

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-500400(P2005-500400A)

【公表日】平成17年1月6日(2005.1.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-001

【出願番号】特願2003-523200(P2003-523200)

【国際特許分類】

C 0 7 C 225/22 (2006.01)  
A 6 1 K 31/136 (2006.01)  
A 6 1 K 31/165 (2006.01)  
A 6 1 K 31/17 (2006.01)  
A 6 1 K 31/222 (2006.01)  
A 6 1 K 31/341 (2006.01)  
A 6 1 K 31/351 (2006.01)  
A 6 1 K 31/357 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4015 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4035 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4166 (2006.01)  
A 6 1 K 31/421 (2006.01)  
A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
A 6 1 K 31/445 (2006.01)  
A 6 1 K 31/495 (2006.01)  
A 6 1 K 31/5375 (2006.01)  
A 6 1 K 31/662 (2006.01)  
A 6 1 K 31/7028 (2006.01)  
A 6 1 P 1/04 (2006.01)  
A 6 1 P 11/06 (2006.01)  
A 6 1 P 17/00 (2006.01)  
A 6 1 P 17/02 (2006.01)  
A 6 1 P 17/06 (2006.01)  
A 6 1 P 17/10 (2006.01)  
A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
A 6 1 P 19/06 (2006.01)  
C 0 7 C 229/44 (2006.01)  
C 0 7 C 233/25 (2006.01)  
C 0 7 C 233/36 (2006.01)  
C 0 7 C 233/43 (2006.01)  
C 0 7 C 235/10 (2006.01)  
C 0 7 C 235/74 (2006.01)  
C 0 7 C 271/20 (2006.01)  
C 0 7 C 271/22 (2006.01)  
C 0 7 C 271/28 (2006.01)  
C 0 7 C 275/24 (2006.01)  
C 0 7 C 275/26 (2006.01)  
C 0 7 C 275/40 (2006.01)  
C 0 7 C 309/73 (2006.01)  
C 0 7 C 311/15 (2006.01)  
C 0 7 C 311/21 (2006.01)

C 0 7 C 317/48 (2006.01)  
C 0 7 C 323/52 (2006.01)  
C 0 7 C 335/12 (2006.01)  
C 0 7 D 207/27 (2006.01)  
C 0 7 D 211/22 (2006.01)  
C 0 7 D 233/72 (2006.01)  
C 0 7 D 233/74 (2006.01)  
C 0 7 D 233/96 (2006.01)  
C 0 7 D 263/44 (2006.01)  
C 0 7 D 265/32 (2006.01)  
C 0 7 D 295/12 (2006.01)  
C 0 7 D 307/14 (2006.01)  
C 0 7 D 309/12 (2006.01)  
C 0 7 D 317/22 (2006.01)  
C 0 7 F 9/38 (2006.01)  
C 0 7 F 9/40 (2006.01)  
C 0 7 H 15/18 (2006.01)  
C 0 7 D 209/48 (2006.01)  
C 0 7 D 277/20 (2006.01)  
C 0 7 D 277/34 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 225/22  
A 6 1 K 31/136  
A 6 1 K 31/165  
A 6 1 K 31/17  
A 6 1 K 31/222  
A 6 1 K 31/341  
A 6 1 K 31/351  
A 6 1 K 31/357  
A 6 1 K 31/4015  
A 6 1 K 31/4035  
A 6 1 K 31/4166  
A 6 1 K 31/421  
A 6 1 K 31/426  
A 6 1 K 31/445  
A 6 1 K 31/495  
A 6 1 K 31/5375  
A 6 1 K 31/662  
A 6 1 K 31/7028  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/02  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 19/06  
C 0 7 C 229/44  
C 0 7 C 233/25  
C 0 7 C 233/36

C 0 7 C	233/43	
C 0 7 C	235/10	
C 0 7 C	235/74	
C 0 7 C	271/20	
C 0 7 C	271/22	
C 0 7 C	271/28	
C 0 7 C	275/24	
C 0 7 C	275/26	
C 0 7 C	275/40	
C 0 7 C	309/73	
C 0 7 C	311/15	
C 0 7 C	311/21	
C 0 7 C	317/48	
C 0 7 C	323/52	
C 0 7 C	335/12	
C 0 7 D	207/27	Z
C 0 7 D	211/22	
C 0 7 D	233/72	
C 0 7 D	233/74	
C 0 7 D	233/96	
C 0 7 D	263/44	
C 0 7 D	265/32	
C 0 7 D	295/12	A
C 0 7 D	295/12	Z
C 0 7 D	307/14	
C 0 7 D	309/12	
C 0 7 D	317/22	
C 0 7 F	9/38	C
C 0 7 F	9/40	C
C 0 7 H	15/18	
C 0 7 D	209/48	Z
C 0 7 D	277/34	

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月23日(2005.8.23)

【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

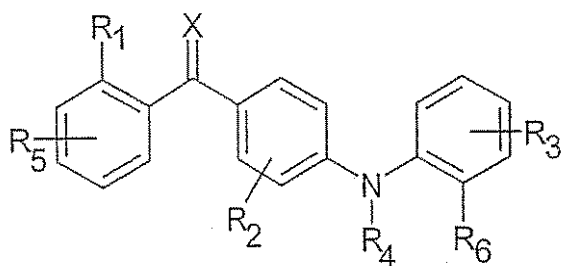
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の一般式Iの化合物ならびに医薬的に許容されるその塩、溶媒和物および水和物、但し一般式Iの化合物は2-クロロ-4-(2-[1,1,1-トリフルオロメチル]フェニルアミノ-2'-メチルベンゾフェノンではないものとする:

## 【化1】



(I)

式中、

Xは、酸素を表し；

R<sub>1</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、トリフルオロメチル、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub>)オレフィン基、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシカルボニル、シアノ、-CONH<sub>2</sub>、フェニルおよびニトロから成る群から選択される置換基を表し；

R<sub>2</sub>は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、トリフルオロメチル、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub>)オレフィン基、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシカルボニル、シアノ、-CONH<sub>2</sub>、フェニルおよびニトロから成る群から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基を表し；

R<sub>3</sub>は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、トリフルオロメチル、シアノ、カルボキシ、カルバモイル、ニトロ、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルコキシカルボニルおよびフェニルから成る群から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基を表し；

