

【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17年11月10日(2005.11.10)

【公表番号】特表2001-513821(P2001-513821A)

【公表日】平成13年9月4日(2001.9.4)

【出願番号】特願平10-538772

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 207/404
 A 6 1 K 31/4015
 A 6 1 K 31/4174
 A 6 1 K 31/4178
 A 6 1 K 31/421
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 43/00
 C 0 7 D 233/78
 C 0 7 D 233/84
 C 0 7 D 233/86
 C 0 7 D 263/44
 C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 403/06
 C 0 7 D 409/06

【F I】

C 0 7 D 207/404
 A 6 1 K 31/4015
 A 6 1 K 31/4174
 A 6 1 K 31/4178
 A 6 1 K 31/421
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 233/78
 C 0 7 D 233/84

C 0 7 D 233/86
C 0 7 D 263/44
C 0 7 D 401/04
C 0 7 D 401/06
C 0 7 D 403/06
C 0 7 D 409/06

【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 平 成 17 年 3 月 3 日 (2005.3.3)

【 手 続 補 正 1 】

【 補 正 対 象 書 類 名 】 明 細 書

【 補 正 対 象 項 目 名 】 補 正 の 内 容 の と お り

【 補 正 方 法 】 変 更

【 補 正 の 内 容 】

手 続 補 正 書

平成 17.3.-3 年 月 日

特許庁長官 小 川 洋 殿



1. 事件の表示 平成10年特許願第538772号

2. 補正をする者

事件との関係 出 願 人

名 称 ベーリンガー／インゲルハイム
ファーマシューティカルズ インコーポレイテッド

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内3丁目3番1号
電話(代) 3211-8741

氏 名 (5995) 弁理士 中 村 稔

方 式 登 査



4. 補正命令の日付 自 発

5. 補正対象書類名 明細書

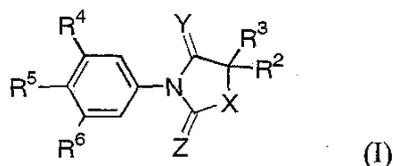
6. 補正対象項目名 請求の範囲

7. 補正の内容 別紙記載の通り



請求の範囲

1. 式Iの化合物またはその医薬上許される塩を含有することを特徴とする炎症性疾患または免疫細胞介在性疾患または症状の治療または予防用医薬組成物。



〔式中、

Yは酸素原子または硫黄原子であり、

Zは酸素原子または硫黄原子であり、

Xは式 $>CHR^1$ 、 $>NR^1$ 、 $>CHSO_2R^1$ 、もしくは $>NSO_2R^1$ の2価の基、または酸素原子もしくは硫黄原子であり、

式中、 R^1 は

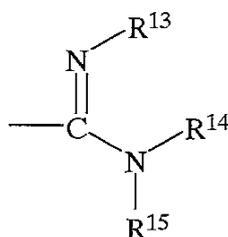
- (A) 水素原子、
- (B) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル〔そのアルキル基またはシクロアルキル基は
- (i) ハロゲン、
- (ii) オキソ、
- (iii) アリール〔これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フ

タラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリアル基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) -COOH,
- (c) -SO₂OH,
- (d) -PO(OH)₂,
- (e) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 -NR⁸R⁹ の基 (式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキル、3～6個の炭素原子のシクロアルキルもしくは1～7個の炭素原子のアシルであり、または R⁸ 及び R⁹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (g) 式 -CONR¹⁰R¹¹ の基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキルもしくは3～6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R¹⁰ 及び R¹¹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (h) 式 -OR^{12a} の基 (式中、R^{12a} は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 -SR^{12b} の基 (式中、R^{12b} は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、

- (j) シアノ、または
(k) 式



のアミノ基（式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい）

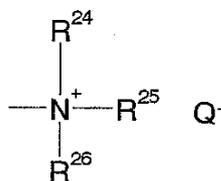
で置換されていてもよい）、

- (iv) 式 $-\text{COOR}^{16}$ の基（式中、 R^{16} は1~7個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (v) シアノ、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{17}\text{R}^{18}$ の基（式中、 R^{17} 及び R^{18} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{17} 及び R^{18} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する）、
- (vii) 式 $-\text{OR}^{19}$ の基（式中、 R^{19} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である）、
- (viii) 式 $-\text{SR}^{20}$ の基（式中、 R^{20} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシルである）、
- (ix) 式 $-\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ の基（式中、 R^{21} 及び R^{22} は夫々独立に
- (a) 水素原子、

