

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成24年1月19日 (2012.1.19)

【公表番号】特表2011-508783(P2011-508783A)

【公表日】平成23年3月17日 (2011.3.17)

【年通号数】公開・登録公報2011-011

【出願番号】特願2010-541562(P2010-541562)

【国際特許分類】

C 07 D 211/76 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 31/451 (2006.01)

C 07 D 401/10 (2006.01)

A 61 K 31/4545 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 211/76 C S P

A 61 P 3/10

A 61 P 9/00

A 61 P 9/12

A 61 P 3/06

A 61 P 9/10

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 27/06

A 61 P 19/10

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 K 31/451

C 07 D 401/10

A 61 K 31/4545

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月25日 (2011.11.25)

【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

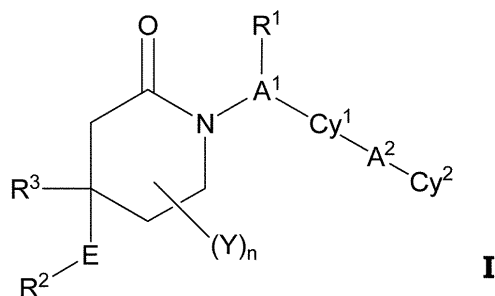
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

## 【化 8 4】



[ 式中、

$R^1$  は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ、又は (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、そして、これらは、 場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>-、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)O-、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、( a ) 結合、又は ( b ) (  $C_1 - C_3$  ) アルキレン、 $CH_2CH_2O$  ( ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している )、若しくは  $CH_2C(=O)$  ( ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している ) であり；

$Cy^1$  は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又は単環式ヘテロシクリルであり、そして、これらは、 場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub> NCO、H<sub>2</sub> NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノカルボニル、{ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル } { (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル } アミノカルボニル、ジ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノスルホニル、{ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル } { (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル } アミノスルホニル、ジ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノスルホニル、シアノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、{ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル } { (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル } アミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル及びジ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルアミノカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は (b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は (b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、そして、これらは、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C

$C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、(  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスルホニル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルスルホニルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルスルホニルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルカルボニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノカルボニル、{ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル } { (  $C_1 - C_6$  ) アルキル } アミノカルボニル、ジ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノカルボニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノスルホニル、{ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル } { (  $C_1 - C_6$  ) アルキル } アミノスルホニル、ジ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノスルホニル、シアノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、{ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル } { (  $C_1 - C_6$  ) アルキル } アミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキル及びジ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルアミノカルボニル (  $C_1 - C_6$  ) アルキルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル又はハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、( a ) 結合、又は ( b ) (  $C_1 - C_3$  ) アルキレン若しくは (  $C_1 - C_2$  ) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、 $R^2$  に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$R^2$  は、(  $C_2 - C_6$  ) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、そして、これらは、場合により、フッ素、塩素、酸素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチ

オ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル、{(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル}{(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル}アミノカルボニル、ジ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノスルホニル、{(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル}{(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル}アミノスルホニル、ジ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノスルホニル、シアノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、アミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、{(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル}{(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル}アミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル及びジ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルアミノカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルから独立して選択される4個以下の基で置換されており；

R<sup>3</sup>は、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(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、又は(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルから選択され、そして、これらは、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)O -、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>C(=O

)  $\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、スピロシクロアルキル、ヘテロシクリル(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、ハロゲン又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}_2$ 、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい)及びヘテロアリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)から独立して選択される4個以下の基で置換されており；

$\text{R}^4$  は、H、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、アミノ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルアミノ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、ジ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルアミノ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル及び $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルコキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

#### 【請求項2】

$\text{R}^1$  が、(a)存在しないか、又は(b) $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル、又は $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルコキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^4\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{N}$  -、 $\text{R}^4\text{O}_2\text{C}$  -、 $\text{R}^4\text{S}$ 、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})$  -、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})_2$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=N})\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4\text{O})_2\text{P}(\text{=O})\text{O}$  -、 $(\text{R}^4\text{O})_2\text{P}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{OS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})$  -、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{S}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{OS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})$  -、 $\text{R}^4\text{OS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{OS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NS}(\text{=O})_2\text{NHC}(\text{=O})\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{C}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $\text{R}^4\text{OC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{O}$  -、 $(\text{R}^4)_2\text{NC}(\text{=O})\text{NHS}(\text{=O})_2\text{NR}^4$  -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される4個以下の基で置換されており；

$\text{A}^1$  が、(a)結合、又は(b) $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$ アルキレン、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ (ここで、酸素は、 $\text{Cy}^1$ に結合している)、若しくは $\text{CH}_2\text{C}(\text{=O})$ (ここで、カルボニル炭素は、 $\text{Cy}^1$ に結合している)であり；

$\text{Cy}^1$  が、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミ

ノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> が、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> が、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ

R<sup>2</sup>が、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)



シクロアルカンスルホニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  が、( $C_2 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4$ -、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ -、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N - モノアルキル置換アミド、N, N - ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N - モノアルキル置換アミド及び N, N - ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい) 及びヘテロアリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N - モノアルキル置換アミド、N, N - ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい) から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

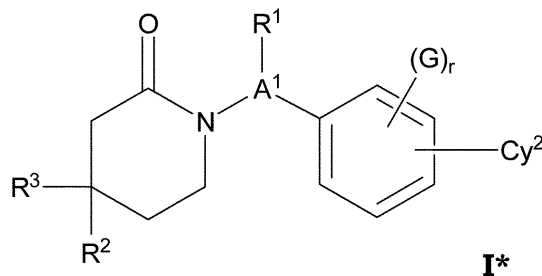
$R^4$  が、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C$

6) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから独立して選択される請求項 1 記載の化合物；或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 3】

式 (I\*)：

【化 85】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、(a) 存在しないか、又は (b) (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから選択され、これは、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=N)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)O -、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

A<sup>1</sup> は、(a) 結合、又は (b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレンであり；

r は、0、1、2、3 又は 4 であり；

G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>

）アルカンスルホニル、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルホニル、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルカンスルホニル、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルホニル、ハロ（ $C_4 - C_7$ ）シクロ - アルキルアルカンスルホニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノカルボニル、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノカルボニル、（ $C_1 - C_3$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_3$ ）アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノスルホニル、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルカルボニルアミノ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルカルボニルアミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルスルホニルアミノ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルスルホニルアミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシカルボニル（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、ヒドロキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、オキソ、アミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、アミノ（ $C_2 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ（ $C_2 - C_6$ ）アルコキシ、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ（ $C_2 - C_6$ ）アルコキシ及び（ $C_1 - C_6$ ）アルキルカルボニルから独立して選択され；そして

Gが、 $A^1$ にメタ又はパラに結合する場合、Gは、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、ヒドロキシ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、ヘテロアリールからも選択され；

$Cy^2$ は、（a）水素、又は（b）アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、ヒドロキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、ヒドロキシ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルキル、（ $C_2 - C_6$ ）アルケニル、ハロ（ $C_2 - C_6$ ）アルケニル、ヒドロキシ（ $C_2 - C_6$ ）アルケニル、（ $C_2 - C_6$ ）アルキニル、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル（ $C_2 - C_4$ ）アルキニル、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキル、ハロ（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルコキシ、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルコキシ、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルコキシ、ハロ（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルコキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルチオ、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキルチオ、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルキルチオ、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルチオ、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルキルチオ、ハロ（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルキルチオ、（ $C_1 - C_6$ ）アルカンスルフィニル、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルフィニル、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルカン - スルフィニル、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルフィニル、ハロ（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルカンスルフィニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルカンスルホニル、（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルホニル、（ $C_4 - C_7$ ）シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルカンスルホニル、ハロ（ $C_3 - C_6$ ）シクロアルカンスルホニル、（ $C_4 - C_7$ ）シクロ - アルキルアルカンスルホニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノ、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、ハロ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノカルボニル、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノカルボニル、（ $C_1 - C_3$ ）アルコキシ（ $C_1 - C_3$ ）アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノスルホニル、ジ（ $C_1 - C_6$ ）アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルカルボニルアミノ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルカルボニルアミノ（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルキルスル

ホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub> N C O、H<sub>2</sub> N S O<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されている、フェニルであり；

