

【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 0 7 D 211/76	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 27/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/10	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/451	(2006.01)
C 0 7 D 401/10	(2006.01)
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/76	C S P
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 27/06	
A 6 1 P 19/10	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 K 31/451	
C 0 7 D 401/10	
A 6 1 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

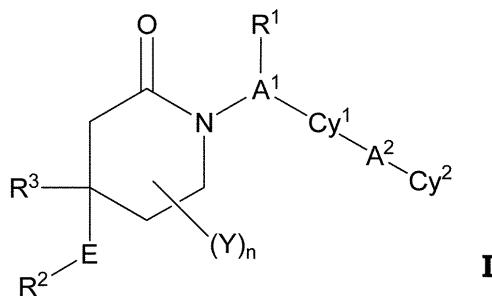
【補正の内容】

【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 、 $(R^4)_2N$ 、 R^4O_2C 、 R^4S 、 $R^4S(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)$ 、 $(R^4)_2NC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=N)CN$ 、 NR^4 、 $(R^4)_2P(=O)O$ 、 $(R^4)_2P(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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、单環式シクロアルキル又は单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 (

$C_1 - C_6$) 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、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；

A^2 は、(a)結合、O、S若しくはNR⁴；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；

C_y^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、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

$C_3 - C_6$) 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $\{(C_3 - C_6)\}$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $\{(C_1 - C_6)\}$ 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 $(C_1 - C_2)$ アルキレンオキシであり、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、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

才、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルカルボニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル、{(C₃ - C₆)シクロアルキル}{(C₁ - C₆)アルキル}アミノカルボニル、ジ(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノスルホニル、{(C₃ - C₆)シクロアルキル}{(C₁ - C₆)アルキル}アミノスルホニル、ジ(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノスルホニル、シアノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノカルボニル(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル(C₁ - C₆)アルキル、{(C₃ - C₆)シクロアルキル}{(C₁ - C₆)アルキル}アミノカルボニル(C₁ - C₆)アルキル及びジ(C₃ - C₆)シクロアルキルアミノカルボニル(C₁ - C₆)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；

R³は、(C₂-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₃-C₅)シクロアルキル(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₃)アルコキシ(C₁-C₃)アルコキシ、又は(C₁-C₃)アルコキシ(C₁-C₃)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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=N)N-、NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂HC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)O-

) N H S (= O) ₂ - 、 R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、 R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ - 、 R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、 R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ N R 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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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、(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル及び(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)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】

R ¹ が、(a)存在しないか、又は(b)(C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、又は(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)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) ₂ N - 、R ⁴ O ₂ C - 、R ⁴ S、R ⁴ S (= O) - 、R ⁴ S (= O) ₂ - 、R ⁴ C (= O) N R ⁴ - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) O - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) N R ⁴ - 、R ⁴ O C (= O) N R ⁴ - 、(R ⁴) ₂ N C (= N C N) N R ⁴ - 、(R ⁴ O) ₂ P (= O) O - 、(R ⁴ O) ₂ P (= O) N R ⁴ - 、R ⁴ O S (= O) ₂ N R ⁴ - 、(R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ O - 、(R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N R ⁴ - 、R ⁴ S (= O) ₂ N R ⁴ - 、R ⁴ S (= O) ₂ N H C (= O) - 、R ⁴ S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、R ⁴ S (= O) ₂ N H C (= O) - 、(R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、(R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) N R ⁴ - 、R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ - 、R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ - 、R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、(R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ N R 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 が、(a)結合、又は(b)(C₁ - C₃)アルキレン、CH₂CH₂O(ここで、酸素は、C_y¹に結合している)、若しくはCH₂C(=O)(ここで、カルボニル炭素は、C_y¹に結合している)であり;

C_y¹ 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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₃ - C₆)アルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカ
ンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカ
ンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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；A²が、(a)結合、O、S若しくはNR⁴；又は(b)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)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；

Cy²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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ

、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン - スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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 が、(C₁ - C₆) アルキル又はハロ(C₁ - C₆) アルキルであり；

n が、 0、 1 又は 2 であり；

E が、(a) 結合、又は (b) (C₁ - C₃) アルキレン若しくは (C₁ - C₂) アルキニルオキシであり、ここで、O は、R² 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 が、(C₂ - C₆) 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカン - スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) アルカンスルホニル、

) 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)₂N、 R^4O_2 、 C^- 、 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)NR⁴、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NC(=N)N、 $R^4O_2P(=O)$ 、 O^- 、(R^4O)₂P(=O)NR⁴、 $R^4OS(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)O、(R^4)₂NS(=O)NR⁴、 $R^4S(=O)NR^4$ 、 $R^4S(=O)NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)NHC(=O)O$ 、 $R^4OS(=O)NHC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)O、 $R^4NS(=O)NHC(=O)O$ 、 $R^4NS(=O)NHC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)NHC(=O)O、 $R^4NS(=O)NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)NR^4$ 、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、N,N-ジ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；

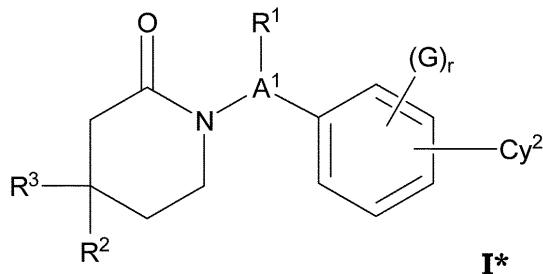
R^4 が、 H 、($C_1 - C_6$)アルキル、ハロ($C_1 - C_6$)アルキル、アミノ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルキルアミノ($C_1 - C_6$)アルキル、ジ($C_1 - C$

₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル及び (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) 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 8 5】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は (b) (C₁ - C₆) 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、R⁴、R⁴O - 、(R⁴)₂N - 、R⁴O₂C - 、R⁴S、R⁴S(=O) - 、R⁴S(=O)₂ - 、R⁴C(=O)NR⁴ - 、(R⁴)₂NC(=O) - 、(R⁴)₂NC(=O)O - 、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴ - 、R⁴OC(=O)NR⁴ - 、(R⁴)₂NC(=N)NR⁴ - 、(R⁴O)₂P(=O)O - 、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴ - 、R⁴OS(=O)₂NR⁴ - 、(R⁴)₂NS(=O)₂O - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴ - 、R⁴S(=O)₂NR⁴ - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O) - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、R⁴OS(=O)₂NHC(=O) - 、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O) - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、R⁴C(=O)NHS(=O)₂ - 、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O - 、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴ - 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂ - 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O - 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ - 、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂ - 、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ - 、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 ;

