 に記載の方法。

【請求項 5 6】

Ar が、メタ位またはパラ位を任意に R^{1 4} で置換されたフェニル基であり、

各 R^{1 4} が、独立して、ハロ、シアノ、R⁰、-OR^{3 0}、-CO₂R^{3 1}、-C(O)R⁰、-C(O)N(R^x)₂、-OC(O)R⁰、-(CH₂)_nCO₂R^{3 1}、O(CH₂)_nCO₂R^{3 1}、NH₂SO₂R⁰、NHC(O)NR^x₂、(CH₂)_nOR^{3 0}、O(CH₂)_nOR^{3 0}、(CH₂)_nC(O)NR⁰₂、O(CH₂)_nC(O)N(R^x)₂ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R⁰ が、独立して、水素、C₁ ~ C₃ ハロアルキル、または C₁ ~ C₃ アルキル基であり、

1 つの R^x が -H または C₁ ~ C₃ アルキルであり、その他がアミン保護基であり、

R^{3 0} が、アルコール保護基であり、かつ、

R^{3 1} が、カルボン酸保護基である、請求項 5 5 に記載の方法。

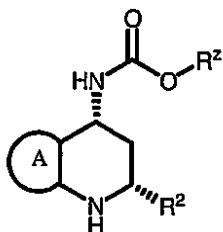
【請求項 5 7】

Ar がフェニル基である、請求項 5 6 に記載の方法。

【請求項 5 8】

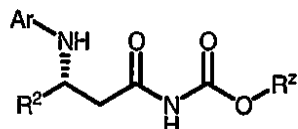
以下の構造式で表される生成化合物：

【化 7】



を以下の構造式で表される出発化合物：

【化 8】



から調製する方法であって、該出発化合物のアミドカルボニルを還元して中間体を生成させてから、該中間体を環化して生成化合物を生成するが、ここでC(O)OR²がアミド保護基である工程を含む方法。

【請求項 59】

R²が、置換されているか、非置換のアルキル基、アリル基、または芳香族基である、請求項 58 に記載の方法。

【請求項 60】

前記出発化合物のアミドカルボニルが、該出発化合物を、水素化ホウ素ナトリウムおよびルイス酸と反応させて還元し、該中間体を酸存在下で環化する、請求項 59 に記載の方法。

【請求項 61】

Ar が、任意で置換されたフェニル基であり、R²がメチルまたはエチルである、請求項 60 に記載の方法。

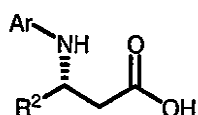
【請求項 62】

R²が、ベンジル、メチル、エチル、アリル、2,2,2-トリクロロメチル、2,2,2-トリクロロメチル-tert-ブチル、tert-ブチル、またはフルオレニルメチルである、請求項 60 に記載の方法。

【請求項 63】

前記出発化合物が、アミノ酸をH₂NC(O)OR²によってアミド化して調製され、該アミノ酸が以下の構造式：

【化 9】



で表される、請求項 58 に記載の方法。

【請求項 64】

前記アミド化が、前記アミノ酸をカルボン酸活性化試薬と反応させて活性化型中間体を形成させ、次いで、該活性化型中間体をH₂NC(O)OR²と反応させることによって行われる、請求項 63 に記載の方法。

【請求項 65】

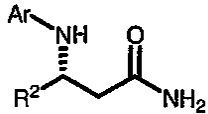
前記カルボン酸活性化試薬がカルボニルジイミダゾールである、請求項 64 に記載の方

法。

【請求項 66】

前記アミド化が、前記アミノ酸をカルボン酸活性化試薬と反応させて活性化型中間体を形成させ、次いで、該活性化型中間体を NH_3 またはその機能的等価物と反応させて、以下の構造式で表されるカルボキサミド中間体を形成させ、

【化 10】

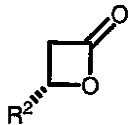


該カルボキサミド中間体を、X が離脱基である $\text{X} - \text{C}(\text{O})\text{OR}^2$ と反応させることによつて行われる、請求項 63 に記載の方法。

【請求項 67】

前記アミノ酸が、 $\text{Ar} - \text{NH}_2$ を

【化 11】



と反応させて調製される、請求項 63 に記載の方法。

【請求項 68】

Ar が、任意で置換されたフェニル基であり、 R^2 がメチルまたはエチルである、請求項 67 に記載の方法。

【請求項 69】

Ar が、任意で 6 および 7 個の位置を R^{1-4} によつて置換されており、

各 R^{1-4} が、独立して、ハロ、シアノ、 R^0 、 $-\text{OR}^{30}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^{31}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^0$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^0$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^{31}$ 、 NHSO_2R^0 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{OR}^{30}$ 、 $(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^x)_2$ であり、

n が 1 ~ 4 の整数であり、

R^0 が、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルキル、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル基であり、

1 つの R^x が $-\text{H}$ または $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキルであり、その他がアミン保護基であり、

R^{30} が、アルコール保護基であり、かつ、

R^{31} が、カルボン酸保護基である、請求項 68 記載の方法。

【請求項 70】

Ar がフェニル基である、請求項 69 に記載の方法。