R<sup>3</sup> は、置換 C<sub>2</sub> アルキル、又は場合により置換されている (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり、ここで、R<sup>3</sup> で表されている置換されている基の各々は、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup> O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N -、R<sup>4</sup> O<sub>2</sub> C -、R<sup>4</sup> S、R<sup>4</sup> S (= O) -、R<sup>4</sup> S (= O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup> C (= O) N R<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N C (= O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N C (= O) O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N C (= O) N R<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup> O C (= O) N R<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N C (= N C N) N R<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup> O)<sub>2</sub> P (= O) O -、(R<sup>4</sup> O)<sub>2</sub> P (= O) N R<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup> O S (= O)<sub>2</sub> N R<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N S (= O)<sub>2</sub> O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub> N S (= O)<sub>2</sub> N R<sup>4</sup>、R

$R^4 S(=O)_2 NR^4$  -、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)$  -、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)O$  -、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)$  -、 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)O$  -、 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2 NS(=O)_2 NHC(=O)$  -、 $(R^4)_2 NS(=O)_2 NHC(=O)O$  -、 $(R^4)_2 NS(=O)_2 NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2$  -、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2 O$  -、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2 NR^4$ 、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2$  -、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2 O$  -、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2 NR^4$ 、 $(R^4)_2 NC(=O)NHS(=O)_2$  -、 $(R^4)_2 NC(=O)NHS(=O)_2 O$  -、 $(R^4)_2 NC(=O)NHS(=O)_2 NR^4$ 、ヘテロシクリル（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい）、ヘテロアリール（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）、アリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい）及びヘテロアリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）から独立して選択される2個以下の置換基を有しており；

$R^4$  は、H、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル、アミノ $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$ アルキル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル及び $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキルから独立して選択されるが；

但し、 $R^2$  が、アリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、 $A^1$  が、 $(C_1)$ アルキレンであり、 $R^3$  が、場合によりフッ素化されている、 $(C_1 - C_5)$ アルキル、 $(C_2 - C_5)$ アルケニル又は $(C_2 - C_6)$ アルキニルであり、そして $Cy^2$  が、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル又はシクロアルキルである場合、 $Cy^2$  は、 $A^1$  にオルト結合されていない]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項4】

$A^1$  が、結合である、請求項1～3記載の化合物。

【請求項5】

$A^1$  が、 $(C_1 - C_3)$ アルキレンである、請求項1～3記載の化合物。

【請求項6】

$A^1$  が、メチレンである、請求項5記載の化合物。

【請求項7】

$A^1$  が、CHであり、そして $R^1$  が、存在している、請求項1～3記載の化合物。

【請求項8】

$R^1$  が、 $(C_1 - C_6)$ アルキルである、請求項1～3記載の化合物。

【請求項9】

$R^1$  が、場合により置換されているメチル又はエチルである、請求項8記載の化合物。

【請求項10】

$R^1$  が、置換されていないメチル又はエチルである、請求項8記載の化合物。

【請求項11】

$Cy^1$  が、場合により置換されているアリール又は場合により置換されているヘテロアリールである、請求項1～3記載の化合物。

【請求項12】

Cy<sup>1</sup> が、場合により置換されているフェニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 13】

Cy<sup>1</sup> が、場合により置換されている単環式シクロアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 14】

Cy<sup>1</sup> が、場合により置換されているシクロヘキシルである、請求項 13 記載の化合物。

【請求項 15】

Cy<sup>1</sup> が、場合により置換されているフェニルである、請求項 12 記載の化合物。

【請求項 16】

Cy<sup>1</sup> が、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、メチル、トリフルオロメチル又はジフルオロメトキシにより置換されている、請求項 15 記載の化合物。

【請求項 17】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が、水素である、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 18】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が、水素である、請求項 13 記載の化合物。

【請求項 19】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が、水素である、請求項 14 記載の化合物。

【請求項 20】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が、水素である、請求項 15 記載の化合物。

【請求項 21】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> がシクロプロピルである、請求項 15 記載の化合物。

【請求項 22】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が場合により置換されているアリール又は場合により置換されているヘテロアリールである、請求項 15 記載の化合物。

【請求項 23】

A<sup>2</sup> が、結合であり、そして Cy<sup>2</sup> が場合により置換されているフェニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 15 記載の化合物。

【請求項 24】

Cy<sup>2</sup> が、場合により置換されているフェニルである、請求項 23 記載の化合物。

【請求項 25】

Cy<sup>2</sup> が、塩素又はフッ素から独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている、請求項 24 記載の化合物。

【請求項 26】

Cy<sup>2</sup> が、ジフルオロフェニルである、請求項 24 記載の化合物。

【請求項 27】

Cy<sup>2</sup> が、フルオロフェニルである、請求項 24 記載の化合物。

【請求項 28】

R<sup>3</sup> が、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>5</sub>) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 29】

R<sup>3</sup> が、ジヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub>) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 30】

R<sup>3</sup> が、-H<sub>2</sub>NCO (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 31】

R<sup>3</sup> が、H<sub>2</sub>NC(=O)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>である、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 32】

R<sup>3</sup> が、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載

の化合物。

【請求項 33】

$R^3$  が、 $H_2NSO_2O(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 34】

$R^3$  が、 $H_2NSO_2NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 35】

$R^3$  が、オキソ ( $C_2 - C_4$ ) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 36】

$R^3$  が、アルケニルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 37】

$R^3$  が、アリルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 38】

$R^3$  が、 $MeC(=O)NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 39】

$R^3$  が、 $MeOC(=O)NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 40】

$R^3$  が、シアノアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 41】

$R^3$  が、アルキルスルホニルアミノアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 42】

$R^3$  が、 $MeS(=O)_2NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 41 記載の化合物。

【請求項 43】

$R^3$  が、 $MeS(=O)_2NHCH_2CH_2CH_2$  である、請求項 41 記載の化合物。

【請求項 44】

$R^3$  が、ヒドロキシアルコキシアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 45】

$R^3$  が、アミノカルボニルアミノアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 46】

$R^3$  が、アミノカルボキシアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 47】

$R^3$  が、2 - (4 - モルホリノ) エチルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 48】

$R^3$  が、2 - (1 - イミダゾリル) エチルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 49】

$R^2$  が、場合により置換されているアリール、場合により置換されているヘテロアリール又は場合により置換されているシクロアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 50】

$R^2$  が、場合により置換されているフェニル、場合により置換されているチエニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 49 記載の化合物。

【請求項 51】

$R^2$  が、場合により置換されているフェニルである、請求項 50 記載の化合物。

【請求項 52】

E が、結合である、請求項 51 記載の化合物。

【請求項 53】

$R^2$  が、フルオロフェニルである、請求項 51 記載の化合物。

【請求項 54】

$R^2$  が、場合により置換されているアルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 55】

$R^2$  が、場合により置換されているイソプロピルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 56】

$R^1$  が、存在しないか、又はメチル若しくはエチルであり；

$A^1$  が、結合又は  $CH_2$  であるか、或いは  $R^1$  が、存在する場合、 $A^1$  は  $CH$  であり；

$Cy^1$  が、フェニル、シクロプロピル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピリジル、N - オキソ - ピリジル、チアゾリル又はピリミジニル（各々、場合により、ハロ、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ、シアノ、ジフルオロメトキシ、t - ブトキシカルボニル、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - プロピル、メトキシメチル、メチルスルホニル及びメチルスルホニルアミノから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている）であり；

$A^2$  が、結合、O、 $OCH_2CO$  又は  $C=O$  であり；

$Cy^2$  が、(a) 水素、又は (b) フェニル、チエニル、ピリジル、N - オキソ - ピリジル、シクロプロピル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、S, S - ジオキソチアジニル、2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジル（各々、場合により、アミノメチル、1 - アミノエチル、ハロ、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、メトキシカルボニル、アミノ、カルバモイル、メチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、(2 - メトキシエチル)アミノカルボニル、アセチルアミノメチル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、メチルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、ピロリジン - 1 - スルホニル、メチルスルホニルアミノメチル、テトラゾリル、メチル、トリフルオロメチル、アセチル、2 - ヒドロキシエチル及び 1 - アミノエチルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている）であり；

n が、0 であり；

E が、結合又は  $CH_2$  であり；

$R^2$  が、シクロヘキシル、イソプロピル、チエニル、フェニル又はピリジル（各々、場合により、ハロ、メチル、メチルチオ又は (4 - モルホリノ)メチルから選択される 1 個の基で置換されている）であり、；