R<sub>4</sub>は、水素、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>)環式炭化水素基、または-C(O)O-C(R<sub>d</sub>)(R<sub>e</sub>)(-O-C(O)-R<sub>14</sub>)を表し；該R<sub>14</sub>基は、R<sub>8</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>5</sub>は、水素およびR<sub>1</sub>から成る群から選択される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基を表し；

R<sub>6</sub>は、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、ヘテロシクリル、(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)アルキニル、Y<sub>1</sub>R<sub>21</sub>、Y<sub>2</sub>R<sub>22</sub>またはY<sub>4</sub>R<sub>24</sub>を表し；該(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)オレフィン基および(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基は、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)アルキニルは、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>7</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-HまたはY-R<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>およびY-R<sub>14</sub>基は、R<sub>8</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>8</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-H、Y-R<sub>14</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>、Y-R<sub>14</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>9</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>9</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-H、Y-R<sub>14</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>、Y-R<sub>14</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>10</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>10</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-H、Y-R<sub>14</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>、Y-R<sub>14</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>11</sub>で示さ

れる1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{11}$ は、 $R_{12}$ または $R_{14}$ を表し；該 $R_{12}$ および $R_{14}$ 基は、 $R_{12}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{12}$ は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、トリフルオロメチル、アミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキルチオ、( $C_1 \sim C_6$ )アルキルアミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシカルボニル、陰イオンと会合した( $C_1 \sim C_9$ )トリアルキルアンモニウム、( $C_2 \sim C_{10}$ )ジアルキルホスフィノイル、( $C_1 \sim C_5$ )アルキル(ヒドロキシ)ホスフィノイル、( $C_2 \sim C_{10}$ )ジアルキルホスフィノイルオキシ、( $C_1 \sim C_5$ )アルキル(ヒドロキシ)ホスフィノイルオキシ、ジヒドロキシホスフィノイル、ジヒドロキシホスフィノイルオキシ、シアノ、アジド、ニトロ、-CHO、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CONHR'または-CONRR'[RおよびR'は( $C_1 \sim C_3$ )アルキルを表す]を表し；

Yは、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(Z)NR<sub>b</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)-C(Z)NR<sub>a</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-C(Z)O-、-C(O)Z-、-C(S)S-、-OC(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(Z)O-、-OC(Z)NR<sub>a</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>O-、-OS(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-OC(Z)O-、-OC(Z)Z-、-OP(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-P(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-C(NR<sub>a</sub>)-、-C(NOR<sub>a</sub>)-、-N=C(R<sub>a</sub>)-、-N=C(OR<sub>a</sub>)-、-N(OR<sub>a</sub>)-、-ON(R<sub>a</sub>)-、-N(R<sub>a</sub>)O-、-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)NR<sub>c</sub>-、-C(=NR<sub>a</sub>)NR<sub>b</sub>-、または-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)-を表し；

Zは、酸素または硫黄を表し；

$R_{14}$ は、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_2 \sim C_6$ )オレフィン基、( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または( $C_2 \sim C_6$ )アルキニルを表し；

$Y_1$ は、-NR<sub>a</sub>C(S)NR<sub>b</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-C(S)O-、-C(O)S-、-C(S)S-、-OC(S)-、-OC(O)-、-NR<sub>a</sub>C(S)O-、-OC(Z)NR<sub>a</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>O-、-OS(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-OC(Z)O-、-OC(Z)Z-、-OP(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-P(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-C(NR<sub>a</sub>)-、-C(NOR<sub>a</sub>)-、-N=C(R<sub>a</sub>)-、-N=C(OR<sub>a</sub>)-、-N(OR<sub>a</sub>)-、-ON(R<sub>a</sub>)-、-N(R<sub>a</sub>)O-、-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)NR<sub>c</sub>-、-C(=NR<sub>a</sub>)NR<sub>b</sub>-、または-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)-を表し；

$R_{21}$ は、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル、( $C_2 \sim C_{10}$ )オレフィン基、( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニルを表し；それらはいずれも、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$Y_2$ は、-O-、-S-、-C(O)O-、または-C(O)NR<sub>a</sub>-を表し；

$R_{22}$ は、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル、( $C_2 \sim C_{10}$ )オレフィン基、または( $C_3 \sim C_8$ )単環式炭化水素基を表し；該( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキルは、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル、( $C_2 \sim C_{10}$ )オレフィン基、および( $C_3 \sim C_{12}$ )単環式炭化水素基は、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$Y_4$ は、-NR<sub>a</sub>C(O)NR<sub>b</sub>CH(R<sub>c</sub>)-、-NR<sub>a</sub>C(O)NR<sub>b</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(O)OCH(R<sub>c</sub>)-、-NR<sub>a</sub>C(O)NR<sub>b</sub>C(R<sub>d</sub>)(R<sub>e</sub>)-OC(O)-、または-NR<sub>a</sub>C(O)OC(R<sub>d</sub>)(R<sub>e</sub>)-OC(O)-を表し；

$R_{24}$ は、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル-( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、( $C_2 \sim C_{10}$ )アルキニル、( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル、( $C_2 \sim C_{10}$ )オレフィン基、または( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基を表し；該( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキル、( $C_2 \sim C_{10}$ )オレフィン基および( $C_3 \sim C_{12}$ )環式炭化水素基は、 $R_{15}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該( $C_1 \sim C_{10}$ )アルキ

ル、(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)アルキニルは、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>15</sub>は、R<sub>12a</sub>、R<sub>12b</sub>またはR<sub>12c</sub>を表し；該R<sub>12a</sub>、R<sub>12b</sub>およびR<sub>12c</sub>は、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>12a</sub>は、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキルチオ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシカルボニル、-CONHR'または-CONRR'[RおよびR'は(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキルを表す]を表し；それらはいずれも、R<sub>42</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており；但し、R<sub>42</sub>による置換も含むR<sub>12a</sub>またはR<sub>15</sub>が、式-(Q-O)<sub>n</sub>-Qまたは-CH<sub>2</sub>(Q-O)<sub>n</sub>-Q[Qは(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキルであり、nは1より大きい整数である]の基を表すとき、該基は、少なくとも16個の原子の連続直鎖配列を有するものとし；

R<sub>12b</sub>は、(C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>)アルコキシ、(C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>)アルキルチオ、(C<sub>7</sub>~C<sub>12</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>)アルコキシカルボニル、-CONHR'または-CONRR'[RおよびR'は(C<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>)アルキルを表す]を表し；それらはいずれも、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>12c</sub>は、-Y<sub>5</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、-Y-アリール、-Y-ヘテロシクリル、-Y-(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、または-Y-(C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>)オレフィン基を表し；それらはいずれも、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