- (b) 1~7個の炭素原子のアルキルもしくはアシルまたは3~7個の炭素原子のシクロアルキル、
- (c) 式 $-(CH_2)_mCOOH$ の基 (式中、 m は0、1または2である)、または
- (d) 式 $-(CH_2)_nCOOR^{23}$ の基 (式中、 n は0、1または2であり、 R^{23} は1~6個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルである) であり、または

R^{21} 及び R^{22} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、または

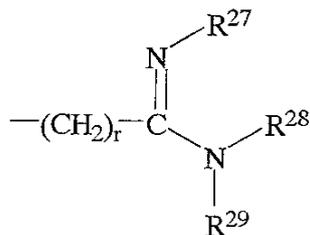
(x) 式



の四級基 (式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々独立に1~7個の炭素原子の分岐または非分岐アルキル基であり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである)

で一置換または多置換されていてもよい)、

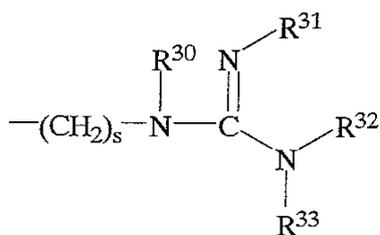
- (C) 3~6個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、
- (D) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、
- (E) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、
- (F) 式



のアミジノ基

(式中、rは2、3、4、5または6であり、かつ R²⁷、R²⁸ 及び R²⁹ は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R²⁷、R²⁸ 及び R²⁹ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、sは2、3、4、5または6であり、かつ R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
- (ii) 2~7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
- (iii) 2~5個の炭素原子のカルボン酸基、
- (iv) 1~6個の炭素原子のホスホン酸基、または
- (v) 1~6個の炭素原子のスルホン酸基

で置換されていてもよい)、または

(I) アリール〔これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル

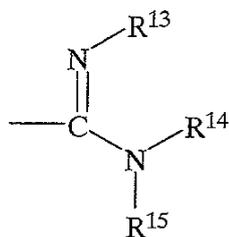
ル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリーール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、
- (v) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (vi) 式 -NR⁸R⁹ の基 (式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁸ 及び R⁹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 -CONR¹⁰R¹¹ の基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R¹⁰ 及び R¹¹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 -OR^{12a} の基 (式中、R^{12a} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 -SR^{12b} の基 (式中、R^{12b} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、

(x) シアノ、または

(xi) 式



のアミノ基

(式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または 1～3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3～5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)

で置換されていてもよい]

であり、

R^2 は

(A) 水素原子、または

(B) 1～3 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3～5 個の炭素原子のシクロアルキル (前記アルキル基またはシクロアルキル基は必要により

(i) 式 $-OR^{34}$ の基 (式中、 R^{34} は水素原子、または 1～7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または

(ii) 式 $-NR^{35}R^{36}$ の基 (式中、 R^{35} 及び R^{36} は夫々独立に水素原子、1～2 個の炭素原子のアルキル、または 1～2 個の炭素原子のアシルである)

で置換されていてもよい)

であり、

R^3 は式 $-(CR^{37}R^{38})_x(CR^{39}R^{40})_yR^{41}$ の基であり、

式中、

x 及び y は夫々独立に 0 または 1 であり、

R³⁷、R³⁸ 及び R³⁹ は夫々独立に

- (A) 水素原子、
- (B) 式 -OR⁴² の基 (式中、R⁴² は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または
- (C) 1~3 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルもしくは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキル

であり、

R⁴⁰ は

- (A) 水素原子、
- (B) 式 -OR⁴² の基 (式中、R⁴² は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (C) 1~3 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキル、または
- (D) アリール [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-,

3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、
6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、
2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテ
リジニル 及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラス
から選ばれ、

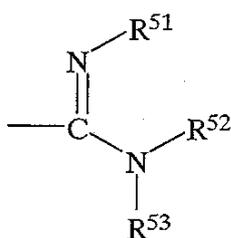
前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) R⁴³ (これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または
6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- また
は 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- また
は 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または
5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4-
または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリ
ル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-
イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-,
4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- ま
たは 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、
2-, 3-, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-
イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニ
ル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5-
または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾ
リル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6-
または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、
2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、
3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、
2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-
ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル 及び 2-,
6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれ
たアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により
独立に