$R^3$  が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ビニル、アリル又はエトキシエチル（各々、場合により、メチル、 $H_2C=CH$ 、 $HO-$ 、 $MeO-$ 、 $MeC(=O)-$ 、 $H_2N-$ 、 $MeC(=O)NH-$ 、 $MeS(=O)_2NH-$ 、 $H_2NC(=O)-$ 、 $MeNHC(=O)-$ 、 $HO_2C-$ 、 $HO-(CH_2)_2O-$ 、 $(HO)_2P(=O)O-$ 、 $H_2NS(=O)_2O-$ 、 $H_2NS(=O)_2NH-$ 、 $MeNHC(=O)NH-$ 、 $MeNHC(=O)O-$ 、シアノ、 $HO_2C-$ 、 $HOCH_2CH_2NH-$ 、4 - モルホリノ、 $HOCH_2C(=O)NH-$ 、 $H_2NCH_2C(=O)NH-$ 、 $EtNHC(=O)NH$ 、 $H_2NHC(=O)NH$ 、 $H_2NHC(=O)O-$ 、 $CH_3C(=O)$ 、 $MeOC(=O)NH-$ 、 $MeNHC(=NCN)NH-$ 、 $Me-$ 、 $MeS-$ 、 $MeSO_2-$ 、 $MeSO_2N(Me)-$ 、 $MeS(=O)_2NHC(=O)-$ 、イミダゾリルアミノ -、イミダゾリル、モルホリノ、テトラゾリル、 $H_2NCONH-$ 、 $H_2NCO_2-$ 、 $HOCH_2CH_2O-$ 、 $MeNH-$ 、 $Me_2N-$  及び  $MeCONMe$  から独立して選択される 2 個以下の基で置換されている）であり；

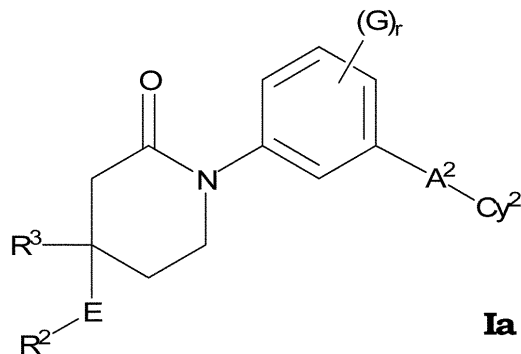
$R^5$  が、水素又はメチルである、  
請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 57】

化合物が、式 (Ia)：



## 【化 8 6】



[ 式中、

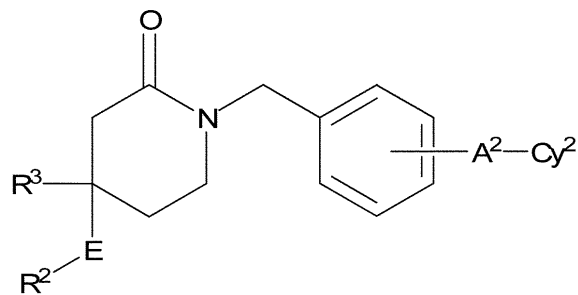
$r$  は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

$G$  は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ヒドロキシ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ハロ $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ヒドロキシ $(C_2 - C_6)$  アルケニル、 $(C_2 - C_6)$  アルキニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル $(C_2 - C_4)$  アルキニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルフィニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルカン - スルフィニル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロ - アルキルアルカンスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_3)$  アルコキシ $(C_1 - C_3)$  アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、アミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ又は $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項 1 ~ 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 58】

化合物が、式 (I b) :

【化 87】

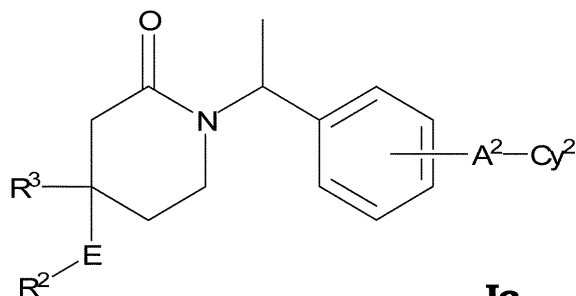
**Ib**

で示される請求項 1 ~ 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 59】

化合物が、式 (I c) :

【化 88】

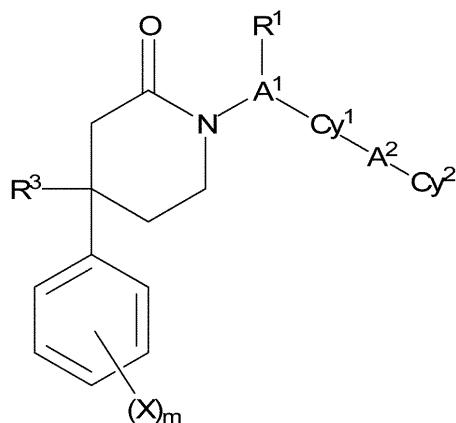
**Ic**

で示される請求項 1 ~ 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 60】

化合物が、式 (I d) :

【化 89】

**Id**

〔式中、

m は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

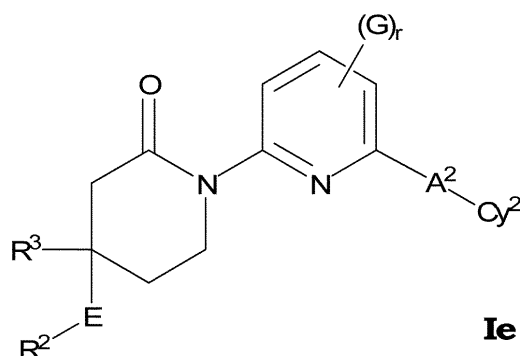
X は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキ

シ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項1～3記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項61】

化合物が、式(Ie)：

【化90】



[式中、

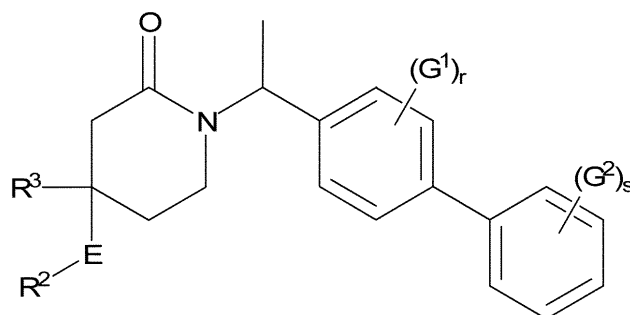
r は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項 1 ~ 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 6 2】

化合物が、式 (I f)：

【化 9 1】



If

[ 式中、

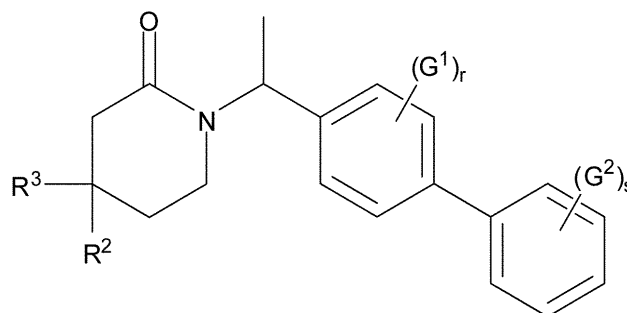
$r$  及び  $s$  は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして

$G^1$  及び  $G^2$  は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ヒドロキシ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ハロ $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ヒドロキシ $(C_2 - C_6)$  アルケニル、 $(C_2 - C_6)$  アルキニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル $(C_2 - C_4)$  アルキニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルフィニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルカンスルフィニル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、ハロ $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、ハロ $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_3)$  アルコキシ $(C_1 - C_3)$  アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ヘテロアリアル、アミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_1 - C_6)$  アルキル、アミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ $(C_2 - C_6)$  アルコキシ及び $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項 1～3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 63】

化合物が、式 $(If^*)$ ：

## 【化 9 2】



If\*

[ 式中、

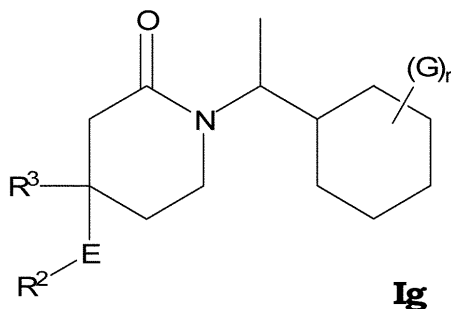
$r$  及び  $s$  は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして

$G^1$  及び  $G^2$  は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

## 【請求項 64】

化合物が、式 (I g) :