Y<sub>5</sub>は、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(Z)NR<sub>b</sub>-、-C(S)NR<sub>a</sub>-、-C(O)-、-C(S)-、-C(S)O-、-C(O)S-、-C(S)S-、-OC(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(Z)O-、-OC(Z)NR<sub>a</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>O-、-OS(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-OC(Z)O-、-OC(Z)Z-、-OP(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-P(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-C(NR<sub>a</sub>)-、-C(NOR<sub>a</sub>)-、-N=C(R<sub>a</sub>)-、-N=C(OR<sub>a</sub>)-、-N(OR<sub>a</sub>)-、-ON(R<sub>a</sub>)-、-N(R<sub>a</sub>)O-、-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)NR<sub>c</sub>-、-C(=NR<sub>a</sub>)NR<sub>b</sub>-、または-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)-を表し；

R<sub>42</sub>は、-Y-H、Y-R<sub>14</sub>、R<sub>52</sub>、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、アジドまたはニトロを表し；該R<sub>52</sub>および-Y-R<sub>14</sub>は、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>52</sub>は、(C<sub>6</sub>~C<sub>10</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、ヘテロシクリル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、またはヘテロアリールを表し；

R<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>およびR<sub>c</sub>は、独立に、水素、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基、アリール、ヘテロシクリル、または(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニルを表し；それらはいずれも、R<sub>12</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>d</sub>およびR<sub>e</sub>は、独立に、水素、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)オレフィン基、または(C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>)環式炭化水素基を表し；それらはいずれも、R<sub>12</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよい。

#### 【請求項2】

R<sub>1</sub>が、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub>)オレフィン基、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシおよびシアノから成る群から選択される置換基を表す請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

R<sub>2</sub>が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub>)オレフィン基および(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>)アルコキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>

) アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>) 単環式炭化水素基、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルコキシおよび(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニルから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R<sub>4</sub>が、水素、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル、または(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) オレフィン基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R<sub>5</sub>が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>3</sub>) オレフィン基、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルコキシカルボニルおよびシアノから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R<sub>6</sub>は、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル-ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル-(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>) 環式炭化水素基、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>) 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) アルキニル、Y<sub>1</sub>R<sub>21</sub>、Y<sub>2</sub>R<sub>22</sub>またはY<sub>4</sub>R<sub>24</sub>を表し；該(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) オレフィン基および(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>) 環式炭化水素基は、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル-ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル-(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>) 環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) アルキニルは、R<sub>7</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>7</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-HまたはY-R<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>およびY-R<sub>14</sub>基は、R<sub>8</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>8</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-H、Y-R<sub>14</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>、Y-R<sub>14</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>9</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>9</sub>は、R<sub>12</sub>、Y-H、Y-R<sub>14</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>、Y-R<sub>14</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>10</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>10</sub>は、R<sub>12</sub>またはR<sub>14</sub>を表し；該R<sub>12</sub>およびR<sub>14</sub>基は、R<sub>12</sub>で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

R<sub>12</sub>は、ハロゲン、ヒドロキシ、メルカプト、トリフルオロメチル、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルキルチオ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルコキシカルボニル、陰イオンと会合した(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) トリアルキルアンモニウム、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) ジアルキルホスフィノイル、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルキル(ヒドロキシ)ホスフィノイル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) ジアルキルホスフィノイルオキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルキル(ヒドロキシ)ホスフィノイルオキシ、ジヒドロキシホスフィノイル、ジヒドロキシホスフィノイルオキシ、シアノ、アジド、ニトロ、-CHO、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CONHR'または-CONRR' [RおよびR'は(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>) アルキルを表す]を表し；

Yは、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)NR<sub>b</sub>-、-NR<sub>a</sub>C(Z)-、-C(Z)NR<sub>a</sub>-、-C(O)-、-C(Z)O-、-OC(Z)-、-NR<sub>a</sub>C(Z)O-、-OC(Z)NR<sub>a</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>O-、-OS(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-OC(Z)Z-、-OP(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-P(O)(OR<sub>a</sub>)O-、-C(NOR<sub>a</sub>)-、-N(OR<sub>a</sub>)-、-ON(R<sub>a</sub>)-、-N(R<sub>a</sub>)O-、-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)NR<sub>c</sub>-、-C(=NR<sub>a</sub>)NR<sub>b</sub>-、または-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)-を表し；

Zは、酸素を表し；

R<sub>14</sub>は、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) オレフィン基、(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>) 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>) アルキニルを表し；

Y<sub>1</sub>は、-NR<sub>a</sub>C(S)NR<sub>b</sub>-、-C(O)-、-OC(O)-、-NR<sub>a</sub>C(S)O-、-OC(Z)NR<sub>a</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>-、-NR<sub>a</sub>S(O)<sub>2</sub>-、-OC(Z)O-、-C(NR<sub>a</sub>)-、-C(NOR<sub>a</sub>)-、-N(OR<sub>a</sub>)-、-ON(R<sub>a</sub>)-、-N(R<sub>a</sub>)O-、-N(R<sub>a</sub>)C(=NR<sub>b</sub>)NR<sub>c</sub>-、-C(=NR<sub>a</sub>)

$\text{NR}_b -$ 、または  $- \text{N}(\text{R}_a) \text{C}(=\text{NR}_b) -$  を表し；

$\text{R}_{2,1}$  は、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル - ヘテロシクリル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル -  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または  $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  アルキニルを表し；それらはいずれも、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$\text{Y}_2$  は、 $- \text{O} -$ 、 $- \text{S} -$ 、 $- \text{C}(\text{O}) \text{O} -$ 、または  $- \text{C}(\text{O}) \text{NR}_a -$  を表し；

$\text{R}_{2,2}$  は、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル - ヘテロシクリル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル -  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  アルキニル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基、または  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  単環式炭化水素基を表し；該  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキルは、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル - ヘテロシクリル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル -  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  アルキニル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基、および  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  単環式炭化水素基は、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$\text{Y}_4$  は、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{NR}_b \text{CH}(\text{R}_c) -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{NR}_b \text{S}(\text{O})_2 -$ 、 $- \text{NR}_a -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{Z}) -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{OCH}(\text{R}_c) -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{NR}_b \text{C}(\text{R}_d)(\text{R}_e) - \text{OC}(\text{O}) -$ 、または  $- \text{NR}_a \text{C}(\text{O}) \text{OC}(\text{R}_d)(\text{R}_e) - \text{OC}(\text{O}) -$  を表し；