- (a) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (b) -COOH、
- (c) -SO₂OH、
- (d) -PO(OH)₂、
- (e) 式 -COOR⁴⁴ の基（式中、R⁴⁴ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (f) 式 -NR⁴⁵R⁴⁶ の基（式中、R⁴⁵ 及び R⁴⁶ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルまたはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁴⁵ 及び R⁴⁶ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する）、
- (g) 式 -CONR⁴⁷R⁴⁸ の基（式中、R⁴⁷ 及び R⁴⁸ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルまたはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R⁴⁷ 及び R⁴⁸ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する）、

- (h) 式 $-OR^{49}$ の基 (式中、 R^{49} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 $-SR^{50}$ の基 (式中、 R^{50} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、
- (k) ニトロ、
- (l) 式



のアミノ基

(式中、 R^{51} 、 R^{52} 及び R^{53} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{51} 、 R^{52} 及び R^{53} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、または

- (m) ハロゲン、
で置換されていてもよい)、
- (ii) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{43} で一置換されていてもよい)、
- (iii) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキ

- ル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、
- (iv) 式 $-\text{COOR}^{54}$ の基 (式中、 R^{54} は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (v) 式 $-\text{NR}^{55}\text{R}^{56}$ の基 (式中、 R^{55} 及び R^{56} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R^{55} 及び R^{56} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{55} 及び R^{56} の一つは更に基 R^{43} であってもよい)、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{57}\text{R}^{58}$ の基 (式中、 R^{57} 及び R^{58} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{57} 及び R^{58} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{57} 及び R^{58} の一つは更に基 R^{43} であってもよい)、
- (vii) 式 $-\text{COR}^{59}$ の基 (式中、 R^{59} は水素原子、1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{43} である)、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{60}$ の基 (式中、 R^{60} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である)、
- (ix) 式 $-\text{SR}^{61}$ の基 (式中、 R^{61} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である)、

- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または
- (xii) ハロゲン、

で置換されていてもよい] であり、

R⁴¹ は

フェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、

前記アリアル基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (A) R⁶² [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または

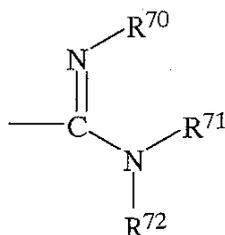
5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、

前記アリアル基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、

- (v) 式 $-\text{COOR}^{63}$ の基 (式中、 R^{63} は 1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (vi) 式 $-\text{NR}^{64}\text{R}^{65}$ の基 (式中、 R^{64} 及び R^{65} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6 個の炭素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素原子のアシルであり、または R^{64} 及び R^{65} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 $-\text{CONR}^{66}\text{R}^{67}$ の基 (式中、 R^{66} 及び R^{67} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{66} 及び R^{67} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-\text{SR}^{69}$ の基 (式中、 R^{69} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または

(xii) 式



のアミジノ基

(式中、 R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルであり、また R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、
または

(xiii) ハロゲン

で置換されていてもよい]、

- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{62} で一置換されていてもよい)、
- (C) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、
- (D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (E) 式 $-\text{NR}^{74}\text{R}^{75}$ の基 (式中、 R^{74} 及び R^{75} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアル

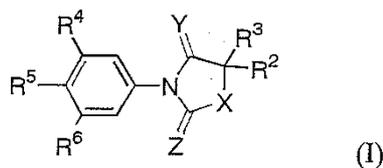
キルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁷⁴ 及び R⁷⁵ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R⁷⁴ 及び R⁷⁵ の一つが更に基 R⁶² であってもよい)、

- (F) 式 -CONR⁷⁶R⁷⁷ の基 (式中、R⁷⁶ 及び R⁷⁷ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R⁷⁶ 及び R⁷⁷ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R⁷⁶ 及び R⁷⁷ の一つが更に基 R⁶² であってもよい)、
- (G) 式 -COR⁷⁸ の基 (式中、R⁷⁸ は水素原子、1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5個の炭素原子のシクロアルキルまたは R⁶² である)、
- (H) 式 -OR⁷⁹ の基 (式中、R⁷⁹ は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R⁶² である)、
- (I) 式 -SR⁸⁰ の基 (式中、R⁸⁰ は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R⁶² である)、
- (J) シアノ、
- (K) ニトロ、または
- (L) ハロゲンで置換されていてもよく、

R⁴ は Cl またはトリフルオロメチルであり、かつ

R⁵ 及び R⁶ は夫々独立に水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子もしくはヨウ素原子、メチルまたはトリフルオロメチルである]