## 【化 93】



[ 式中、

r は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

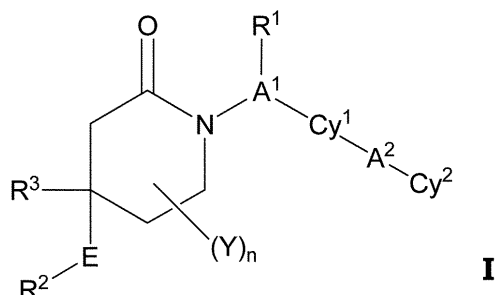
G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される請求項 1 ~ 3 記載の化合物、或いはその薬学的に許容しう

る塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 65】

糖尿病を有する対象を処置する方法であって、そのような処置を必要とする対象に、有効量の下記構造式 (I) :

【化 94】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル、又は ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルコキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>-、R<sup>4</sup>C( = O )NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>OC( = O )NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = N CN )NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )O -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>-、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>-、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>-、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

A<sup>1</sup> は、( a ) 結合、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O ( ここで、酸素は、Cy<sup>1</sup> に結合している )、若しくは CH<sub>2</sub>C( = O ) ( ここで、カルボニル炭素は、Cy<sup>1</sup> に結合している ) であり；

Cy<sup>1</sup> は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ヒドロキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ハロ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ヒドロキシ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル ( C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> )



アルキルチオ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルフィニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$A^2$  は、(a) 結合、O、S 若しくは  $NR^4$ 、又は (b) ( $C_1 - C_3$ ) アルキレン若しくは ( $C_1 - C_2$ ) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$Cy^2$  は、(a) 水素、又は (b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ハロ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ヒドロキシ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルフィニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ )

アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

Yは、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

nは、0、1又は2であり；

Eは、(a) 結合、又は(b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、Oは、R<sup>2</sup>に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

R<sup>2</sup>は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> -

C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

R<sup>3</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル及び (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C(=O)NR<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)O -、(R<sup>4</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、R<sup>4</sup>OS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O) -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub> -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O -、(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N - モノアルキル置換アミド、N, N - ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N - モノアルキル置換アミド及び N, N - ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい) 及びヘテロアリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N - モノアルキル置換アミド、N, N - ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい) から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

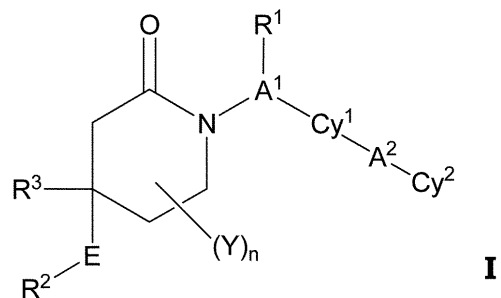
R<sup>4</sup> は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む方法。

#### 【請求項 66】

糖尿病を有する対象を処置する方法であって、そのような処置を必要とする対象に、有効量の下記構造式 (I)：

## 【化 9 5】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル又は ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルコキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>-、R<sup>4</sup>C( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = NCN )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )O -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

A<sup>1</sup> は、( a ) 結合、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O ( ここで、酸素は、Cy<sup>1</sup> に結合している )、若しくは CH<sub>2</sub>C( = O ) ( ここで、カルボニル炭素は、Cy<sup>1</sup> に結合している ) であり；

Cy<sup>1</sup> は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ヒドロキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ハロ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ヒドロキシ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル ( C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカンスルフィニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (

C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；  
A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、若しくは S；又は(b) (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)

) アルキル、アミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ及び (  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルから独立して選択される4個以下の基で置換されており；  
 $R^3$  は、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル及び (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_2 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)O-、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい )、ヘテロアリール ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい )、アリールアミノ ( これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい ) 及びヘテロアリールアミノ ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい ) から独立して選択される4個以下の基で置換されており；

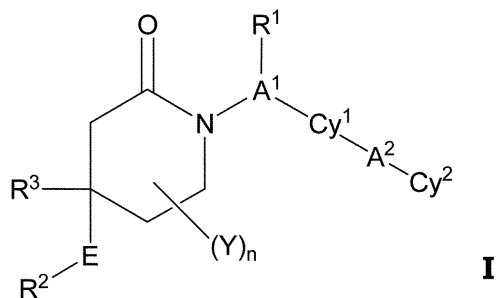
$R^4$  は、H、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル及び (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルから独立して選択されるが；

但し、 $R^2$  が、アリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、 $A^1$  が、(  $C_1$  ) アルキレンであり、 $R^3$  が、場合によりフッ素化されている、(  $C_1 - C_5$  ) アルキル、(  $C_2 - C_5$  ) アルケニル又は (  $C_2 - C_6$  ) アルキニルであり、そして $Cy^1$  が、場合により置換されているフェニルである場合、 $Cy^1$  は、場合により置換されている、アリール、ヘテロアリール又はシクロアルキルによりオルト位置で置換されていない]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む方法。

#### 【請求項67】

心血管疾患を有する対象を処置する方法であって、そのような処置を必要とする対象に、有効量の下記構造式 ( I ) ：

## 【化 9 6】



[ 式中、

$R^1$  は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、又は (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、 $(R^4)_2N-$ 、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)O-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、 $(R^4)_2NC(=N)NR^4-$ 、 $(R^4O)_2P(=O)O-$ 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、( a ) 結合、又は ( b ) (  $C_1 - C_3$  ) アルキレン、 $CH_2CH_2O$  (ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している)、若しくは  $CH_2C(=O)$  (ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している) であり；

$Cy^1$  は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルカン - スルフィニル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (



C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルア

ミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい)及びヘテロアリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

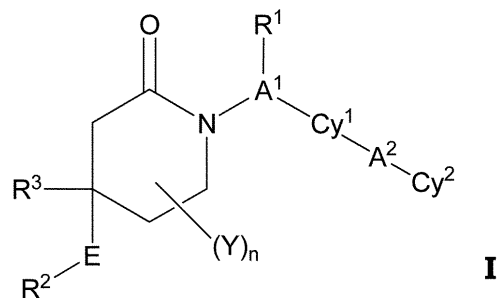
$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む方法。

#### 【請求項 68】

心血管疾患を有する対象を処置する方法であって、そのような処置を必要とする対象に、有効量の下記構造式 (I)：

## 【化 9 7】



[ 式中、

$R^1$  は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、又は (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=N-CN)NR<sup>4</sup>-、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)O-、(  $R^4O$  )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、(  $R^4$  )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、( a ) 結合、又は ( b )  $C_1$  アルキレン、 $CH_2CH_2O$  (ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している)、若しくは  $CH_2C(=O)$  (ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している) であり；

$Cy^1$  は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルカン - スルフィニル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (

C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；  
A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O 若しくは S；又は (b) (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

C<sub>y</sub><sup>2</sup> は、(a) 水素、又は (b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は(b)(C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルア

ミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_2 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_2 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい)及びヘテロアリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい)から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択されるが；

但し、 $R^2$  が、アリール、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、 $A^1$  が、( $C_1$ ) アルキレンであり、 $R^3$  が、場合によりフッ素化されている、( $C_1 - C_5$ ) アルキル、( $C_2 - C_5$ ) アルケニル又は ( $C_2 - C_6$ ) アルキニルであり、そして  $Cy^1$  が、場合により置換されているフェニルである場合、 $Cy^1$  は、場合により置換されている、アリール、ヘテロアリール又はシクロアルキルによりオルト位置で置換されていなく；

但し、 $A^1$  が及び  $A^2$  が、両方とも結合であり、そして  $Cy^1$  が、ピペリジニルである場合、 $Cy^2$  は、場合により置換されているキナゾリン-4-アミンではない]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む方法。

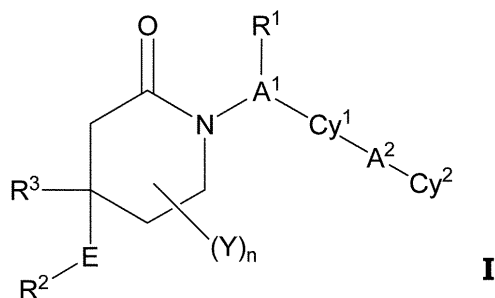
#### 【請求項 69】

心血管障害が、高血圧、高脂血症、心血管疾患、脂質代謝異常、及びアテローム性動脈硬化症からなる群より選択される、請求項 67 又は 68 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 70】

不安又は抑うつを有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 (I) :

## 【化 98】



[ 式中、

$R^1$  は、(a) 存在しないか、又は (b) ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、又は ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR^4-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=N)CN)NR^4-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR^4-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR^4-、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR^4-、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR^4-、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、(a) 結合、又は (b) ( $C_1 - C_3$ ) アルキレン、 $CH_2CH_2O$  (ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している)、若しくは  $CH_2C(=O)$  (ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している) であり；