$\text{R}_{2,4}$  は、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル - ヘテロシクリル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル -  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  アルキニル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基、または  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基を表し；該  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基および  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基は、 $\text{R}_{1,5}$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル - ヘテロシクリル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル -  $(\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび  $(\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  アルキニルは、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$\text{R}_{1,5}$  は、 $\text{R}_{1,2,a}$ 、 $\text{R}_{1,2,b}$  または  $\text{R}_{1,2,c}$  を表し；該  $\text{R}_{1,2,a}$ 、 $\text{R}_{1,2,b}$  および  $\text{R}_{1,2,c}$  は、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されていてもよく；

$\text{R}_{1,2,a}$  は、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$  アルコキシ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$  アルキルチオ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキルアミノ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$  アルコキシカルボニル、 $- \text{CONHR}'$  または  $- \text{CONRR}'$  [ $\text{R}$  および  $\text{R}'$  は  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$  アルキルを表す] を表し；それらはいずれも、 $\text{R}_{4,2}$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており；但し、 $\text{R}_{4,2}$  による置換も含む  $\text{R}_{1,2,a}$  または  $\text{R}_{1,5}$  が、式  $- (\text{Q} - \text{O})_n - \text{Q}$  または  $- \text{CH}_2(\text{Q} - \text{O})_n - \text{Q}$  [ $\text{Q}$  は  $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$  アルキルであり、 $n$  は1より大きい整数である] の基を表すとき、該基は、少なくとも16個の原子の連続直鎖配列を有するものとし；

$\text{R}_{1,2,b}$  は、 $(\text{C}_4 \sim \text{C}_6)$  アルコキシ、 $(\text{C}_4 \sim \text{C}_6)$  アルキルチオ、 $(\text{C}_7 \sim \text{C}_{12})$  アルキルアミノ、 $(\text{C}_4 \sim \text{C}_8)$  アルコキシカルボニル、 $- \text{CONHR}'$  または  $- \text{CONRR}'$  [ $\text{R}$  および  $\text{R}'$  は  $(\text{C}_4 \sim \text{C}_8)$  アルキルを表す] を表し；それらはいずれも、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$\text{R}_{1,2,c}$  は、 $- \text{Y}_5(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$  アルキル、 $- \text{Y} -$  アリール、 $- \text{Y} -$  ヘテロシクリル、 $- \text{Y} - (\text{C}_3 \sim \text{C}_9)$  環式炭化水素基、または  $- \text{Y} - (\text{C}_2 \sim \text{C}_6)$  オレフィン基を表し；それらはいずれも、 $\text{R}_7$  で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$\text{Y}_5$  は、 $- \text{S}(\text{O}) -$ 、 $- \text{S}(\text{O})_2 -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{Z}) -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{Z}) \text{NR}_b -$ 、 $- \text{C}(\text{O}) -$ 、 $- \text{OC}(\text{Z}) -$ 、 $- \text{NR}_a \text{C}(\text{Z}) \text{O} -$ 、 $- \text{OC}(\text{Z}) \text{NR}_a -$ 、 $- \text{S}(\text{O})_2 \text{NR}_a -$ 、 $- \text{NR}_a \text{S}(\text{O})_2 -$ 、 $- \text{OC}(\text{Z}) \text{O} -$ 、 $- \text{OP}(\text{O})(\text{OR}_a) \text{O} -$ 、 $- \text{P}(\text{O})(\text{OR}_a) \text{O} -$ 、 $- \text{C}(\text{NR}_a) -$ 、 $- \text{C}(\text{NOR}_a) -$ 、 $- \text{N}(\text{OR}_a) -$ 、 $- \text{ON}(\text{R}_a) -$ 、 $- \text{N}(\text{R}_a) \text{O} -$ 、 $- \text{N}(\text{R}_a) \text{C}(=\text{NR}_b) \text{NR}_c -$ 、 $- \text{C}(=\text{NR}_a) \text{NR}_b -$ 、または  $- \text{N}(\text{R}_a) \text{C}(=\text{NR}_b) -$  を表し；

$\text{R}_{4,2}$  は、 $- \text{Y} - \text{H}$ 、 $- \text{Y} - \text{R}_{1,4}$ 、 $\text{R}_{5,2}$ 、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、アジドまた

はニトロを表し；該 $R_{52}$ および $-Y-R_{14}$ は、 $R_8$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{52}$ は、( $C_6 \sim C_8$ )アルキル、( $C_2 \sim C_4$ )オレフィン基、( $C_3 \sim C_6$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリル、( $C_2 \sim C_4$ )アルキニル、またはヘテロアリールを表し；

$R_a$ 、 $R_b$ および $R_c$ は、独立に、水素、( $C_1 \sim C_4$ )アルキル、( $C_2 \sim C_4$ )オレフィン基、( $C_3 \sim C_9$ )環式炭化水素基、アリール、ヘテロシクリル、または( $C_2 \sim C_4$ )アルキニルを表し；それらはいずれも、 $R_{12}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_d$ および $R_e$ は、独立に、水素、( $C_1 \sim C_4$ )アルキル、( $C_2 \sim C_4$ )オレフィン基、または( $C_3 \sim C_9$ )環式炭化水素基を表し；それらはいずれも、 $R_{12}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよい請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

$R_1$ は、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、( $C_2 \sim C_3$ )オレフィン基、( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ、およびシアノから成る群から選択される置換基を表し；

$R_2$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、( $C_2 \sim C_3$ )オレフィン基、および( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表し；

$R_3$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_2 \sim C_6$ )オレフィン基、( $C_3 \sim C_6$ )単環式炭化水素基、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシおよび( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシカルボニルから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表し；

$R_4$ は、水素、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、または( $C_2 \sim C_6$ )オレフィン基を表し；

$R_5$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、( $C_1 \sim C_3$ )アルキル、( $C_2 \sim C_3$ )オレフィン基、( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシ、( $C_1 \sim C_3$ )アルコキシカルボニル、およびシアノから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

$R_1$ が、ハロゲン、シアノ、メチルおよびメトキシから成る群から選択される置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

$R_2$ が、水素、ハロゲン、シアノ、メチルおよびメトキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

$R_3$ が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、メトキシおよびシアノから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

