

【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22年3月18日(2010.3.18)

【公表番号】特表2009-524678(P2009-524678A)

【公表日】平成21年7月2日(2009.7.2)

【年通号数】公開・登録公報2009-026

【出願番号】特願2008-552424(P2008-552424)

【国際特許分類】

C 0 7 D 263/34	(2006.01)
C 0 7 D 333/38	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 21/04	(2006.01)
A 6 1 P 7/00	(2006.01)
A 6 1 P 7/06	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/08	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/16	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 1/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 K 45/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/08	(2006.01)
A 6 1 P 11/02	(2006.01)
A 6 1 P 17/04	(2006.01)
A 6 1 P 27/16	(2006.01)
A 6 1 K 31/381	(2006.01)
C 0 7 D 413/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/422	(2006.01)
C 0 7 D 307/68	(2006.01)
A 6 1 K 31/343	(2006.01)
C 0 7 D 277/20	(2006.01)
C 0 7 D 277/38	(2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 C 0 7 D 277/56 (2006.01)
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)
 A 6 1 K 31/421 (2006.01)
 C 0 7 D 417/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 C 0 7 D 409/04 (2006.01)
 C 0 7 D 417/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/433 (2006.01)
 C 0 7 D 413/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 K 31/501 (2006.01)
 C 0 7 D 401/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 263/34	
C 0 7 D 333/38	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 37/00	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 21/04	
A 6 1 P 7/00	
A 6 1 P 7/06	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 19/08	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 1/16	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 21/00	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 1/02	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/14	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 K 45/00	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 11/02	
A 6 1 P 17/04	

A 6 1 P 27/16
 A 6 1 K 31/381
 C 0 7 D 413/04
 A 6 1 K 31/422
 C 0 7 D 307/68
 A 6 1 K 31/343
 C 0 7 D 277/38
 A 6 1 K 31/5377
 C 0 7 D 277/56
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/421
 C 0 7 D 417/04
 A 6 1 K 31/427
 C 0 7 D 409/04
 C 0 7 D 417/14
 A 6 1 K 31/433
 C 0 7 D 413/14
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/501
 C 0 7 D 401/14
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/506

【手続補正書】

【提出日】平成22年1月25日(2010.1.25)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

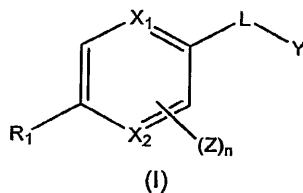
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

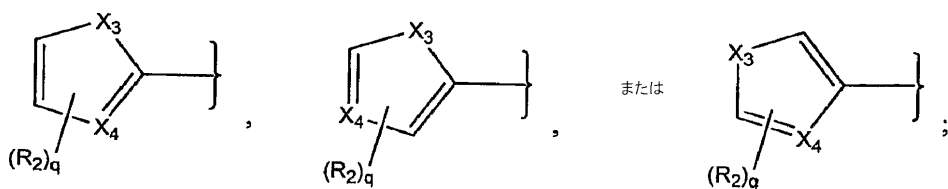
【請求項1】

式(I)の化合物であって：

【化13】

ここで：R₁ は：

【化14】



から成る群より選択され；

X_1 及び X_2 は CH、CZ、又は N だが、ただし、 X_1 又は X_2 の少なくとも一方は C
H 又は CZ であり；

X_3 は O 又は S であり；

X_4 は CH、 CR_2 、又は N であり；

R_2 は置換基であり；

L は、 $NR_5CR^aR^b$ 、 $CR^aR^bNR_5$ 、 $C(O)$ 、 $NR_5C(O)$ 、 $C(O)NR_5$ 、 $C(S)$ 、 $C(NR_8)$ 、 $NR_5C(S)$ 、 $C(S)NR_5$ 、 $NR_5C(NR_8)$ 、 $C(NR_8)NR_5$ 、 $NR_5C(O)NR_5$ 、 $NR_5C(S)NR_5$ 、 $NR_5C(NR_8)NR_5$ 、 $S(O)_2NR_5$ 、 $NR_5S(O)_2$ 、 $NR_5S(O)_2NR_5$ 、 $NR_5CR^aR^bNR_5$ 、 $CR^a=CR^b$ 、 CC 、 $N=CR^a$ 、 $CR^a=N$ 、 $NR_5N=CR^a$ 、又は $CR^a=N$ NR_5 から成る群より選択されるリンカーであり；

Y は任意に置換されていてもよいフェニル、又は任意に置換されていてもよいヘテロアリールであり；

Z は、各々独立して、低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ、又は低級ハロアルコキシから成る群より選択され；

R^a 及び R^b は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、ハロ、 OR_5 、 SR_5 、 NR_6R_7 、 $C(O)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(O)R_5$ 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、 $OC(O)R_5$ 、 $C(O)SR_5$ 、 $SC(O)R_5$ 、 $C(S)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(S)R_5$ 、 $C(S)R_5$ 、 $C(S)OR_5$ 、 $OC(S)R_5$ 、 $C(S)SR_5$ 、 $SC(S)R_5$ 、 $C(NR_8)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(NR_8)R_5$ 、 $C(NR_8)R_5$ 、 $C(NR_8)OR_5$ 、 $OC(NR_8)R_5$ 、 $C(NR_8)SR_5$ 、 $SC(NR_8)R_5$ 、 $OC(O)OR_5$ 、 $OC(O)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(O)OR_5$ 、 $NR_5C(O)NR_6R_7$ 、 $SC(O)OR_5$ 、 $SC(O)NR_6R_7$ 、 $SC(O)SR_5$ 、 $NR_5C(O)SR_5$ 、 $OC(O)SR_5$ 、 $OC(S)OR_5$ 、 $OC(S)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(S)OR_5$ 、 $NR_5C(S)NR_6R_7$ 、 $SC(S)OR_5$ 、 $SC(S)NR_6R_7$ 、 $SC(S)SR_5$ 、 $NR_5C(S)SR_5$ 、 $OC(S)SR_5$ 、 $OC(NR_8)OR_5$ 、 $OC(NR_8)NR_6R_7$ 、 $NR_5C(NR_8)OR_5$ 、 $NR_5C(NR_8)NR_6R_7$ 、 $SC(NR_8)OR_5$ 、 $SC(NR_8)NR_6R_7$ 、 $SC(NR_8)SR_5$ 、 $NR_5C(NR_8)SR_5$ 、又は $OC(NR_8)SR_5$ であり；