$Cy^1$  は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ハロ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ヒドロキシ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアル



キルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカン  
 スルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)  
 シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、  
 (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンス  
 ルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカン  
 スルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> -  
 C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> -  
 C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>O、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミ  
 ノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ  
 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロ  
 スルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボ  
 ニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub>  
 - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ  
 カルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキ  
 ル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> -  
 C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub>  
 - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若  
 しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、  
 エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換  
 されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しく  
 はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、  
 シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキ  
 シ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)  
 シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、  
 ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル  
 アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)  
 シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シク  
 ロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル  
 チオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ  
 、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)  
 シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub>  
 - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィ  
 ニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカン  
 スルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シク  
 ロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> -  
 C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホ  
 ニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)  
 アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>O、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>

- C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は (b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub> N C O、H<sub>2</sub> N S O<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C

$C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、 (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、 (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ及び (  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、 (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、 (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、 (  $C_2 - C_6$  ) アルキニル及び (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、 $(R^4)_2N-$ 、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)O-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、 $(R^4)_2NC(=NCN)NR^4$ 、 $(R^4O)_2P(=O)O-$ 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4-$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、ヘテロシクリル ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい )、ヘテロアリール ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $N$ -モノアルキル置換アミド、 $N$ 、 $N$ -ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい )、アリールアミノ ( これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $N$ -モノアルキル置換アミド及び  $N$ 、 $N$ -ジアルキル置換アミドで置換されていてもよい ) 及びヘテロアリールアミノ ( これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、 $N$ -モノアルキル置換アミド、 $N$ 、 $N$ -ジアルキル置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい ) から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

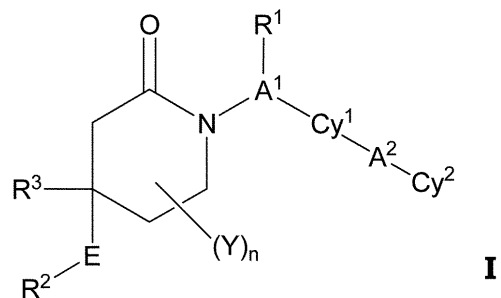
$R^4$  は、 $H$ 、 (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、 (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル及び (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルから独立して選択される ] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

#### 【請求項 71】

不安及び / 又は抑うつを有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 ( I )：

## 【化 9 9】



[ 式中、

$R^1$  は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル又は (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4 O -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> N -、 $R^4 O_2 C -$ 、 $R^4 S$ 、 $R^4 S ( = O ) -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 -$ 、 $R^4 C ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 OC ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = NC N ) NR<sup>4</sup> -、(  $R^4 O$  )<sub>2</sub> P ( = O ) O -、(  $R^4 O$  )<sub>2</sub> P ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 OS ( = O )_2 NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> -、 $R^4 S ( = O )_2 NR^4 -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) O -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) NR^4 -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) O -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 -$ 、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 O -$ 、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 NR^4 -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 O -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、( a ) 結合、又は ( b ) (  $C_1 - C_3$  ) アルキレン、 $CH_2CH_2O$  ( ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している )、若しくは  $CH_2C ( = O )$  ( ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している ) であり；

$Cy^1$  は、アリール、2 - 若しくは 3 - チエニル、2 - 若しくは 3 - フラニル、2 - 若しくは 3 - ピロリル、2 - 、3 - 、若しくは 4 - ピリジル、2 - ピラジニル、2 - 、4 - 、若しくは 5 - ピリミジニル、3 - 若しくは 4 - ピリダジニル、1 H - ベンゾイミダゾール - 6 - イル、1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル、2 - 、4 - 、5 - 、6 - 、7 - 若しくは 8 - キナゾリニル、2 - 、3 - 、5 - 、6 - 、7 - 若しくは 8 - キノキサリニル、2 - 、3 - 、4 - 、5 - 、6 - 、7 - 若しくは 8 - キノリニル、1 - 、3 - 、4 - 、5 - 、6 - 、7 - 若しくは 8 - イソキノリニル、2 - 、4 - 、若しくは 5 - チアゾリル、2 - 、3 - 、4 - 、若しくは 5 - ピラゾリル、2 - 、3 - 、4 - 、若しくは 5 - イミダゾリル、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロ

アルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC<sub>2</sub>O、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

A<sup>2</sup>は、(a)結合、O、S若しくはNR<sup>4</sup>、又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル若しくはトリフルオロメチルから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup>は、(a)水素、又は(b)アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> -

C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub> NCO、H<sub>2</sub> NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は(b) (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これは、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub> NCO、H<sub>2</sub> NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミ

ノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル；及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_2 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい）、ヘテロアリール（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N, N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）、アリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド及び N, N-ジアルキル-置換アミドで置換されていてもよい）及びヘテロアリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N, N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

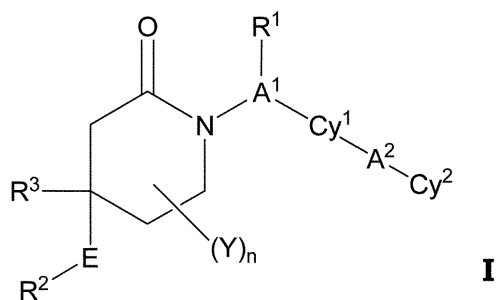
$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

#### 【請求項 72】

緑内障を有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 (I)：

「式中



Cy<sup>1</sup>は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカン-スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C



C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は (a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>、又は (b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は (b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、R<sup>2</sup> に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

R<sup>2</sup> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C

$C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$  ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$  ) アルキル、( $C_2 - C_6$  ) アルケニル、( $C_2 - C_6$  ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$  ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい)、ヘテロアリール(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド及びN,N-ジアルキル-置換アミドで置換されていてもよい)及びヘテロアリールアミノ(これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい)から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

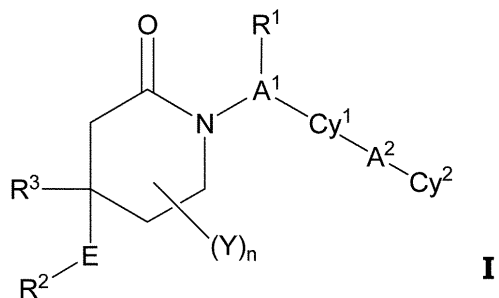
$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$  ) アルキル、( $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$  ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$  ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$  ) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

### 【請求項 73】

緑内障を有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 (I)：

## 【化 1 0 1】



[ 式中、

$R^1$  は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル又は (  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ (  $C_1 - C_3$  ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4 O -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> N -、 $R^4 O_2 C -$ 、 $R^4 S$ 、 $R^4 S ( = O ) -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 -$ 、 $R^4 C ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 OC ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = NC N ) NR<sup>4</sup> -、(  $R^4 O$  )<sub>2</sub> P ( = O ) O -、(  $R^4 O$  )<sub>2</sub> P ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 OS ( = O )_2 NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> -、 $R^4 S ( = O )_2 NR^4 -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) O -$ 、 $R^4 S ( = O )_2 NHC ( = O ) NR^4 -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) O -$ 、 $R^4 OS ( = O )_2 NHC ( = O ) NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NS ( = O )<sub>2</sub> NHC ( = O ) NR<sup>4</sup> -、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 -$ 、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 O -$ 、 $R^4 C ( = O ) NHS ( = O )_2 NR^4 -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 O -$ 、 $R^4 OC ( = O ) NHS ( = O )_2 NR^4 -$ 、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> O -、(  $R^4$  )<sub>2</sub> NC ( = O ) NHS ( = O )<sub>2</sub> NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$A^1$  は、( a ) 結合、又は ( b ) (  $C_1$  ) アルキレン、 $CH_2CH_2O$  ( ここで、酸素は、 $Cy^1$  に結合している )、若しくは  $CH_2C ( = O )$  ( ここで、カルボニル炭素は、 $Cy^1$  に結合している ) であり；

$Cy^1$  は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ (  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル (  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、ハロ (  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (  $C_1 - C_6$  ) アルカン - スルフィニル、ハロ (  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (

C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル若しくはトリフルオロメチルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) ア

ルキルカルボニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル又はハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は (b) ( $C_1 - C_3$ ) アルキレン若しくは ( $C_1 - C_2$ ) アルキレニルオキシであり、ここで、O は、 $R^2$  に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$R^2$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ハロ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ヒドロキシ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルフィニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキ

ルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル；及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_2 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4$ -、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、ヘテロシクリル（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい）、ヘテロアリール（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）、アリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド及びN,N-ジアルキル-置換アミドで置換されていてもよい）及びヘテロアリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい）から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

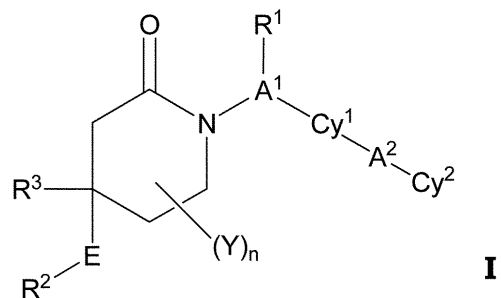
$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

#### 【請求項 74】

骨粗鬆症を有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 (I)：

## 【化 1 0 2】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル又は ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルコキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>-、R<sup>4</sup>C( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = NCN )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )O -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

A<sup>1</sup> は、( a ) 結合、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O ( ここで、酸素は、Cy<sup>1</sup> に結合している )、若しくは CH<sub>2</sub>C( = O ) ( ここで、カルボニル炭素は、Cy<sup>1</sup> に結合している ) であり；

Cy<sup>1</sup> は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ヒドロキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ハロ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ヒドロキシ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル ( C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカンスルフィニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (



C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

A<sup>2</sup> は、(a) 結合、O、S 若しくは NR<sup>4</sup>；又は(b)(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Cy<sup>2</sup> は、(a) 水素、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

Yは、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル又はハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

nは、0、1又は2であり；

Eは、(a) 結合、又は(b) (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン若しくは(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレニルオキシであり、ここで、Oは、R<sup>2</sup>に結合しており、これらの各々は、場合によりメチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される1～4個の基で置換されており；

R<sup>2</sup>は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NC(O)、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルア

ミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されていてもよい）、ヘテロアリール（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい）、アリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド及びN,N-ジアルキル-置換アミドで置換されていてもよい）及びヘテロアリールアミノ（これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、 $CO_2H$ 、 $CONH_2$ 、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド、又はオキソで置換されていてもよい）から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

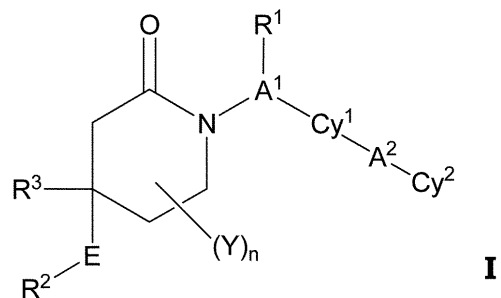
$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択される ] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

#### 【請求項 75】

骨粗鬆症を有する対象を処置する方法であって、そのような処置が必要な対象に、有効量の下記構造式 (I)：

## 【化 1 0 3】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、( a ) 存在しないか、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル又は ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルコキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>N -、R<sup>4</sup>O<sub>2</sub>C -、R<sup>4</sup>S、R<sup>4</sup>S( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = NCN )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )O -、( R<sup>4</sup>O )<sub>2</sub>P( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>S( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、R<sup>4</sup>OS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O ) -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NS( = O )<sub>2</sub>NHC( = O )NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>C( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、R<sup>4</sup>OC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub> -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>O -、( R<sup>4</sup> )<sub>2</sub>NC( = O )NHS( = O )<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリールアミノ及びテロアリールアミノから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

A<sup>1</sup> は、( a ) 結合、又は ( b ) ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O ( ここで、酸素は、Cy<sup>1</sup> に結合している )、若しくは CH<sub>2</sub>C( = O ) ( ここで、カルボニル炭素は、Cy<sup>1</sup> に結合している ) であり；

Cy<sup>1</sup> は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ヒドロキシ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ハロ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、ヒドロキシ ( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルケニル、( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル ( C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキル、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルコキシ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルコキシ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルコキシ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキルチオ、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルチオ、ハロ ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルキルチオ、( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカンスルフィニル、( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルカン - スルフィニル、ハロ ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (

$C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、(  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_3$  ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスルホニル、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルアミノ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルスルホニルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルスルホニルアミノ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシカルボニル(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、アミノ(  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ(  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ(  $C_2 - C_6$  ) アルコキシ及び(  $C_1 - C_6$  ) アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；  
 $A^2$  は、( a ) 結合、O 若しくは S；又は( b ) (  $C_1 - C_3$  ) アルキレン若しくは(  $C_1 - C_2$  ) アルキレンオキシであり、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル若しくはオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$Cy^2$  は、( a ) 水素、又は( b ) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ヒドロキシ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ハロ(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、ヒドロキシ(  $C_2 - C_6$  ) アルケニル、(  $C_2 - C_6$  ) アルキニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル(  $C_2 - C_4$  ) アルキニル、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキル、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルコキシ、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルチオ、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルキルチオ、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルキルチオ、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルフィニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルカン - スルフィニル、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、(  $C_4 - C_7$  ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルカンスルホニル、ハロ(  $C_3 - C_6$  ) シクロアルカンスルホニル、ハロ(  $C_4 - C_7$  ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ハロ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノカルボニル、(  $C_1 - C_3$  ) アルコキシ(  $C_1 - C_3$  ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスルホニル、ジ(  $C_1 - C_6$  ) アルキルアミノスル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、アミノ  $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ  $(C_2 - C_6)$  アルコキシ、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ  $(C_2 - C_6)$  アルコキシ及び  $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

Y は、 $(C_1 - C_6)$  アルキル又はハロ  $(C_1 - C_6)$  アルキルであり；

n は 0、1 又は 2 であり；

E は、(a) 結合、又は (b)  $(C_1 - C_3)$  アルキレン若しくは  $(C_1 - C_2)$  アルキレニルオキシであり、ここで、O は、 $R^2$  に結合しており、これらの各々は、場合により、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されており；

$R^2$  は、 $(C_1 - C_6)$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、各々は、場合により、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ヒドロキシ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ハロ  $(C_2 - C_6)$  アルケニル、ヒドロキシ  $(C_2 - C_6)$  アルケニル、 $(C_2 - C_6)$  アルキニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル  $(C_2 - C_4)$  アルキニル、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキル、ハロ  $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルコキシ、ハロ  $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルキルチオ、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルキルチオ、ハロ  $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルフィニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルカン - スルフィニル、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルフィニル、ハロ  $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、 $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、 $(C_4 - C_7)$  シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルカンスルホニル、ハロ  $(C_3 - C_6)$  シクロアルカンスルホニル、ハロ  $(C_4 - C_7)$  シクロ - アルキルアルカンスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_3)$  アルコキシ  $(C_1 - C_3)$  アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルカルボニルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$  アルキルスルホニルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシカルボニル  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ハロ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ヒドロキシ  $(C_1 - C_6)$  アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、 $(C_1 - C_6)$  アルキルアミノ  $(C_1 - C_6)$  アルキル、ジ  $(C_1 - C_6)$  アルキルア

ミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^3$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル及び ( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルから選択され、ここで、各々は、場合により、フッ素、シアノ、オキソ、 $R^4$ 、 $R^4O-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>N-、 $R^4O_2C-$ 、 $R^4S$ 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=NCN)NR<sup>4</sup>、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)O-、( $R^4O$ )<sub>2</sub>P(=O)NR<sup>4</sup>-、 $R^4OS(=O)_2NR^4-$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、 $R^4S(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NS(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)NR<sup>4</sup>、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>O-、( $R^4$ )<sub>2</sub>NC(=O)NHS(=O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>、ヘテロシクリル (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル又はオキソで置換されてもよい)、ヘテロアリール (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい)、アリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド及びN,N-ジアルキル-置換アミドで置換されていてもよい) 及びヘテロアリールアミノ (これも同様に、場合により、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル-置換アミド、N,N-ジアルキル-置換アミド又はオキソで置換されていてもよい) から独立して選択される 4 個以下の基で置換されており；

$R^4$  は、H、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル及び ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを投与する工程を含む、方法。

【請求項 76】

A<sup>1</sup> が、結合である、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 77】

A<sup>1</sup> が、( $C_1 - C_3$ ) アルキレンである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 78】

A<sup>1</sup> が、メチレンである、請求項 77 記載の方法。

【請求項 79】

A<sup>1</sup> が、CH であり、そして R<sup>1</sup> が存在する、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の

方法。

【請求項 8 0】

$R^1$  が、( $C_1 - C_6$ ) アルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 8 1】