$R_4$ が、水素、メチルまたはエチルを表す請求項1に記載の化合物。

【請求項13】

$R_5$ が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メチル、エチルおよびメトキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

$R_6$ は、( $C_1 \sim C_4$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_4$ )アルキル-( $C_3 \sim C_6$ )環式炭化水素基、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、( $C_2 \sim C_4$ )オレフィン基、ヘテロシクリル、( $C_2 \sim C_4$ )アルキニル、 $Y_1R_{21}$ 、 $Y_2R_{22}$ または $Y_4R_{24}$ を表し；該( $C_1 \sim C_6$ )アルキルおよび( $C_2 \sim C_4$ )オレフィン基は、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該( $C_1 \sim C_4$ )アルキル-ヘテロシクリル、( $C_1 \sim C_4$ )アルキル-( $C_3 \sim C_6$ )環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび( $C_2 \sim C_4$ )アルキニルは、 $R_7$ で示される1個

またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_7$ は、 $R_{12}$ 、 $Y-H$ または $Y-R_{14}$ を表し；該 $R_{12}$ および $Y-R_{14}$ 基は、 $R_8$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意にさらに置換されていてもよく；

$R_8$ は、 $R_{12}$ 、 $Y-H$ 、 $Y-R_{14}$ または $R_{14}$ を表し；該 $R_{12}$ 、 $Y-R_{14}$ および $R_{14}$ 基は、 $R_9$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_9$ は、 $R_{12}$ 、 $Y-R_{14}$ または $R_{14}$ を表し；該 $R_{12}$ 、 $Y-R_{14}$ および $R_{14}$ 基は、 $R_{12}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{12}$ は、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、 $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_3)$ アルキルチオ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシカルボニル、陰イオンと会合した $(C_1 \sim C_6)$ トリアルキルアンモニウム、 $(C_2 \sim C_6)$ ジアルキルホスフィノイル、 $(C_2 \sim C_6)$ ジアルキルホスフィノイルオキシ、ジヒドロキシホスフィノイル、ジヒドロキシホスフィノイルオキシ、シアノ、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHR'$ または $-CONRR'$  [ $R$ および $R'$ は $(C_1 \sim C_3)$ アルキルを表す]を表し；

$Y$ は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR_a-$ 、 $-NR_aC(Z)NR_b-$ 、 $-NR_aC(Z)-$ 、 $-C(Z)NR_a-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(Z)O-$ 、 $-OC(Z)-$ 、 $-NR_aC(Z)O-$ 、 $-OC(Z)NR_a-$ 、 $-S(O)_2O-$ 、 $-OS(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR_a-$ 、 $-NR_aS(O)_2-$ 、 $-OC(Z)Z-$ 、 $-N(R_a)C(=NR_b)NR_c-$ 、 $-C(=NR_a)NR_b-$ 、または $-N(R_a)C(=NR_b)-$ を表し；

$Z$ は、酸素を表し；

$R_{14}$ は、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、 $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または $(C_2 \sim C_3)$ アルキニルを表し；

$Y_1$ は、 $-NR_aC(S)NR_b-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-NR_aC(S)O-$ 、 $-OC(Z)NR_a-$ 、 $-S(O)_2NR_a-$ 、 $-NR_aS(O)_2-$ 、または $-OC(Z)O-$ を表し；

$R_{21}$ は、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル-ヘテロシクリル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル- $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、 $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、または $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルを表し；それらはいずれも、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており；

$Y_2$ は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)O-$ 、または $-C(O)NR_a-$ を表し；

$R_{22}$ は、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル-ヘテロシクリル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル- $(C_3 \sim C_9)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、または $(C_3 \sim C_6)$ 単環式炭化水素基を表し；該 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルは、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル-ヘテロシクリル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル- $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキニル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、および $(C_3 \sim C_6)$ 単環式炭化水素基は、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$Y_4$ は、 $-NR_aC(O)NR_bCH(R_c)-$ 、 $-NR_aC(O)NR_bS(O)_2-$ 、 $-NR_a-$ 、 $-NR_aC(Z)-$ 、 $-NR_aC(O)OCH(R_c)-$ 、 $-NR_aC(O)NR_bC(R_d)(R_e)-OC(O)-$ 、または $-NR_aC(O)OC(R_d)(R_e)-OC(O)-$ を表し；

$R_{24}$ は、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル-ヘテロシクリル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル- $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、または $(C_3 \sim C_9)$ 環式炭化水素基を表し；該 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基および $(C_3 \sim C_9)$ 環式炭化水素基は、 $R_{15}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており、該 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、 $(C_3 \sim C_9)$ 環式炭化水素基、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル-ヘテロシクリル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル- $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリルおよび $(C_2 \sim C_4)$ アルキニルは、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{15}$ は、 $R_{12a}$ 、 $R_{12b}$ または $R_{12c}$ を表し；該 $R_{12a}$ 、 $R_{12b}$ および $R_{12c}$ は、 $R_7$ で示される1個ま

たはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{1,2a}$ は、 $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_3)$ アルキルチオ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシカルボニル、 $-\text{CONHR}'$ または $-\text{CONRR}'$  [ $R$ および $R'$ は $(C_1 \sim C_3)$ アルキルを表す]を表し；それらはいずれも、 $R_{4,2}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって置換されており；但し、 $R_{4,2}$ による置換も含む $R_{1,2a}$ または $R_{1,5}$ が、式 $-(Q-O)_n-Q$ または $-\text{CH}_2(Q-O)_n-Q$  [ $Q$ は $(C_1 \sim C_3)$ アルキルであり、 $n$ は1より大きい整数である]の基を表すとき、該基は、少なくとも16個の原子の連続直鎖配列を有するものとし；

$R_{1,2b}$ は、 $(C_4 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_4 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_7 \sim C_{12})$ アルキルアミノ、 $(C_4 \sim C_8)$ アルコキシカルボニル、 $-\text{CONHR}'$ または $-\text{CONRR}'$  [ $R$ および $R'$ は $(C_4 \sim C_8)$ アルキルを表す]を表し；それらはいずれも、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{1,2c}$ は、 $-Y_5(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-Y-$ アリール、 $-Y-$ ヘテロシクリル、 $-Y-(C_3 \sim C_9)$ 環式炭化水素基、または $-Y-(C_2 \sim C_6)$ オレフィン基を表し；それらはいずれも、 $R_7$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$Y_5$ は、 $-\text{S}(O)-$ 、 $-\text{S}(O)_2-$ 、 $-\text{NR}_a\text{C}(Z)-$ 、 $-\text{NR}_a\text{C}(Z)\text{NR}_b-$ 、 $-\text{C}(O)-$ 、 $-\text{OC}(Z)-$ 、 $-\text{NR}_a\text{C}(Z)O-$ 、 $-\text{OC}(Z)\text{NR}_a-$ 、 $-\text{S}(O)_2\text{NR}_a-$ 、 $-\text{NR}_a\text{S}(O)_2-$ 、または $-\text{OC}(Z)O-$ を表し；