2. 式 I



の化合物またはその医薬上許される塩。

〔式中、

Yは酸素原子または硫黄原子であり、

Zは酸素原子または硫黄原子であり、

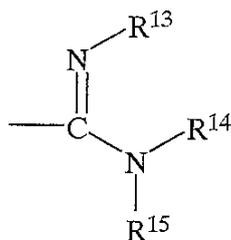
Xは式 $>CHR^1$ 、 $>NR^1$ 、 $>CHSO_2R^1$ 、もしくは $>NSO_2R^1$ の2価の基、または酸素原子もしくは硫黄原子であり、

式中、 R^1 は

- (A) 水素原子、
- (B) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル〔そのアルキル基またはシクロアルキル基は
 - (i) ハロゲン、
 - (ii) オキシ、
 - (iii) アリール〔これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフエニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフエニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) $-\text{COOH}$ 、
- (c) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
- (d) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、
- (e) 式 $-\text{COOR}^7$ の基 (式中、 R^7 は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 $-\text{NR}^8\text{R}^9$ の基 (式中、 R^8 及び R^9 は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキル、3～6個の炭素原子のシクロアルキルもしくは1～7個の炭素原子のアシルであり、または R^8 及び R^9 はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (g) 式 $-\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$ の基 (式中、 R^{10} 及び R^{11} は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキルもしくは3～6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{10} 及び R^{11} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (h) 式 $-\text{OR}^{12a}$ の基 (式中、 R^{12a} は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 $-\text{SR}^{12b}$ の基 (式中、 R^{12b} は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、または
- (k) 式



のアミノ基（式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい）

で置換されていてもよい]、

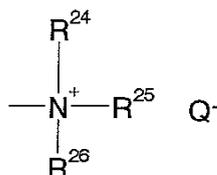
- (iv) 式 $-\text{COOR}^{16}$ の基（式中、 R^{16} は1~7個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (v) シアノ、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{17}\text{R}^{18}$ の基（式中、 R^{17} 及び R^{18} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{17} 及び R^{18} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する）、
- (vii) 式 $-\text{OR}^{19}$ の基（式中、 R^{19} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である）、
- (viii) 式 $-\text{SR}^{20}$ の基（式中、 R^{20} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である）、
- (ix) 式 $-\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ の基（式中、 R^{21} 及び R^{22} は夫々独立に
 - (a) 水素原子、
 - (b) 1~7個の炭素原子のアルキルもしくはアシルまたは3~7個の炭素原子のシクロアルキル、

(c) 式 $-(CH_2)_mCOOH$ の基 (式中、 m は 0、1 または 2 である)、または

(d) 式 $-(CH_2)_nCOOR^{23}$ の基 (式中、 n は 0、1 または 2 であり、 R^{23} は 1~6 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルである) であり、または

R^{21} 及び R^{22} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、または

(x) 式



の四級基 (式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々独立に 1~7 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキル基であり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである)

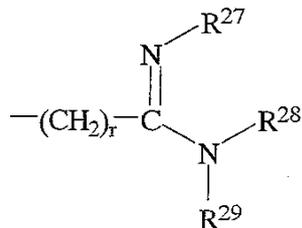
で一置換または多置換されていてもよい)、

(C) 3~6 個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、

(D) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、

(E) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、

(F) 式

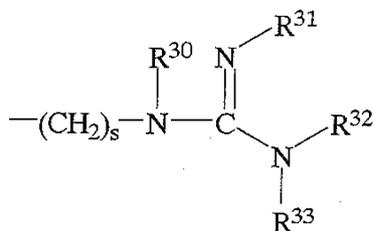


のアミジノ基

(式中、 r は 2、3、4、5 または 6 であり、かつ

R²⁷、R²⁸ 及び R²⁹ は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R²⁷、R²⁸ 及び R²⁹ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、s は 2、3、4、5 または 6 であり、かつ R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

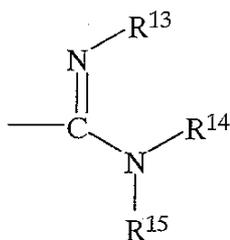
- (i) 1~3 個の炭素原子のアルキル、
 - (ii) 2~7 個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
 - (iii) 2~5 個の炭素原子のカルボン酸基、
 - (iv) 1~6 個の炭素原子のホスホン酸基、または
 - (v) 1~6 個の炭素原子のスルホン酸基
- で置換されていてもよい)、または