R_5 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、又は任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであり；

R_6 及び R_7 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラ

ラルキル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロラルキルであるか；又は、
 R_6 及び R_7 は、これらに結合する窒素と共に、任意に置換されていてもよいヘテロシ
 クリル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロアリールであり；

R_8 は、存在する各々の場合は、独立して、H、ハロ、アルキル、 OR_5 、 $-NR_6$
 R_7 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、又は $C(O)NR_6R_7$ であり；

q は 0、1、又は 2 であり；及び

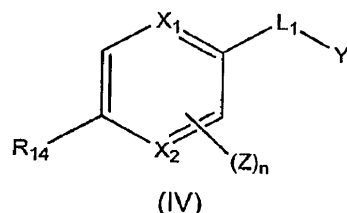
n は 0、1、又は 2 である化合物、

又はその薬理的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグ。

【請求項 2】

構造式 (IV) の化合物であって；

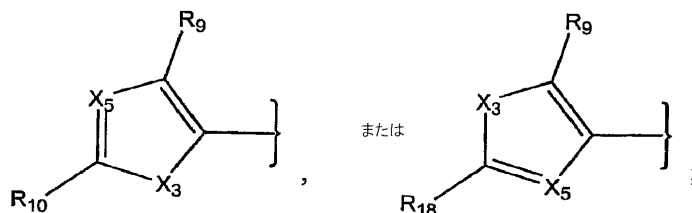
【化 5 2】



ここで；

R_{14} は；

【化 5 3】



から成る群より選択され；

X_1 及び X_2 は、CH、CZ、又はNだが、ただし、 X_1 又は X_2 の少なくとも一方は
 CH又はCZであり；

X_3 は、O又はSであり；

X_5 は、CH又はNであり；

L_1 は、 $NRC(R)_2$ 、 $C(R)_2NR$ 、 $C(O)$ 、 NR 、 $C(O)$ 、 $C(O)NR$ 、 $C(S)$ 、 $C(NR_8)$ 、 NR 、 $C(S)$ 、 $C(S)NR$ 、 NR 、 $C(NR_8)$ 、 $C(NR_8)NR$ 、 $NRC(O)NR$ 、 $NRC(S)NR$ 、 $NRC(NR_8)NR$ 、 $S(O)_2NR$ 、 NR 、 $S(O)_2$ 、 $NRS(O)_2NR$ 、 $NRC(R)_2NR$ 、 $CR=CR$ 、 CC 、 $N=CR$ 、 $CR=N$ 、 NR 、 $N=CR$ 、又は $CR=N$ 、 NR

から成る群より選択されるリンカーであり；

Y は、任意に置換されていてもよいフェニル、又は任意に置換されていてもよいヘテロ
 アリールであり；

Z は、各々独立して、低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級
 アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ、又は低級ハロアルコキシから成る群より選択さ
 れ；

R は、H又は低級アルキルであり；

R_9 は、ハロ、 OR_5 、 SR_5 、 NR_6R_7 、任意に置換されていてもよいアル
 キル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル
 、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアル
 ケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリ
 ール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラ

キル、又は、任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであり；

R_{10} は、ハロ、ニトロ、シアノ、ハロアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル、 $C(O)NR_6R_7$ 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、 $C(O)SR_5$ 、 $C(S)NR_6R_7$ 、 $C(S)R_5$ 、 $C(S)OR_5$ 、 $C(S)SR_5$ 、 $C(NR_8)NR_6R_7$ 、 $C(NR_8)R_5$ 、 $C(NR_8)OR_5$ 、 $C(NR_8)SR_5$ 、 $S(O)_pR_5$ 、 $S(O)_pNR_6R_7$ 、 $P(O)(OR_5)_2$ 、 $P(S)(OR_5)_2$ 、 $P(O)(OR_5)(SR_5)$ 、 $P(S)(OR_5)(SR_5)$ 、 $P(O)(SR_5)_2$ 、又は $P(S)(SR_5)_2$ であり；

R_{18} は、ハロ、ニトロ、シアノ、ハロアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル、 $C(O)NR_6R_7$ 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、 $C(O)SR_5$ 、 $C(S)NR_6R_7$ 、 $C(S)R_5$ 、 $C(S)OR_5$ 、 $C(S)SR_5$ 、 $C(NR_8)NR_6R_7$ 、 $C(NR_8)R_5$ 、 $C(NR_8)OR_5$ 、 $C(NR_8)SR_5$ 、 $S(O)_pR_5$ 、 $S(O)_pNR_6R_7$ 、 $P(O)(OR_5)_2$ 、 $P(S)(OR_5)_2$ 、 $P(O)(OR_5)(SR_5)$ 、 $P(S)(OR_5)(SR_5)$ 、 $P(O)(SR_5)_2$ 、又は $P(S)(SR_5)_2$ であり；

R_5 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、又は任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであり；

R_6 及び R_7 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか；又は、

R_6 及び R_7 は、これらに結合する窒素と共に、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロアリールであり；

R_8 は、存在する各々の場合は、独立して、H、ハロ、アルキル、 OR_5 、 $-NR_6R_7$ 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、又は $C(O)NR_6R_7$ であり；及び、 n は、0、1、又は2であるが、