$R_{4,2}$ は、 $-Y-H$ 、 $Y-R_{1,4}$ 、 $R_{5,2}$ 、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、アジドまたはニトロを表し；該 $R_{5,2}$ および $-Y-R_{1,4}$ は、 $R_8$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_{5,2}$ は、 $(C_6 \sim C_8)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ オレフィン基、 $(C_3 \sim C_6)$ 環式炭化水素基、ヘテロシクリル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキニル、またはヘテロアリールを表し；

$R_a$ 、 $R_b$ および $R_c$ は、独立に、水素、 $(C_1 \sim C_2)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_3)$ オレフィン基、または $(C_2 \sim C_3)$ アルキニルを表し；それらはいずれも、 $R_{1,2}$ で示される1個またはそれ以上の同じかまたは異なる置換基によって任意に置換されていてもよく；

$R_d$ および $R_e$ は、独立に、水素または $(C_1 \sim C_2)$ アルキルを表す請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項15】

$R_1$ は、ハロゲン、シアノ、メチルおよびメトキシから成る群から選択される置換基を表し；

$R_2$ は、水素、ハロゲン、シアノ、メチルおよびメトキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表し；

$R_3$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、メトキシおよびシアノから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表し；

$R_4$ は、水素、メチルまたはエチルを表し；

$R_5$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メチル、エチルおよびメトキシから成る群から独立に選択される1個またはそれ以上の置換基を表す請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項16】

分子量が約1500Da未満である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項17】

分子量が約1200Da未満である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項18】

分子量が約800Da未満である請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項19】

下記化合物から成る群から選択される請求項1に記載の化合物：

[2-クロロ-4-( {2-[2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ)エチル]フェニル}アミノ)フェニル](2-メチルフェニル)メタノン；

(2-クロロ-4- { [2- (2-ヒドロキシエチル)フェニル]アミノ}フェニル) (2-メチルフェニル)メタノン;

2- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)エチルアセテート;

4- (2- {2- [ (3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル)アミノ]フェニル}エトキシ) - 4-オキソブタン酸;

2- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)エチルヘキサノエート;

2- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - 1-メチルエチルアセテート;

(2-クロロ-4- { [2- (2-ヒドロキシプロピル)フェニル]アミノ}フェニル) (2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (1E) - 3-ヒドロキシプロパ-1-エニル]フェニル}アミノ)フェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

(2-クロロ-4- { [2- (3-ヒドロキシプロピル)フェニル]アミノ}フェニル) (2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (1E) - 4-ヒドロキシブタ-1-エニル]フェニル}アミノ)フェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

[4- ( {2- [ (1E) - 3-アミノプロパ-1-エニル]フェニル}アミノ) - 2-クロロフェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

ジエチル (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニルホスホネート;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (1E) - 3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-エニル]フェニル}アミノ)フェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

エチル (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)アクリレート;

(2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)アクリル酸;

{2-クロロ-4- [ (2- { (1E) - 3- [ (2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル)メトキシ]プロパ-1-エニル}フェニル)アミノ]フェニル} (2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (1E) - 3- (2, 3-ジヒドロキシプロポキシ)プロパ-1-エニル]フェニル}アミノ)フェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

tert-ブチル (1R) - 3- { [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]アミノ} - 1- (ヒドロキシメチル) - 2-オキソエチリルカルバメート;

メチル0- (tert-ブチル) - N- ( { [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]アミノ}カルボニル) - L-セリネート;

N- (tert-ブチル) - N'- [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]チオウレア;

N- [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル] - 4-オキソペンタンアミド;

N- [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル] - N'-エチルウレア;

エチル4- { [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]アミノ} - 4-オキソブタノエート;

N- [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル] - N'-シクロヘキシルウレア;

N'- [ (2E) - 3- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミ

ノ}フェニル)プロパ-2-エニル]-N,N-ジメチルスクシニアミド;

ジメチル[(2E)-3-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]マロネート;

[2-クロロ-4-(2-{[2-(1E)-3-モルホリン-4-イルプロパ-1-エニル]フェニル}アミノ)フェニル](2-メチルフェニル)メタノン;

6-0-[(2E)-3-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]-1,2:3,4-ジ-0-(1-メチルエチリデン)-D-ガラクトピラノース;

メチル5-0-[(2E)-3-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]-2,3-0-(1-メチルエチリデン)-D-リボフラノシド;

メチル5-0-[(2E)-3-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]-D-リボフラノシド;

メチル(4E)-5-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)-2-(メチルスルホニル)ペンタ-4-エノエート;

エチル{[(2E)-3-(2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)プロパ-2-エニル]チオ}アセテート;

[2-クロロ-4-{[2-(1E)-3-{ビス[2-(アセチルオキシ)エチル]アミノ}プロパ-1-エニル]フェニル]アミノ}フェニル](2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4-{[2-(1E)-3-{ビス[2-(ヒドロキシ)エチル]アミノ}プロパ-1-エニル]フェニル]アミノ}フェニル](2-メチルフェニル)メタノン;

(2-クロロ-4-{[2-(1E)-3-{4-[2-(アセチルオキシ)エチル]ピペリジン-1-イル}プロパ-1-エニル]フェニル]アミノ}フェニル)(2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{(1E)-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-1-イル]プロパ-1-エニル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4-({2-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル]フェニル}アミノ)フェニル](2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[(3-モルホリン-4-イルプロピル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

(2-クロロ-4-{[2-(2-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ}エチル)フェニル]アミノ}フェニル)(2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[(2-メトキシエチル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

1-[3-({2-[2-({3-クロロ-4-[(2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)フェニル]エチル}アミノ)プロピル]ピロリジン-2-オン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[メチル(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

(2-クロロ-4-{[2-(2-{[(2,2-ジメチル-1,3-ジオキソラン-4-イル)メチル]アミノ}エチル)フェニル]アミノ}フェニル)(2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[4-(2-メトキシエチル)ピペラジン-1-イル]エチル}フェニル)アミノ]フェニル}(2-メチルフェニル)メタノン;