A¹ は、(a) 結合、又は (b) (C₁ - C₃) 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ (C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ (C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₂ - C₄) アルキニル、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ (C₁ - C₆) アルカン - スルフィニル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)

) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)アルキルカルボニルから独立して選択され；そして

Gが、A¹にメタ又はパラに結合する場合、Gは、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヘテロアリールからも選択され；

Cy²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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスル

ホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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；

R²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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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；

R³は、置換C₂アルキル、又は場合により置換されている(C₃ - C₆)アルキルであり、ここで、R³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、R⁴O -、(R⁴)₂N -、R⁴O₂C -、R⁴S、R⁴S(=O) -、R⁴S(=O)₂ -、R⁴C(=O)NR⁴、(R⁴)₂NC(=O) -、(R⁴)₂NC(=O)O -、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴ -、R⁴OCS(=O) -、(R⁴O)₂P(=O)O -、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴ -、R⁴OS(=O) -、(R⁴)₂NS(=O)O -、(R⁴)₂NS(=O)NR⁴、R

$R^4S(=O)_2NR^4$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2N$ R^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2個以下の置換基を有しております;

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 $\underline{(C_1-C_5)}$ 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】

C_y^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 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 1 3】

C_y^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 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 1 4】

C_y^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 1 3 記載の化合物。

【請求項 1 5】

C_y^1 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 記載の化合物。

【請求項 1 6】

C_y^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 1 5 記載の化合物。

【請求項 1 7】

A^2 が、結合であり、そして C_y^2 が、水素である、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 1 8】

A^2 が、結合であり、そして C_y^2 が、水素である、請求項 1 3 記載の化合物。

【請求項 1 9】

A^2 が、結合であり、そして C_y^2 が、水素である、請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 2 0】

A^2 が、結合であり、そして C_y^2 が、水素である、請求項 1 5 記載の化合物。

【請求項 2 1】

A^2 が、結合であり、そして C_y^2 がシクロプロピルである、請求項 1 5 記載の化合物。

【請求項 2 2】

A^2 が、結合であり、そして C_y^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 1 5 記載の化合物。

【請求項 2 3】

A^2 が、結合であり、そして C_y^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 1 5 記載の化合物。

【請求項 2 4】

C_y^2 が、場合により置換されているフェニルである、請求項 2 3 記載の化合物。

【請求項 2 5】

C_y^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 2 4 記載の化合物。

【請求項 2 6】

C_y^2 が、ジフルオロフェニルである、請求項 2 4 記載の化合物。

【請求項 2 7】

C_y^2 が、フルオロフェニルである、請求項 2 4 記載の化合物。

【請求項 2 8】

R^3 が、ヒドロキシ (C_2 ~ C_5) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 2 9】

R^3 が、ジヒドロキシ (C_3 ~ C_5) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 3 0】

R^3 が、 $-H_2NCO$ (C_1 ~ C_3) アルキルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 3 1】

R^3 が、 $H_2NC(=O)CH_2CH_2$ である、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 3 2】

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 1 ~ 3 記載

の化合物。

【請求項 3 3】

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 3 4】

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 3 5】

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 3 6】

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 3 7】

R^3 が、 アリルである、請求項 1 ~ 3 記載の化合物。

【請求項 3 8】

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 3 9】

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 4 0】

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 4 1】

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 4 2】

R^3 が、 $MeS(=O)_2NH (C_2 - C_4)$ アルキルである、請求項 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 3】

R^3 が、 $MeS(=O)_2NHCH_2CH_2CH_2$ である、請求項 4 1 記載の化合物。

【請求項 4 4】

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 4 5】

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 4 6】

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 4 7】

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 4 8】

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 4 9】

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 5 0】

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 4 9 記載の化合物。

【請求項 5 1】

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 5 0 記載の化合物。

【請求項 5 2】

E が、 結合である、請求項 5 1 記載の化合物。

【請求項 5 3】

R^2 が、 フルオロフェニルである、請求項 5 1 記載の化合物。

【請求項 5 4】

R² 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 5 5】

R² 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 5 6】

R¹ が、存在しないか、又はメチル若しくはエチルであり；

A¹ が、結合又は C H₂ であるか、或いは R¹ が、存在する場合、A¹ は C H であり；
C y¹ 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；

A² が、結合、O、O C H₂ C O 又は C = O であり；

C y² 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 C H₂ であり；

R² 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；

R³ 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、H₂C = C H、HO-、MeO-、MeC(=O)、H₂N-、MeC(=O)NH-、MeS(=O)₂NH-、H₂NC(=O)-、MeNHC(=O)-、HO₂C-、HO-(CH₂)₂O-、(HO)₂P(=O)O-、H₂NS(=O)₂O-、H₂NS(=O)₂NH-、MeNHC(=O)NH-、MeNHC(=O)O-、シアノ、HO₂C-、HOCH₂CH₂NH-、4-モルホリノ、HOCH₂C(=O)NH-、H₂NCH₂C(=O)NH-、EtNHC(=O)NH、H₂NHC(=O)NH、H₂NHC(=O)O-、CH₃C(=O)、MeOC(=O)NH-、MeNHC(=NC)NH-、Me-、MeS-、MeSO₂-、MeSO₂N(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、H₂NCONH-、H₂NCO₂-、HOCH₂CH₂O-、MeNH-、Me₂N- 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；

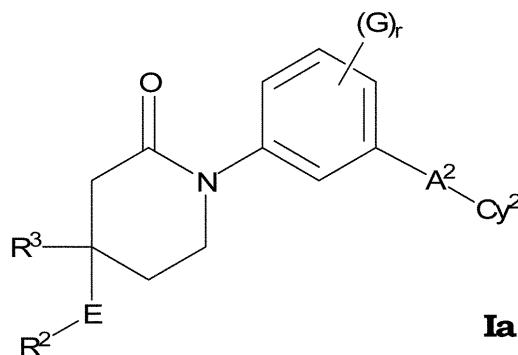
R⁵ が、水素又はメチルである、

請求項 1～3 記載の化合物。

【請求項 5 7】

化合物が、式 (I a) :

【化 8 6】



[式中、

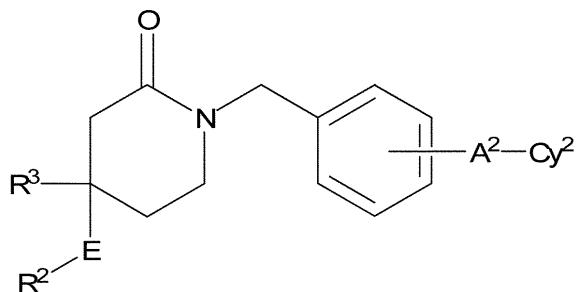
r は、0、1、2、3 又は4 であり；そして

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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ又は(C₁ - C₆)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 5 8】