$R^1$  が、場合により置換されている、メチル又はエチルである、請求項 8 0 記載の方法。

【請求項 8 2】

$R^1$  が、置換されていないメチル又はエチルである、請求項 8 0 記載の方法。

【請求項 8 3】

$Cy^1$  が、場合により置換されているアリール又は場合により置換されているヘテロアリールである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 8 4】

$Cy^1$  が、場合により置換されているフェニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 8 5】

$Cy^1$  が、場合により置換されている単環式シクロアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 8 6】

$Cy^1$  が、場合により置換されているシクロヘキシルである、請求項 8 5 記載の方法。

【請求項 8 7】

$Cy^1$  が、場合により置換されているフェニルである、請求項 8 4 記載の化合物。

【請求項 8 8】

$Cy^1$  が、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、メチル、トリフルオロメチル又はジフルオロメトキシにより置換されている、請求項 8 7 記載の方法。

【請求項 8 9】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、水素である、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 9 0】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、水素である、請求項 8 5 記載の方法。

【請求項 9 1】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、水素である、請求項 8 6 記載の方法。

【請求項 9 2】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、水素である、請求項 8 7 記載の方法。

【請求項 9 3】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、シクロプロピルである、請求項 8 7 記載の方法。

【請求項 9 4】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、場合により置換されているアリール又は場合により置換されているヘテロアリールである、請求項 8 7 記載の方法。

【請求項 9 5】

$A^2$  が、結合であり、そして  $Cy^2$  が、場合により置換されているフェニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 8 7 記載の方法。

【請求項 9 6】

$Cy^2$  が、場合により置換されているフェニルである、請求項 9 5 記載の方法。

【請求項 9 7】

$Cy^2$  が、塩素又はフッ素から独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている、請求項 9 6 記載の方法。

【請求項 9 8】



$Cy^2$  が、ジフルオロフェニルである、請求項 96 記載の方法。

【請求項 99】

$Cy^2$  が、フルオロフェニルである、請求項 96 記載の方法。

【請求項 100】

$R^3$  が、ヒドロキシ ( $C_2 - C_5$ ) アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 101】

$R^3$  が、ジヒドロキシ ( $C_3 - C_5$ ) アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 102】

$R^3$  が、 $-H_2NCO(C_1 - C_3)$  アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 103】

$R^3$  が、 $H_2NC(=O)CH_2CH_2$  である、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 104】

$R^3$  が、( $C_1 - C_2$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 105】

$R^3$  が、 $H_2NSO_2O(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 106】

$R^3$  が、 $H_2NSO_2NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 107】

$R^3$  が、オキソ ( $C_2 - C_4$ ) アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 108】

$R^3$  が、アルケニルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 109】

$R^3$  が、アリルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 110】

$R^3$  が、 $MeC(=O)NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 111】

$R^3$  が、 $MeOC(=O)NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 112】

$R^3$  が、シアノアルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 113】

$R^3$  が、アルキルスルホニルアミノアルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 114】

$R^3$  が、 $MeS(=O)_2NH(C_2 - C_4)$  アルキルである、請求項 113 記載の方法。

【請求項 115】

$R^3$  が、 $MeS(=O)_2NHCH_2CH_2CH_2$  である、請求項 113 記載の方法。

【請求項 116】

$R^3$  が、アルキルヒドロキシアルキルである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 1 7】

R<sup>3</sup> が、ヒドロキシアルコキシアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 1 8】

R<sup>3</sup> が、アミノカルボニルアミノアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 1 9】

R<sup>3</sup> が、アミノカルボキシアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 2 0】

R<sup>3</sup> が、2 - ( 4 - モルホリノ ) エチルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 2 1】

R<sup>3</sup> が、2 - ( 1 - イミダゾリル ) エチルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 2 2】

R<sup>2</sup> が、場合により置換されているアリール、場合により置換されているヘテロアリール又は場合により置換されているシクロアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 2 3】

R<sup>2</sup> が、場合により置換されているフェニル、場合により置換されているチエニル又は場合により置換されているピリジルである、請求項 1 2 2 記載の方法。

## 【請求項 1 2 4】

R<sup>2</sup> が、場合により置換されているフェニルである、請求項 1 2 3 記載の方法。

## 【請求項 1 2 5】

E が、結合である、請求項 1 2 4 記載の方法。

## 【請求項 1 2 6】

R<sup>2</sup> が、フルオロフェニルである、請求項 1 2 4 記載の方法。

## 【請求項 1 2 7】

R<sup>2</sup> が、場合により置換されているアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

## 【請求項 1 2 8】

R<sup>2</sup> が、場合により置換されているイソプロピルである、請求項 1 2 7 記載の方法。

## 【請求項 1 2 9】

R<sup>1</sup> が、存在しないか、又はメチル若しくはエチルであり；

A<sup>1</sup> が、結合若しくは C H<sub>2</sub> であり、又は R<sup>1</sup> が存在する場合、A<sup>1</sup> は、C H であり；

C y<sup>1</sup> が、フェニル、シクロプロピル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピリジル、N - オキソ - ピリジル、チアゾリル又はピリミジニル（各々は、場合により、ハロ、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ、シアノ、ジフルオロメトキシ、t - ブトキシカルボニル、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - プロピル、メトキシメチル、メチルスルホニル及びメチルスルホニルアミノから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている）であり；

A<sup>2</sup> が、結合、O、O C H<sub>2</sub> C O 又は C = O であり；

C y<sup>2</sup> が、( a ) 水素、又は ( b ) フェニル、チエニル、ピリジル、N - オキソ - ピリジル、シクロプロピル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピラゾリル、S、S - ジオキソチアジニル、2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジル（各々は、場合により、アミノメチル、1 - アミノエチル、ハロ、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、メトキシカルボニル、アミノ、カルバモイル、メチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、( 2 - メトキシエチル ) アミノカ

ルボニル、アセチルアミノメチル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、メチルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、ピロリジン - 1 - スルホニル、メチルスルホニルアミノメチル、テトラゾリル、メチル、トリフルオロメチル、アセチル、2 - ヒドロキシエチル及び 1 - アミノエチルから独立して選択される 1 ~ 4 個の基で置換されている) であり;

n が、0 であり;

E が、結合又は  $\text{CH}_2$  であり;

$\text{R}^2$  が、シクロヘキシル、イソプロピル、チエニル、フェニル又はピリジル (各々は、場合により、ハロ、メチル、メチルチオ又は (4 - モルホリノ) メチルから選択される 1 個の基で置換されている) であり;

$\text{R}^3$  が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ビニル、アリル又はエトキシエチル (各々は、場合により、メチル、 $\text{H}_2\text{C}=\text{CH}$ 、 $\text{HO}-$ 、 $\text{MeO}-$ 、 $\text{MeC}(=\text{O})$ 、 $\text{H}_2\text{N}-$ 、 $\text{MeC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $\text{MeS}(=\text{O})_2\text{NH}-$ 、 $\text{H}_2\text{NC}(=\text{O})-$ 、 $\text{MeNHC}(=\text{O})-$ 、 $\text{HO}_2\text{C}-$ 、 $\text{HO}-(\text{CH}_2)_2\text{O}-$ 、 $(\text{HO})_2\text{P}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $\text{H}_2\text{NS}(=\text{O})_2\text{O}-$ 、 $\text{H}_2\text{NS}(=\text{O})_2\text{NH}-$ 、 $\text{MeNHC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $\text{MeNHC}(=\text{O})\text{O}-$ 、シアノ、 $\text{HO}_2\text{C}-$ 、 $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ 、4 - モルホリノ、 $\text{HOCCH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $\text{H}_2\text{NCH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $\text{EtNHC}(=\text{O})\text{NH}$ 、 $\text{H}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{NH}$ 、 $\text{H}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{MeOC}(=\text{O})\text{NH}-$ 、 $\text{MeNHC}(=\text{NCoN})\text{NH}-$ 、 $\text{Me}-$ 、 $\text{MeS}-$ 、 $\text{MeSO}_2-$ 、 $\text{MeSO}_2\text{N}(\text{Me})-$ 、 $\text{MeS}(=\text{O})_2\text{NHC}(=\text{O})-$ 、イミダゾリルアミノ、イミダゾリル、モルホリノ、テトラゾリル、 $\text{H}_2\text{NCONH}-$ 、 $\text{H}_2\text{NCO}_2-$ 、 $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{MeNH}-$ 、 $\text{Me}_2\text{N}-$  及び  $\text{MeCONMe}$  から独立して選択される 2 個以下の基で置換されている) であり;