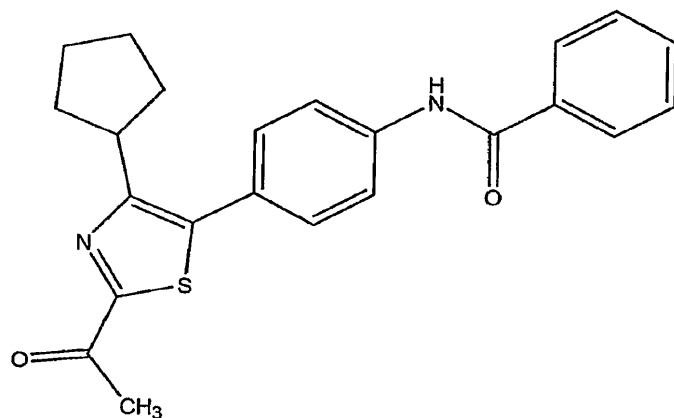
ただし、

L_1 が、 $C(O)$ 、 $NH-C(O)$ 、 $S(O)_2NH$ 、 $CH=CH$ 、又は $C-C$ である場合、 R_{10} は任意に置換されていてもよいアリールではなく；

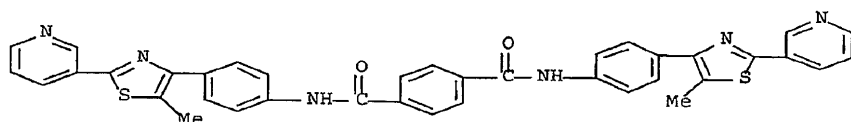
L_1 が、 $S(O)_2NH$ である場合、 R_{10} はハロアルキルではなく；及び、

前記化合物は、以下に示す式の一つによって表される化合物ではなく；

【化 5 4】

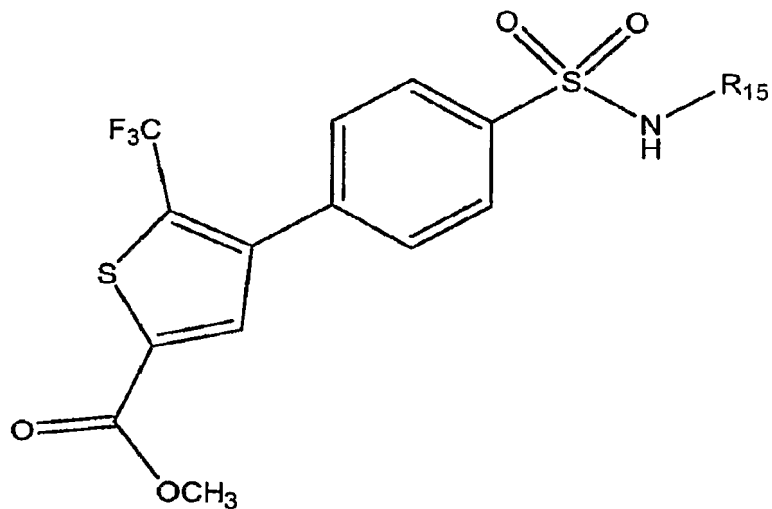


【化 5 5】



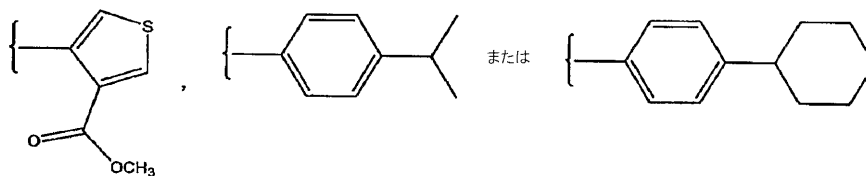
または、

【化 5 6】



ここで、 R_{15} は：

【化 5 7】



から成る群より選択される、請求項 1 に記載の化合物、
又はその薬理学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグ。

【請求項 3】

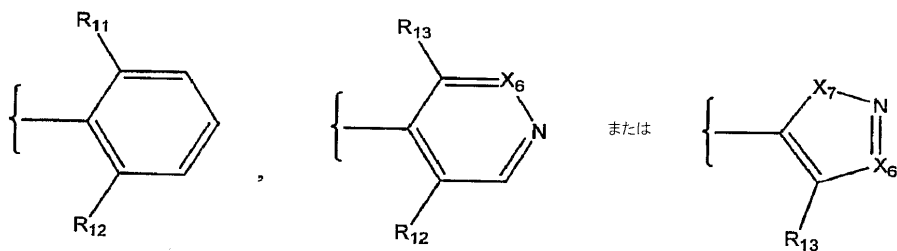
Y が、任意に置換されていてもよいフェニル、任意に置換されていてもよいピリジニル、任意に置換されていてもよいピリダジニル、任意に置換されていてもよいイソチアゾリル、任意に置換されていてもよいイソオキサゾリル、任意に置換されていてもよいオキサジアゾリル、又は任意に置換されていてもよいチアジアゾリルである、請求項 2 に記載の

化合物。

【請求項 4】

Y が：

【化 5 8】



から成る群より選択され；

X_6 は、CH 又は N であり；

X_7 は、O 又は S であり；

R_{11} 及び R_{12} は、各々独立して、置換基であり；及び、

R_{13} は、H 又は置換基である、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R_9 が、ハロ、任意に置換されていてもよいアルコキシ、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、又は任意に置換されていてもよいヘテロアリアルであり；及び、

R_{10} 及び R_{18} が、各々独立して、ハロ、ハロアルキル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいヘテロアリアル、 $C(O)NR_6R_7$ 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、 $C(NR_8)NR_6R_7$ 、 $S(O)_pR_5$ 、又は $S(O)_pNR_6R_7$ から成る群より選択される、請求項 2 又は 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