化合物が、式 (I b) :

【化 8 7】

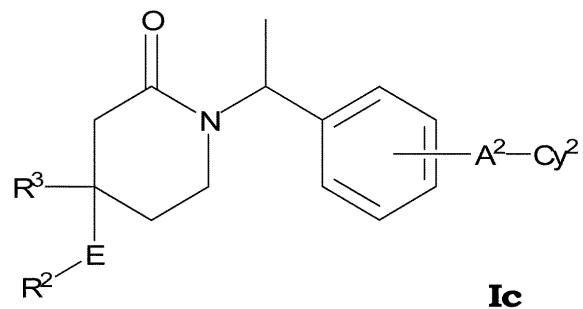
**Ib**

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 5 9】

化合物が、式 (I c) :

【化 8 8】

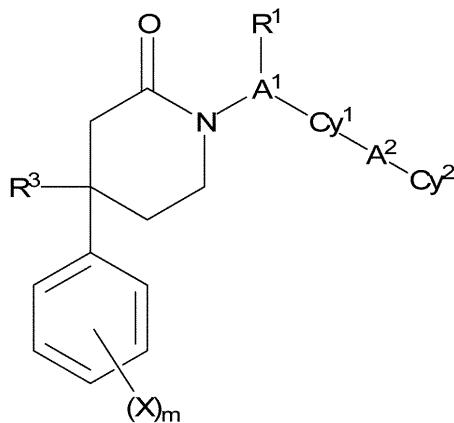
**Ic**

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 6 0】

化合物が、式 (I d) :

【化 8 9】

**Id**

[式中、

m は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

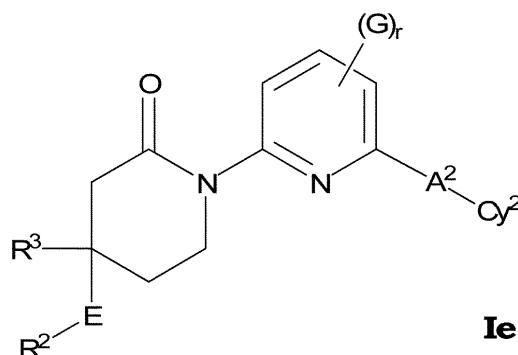
X は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキ

シ、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、

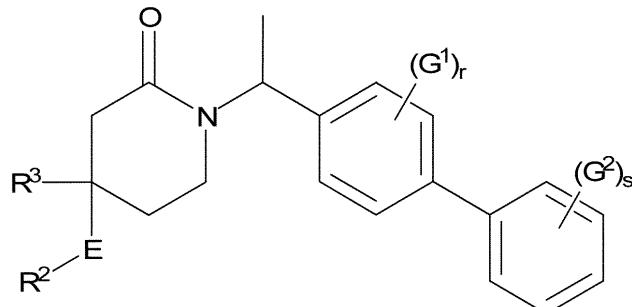
r は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキル、アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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62】

化合物が、式(I f)：

【化91】



If

[式中、

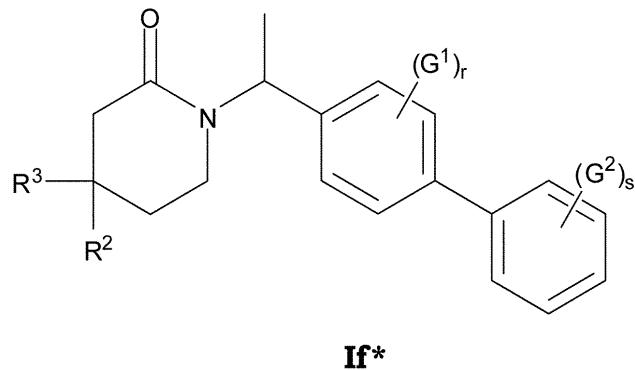
r 及び s は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして

G¹ 及び G² 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NC₆O、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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 3】

化合物が、式(I f^{*}) :

【化92】

**If***

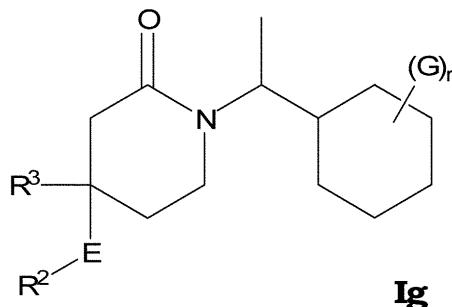
[式中、

r 及び s は、独立して 0、1、2、3 又は 4 であり；そして
 G¹ 及び G² 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカスルホニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NS(=O)₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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 6 4】

化合物が、式 (Ig) :

【化 9 3】



[式中、

r は、0、1、2、3 又は 4 であり；そして

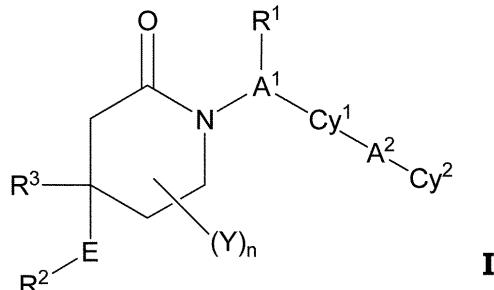
G は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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

る塩、鏡像異性体又はジアステレオマー。

【請求項 6 5】

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 4】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は(b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OOC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=N)CN)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂N R⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、R⁴OOC(=O)NHS(=O)₂-、R⁴OOC(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴OOC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、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；

A¹ は、(a) 結合、又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン、C H₂ C H₂ O (ここで、酸素は、Cy¹ に結合している)、若しくはC H₂ C(=O) (ここで、カルボニル炭素は、Cy¹ に結合している) であり；

Cy¹ 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)

アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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； A²は、(a)結合、O、S若しくはNR⁴、又は(b)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)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；

Cy²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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₂ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)

アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルカスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ -

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)₂N - 、 R^4O_2 C - 、 R^4S 、 R^4S (=O) - 、 R^4S (=O)₂ - 、 R^4C (=O) NR⁴、(R^4)₂NC (=O) - 、(R^4)₂NC (=O) O - 、(R^4)₂NC (=O) NR⁴ - 、 R^4OC (=O) NR⁴ - 、(R^4)₂NC (=NCN) NR⁴、(R^4O)₂P (=O) O - 、(R^4O)₂P (=O) NR⁴ - 、 R^4OS (=O)₂NR⁴ - 、(R^4)₂NS (=O)₂O - 、(R^4)₂NS (=O)₂NR⁴、 R^4S (=O)₂NR⁴ - 、 R^4S (=O)₂NHC (=O) - 、 R^4S (=O)₂NHC (=O) O - 、 R^4S (=O)₂NHC (=O) NR⁴、 R^4OS (=O)₂NHC (=O) - 、 R^4OS (=O)₂NHC (=O) O - 、 R^4OS (=O)₂NHC (=O) NR⁴、(R^4)₂NS (=O)₂NHC (=O) - 、(R^4)₂NS (=O)₂NHC (=O) NR⁴、 R^4C (=O) NHS (=O)₂O - 、 R^4C (=O) NHS (=O)₂NR⁴、 R^4OC (=O) NHS (=O)₂ - 、 R^4OC (=O) NHS (=O)₂O - 、 R^4OC (=O) NHS (=O)₂NR⁴、(R^4)₂NC (=O) NHS (=O)₂O - 、(R^4)₂NC (=O) NHS (=O)₂NR⁴、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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；

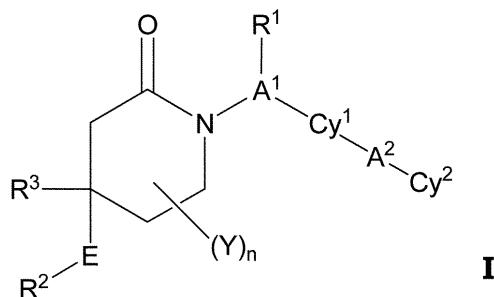
R^4 は、H、($C_1 - C_6$) アルキル、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル、アミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 - C_6$) アルキル及び ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

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 6 6】

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95】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は(b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O⁻、(R⁴)₂N⁻、R⁴O₂C⁻、R⁴S⁻、R⁴S(=O)⁻、R⁴S(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)⁻、(R⁴)₂NC(=O)O⁻、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴⁻、(R⁴O)₂P(=O)O⁻、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴⁻、R⁴OS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂O⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴C(=O)NH⁻S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O⁻、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；

A¹ は、(a) 結合、又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン、CH₂CH₂O (ここで、酸素は、Cy¹ に結合している)、若しくはCH₂C(=O) (ここで、カルボニル炭素は、Cy¹ に結合している) であり；

Cy¹ は、アリール、ヘテロアリール、单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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキル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、 $(C_1 - C_6)$ 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、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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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) $(C_2 - C_3)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_3 - C_6)$ 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、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC₆O、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)

) 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) $_2N^-$ 、 R^4O^- C^- 、 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) $_2P(=O)^-$ 、(R^4O) $_2P(=O)NR^4^-$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4^-$ 、(R^4) $_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4^-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)^-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O^-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)^-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、(R^4) $_2NS(=O)_2NHC(=O)^-$ 、(R^4) $_2NS(=O)_2NHC(=O)O^-$ 、(R^4) $_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2^-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O^-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2^-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O^-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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；

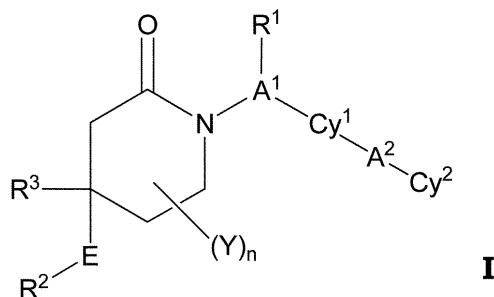
R^4 は、H、($C_1 - C_6$) アルキル、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル、アミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 - C_6$) アルキル及び ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキルから独立して選択されるが；

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 6 7】

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96】



[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)NR⁴ -、 $R^4OC(=O)NR^4$ -、(R^4)₂NC(=N)NR⁴ -、(R^4O)₂P(=O)O -、(R^4O)₂P(=O)NR⁴ -、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ -、(R^4)₂NS(=O)₂O -、(R^4)₂NS(=O)₂NR⁴ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ -、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)O -、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O$ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ -、 $R^4O_2C(=O)NHS(=O)_2$ -、 $R^4O_2C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ -、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂O -、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ -、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 ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_3 - C_6$) シクロアルキルチオ、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_4 - C_7$) シクロアルキルチオ、ハロ ($C_3 - C_6$) シクロアルキルチオ、ハロ ($C_4 - C_7$) シクロアルキルチオ、ハロ ($C_1 - C_6$) 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、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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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NR⁴；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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_3 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)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 、 $R^4S(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=NCN)NR^4$ 、 $(R^4O)_2P(=O)$ 、 O 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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、 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；

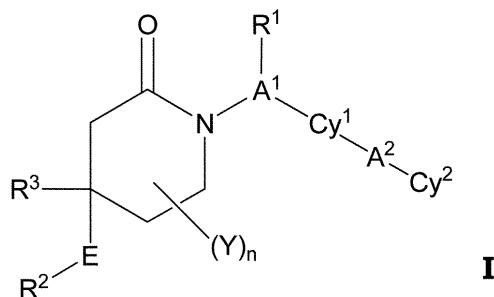
R^4 は、 H 、($C_1 - C_6$)アルキル、ハロ($C_1 - C_6$)アルキル、アミノ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルキルアミノ($C_1 - C_6$)アルキル、ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノ($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ($C_1 - C_6$)アルキル及び($C_1 - C_6$)アルコキシ($C_1 - C_6$)アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

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 6 8】

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97】



[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)NR⁴ -、 $R^4OC(=O)NR^4$ -、(R^4)₂NC(=N)NR⁴ -、(R^4O)₂P(=O)O -、(R^4O)₂P(=O)NR⁴ -、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ -、(R^4)₂NS(=O)₂O -、(R^4)₂NS(=O)₂NR⁴ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ -、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ -、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ -、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)O -、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O$ -、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ -、 $R^4O_2C(=O)NHS(=O)_2$ -、 $R^4O_2C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ -、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂O -、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ -、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($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_3 - C_6$) シクロアルキルチオ、ハロ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_4 - C_7$) シクロアルキルチオ、ハロ($C_3 - C_6$) シクロアルキルチオ、ハロ($C_4 - C_7$) シクロアルキルチオ、ハロ($C_1 - C_6$) 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、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、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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、○若しくはS；又は(b) $(C_2 - C_3)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_3 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、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、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₂ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₂ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)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 、 $(R^4)_2N$ 、 R^4O_2C 、 R^4S 、 $R^4S(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=NCN)NR^4$ 、 $(R^4O)_2P(=O)$ 、 O 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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くなく；