(2-クロロ-4-{[2-(2-モルホリン-4-イルエチル)フェニル]アミノ}フェニル)(2-メチルフェニル)メタノン;

{2-クロロ-4-[(2-{2-[(2,3-ジヒドロキシプロピル)アミノ]エチル}フ

エニル) アミノ] フェニル} (2-メチルフェニル) メタノン;

(4- { [2- (アミノメチル) フェニル] アミノ} - 2-クロロフェニル) (2-メチルフェニル) メタノン;

(2-クロロ-4- { [2- ( {2- [2- (テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ) エトキシ] エトキシ} メチル) フェニル] アミノ} フェニル) (2-メチルフェニル) メタノン;

{2-クロロ-4- [ (2- { [ (テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ) エトキシ] メチル} フェニル) アミノ] フェニル} (2-メチルフェニル) メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (2- {2- [2- (テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ) エトキシ] エトキシ} エトキシ) メチル] フェニル} アミノ) フェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (3,3,3-トリフルオロプロポキシ) メチル] フェニル} アミノ) フェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

ジエチル2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジルホスホネート;

2- [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジル] -1H-イソインドール-1,3(2H)-ジオン;

{2-クロロ-4- [ (2- { [2- (2-ヒドロキシエトキシ) エトキシ] メチル} フェニル) アミノ] フェニル} (2-メチルフェニル) メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (ヒドロキシエトキシ) メチル] フェニル} アミノ) フェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

(2-クロロ-4- { [2- ( {2- [2- (2-ヒドロキシエトキシ) エトキシ] エトキシ} エトキシ) メチル) フェニル] アミノ} フェニル) (2-メチルフェニル) メタノン;

[4- ( {4-プロモ-2- [ (2-ヒドロキシエトキシ) メチル] フェニル} アミノ) - 2-クロロフェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

(4- { [4-プロモ-2- ( {2- [2- (2-ヒドロキシエトキシ) エトキシ] エトキシ} エトキシ) メチル) フェニル] アミノ} - 2-クロロフェニル) (2-メチルフェニル) メタノン;

{4- [ (4-プロモ-2- { [2- (2-ヒドロキシエトキシ) エトキシ] メチル} フェニル) アミノ] - 2-クロロフェニル} (2-メチルフェニル) メタノン;

ジエチル5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジルホスホネート;

[4- ( {4-プロモ-2- [ (3,3,3-トリフルオロプロポキシ) メチル] フェニル} アミノ) - 2-クロロフェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

2- { [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジル] オキシ} エチル 4-メチルベンゼンスルホネート;

2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジル] オキシ} エチル4-メチルベンゼンスルホネート;

2- (2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジル] オキシ} エトキシ) エチル 4-メチルベンゼンスルホネート;

2- [2- (2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル) カルボニル] フェニル} アミノ) ベンジル] オキシ} エトキシ) エトキシ] エチル 4-メチルベンゼンスルホネート;

[4- ( {4-プロモ-2- [ (2-ヨードエトキシ) メチル] フェニル} アミノ) - 2-クロロフェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

{4- [ (4-プロモ-2- { [2- (2-ヨードエトキシ) エトキシ] メチル} フェニル) アミノ] - 2-クロロフェニル} (2-メチルフェニル) メタノン;

(4- { [4-プロモ-2- ( {2- [2- (2-ヨードエトキシ) エトキシ] エトキシ} エトキシ) メチル) フェニル] アミノ} - 2-クロロフェニル) (2-メチルフェニル) メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (2-ヨードエトキシ) メチル] フェニル} アミノ) フェニル] (2-メチルフェニル) メタノン;

ル] (2-メチルフェニル)メタノン;

ジエチル2- { [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチルホスホネート;

ジエチル2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチルホスホネート;

ジエチル2- ( { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エトキシ)エチルホスホネート;

ジエチル2- [2- (2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エトキシ)エトキシ]エチルホスホネート;

ジエチル2- { [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]アミノ} - 2- オキソエチルホスホネート;

ジエチル2- { [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)フェニル]アミノ} - 2- オキソエチルホスホネート;

{ [2- ( {5-プロモ-3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル (ジエトキシホスホリル)アセテート;

2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジルホスホン酸;

N- [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル] - 2, 2, 2- トリフルオロエタンスルホンアミド;

N- [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)フェニル] - 2, 2, 2- トリフルオロエタンスルホンアミド;

{ 2-クロロ-4- [ (2- { [ (テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イルオキシ)プロポキシ]メチル}フェニル)アミノ]フェニル} (2-メチルフェニル)メタノン;

[2-クロロ-4- ( {2- [ (ヒドロキシプロポキシ)メチル]フェニル}アミノ)フェニル] (2-メチルフェニル)メタノン;

ジエチル3- { [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}プロピルホスホネート;

ジエチル2- [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)フェニル]エチルホスホネート;

ジエチル2- [5-プロモ-2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)フェニル]エチルホスホネート;

2- { [2- ( {3-クロロ-4- [ (2-メチルフェニル)カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジル]アミノ} - 2- オキソエチルホスホン酸;

(2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - カルバミン酸フェネチルエステル;

N- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - 2- フェノキシ - アセトアミド;

N- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - 3- フェノキシ - プロピオンアミド;

N- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - 2- (1, 3-ジオキソ-1, 3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル) - アセトアミド;

N- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - スクシンアミド酸2- (2-メトキシ-エトキシ)エチルエステル;

N- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル) - ベンゼンスルホンアミド;

酢酸(2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニルカルバモイル) - メチルエステル;

1- (2- { [3-クロロ-4- (2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}フェニル)ピロリジン-2, 5-ジオン;

2- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) エチルプロピオネート;

2, 2- ジメチル - プロピオン酸 2- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) エチルエステル;

[2- クロロ - 4- ( {2- [3- (テトラヒドロ - 2H- ピラン - 2- イルオキシ) プロポキシ] フェニル } アミノ) フェニル] (2- メチルフェニル) メタノン;

(2- クロロ - 4- { [2- (3- ヒドロキシプロポキシ) フェニル] アミノ } フェニル) (2- メチルフェニル) メタノン;

tert- ブチル 2- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) エチルカーボネート;

2- ( { [ (5- プロモ - 2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) アミノ ] カルボニル } アミノ ) エチル 2- メチルアクリレート;