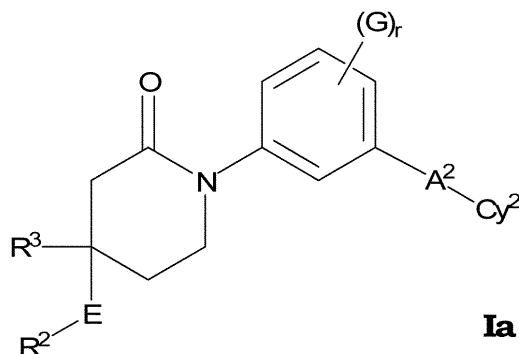
$\text{R}^5$  が、水素又はメチルである、

請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 130】

化合物が、式 (Ia) :

【化 104】



[ 式中、

r は、0、1、2、3 又は 4 であり; そして

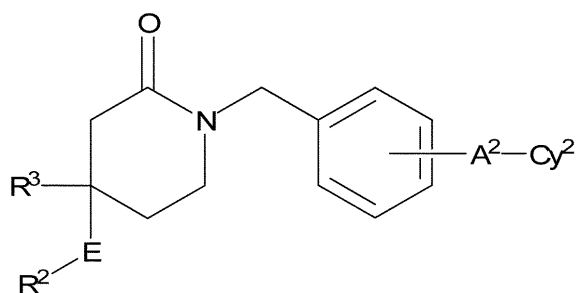
G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキル、ヒドロキシ $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキル、 $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$  アルケニル、ハロ $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$  アルケニル、ヒドロキシ $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$  アルケニル、 $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$  アルキニル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキル $(\text{C}_2 - \text{C}_4)$  アルキニル、ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、ハロ $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキル、ハロ $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  シクロアルキルアルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、 $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルコキシ、 $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  シクロアルキルアルコキシ、ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、ハロ $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルコキシ、ハロ $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  シクロアルキ

ルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカン-スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル-スルホニル-アミノ-(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルコキシ又は(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項65～75のいずれか一項記載の方法。

【請求項131】

化合物が、式(Ib)：

【化105】



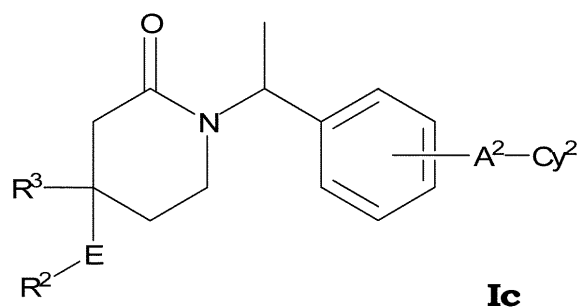
**Ib**

で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項65～75のいずれか一項記載の方法。

【請求項132】

化合物が、式(Ic)：

【化 1 0 6】

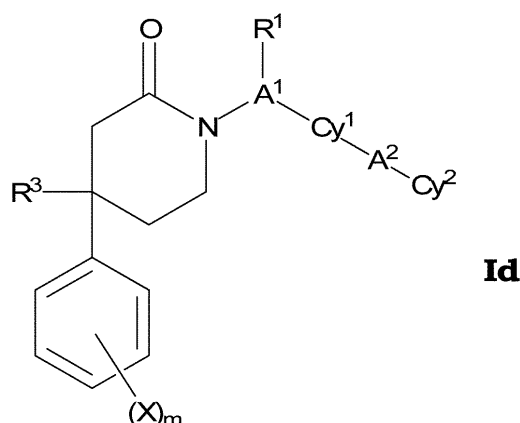


で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 133】

化合物が、式 ( I d ) :

【化 1 0 7】



[ 式中、

m は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

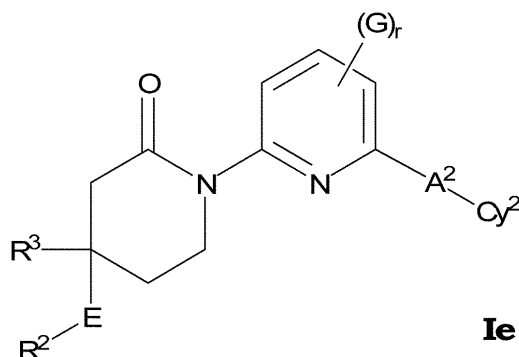
X は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン - スルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>

- C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル-アミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 134】

化合物が、式 (Ie) :

【化 108】



[ 式中

r は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

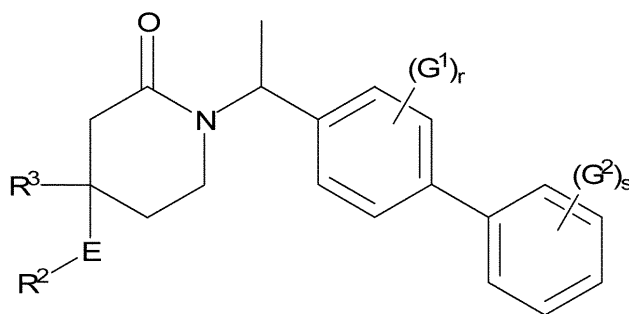
G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカン-スルフィニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル-アルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル-アルカンスルホニル、ハロ (C<sub>1</sub>

- C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される] で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 135】

化合物が、式 (If) :

【化 109】



If

[ 式中、

r 及び s は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして

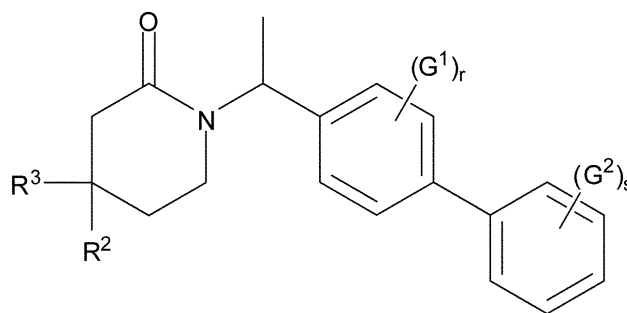
G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンス

ルフィニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルフィニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルフィニル、( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルカンスルホニル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルカンスルホニル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル、 $H_2NCO$ 、 $H_2NSO_2$ 、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、( $C_1 - C_3$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_3$ ) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルスルホニルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、アミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ、ジ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノ ( $C_2 - C_6$ ) アルコキシ及び ( $C_1 - C_6$ ) アルキルカルボニルから独立して選択される] で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項 65 ~ 75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 136】

化合物が、式 (If\*) :

【化 110】



If\*

[ 式中、

r 及び s は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして

G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ヒドロキシ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ハロ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、ヒドロキシ ( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル ( $C_2 - C_4$ ) アルキニル、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキル、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルコキシ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ ( $C_1 - C_6$ ) アルキルチオ、ハロ ( $C_3 - C_6$ ) シクロアルキルチオ、ハロ ( $C_4 - C_7$ ) シクロアルキルアルキルチオ

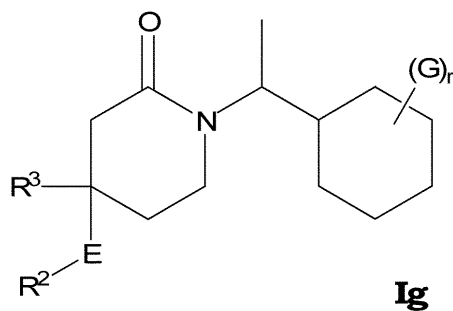


オ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立して選択される]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである請求項65～75のいずれか一項記載の方法。

【請求項137】

化合物が、式(Ig)：

【化111】



[式中、

r は、0、1、2、3又は4であり；

G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ヒドロキシ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ハロ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) アルキニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルコキシ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルチオ、ハロ(C<sub>3</sub>

- C<sub>6</sub>) シクロアルキルチオ、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルキルチオ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルカンスルホニル、ハロ(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル、H<sub>2</sub>NCO、H<sub>2</sub>NSO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルスルホニルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ハロ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルアミノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルカルボニルから独立独立して選択される]で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項65～75のいずれか一項記載の方法。

【請求項138】

i) 薬学的に許容しうる担体又は希釈剤；及びii) 請求項1～64のいずれか一項記載の化合物；或いは、その薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーを含む、医薬組成物。

【請求項139】

11 - HSD1の活性又は発現に関連する疾患を有する対象を処置する方法であって、対象に有効量の請求項1～64記載の化合物を投与する工程を含む、方法。

【請求項140】

11 - HSD1活性を阻害する方法であって、そのような処置が必要な哺乳類に有効量の請求項1～64記載の化合物を投与する工程を含む、方法。