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。

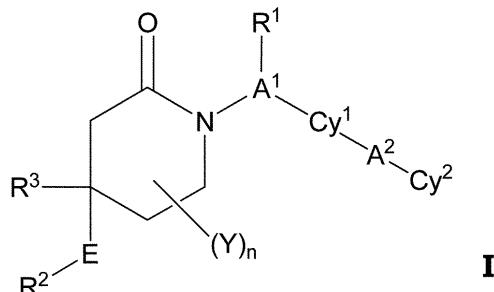
【請求項 6 9】

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 6 7 又は 6 8 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、

R¹は、(a)存在しないか、又は(b)(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、又は(C₁-C₃)アルコキシ(C₁-C₃)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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=N)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、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；

A¹は、(a)結合、又は(b)(C₁-C₃)アルキレン、CH₂CH₂O(ここで、酸素は、Cy¹に結合している)、若しくはCH₂C(=O)(ここで、カルボニル炭素は、Cy¹に結合している)であり；

Cy¹は、アリール、ヘテロアリール、单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、(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂-C₆)アルケニル、ハロ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄-C₇)シクロアル

キルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アルコキシ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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；A²は、(a)結合、O、S若しくはNR⁴；又は(b)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)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；

Cy²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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ -

- C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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、(C₁ - C₆) アルキル又はハロ(C₁ - C₆) 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)(C₁ - C₃) アルキレン若しくは(C₁ - C₂) アルキレニルオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆) 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) 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($C_1 - C_6$) 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⁻、 $R^4O_2^-$ 、 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)NR⁴⁻、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NC(=N)N⁻NR⁴、(R^4O)₂P(=O)⁻、(R^4O)₂P(=O)NR⁴⁻、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)⁻、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)^-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O^-$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)^-$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O^-$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O^-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NHC(=O)O^-$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、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、 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；

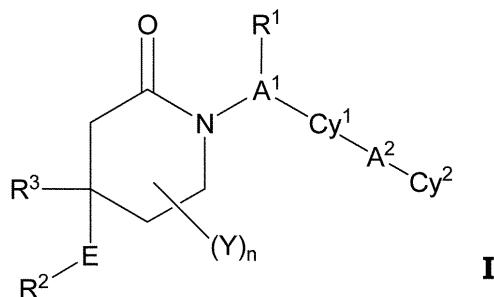
R^4 は、 H 、($C_1 - C_6$) アルキル、ハロ($C_1 - C_6$) アルキル、アミノ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ($C_1 - C_6$) アルキル、ヒドロキシ($C_1 - C_6$) アルキル及び($C_1 - C_6$) アルコキシ($C_1 - C_6$) アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

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99】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は(b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O⁻、(R⁴)₂N⁻、R⁴O₂C⁻、R⁴S⁻、R⁴S(=O)⁻、R⁴S(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)⁻、(R⁴)₂NC(=O)O⁻、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴⁻、(R⁴O)₂P(=O)O⁻、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴⁻、R⁴OS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂O⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴C(=O)NH⁻S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴⁻、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；

A¹ は、(a) 結合、又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン、CH₂CH₂O (ここで、酸素は、Cy¹ に結合している)、若しくはCH₂C(=O) (ここで、カルボニル炭素は、Cy¹ に結合している) であり；

Cy¹ 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、1H-ベンゾイミダゾール-6-イル、1H-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-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、单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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロ

アルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC₁O、H₂NSO₂、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、アルコキシ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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 NR⁴、又は (b) (C₁ - C₃) アルキレン若しくは (C₁ - C₂) 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；

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、($C_1 - C_6$) 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、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、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)($C_1 - C_2$) 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、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、($C_4 - C_7$) シクロアルキルチオ、($C_3 - C_6$) 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 (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ及び (C₁ - C₆) 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；

R³ は、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル；及び (C₁ - C₃) アルコキシ (C₂ - C₃) 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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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；

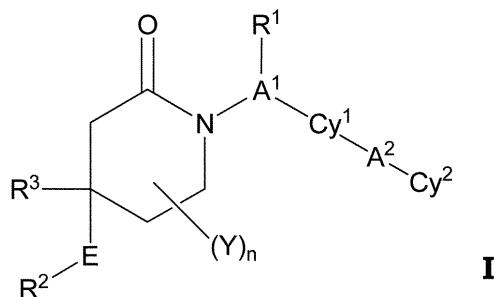
R⁴ は、H、(C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル及び (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

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 7 2】

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100】



[式中

R¹は、(a)存在しないか、又は(b)(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル又は(C₁-C₃)アルコキシ(C₁-C₃)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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NH(=O)₂NR⁴-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、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；

A¹は、(a)結合、又は(b)(C₁-C₃)アルキレン、CH₂CH₂O(ここで、酸素は、Cy¹に結合している)、若しくはCH₂C(=O)(ここで、カルボニル炭素は、Cy¹に結合している)であり；

Cy¹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、(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂-C₆)アルケニル、ハロ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₂-C₄)アルキニル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ、(C₄-C₇)シクロアルキルチオ、(C₁-C₆)アルカンスルフィニル、(C₃-C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁-C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルカ

$C_4 - C_7$) 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、($C_1 - C_6$) 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、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NR⁴、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；

Cy²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、(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂-C₆)アルケニル、ハロ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₂-C₄)アルキニル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₃-C₆)シクロアルキルチオ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁-C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁-C₆)アルカンスルフィニル、(C₃-C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁-C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁-C₆)アルカンスルホニル、(C₃-C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁-C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄-C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NSO₂、(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₃)アルコキシ(C₁-C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカノンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカノンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC₆O、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキル、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C

$C_1 - C_6$) アルキル $\underline{\text{アミノ}}$ ($C_2 - C_6$) 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_2 C - 、 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)NR⁴ - 、 $R^4OC(=O)NR^4$ - 、(R^4)₂NC(=NCN)NR⁴、(R^4O)₂P(=O)O - 、(R^4O)₂P(=O)NR⁴ - 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ - 、(R^4)₂NS(=O)₂O - 、(R^4)₂NS(=O)₂NR⁴、 $R^4S(=O)_2NR^4$ - 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ - 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ - 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)O$ - 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O) - 、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)O - 、(R^4)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ - 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O$ - 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂O - 、(R^4)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴、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；

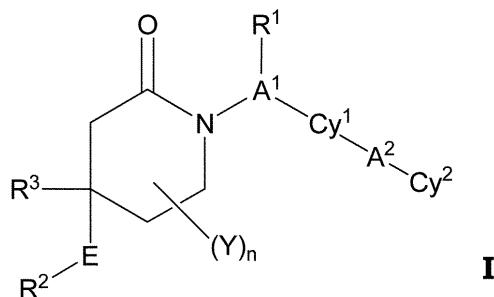
R^4 は、H、($C_1 - C_6$) アルキル、ハロ ($C_1 - C_6$) アルキル、アミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ ($C_1 - C_6$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 - C_6$) アルキル及び ($C_1 - C_6$) アルコキシ ($C_1 - C_6$) アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