R_9 が、ハロ、低級アルコキシ、又は低級アルキルであり；

R_{10} 及び R_{18} が、各々独立して、オキサゾリル、モルホリニル、フラニル、低級ハロアルキル、チアゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、 $C(O)N(R_{19})_2$ 、 $C(O)R_{20}$ 、 $C(O)OR_{20}$ から成る群より選択され、ここで、オキサゾリル、モルホリニル、フラニル、低級ハロアルキル、チアゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、イソチアゾリル、及びチアジアゾリルは、任意に、独立して、ハロ又は低級アルキルから選択される 1 種類以上の置換基で置換されていてもよく；及び、

R_{19} 及び R_{20} が、存在する各々の場合は、独立して、低級アルキルである、

請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が：

4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル；

5 メチル 4 { 4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フェニル } チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル；

2 , 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 3 イル) フェニル ベンズアミド；

5 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル；

2 , 6 ジフルオロ N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] ベンズアミド；

3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 オキサゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル フ
 ラン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 モルホリン 4 イル チアゾー
 ル 5 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [4 (4 メチル 2 モルホリン 4 イル チアゾール 5
 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 5 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チ
 アゾール 2 カルボン酸メチルエステル ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル オ
 キサゾール 2 カルボン酸メチルエステル ;
 5 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チ
 アゾール 2 カルボン酸メチルエステル ;
 5 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル オ
 キサゾール 2 カルボン酸メチルエステル ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸エチルエステル ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (4 メチル 2
 オキサゾール 2 イル チアゾール 5 イル) フェニル] アミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾ
 ール 5 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 フルオロ N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾール
 5 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 3 メチル N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾール 5
 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 5 メチル 4 { 4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フ
 ェニル } フラン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 5 メチル 4 { 4 [(4 メチル イソチアゾール 5 カルボニル) アミノ
] フェニル } チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 5 クロロ 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メトキシ
 チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 ェン 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 3 イル 2 メチル チオフェン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 2 イル 2 メチル チオフェン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 ェン 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;

N [4 (2 クロロ 5 トリフルオロメチル チオフェン 3 イル) フェニ
 ル] 2 , 6 ジフルオロ ベンズアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 2 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 4 { 4 [(3 フルオロ ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フェニル }
 5 メチル チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 5 メチル 4 { 4 [(4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボ
 ニル) アミノ] フェニル } チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル ;
 4 [4 (2 , 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル フ
 ラン 2 カルボン酸エチルエステル ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 フルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン 3 イ
 ル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (2 メチル 5
 チアゾール 2 イル フラン 3 イル) フェニル] アミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド ;
 3 フルオロ 5 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル
 フラン 3 イル) フェニル] イソニコチンアミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル
 チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2
 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 オキサゾール 5 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン
 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル
 チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チ
 オフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チ
 オフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;

3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 2 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] 6 メチル ベンズアミド ;
 N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェン 2 イル)
 ピリジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸
 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] アミド ;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] 5 メチル イソニコチンアミド ;
 3 メチル ピリダジン 4 カルボン酸 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル
 3 メチル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] オキサジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキ
 サゾール 5 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル]
 アミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 [1 , 3 , 4] オキサジアゾール
 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 [1 , 3 , 4] オキサジアゾール
 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 [1 , 3 , 4] オキサジアゾール 2
 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 [1 , 3 , 4] オキサジア
 ザール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 [1 , 3 , 4] オキサジアゾール 2 イ
 ル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 [1 , 3 , 4] オキサジアゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2
 イル] アミド ;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 2 , 6 ジフルオロ ベンズアミド ;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3 , 5 ジフルオロ イソニコチンアミド ;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3 フルオロ イソニコチンアミド ;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 2 フルオロ 6 メチル ベンズアミド ;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド ;
 4 メチル [1 , 2 , 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 クロロ 5
 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド ;
 2 , 6 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チ
 オフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド ;
 3 , 5 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チ
 オフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ
 ン 3 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド ;
 2 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ
 ン 3 イル) ピリジン 2 イル] 6 メチル ベンズアミド ;
 N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル)

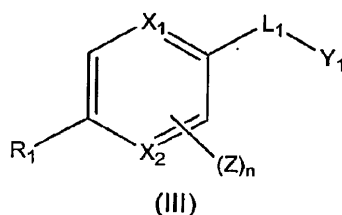
ピリジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキサ
 ザール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] アミ
 ド;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ
 ン 3 イル) ピリジン 2 イル] 5 メチル イソニコチンアミド;
 3 メチル ピリダジン 4 カルボン酸 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル
 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]オキサジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキ
 サゾール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] ア
 ミド;
 2, 6 ジフルオロ N [3 メチル 4 (4 トリフルオロメチル チアゾール
 2 イル) フェニル ベンズアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド塩酸塩;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリジン 3 イル チオフェン 2 イ
 ル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリミジン 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリミジン 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 4 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド塩酸塩;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド塩酸塩;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリミジン 4 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキ
 サゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾ
 ール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1H ピラゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキ
 サゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 イソチアゾール 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イ
 ル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 [1, 2, 3]チアジアゾール 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサ
 ザール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 5 メチル ピリミジン カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル ピリミジン 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 4 クロロ チアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5

イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 チアゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 クロロ 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] ソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 クロロ 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 フルオロ N [4 (3 クロロ 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェ
 ン 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 5 メチル ピリミジン 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール
 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル 1H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾ
 ール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 4 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 メトキシカルボニル チアゾール
 5 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 メチル 2 エトキシカルボニル チアゾール
 4 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 1 (2, 6 ジフルオロ フェニル) 3 [4 (5 イソオキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 1 (2, 6 ジフルオロ フェニル) 3 [4 (5 オキサゾール 5 イル
 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 1 (3 フルオロ ピリジン 4 イル) 3 [4 (5 オキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 (3 フルオロ ピリジン 4 イル メチル) [4 (5 イソオキサゾール 5
 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] アミン; 並びに、
 (3 フルオロ ピリジン 4 イル メチル) [4 (5 オキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] アミン; から成る群より選択
 される、請求項 2 に記載の化合物、
 又はこれらの薬理的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグ。

【請求項 8】

構造式 (I I I) の化合物であって：

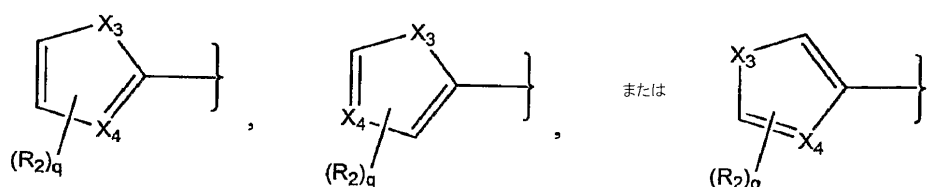
【化 5 9】



ここで：

R_1 は :

【化 6 0】



から成る群より選択され ;

X_1 及び X_2 は、CH、CZ、又はNだが、ただし、 X_1 又は X_2 の少なくとも一方はCH又はCZであり ;

X_3 は、O又はSであり ;

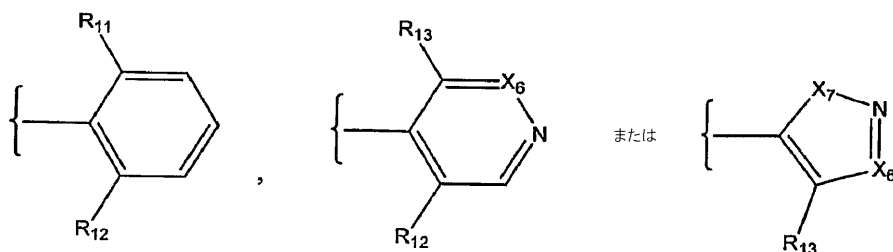
X_4 は、CH、 CR_2 、又はNであり ;

R_2 は、置換基であり ;

L_1 は、 $NRC(R)_2$ 、 $C(R)_2NR$ 、 $C(O)$ 、 NR 、 $C(O)$ 、 $C(O)NR$ 、 $C(S)$ 、 $C(NR_8)$ 、 NR 、 $C(S)$ 、 $C(S)NR$ 、 NR 、 $C(NR_8)$ 、 $C(NR_8)NR$ 、 $NRC(O)NR$ 、 $NRC(S)NR$ 、 $NRC(NR_8)NR$ 、 $S(O)_2NR$ 、 NR 、 $S(O)_2$ 、 $NRS(O)_2NR$ 、 $NRC(R)_2NR$ 、 $CR=CR$ 、 CC 、 $N=CR$ 、 $CR=N$ 、 NR 、 $N=CR$ 、又は $CR=N$ 、 NR から成る群より選択されるリンカーであり ;

Y_1 は :

【化 6 1】



から成る群より選択され ;

X_6 は、CH又はNであり ;

X_7 は、O又はSであり ;

R_{11} 及び R_{12} は、各々独立して、置換基であるが、ただし、 L_1 が $NRS(O)_2$ の場合は、 R_{11} 及び R_{12} は、同時にハロにはならず ;

R_{13} は、H又は置換基であり ;

Z は、各々独立して、低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ、又は低級ハロアルコキシから成る群より選択され ;

R は、H又は低級アルキルであり ;

R_8 は、存在する各々の場合は、独立して、H、ハロ、アルキル、 OR_5 、 NR_6 、 R_7 、 $C(O)R_5$ 、 $C(O)OR_5$ 、又は $C(O)NR_6R_7$ であり ;

R_5 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、又は任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであり ;

R_6 及び R_7 は、存在する各々の場合は、独立して、H、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキ

ニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロアラルキルであるか；又は、

R_6 及び R_7 は、これらに結合する窒素と共に、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、若しくは任意に置換されていてもよいヘテロアリールであり；