(4- { [4- プロモ - 2- (2- ヒドロキシエチル) フェニル] アミノ } - 2- クロロ - フェニル) (2- メチルフェニル) メタノン;

3- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェノキシ) プロピルアセテート;

[2- クロロ - 4- ( {2- [3- (モルホリン - 4- イル) プロポキシ] フェニル } アミノ) フェニル] (2- メチルフェニル) メタノン;

N- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - N' - (4- フェノキシブチル) スクシニアミド;

N- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - N' - (6- ヒドロキシヘキシル) スクシニアミド;

N- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - N' - (2, 3- ジヒドロキシプロピル) スクシニアミド;

tert- ブチル (1R) - 3- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - 1- (ヒドロキシメチル) プロピルカルバメート;

ジエチル 6- [3- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニルカルバモイル) プロピオニルアミノ] - ヘキシルホスフェート;

エチル N- ( { [ (2E) - 3- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) プロパ - 2- エニル ] アミノ } カルボニル) グリシネート;

tert- ブチル 2- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) エチル (メチル) カルバメート;

N- (5- プロモ - 2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - N' - (6- ヒドロキシヘキシル) スクシニアミド;

N- (5- プロモ - 2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) - N' - (2, 3- ジヒドロキシプロピル) スクシニアミド;

(2Z) - N- [ (2E) - 3- (2- { [3- クロロ - 4- (2- メチルベンゾイル) フェニル] アミノ } フェニル) プロパ - 2- エニル ] - 2- (2, 5- ジオキソイミダゾリジン - 4- イリデン) アセトアミド;

(2- クロロ - 4- { [2- (ジフルオロメチル) フェニル] アミノ } フェニル) (2- メチルフェニル) メタノン;

3- { [2- ( {3- クロロ - 4- [ (2- メチルフェニル) カルボニル] フェニル } アミノ) フェニル] エチル } - 1- メチルイミダゾリジン - 2, 4- ジオン;

3- { [2- ( {3- クロロ - 4- [ (2- メチルフェニル) カルボニル] フェニル } アミノ) フェニル] エチル } - 5, 5- ジメチルオキサゾリン - 2, 4- ジオン;

4- { [2- ( {3- クロロ - 4- [ (2- メチルフェニル) カルボニル] フェニル } アミノ) フェニル] エチル } モルホリン - 3, 5- ジオン;

1- { [2- ( {3- クロロ - 4- [ (2- メチルフェニル) カルボニル] フェニル } アミノ) フェニル] エチル } ピペリジン - 2, 6- ジオン;

4- (2- { [5- プロモ - 2- ( {3- クロロ - 4- [ (2- メチルフェニル) カルボニル

]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)モルホリン-3,5-ジオン;  
 1-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)ピロリジン-2,5-ジオン;  
 エチル2-[3-(2-{5-プロモ-[2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)  
 カルボニル]フェニル}アミノ)ベンジルオキシ}エチル)-2,4,5-トリオキソイミ  
 ダゾリジン-1-イル]アセテート;  
 3-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)イミダゾリジン-2,4-ジオン;  
 1-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)-3,4-シス-ジアセトキシピロリジ  
 ン-2,5-ジオン;  
 3-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)チアゾリン-2,4-ジオン;  
 3-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)-1-メチルイミダゾリジン-2,4-  
 ジオン;  
 1-(2-{[5-プロモ-2-( {3-クロロ-4-[ (2-メチルフェニル)カルボニル  
 ]フェニル}アミノ)ベンジル]オキシ}エチル)イミダゾリジン-2,4,5-トリオン  
 ;  
 (2-クロロ-4-{ [(2-ヒドロキシメチル)フェニル]アミノ}フェニル)(2-メ  
 チルフェニル)メタノン;  
 2-{[3-クロロ-4-(2-メチルベンゾイル)フェニル]アミノ}ベンジルアセテ  
 ート;

ならびに医薬的に許容されるそれらの塩、溶媒和物および水和物。

【請求項20】

請求項1~19のいずれかに記載の化合物を、場合により医薬的に許容される賦形剤と共に、および場合によりグルココルチコイド、ビタミンD類似体、抗ヒスタミン剤、血小板活性化因子(PAF)拮抗剤、抗コリン作動剤、メチルキサンチン類、 $\beta$ -アドレナリン作動剤、COX-2阻害剤、サリチレート、インドメタシン、フルフェナメート、ナプロキセン、チメガジン、金塩、ペニシラミン、血清コレステロール低下剤、レチノイド、亜鉛塩およびサリチルアゾスルファピリジンから成る群から選択される別の医薬活性成分と共に含有する医薬組成物。

【請求項21】

式Iの化合物を0.1~100%含有する請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項22】

式Iの化合物を0.07mg~1g含有する用量単位形態である請求項20に記載の医薬組成物。

【請求項23】

喘息、アレルギー、関節炎、慢性関節リウマチ、痛風、アテローム性動脈硬化症、慢性炎症性腸疾患(クローン病)、増殖性および炎症性皮膚疾患、乾癬、アトピー性皮膚炎、ブドウ膜炎、敗血性ショック、エイズ、骨粗鬆症ならびにアクネを治療または予防する方法であって、それを必要とする患者に、請求項1に記載の化合物の有効量を、場合により医薬的に許容される賦形剤と共に、および場合によりグルココルチコイド、ビタミンD類似体、抗ヒスタミン剤、血小板活性化因子(PAF)拮抗剤、抗コリン作動剤、メチルキサンチン類、 $\beta$ -アドレナリン作動剤、COX-2阻害剤、サリチレート、インドメタシン、フルフェナメート、ナプロキセン、チメガジン、金塩、ペニシラミン、血清コレステロール低下剤、レチノイド、亜鉛塩およびサリチルアゾスルファピリジンから成る群から選択される別の医薬活性成分と共に投与することを含んで成る方法。

【請求項24】

医薬の製造における請求項1~19のいずれかに記載の化合物の使用。

**【請求項 25】**

喘息、アレルギー、関節炎、慢性関節リウマチ、痛風、アテローム性動脈硬化症、慢性炎症性腸疾患（クローン病）、増殖性および炎症性皮膚疾患、乾癬、アトピー性皮膚炎、ブドウ膜炎、敗血性ショック、エイズ、骨粗鬆症ならびにアクネを治療または予防するための医薬の製造における請求項 1 ~ 19のいずれかに記載の化合物の使用。