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 7 3】

縁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101】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は(b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NH₂-、R⁴O₂C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴O₂C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴O₂C(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、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；

A¹ は、(a) 結合、又は(b) (C₁) アルキレン、CH₂CH₂O(ここで、酸素は、Cy¹ に結合している)、若しくはCH₂C(=O)(ここで、カルボニル炭素は、Cy¹ に結合している) であり；

Cy¹ は、アリール、ヘテロアリール、单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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、

$C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルカンスルフィニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルカンスルホニル、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルホニル、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルカンスルホニル、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルホニル、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシカルボニル、 H_2NCO 、 H_2NSO_2 、($C_{1\text{-}C_3}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_3}$) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノスルホニル、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルカルボニルアミノ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルカルボニルアミノ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルスルホニルアミノ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシカルボニル($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、ヒドロキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、アミノ($C_{2\text{-}C_6}$) アルコキシ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ($C_{2\text{-}C_6}$) アルコキシ、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ($C_{2\text{-}C_6}$) アルコキシ及び($C_{1\text{-}C_6}$) 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 NR⁴；又は(b)($C_{1\text{-}C_3}$) アルキレン若しくは($C_{1\text{-}C_2}$) 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；

C_y^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、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、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、ヒドロキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキル、ヒドロキシ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキル、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルキル、($C_{2\text{-}C_6}$) アルケニル、ハロ($C_{2\text{-}C_6}$) アルケニル、ヒドロキシ($C_{2\text{-}C_6}$) アルケニル、($C_{2\text{-}C_6}$) アルキニル、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキル($C_{2\text{-}C_4}$) アルキニル、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキル、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキル、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルキル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルコキシ、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルコキシ、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルコキシ、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルコキシ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルチオ、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキルチオ、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルチオ、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルキルチオ、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルキルチオ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルカンスルフィニル、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルフィニル、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルカン - スルフィニル、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルフィニル、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルカンスルフィニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルカンスルホニル、($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルホニル、($C_{4\text{-}C_7}$) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルカンスルホニル、ハロ($C_{3\text{-}C_6}$) シクロアルカンスルホニル、ハロ($C_{4\text{-}C_7}$) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、ハロ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシ、($C_{1\text{-}C_6}$) アルコキシカルボニル、 H_2NCO 、 H_2NSO_2 、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノカルボニル、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノカルボニル、($C_{1\text{-}C_3}$) アルコキシ($C_{1\text{-}C_3}$) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノスルホニル、ジ($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、($C_{1\text{-}C_6}$) アルキルカルボニルアミノ、($C_{1\text{-}C_6}$) ア

ルキルカルボニルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ及び (C₁ - C₆) 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、(C₁ - C₆) アルキル又はハロ (C₁ - C₆) 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) (C₁ - C₃) アルキレン若しくは (C₁ - C₂) アルキレンオキシであり、ここで、O は、R² 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；

R² は、(C₁ - C₆) 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ (C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ (C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ (C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル (C₂ - C₄) アルキニル、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ (C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C₁ - C₆) アルカン - スルフィニル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ (C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ (C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ (C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ (C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル (C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) 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 、 $(R^4)_2N$ 、 R^4O_2C 、 R^4S 、 $R^4S(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)$ 、 $(R^4)_2NC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=NCN)NR^4$ 、 $(R^4O)_2P(=O)$ 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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；

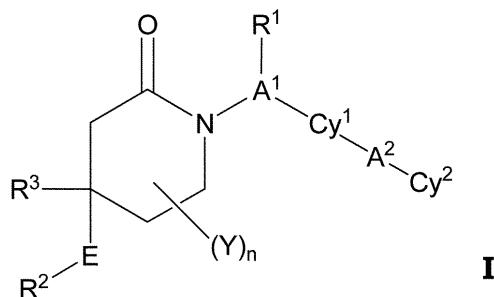
R^4 は、 H 、($C_1 - C_6$)アルキル、ハロ($C_1 - C_6$)アルキル、アミノ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルキルアミノ($C_1 - C_6$)アルキル、ジ($C_1 - C_6$)アルキルアミノ($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ($C_1 - C_6$)アルキル及び($C_1 - C_6$)アルコキシ($C_1 - C_6$)アルキルから独立して選択される]で示される化合物、或いは

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 7 4】

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102】



[式中、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は(b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O⁻、(R⁴)₂N⁻、R⁴O₂C⁻、R⁴S⁻、R⁴S(=O)⁻、R⁴S(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)⁻、(R⁴)₂NC(=O)O⁻、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴⁻、(R⁴O)₂P(=O)O⁻、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴⁻、R⁴OS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂O⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O⁻、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O⁻、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴C(=O)NH⁻S(=O)₂NR⁴⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O⁻、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂⁻、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O⁻、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；

A¹ は、(a) 結合、又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン、CH₂CH₂O (ここで、酸素は、Cy¹ に結合している)、若しくはCH₂C(=O) (ここで、カルボニル炭素は、Cy¹ に結合している) であり；

Cy¹ 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、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキル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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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NR⁴；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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_3 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル

ホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルア

ミノ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₂ - C₆) アルコキシ及び (C₁ - C₆) 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；

R³ は、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル及び (C₁ - C₃) アルコキシ (C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=N)N NR⁴、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴NS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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、CO₂H、CONH₂、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；

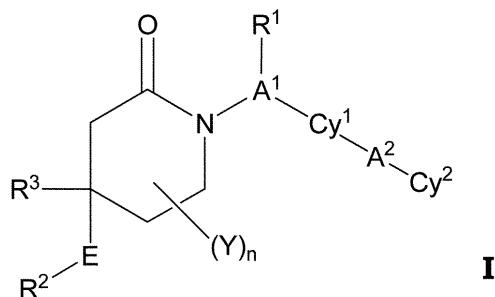
R⁴ は、H、(C₁ - C₆) アルキル、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、アミノ (C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ジ (C₁ - C₆) アルキルアミノ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル及び (C₁ - C₆) アルコキシ (C₁ - C₆) アルキルから独立して選択される] で示される化合物、或いは

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 7 5】

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、

R¹ は、(a) 存在しないか、又は (b) (C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は (C₁ - C₃) アルコキシ (C₁ - C₃) 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、R⁴、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=NCN)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴O₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂-、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、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：