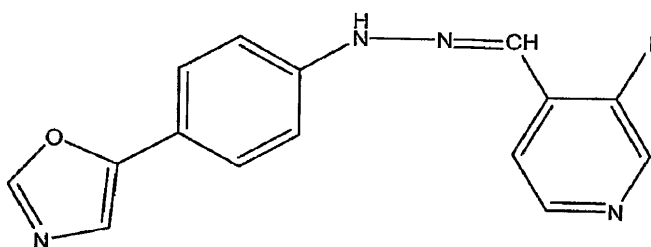
q は 0、1、又は 2 であり；及び

n は 0、1、又は 2 であって、

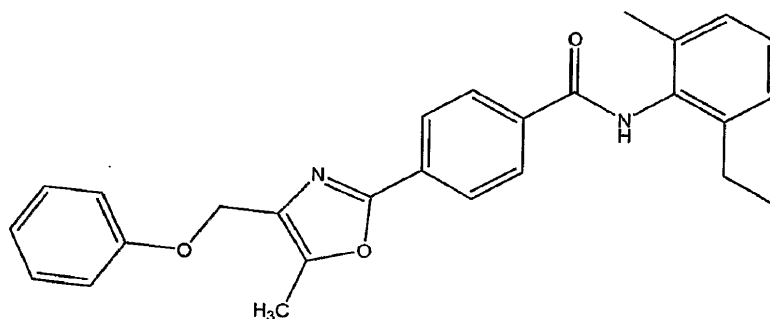
ただし、

前記化合物は：

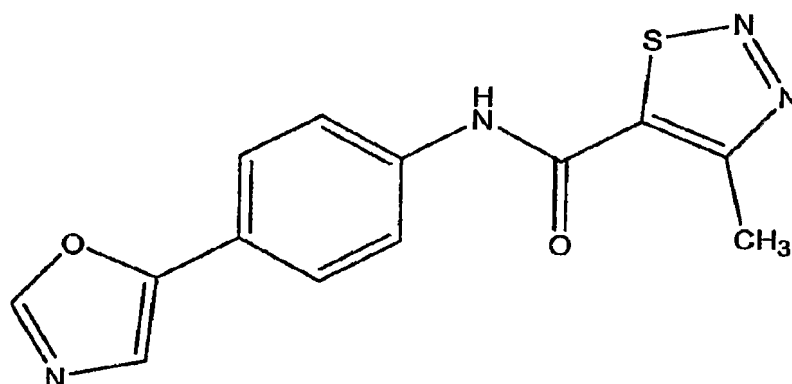
【化 6 2】



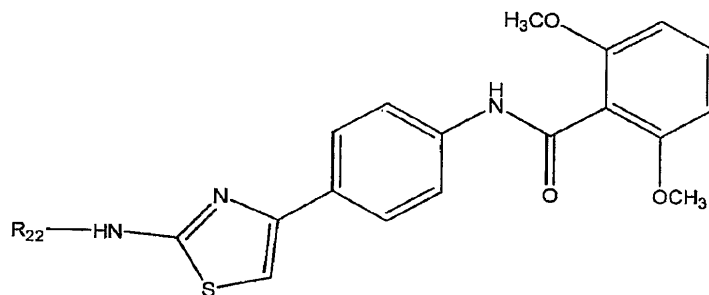
【化 6 3】



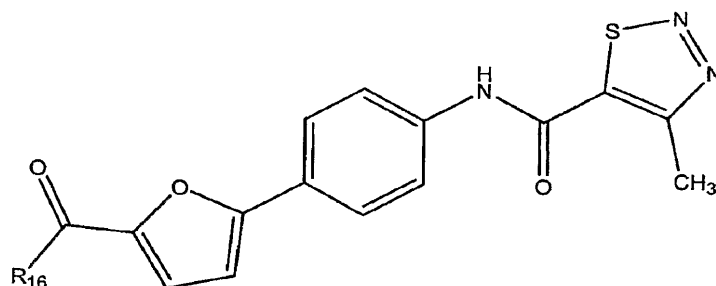
【化 6 4】



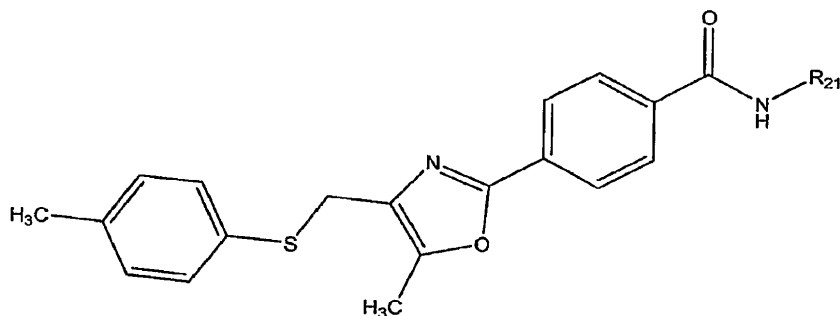
【化 6 5】



ここで、 R_{22} はアリル、2-クロロフェニル、又は3-メチルフェニルであり；
【化 6 6】



R_{16} は NH_2 、2-アミノエチルアミノ、又は[1,4]ジアゼパン-1-イルであり；
【化 6 7】



及び、 R_{21} は、2-メチル-6-エチルフェニル、又は2,6-ジメチルフェニルである、

から成る群より選択される化合物ではない請求項 1 に記載の化合物、
又はその薬理学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグ。

【請求項 9】

L_1 が、 $NH-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、 $NHCH_2-$ 、又は $-CH_2-NH-$ である、請求項 2 又は 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

X_1 及び X_2 の両方が CH である；又は、 X_1 が N であり、 X_2 が CH である、請求項 2、8 又は 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

X_3 が O であり、 X_4 が CH 若しくは CR_2 である；又は、 X_3 が S であり、 X_4 が CH 若しくは CR_2 である、請求項 2 又は 8 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

X_3 が O であり、 X_4 が N である；又は、 X_3 が S であり、 X_4 が N である、請求項 2 又は 8 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 13】

R_2 が、存在する各々の場合は、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ハロアルキル、

OR₅、SR₅、NR₆R₇、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアルケニル、任意に置換されていてもよいアルキニル、任意に置換されていてもよいシクロアルキル、任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、任意に置換されていてもよいヘテロシクリル、任意に置換されていてもよいアリール、任意に置換されていてもよいヘテロアリール、任意に置換されていてもよいアラルキル、任意に置換されていてもよいヘテロアラルキル、C(O)NR₆R₇、C(O)R₅、C(O)OR₅、C(O)SR₅、C(S)NR₆R₇、C(S)R₅、C(S)OR₅、C(S)SR₅、C(NR₈)NR₆R₇、C(NR₈)R₅、C(NR₈)OR₅、C(NR₈)SR₅、S(O)_pR₅、S(O)_pNR₆R₇、P(O)(OR₅)₂、P(S)(OR₅)₂、P(O)(OR₅)(SR₅)、P(S)(OR₅)(SR₅)、P(O)(SR₅)₂、若しくは P(S)(SR₅)₂、OC(O)NR₆R₇、OC(O)R₅、OC(O)OR₅、OC(O)SR₅、NR₅C(O)NR₆R₇、NR₅C(O)R₅、NR₅C(O)OR₅、NR₅C(O)SR₅、SC(O)NR₆R₇、SC(O)R₅、SC(O)OR₅、SC(O)SR₅、OC(S)NR₆R₇、OC(S)R₅、OC(S)OR₅、OC(S)SR₅、NR₅C(S)NR₆R₇、NR₅C(S)R₅、NR₅C(S)OR₅、NR₅C(S)SR₅、SC(S)NR₆R₇、SC(S)R₅、SC(S)OR₅、SC(S)SR₅、OC(NR₈)NR₆R₇、OC(NR₈)R₅、OC(NR₈)OR₅、OC(NR₈)SR₅、NR₅C(NR₈)NR₆R₇、NR₅C(NR₈)R₅、NR₅C(NR₈)OR₅、NR₅C(NR₈)SR₅、OS(O)_pR₅、NR₅S(O)_pR₅、OP(O)(OR₅)₂、又は OP(S)(OR₅)₂、から成る群より選択される、請求項 8～12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