A¹は、(a)結合、又は(b)(C₁-C₃)アルキレン、CH₂CH₂O(ここで、酸素は、C^y¹に結合している)、若しくはCH₂C(=O)(ここで、カルボニル炭素は、C^y¹に結合している)であり;

C_6^1 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(

$C_4 - C_7$) 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、○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、 $(C_1 - C_6)$ 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、 $(C_3 - C_6)$ 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、 $(C_1 - C_6)$ 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、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)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)(C₁ - C₃)アルキレン若しくは(C₁ - C₂)アルキレンオキシであり、ここで、Oは、R²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；

R²は、(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)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 、 $R^4S(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NR^4$ 、 $R^4OC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=NCN)NR^4$ 、 $(R^4O)_2P(=O)$ 、 O 、 $(R^4O)_2P(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NR^4$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $R^4S(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4OS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)O$ 、 $(R^4)_2NS(=O)_2NHC(=O)NR^4$ 、 $R^4C(=O)NHS(=O)_2$ 、 $R^4C(=O)NH$ 、 $S(=O)_2O$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $R^4OC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2O$ 、 $(R^4)_2NC(=O)NHS(=O)_2NR^4$ 、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 7 6】

A^1 が、結合である、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 7 7】

A^1 が、($C_1 - C_3$)アルキレンである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 7 8】

A^1 が、メチレンである、請求項 7 7 記載の方法。

【請求項 7 9】

A^1 が、CHであり、そして R^1 が存在する、請求項 6 5 ~ 7 5 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】

C_y^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】

C_y^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】

C_y^1 が、場合により置換されている单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】

C_y^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】

C_y^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】

C_y^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 C_y^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 C_y^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 C_y^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 C_y^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 C_y^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 C_y^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 C_y^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】

C_y^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】

C_y^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】

C_y^2 が、ジフルオロフェニルである、請求項 9 6 記載の方法。

【請求項 9 9】

C_y^2 が、フルオロフェニルである、請求項 9 6 記載の方法。

【請求項 1 0 0】

R^3 が、ヒドロキシ ($C_2 - C_5$) 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 0 1】

R^3 が、ジヒドロキシ ($C_3 - C_5$) 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 0 2】

R^3 が、 $-H_2NCO$ ($C_1 - C_3$) 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 0 3】

R^3 が、 $H_2NC(=O)CH_2CH_2$ 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 0 4】

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 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 1 0 5】

R^3 が、 H_2NSO_2O ($C_2 - C_4$) 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 0 6】

R^3 が、 H_2NSO_2NH ($C_2 - C_4$) 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 0 7】

R^3 が、オキソ ($C_2 - C_4$) 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 0 8】

R^3 が、アルケニルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 1 0 9】

R^3 が、アリルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 1 1 0】

R^3 が、 $MeC(=O)NH$ ($C_2 - C_4$) 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 1】

R^3 が、 $MeOC(=O)NH$ ($C_2 - C_4$) 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 2】

R^3 が、シアノアルキルである、請求項 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 1 1 3】

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 6 5 ~ 7 5 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 1 1 4】

R^3 が、 $MeS(=O)_2NH$ ($C_2 - C_4$) アルキルである、請求項 1 1 3 記載の方法。

【請求項 1 1 5】

R^3 が、 $MeS(=O)_2NHCH_2CH_2CH_2$ である、請求項 1 1 3 記載の方法。

【請求項 1 1 6】

R^3 が、アルキルヒドロ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 117】

R³ が、ヒドロキシアルコ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 118】

R³ が、アミノカルボ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 119】

R³ が、アミノカルボ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 120】

R³ が、2-(4-モルホリノ)エチルである、請求項 65～75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 121】

R³ が、2-(1-イミダゾリル)エチルである、請求項 65～75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 122】

R² 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 65～75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 123】

R² 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 122 記載の方法。

【請求項 124】

R² が、場合により置換されているフェニルである、請求項 123 記載の方法。

【請求項 125】

E が、結合である、請求項 124 記載の方法。

【請求項 126】

R² が、フルオロフェニルである、請求項 124 記載の方法。

【請求項 127】

R² が、場合により置換されているアルキルである、請求項 65～75 のいずれか一項記載の方法。

【請求項 128】

R² 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 127 記載の方法。

【請求項 129】

R¹ が、存在しないか、又はメチル若しくはエチルであり；
 A¹ が、結合若しくは CH₂ であり、又は R¹ が存在する場合、A¹ は、CH₂ であり；
 Cy¹ 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；

A² が、結合、O、OCH₂CO 又は C=O であり；

Cy² 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CH₂であり;

R²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;

R³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、H₂C=CH、HO-、MeO-、MeC(=O)、H₂N-、MeC(=O)NH-、MeS(=O)₂NH-、H₂NC(=O)-、MeNHC(=O)-、HO₂C-、HO-(CH₂)₂O-、(HO)₂P(=O)O-、H₂NS(=O)₂O-、H₂NS(=O)₂NH-、MeNHC(=O)NH-、MeNHC(=O)O-、シアノ、HO₂C-、HOCH₂CH₂NH-、4-モルホリノ、HOCH₂C(=O)NH-、H₂NCH₂C(=O)NH-、EtNHC(=O)NH、H₂NHC(=O)NH、H₂NHC(=O)O-、CH₃C(=O)-、MeOC(=O)NH-、Me-、MeS-、MeSO₂-、MeSO₂N(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、H₂NCONH-、H₂NCO₂-、HOCH₂CH₂O-、MeNH-、Me₂N-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;

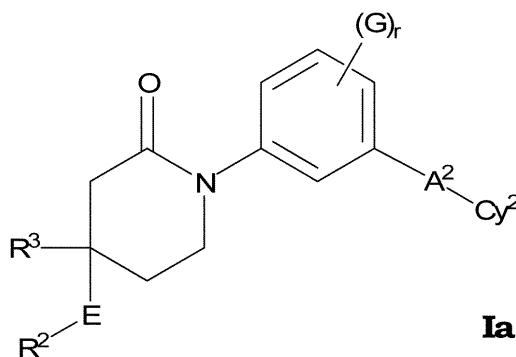
R⁵が、水素又はメチルである、

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

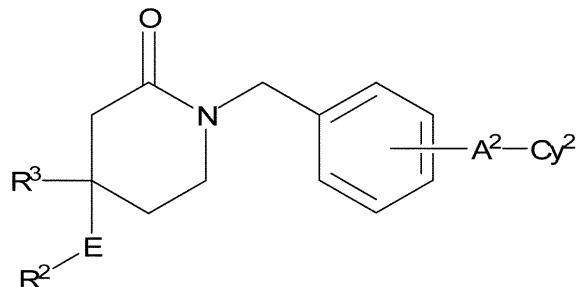
Gは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂-C₆)アルケニル、ハロ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₂-C₄)アルキニル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキ

ルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカン-スルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキル-スルホニル-アミノ-(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ又は(C₁ - C₆)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】

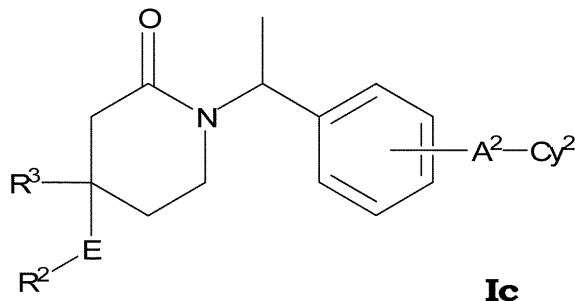
**Ib**

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106】

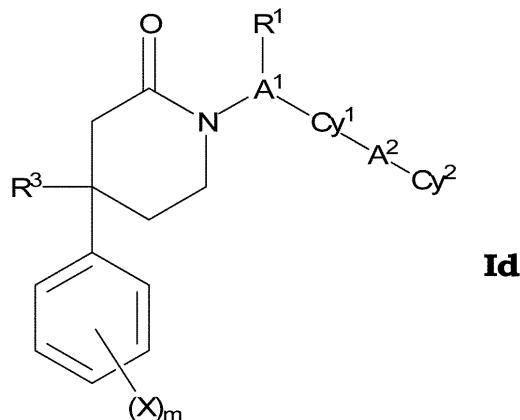


で示される化合物、或いはその薬学的に許容しうる塩、鏡像異性体又はジアステレオマーである、請求項65～75のいずれか一項記載の方法。

【請求項133】

化合物が、式(I d)：

【化107】



[式中、

mは、0、1、2、3又は4であり；そして

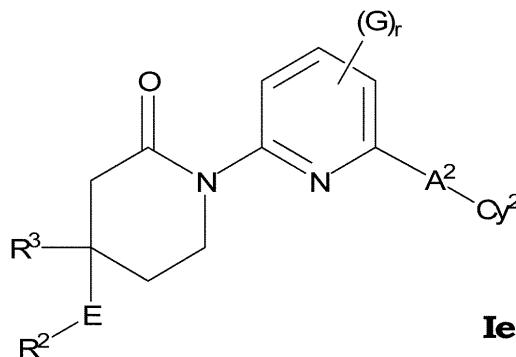
Xは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁～C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁～C₆)アルキル、(C₃～C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃～C₆)シクロアルキル、(C₄～C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂～C₆)アルケニル、ハロ(C₂～C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂～C₆)アルケニル、(C₂～C₆)アルキニル、(C₃～C₆)シクロアルキル(C₂～C₄)アルキニル、ハロ(C₁～C₆)アルキル、ハロ(C₃～C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄～C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁～C₆)アルコキシ、(C₃～C₆)シクロアルコキシ、(C₄～C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁～C₆)アルコキシ、ハロ(C₃～C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄～C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁～C₆)アルキルチオ、(C₃～C₆)シクロアルキルチオ、(C₄～C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁～C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃～C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄～C₇)アルカンスルフィニル、(C₃～C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄～C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁～C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃～C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄～C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁～C₆)アルカンスルホニル、(C₃～C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄～C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁～C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃～C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄～C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁～C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁

- C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキル-アミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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

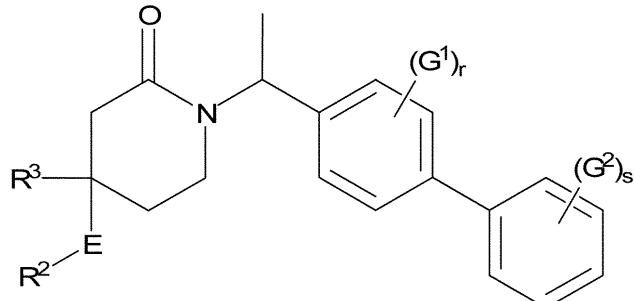
Gは、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキル-アルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロアルキル-アルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇) シクロアルキル-アルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)

- C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、オキソ、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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(I^f)：

【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

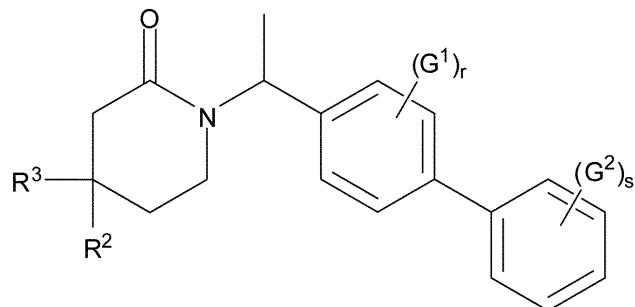
G¹及びG²は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、ハロ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₃ - C₆) シクロアルキル(C₂ - C₄) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆) アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンス

ルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロ-アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC(=O)、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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

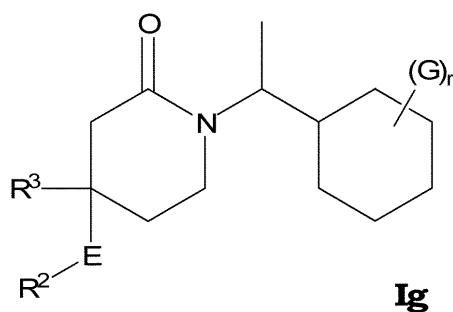
G¹ 及び G² は、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ

オ、(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆)アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル、H₂NC₆O、H₂NSO₂、(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆)アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシカルボニル(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₂ - C₆)アルコキシ及び(C₁ - C₆)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、(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₃ - C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆)シクロアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルキルチオ、(C₃ - C₆)シクロアルキルチオ、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキルチオ、ハロ(C₁ - C₆)アルキルチオ、ハロ(C₃

- C₆) シクロアルキルチオ、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルキルチオ、(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルフィニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルフィニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロアルキルアルカンスルフィニル、(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₁ - C₆) アルカンスルホニル、ハロ(C₃ - C₆) シクロアルカンスルホニル、ハロ(C₄ - C₇) シクロ - アルキルアルカンスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル、H₂NCO、H₂NSO₂、(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルアミノカルボニル、ヘテロシクリルカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ヘテロシクロスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルカルボニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、ヘテロアリール、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₂ - C₆) アルコキシ及び(C₁ - C₆) 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。