R₂ が、存在する各々の場合は、独立して、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキル、オキサゾリル、モルホリニル、フラニル、低級ハロアルキル、チアゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、C(O)N(R₁₉)₂、C(O)R₂₀、C(O)OR₂₀ であり、ここで、オキサゾリル、モルホリニル、フラニル、低級ハロアルキル、チアゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、イソチアゾリル、及びチアジアゾリルは、任意に、独立して、ハロ又は低級アルキルから選択される 1 種類以上の置換基で置換されていてもよく；及び、

R₁₉ 及び R₂₀ が、存在する各々の場合は、独立して、低級アルキルである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

R₁₁ 及び R₁₂ が、各々独立して、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシルから成る群より選択され；及び、

R₁₃ が、H、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシルである、請求項 2 又は 8 に記載の化合物。

【請求項 16】

前記化合物が：

4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル；

4 {4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フェニル} チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル；

4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2 カルボン酸プロピルエステル；

4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2 カルボン酸 2 メトキシエチルエステル；

2, 6 ジフルオロ N [4 (5 オキサゾール 2 イル) チオフェン 3 イ

ル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 オキサゾール 5 イル チオフェン 3 イ
 ル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 3 イル チオフェン 3 イル)
 フェニル] ベンズアミド; 並びに、
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル チアゾール 5 イル) フェニル]
 ベンズアミド; から成る群より選択される、請求項 8 に記載の化合物、
 又はこれらの薬理学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグ。
 【請求項 17】

薬理学的に許容される担体、及び請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、
 医薬組成物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、
免疫疾患の治療若しくは予防、
炎症性疾患の治療若しくは予防、
免疫システムの抑制、又は、
アレルギー性疾患の治療若しくは予防のための医薬組成物。

【請求項 19】

前記化合物が:

4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2
 カルボン酸メチルエステル;
 4 {4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フェニル} チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2
 カルボン酸プロピルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チオフェン 2
 カルボン酸 2 メトキシエチルエステル;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 オキサゾール 2 イル チオフェン 3 イ
 ル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 オキサゾール 5 イル チオフェン 3 イ
 ル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 3 イル チオフェン 3 イル)
 フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル チアゾール 5 イル) フェニル]
 ベンズアミド;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 5 メチル 4 {4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フ
 ェニル} チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 ェン 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 5 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 ェン 2 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 オキサゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル フ

ラン 2 カルボン酸メチルエステル;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 モルホリン 4 イル チアゾール
 5 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (4 メチル 2 モルホリン 4 イル チアゾール 5
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 5 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チ
 アゾール 2 カルボン酸メチルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル オ
 キサゾール 2 カルボン酸メチルエステル;
 5 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル チ
 アゾール 2 カルボン酸メチルエステル;
 5 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 4 メチル オ
 キサゾール 2 カルボン酸メチルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル チ
 オフェン 2 カルボン酸エチルエステル;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (4 メチル 2
 オキサゾール 2 イル チアゾール 5 イル) フェニル] アミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾ
 ール 5 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 フルオロ N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾール
 5 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (4 メチル 2 オキサゾール 2 イル チアゾール 5
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 5 メチル 4 { 4 [(3 メチル ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フ
 ェニル} フラン 2 カルボン酸メチルエステル;
 5 メチル 4 { 4 [(4 メチル イソチアゾール 5 カルボニル) アミノ
] フェニル} チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 5 クロロ 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] チ
 オフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メトキシ
 チオフェン 2 カルボン酸メチルエステル;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 ェン 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 3 イル 2 メチル チオフェン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 フラン 2 イル 2 メチル チオフェン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 ェン 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 N [4 (2 クロロ 5 トリフルオロメチル チオフェン 3 イル) フェニ
 ル] 2, 6 ジフルオロ ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 ェン 2 イル) フェニル] ベンズアミド;
 4 { 4 [(3 フルオロ ピリジン 4 カルボニル) アミノ] フェニル}

5 メチル チオフエン 2 カルボン酸メチルエステル；
 5 メチル 4 { 4 [(4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボ
 ニル) アミノ] フェニル} チオフエン 2 カルボン酸メチルエステル；
 4 [4 (2, 6 ジフルオロ ベンゾイルアミノ) フェニル] 5 メチル フ
 ラン 2 カルボン酸エチルエステル；
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド；
 3 フルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン 3 イ
 ル) フェニル] イソニコチンアミド；
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (2 メチル 5
 チアゾール 2 イル フラン 3 イル) フェニル] アミド；
 3, 5 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] イソニコチンアミド；
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 チアゾール 2 イル フラン
 3 イル) フェニル] ベンズアミド；
 3 フルオロ 5 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル
 フラン 3 イル) フェニル] イソニコチンアミド；
 2, 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド；
 3, 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフエン
 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル
 チオフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド；
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 5 イル チオフエン 2
 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 オキサゾール 5 イル チオフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド；
 2, 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド；
 3, 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフエン
 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル
 チオフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド；
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフエン 2
 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 オキサゾール 2 イル チオフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド；
 2, 6 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チ
 オフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド；
 3, 5 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チ
 オフエン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフエ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド；
 2 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフエ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] 6 メチル ベンズアミド；
 N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフエン 2 イル)

ピリジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸
 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] アミド;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 3 メチル チオフェ
 ン 2 イル) ピリジン 2 イル] 5 メチル イソニコチンアミド;
 3 メチル ピリダジン 4 カルボン酸 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル
 3 メチル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]オキサジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキ
 サゾール 5 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル]
 アミド;
 2, 6 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 [1, 3, 4]オキサジアゾール
 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド;
 3, 5 ジフルオロ N [5 (3 メチル 5 [1, 3, 4]オキサジアゾール
 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド;
 3 フルオロ N [5 (3 メチル 5 [1, 3, 4]オキサジアゾール 2
 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド;
 2 フルオロ 6 メチル N [5 (3 メチル 5 [1, 3, 4]オキサジア
 ザール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド;
 3 メチル N [5 (3 メチル 5 [1, 3, 4]オキサジアゾール 2 イ
 ル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 メチル 5
 [1, 3, 4]オキサジアゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2
 イル] アミド;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 2, 6 ジフルオロ ベンズアミド;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3, 5 ジフルオロ イソニコチンアミド;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3 フルオロ イソニコチンアミド;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 2 フルオロ 6 メチル ベンズアミド;
 N [5 (3 クロロ 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピ
 リジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (3 クロロ 5
 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) ピリジン 2 イル] アミド;
 2, 6 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チ
 オフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] ベンズアミド;
 3, 5 ジフルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チ
 オフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ
 ン 3 イル) ピリジン 2 イル] イソニコチンアミド;
 2 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ
 ン 3 イル) ピリジン 2 イル] 6 メチル ベンズアミド;
 N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル)
 ピリジン 2 イル] 3 メチル イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキサ
 ザール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] アミ
 ド;
 3 フルオロ N [5 (5 イソオキサゾール 5 イル 2 メチル チオフェ

ン 3 イル) ピリジン 2 イル] 5 メチル イソニコチンアミド;
 3 メチル ピリダジン 4 カルボン酸 [5 (5 イソオキサゾール 5 イル
 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3] オキサジアゾール 5 カルボン酸 [5 (5 イソオキ
 サゾール 5 イル 2 メチル チオフェン 3 イル) ピリジン 2 イル] ア
 ミド;
 2, 6 ジフルオロ N [3 メチル 4 (4 トリフルオロメチル チアゾール
 2 イル) フェニル ベンズアミド;
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 オキサゾール 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド塩酸塩;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリジン 3 イル チオフェン 2 イ
 ル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリミジン 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリミジン 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 4 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド塩酸塩;
 4 メチル [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド塩酸塩;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 ピリミジン 4 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 [1, 2, 3] チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキ
 サゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1 H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾ
 ール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1 H ピラゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキ
 サゾール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 イソチアゾール 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5 イ
 ル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 [1, 2, 3] チアジアゾール 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサ
 ザール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 5 メチル ピリミジン カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル ピリミジン 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 4 クロロ チアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル N [4 (3 メチル 5 チアゾール 2 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 メチル N [4 (3 クロロ 5 オキサゾール 5 イル チオフェン 2
 イル) フェニル] ソニコチンアミド;

3 メチル N [4 (3 クロロ 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェン
 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 3 フルオロ N [4 (3 クロロ 5 イソオキサゾール 5 イル チオフェ
 ン 2 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 5 メチル ピリジン 4 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール 5
 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 1 メチル 1 H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 オキサゾール
 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 3 メチル 1 H ピロール 2 カルボン酸 [4 (3 メチル 5 イソオキサゾ
 ール 5 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 4 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 4 メチル [1, 2, 3]チアジアゾール 5 カルボン酸 [4 (3 メチル 5
 ピリジン 2 イル チオフェン 2 イル) フェニル] アミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (4 メチル 2 メトキシカルボニル チアゾール
 5 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフ
 エン 3 イル) フェニル] ベンズアミド;
 2, 6 ジフルオロ N [4 (5 メチル 2 エトキシカルボニル チアゾール
 4 イル) フェニル] ベンズアミド;
 3 メチル N [4 (2 メチル 5 オキサゾール 2 イル チオフェン 3
 イル) フェニル] イソニコチンアミド;
 1 (2, 6 ジフルオロ フェニル) 3 [4 (5 イソオキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 1 (2, 6 ジフルオロ フェニル) 3 [4 (5 オキサゾール 5 イル
 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 1 (3 フルオロ ピリジン 4 イル) 3 [4 (5 オキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] 尿素;
 (3 フルオロ ピリジン 4 イル メチル) [4 (5 イソオキサゾール 5
 イル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] アミン;
 (3 フルオロ ピリジン 4 イル メチル) [4 (5 オキサゾール 5 イ
 ル 3 メチル チオフェン 2 イル) フェニル] アミン; 並びに、

これらの薬理学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、及びプロドラッグから成る
 群より選択される、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、
 細胞内の免疫細胞活性化を阻害するため、
 細胞内のサイトカイン産生を阻害するため、
 免疫細胞活性化に関与するイオンチャネルを細胞内で調節するため、又は、
 抗原に反応して T 細胞および / 若しくは B 細胞の増殖を阻害するための医薬組成物。