(I) アリール [これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、イ

ンダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、
- (v) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (vi) 式 -NR⁸R⁹ の基 (式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁸ 及び R⁹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 -CONR¹⁰R¹¹ の基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R¹⁰ 及び R¹¹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 -OR^{12a} の基 (式中、R^{12a} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 -SR^{12b} の基 (式中、R^{12b} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、または
- (xi) 式



のアミノ基

(式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または 1～3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3～5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)

で置換されていてもよい]

であり、

R^2 は

- (A) 水素原子、または
- (B) 1～3 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3～5 個の炭素原子のシクロアルキル (前記アルキル基またはシクロアルキル基は必要により)
 - (i) 式 $-OR^{34}$ の基 (式中、 R^{34} は水素原子、または 1～7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または
 - (ii) 式 $-NR^{35}R^{36}$ の基 (式中、 R^{35} 及び R^{36} は夫々独立に水素原子、1～2 個の炭素原子のアルキル、または 1～2 個の炭素原子のアシルである)

で置換されていてもよい)

であり、

R^3 は式 $-(CR^{37}R^{38})_x(CR^{39}R^{40})_yR^{41}$ の基であり、

式中、

x 及び y は夫々独立に 0 または 1 であり、

R^{37} 、 R^{38} 及び R^{39} は夫々独立に

- (A)水素原子、
 (B)式 $-OR^{42}$ の基 (式中、 R^{42} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または
 (C)1~3個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルもしくは3~5個の炭素原子のシクロアルキル
 であり、

R^{40} は

- (A)水素原子、
 (B)式 $-OR^{42}$ の基 (式中、 R^{42} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
 (C)1~3個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキル、または
 (D)アリール〔これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3-, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-,

6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル 及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) R⁴³ (これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3-, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル 及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

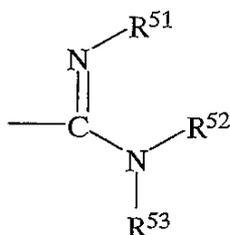
前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (a) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル

(そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、

- (b) $-\text{COOH}$ 、
- (c) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
- (d) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、
- (e) 式 $-\text{COOR}^{44}$ の基 (式中、 R^{44} は 1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 $-\text{NR}^{45}\text{R}^{46}$ の基 (式中、 R^{45} 及び R^{46} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルまたはフルオロアルキル、3~6 個の炭素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素原子のアシルであり、または R^{45} 及び R^{46} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (g) 式 $-\text{CONR}^{47}\text{R}^{48}$ の基 (式中、 R^{47} 及び R^{48} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルまたはフルオロアルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{47} 及び R^{48} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (h) 式 $-\text{OR}^{49}$ の基 (式中、 R^{49} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、

- (i) 式 $-SR^{50}$ の基 (式中、 R^{50} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、
- (k) ニトロ、
- (l) 式



のアミノ基

(式中、 R^{51} 、 R^{52} 及び R^{53} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{51} 、 R^{52} 及び R^{53} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、または

- (m) ハロゲン、
で置換されていてもよい)、
- (ii) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{43} で一置換されていてもよい)、
- (iii) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、

- (iv) 式 $-\text{COOR}^{54}$ の基 (式中、 R^{54} は 1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキルである) 、
- (v) 式 $-\text{NR}^{55}\text{R}^{56}$ の基 (式中、 R^{55} 及び R^{56} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6 個の炭素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素原子のアシルであり、または R^{55} 及び R^{56} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{55} 及び R^{56} の一つは更に基 R^{43} であってもよい) 、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{57}\text{R}^{58}$ の基 (式中、 R^{57} 及び R^{58} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{57} 及び R^{58} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{57} 及び R^{58} の一つは更に基 R^{43} であってもよい) 、
- (vii) 式 $-\text{COR}^{59}$ の基 (式中、 R^{59} は水素原子、1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5 個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{43} である) 、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{60}$ の基 (式中、 R^{60} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である) 、
- (ix) 式 $-\text{SR}^{61}$ の基 (式中、 R^{61} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である) 、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または

(xii) ハロゲン、
で置換されていてもよい] であり、

R⁴¹ は

フェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3-, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、

前記アリアル基の水素原子の少なくとも一つが

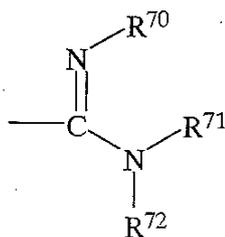
- (A) R⁶² [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル]

ル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル 及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、
- (v) 式 -COOR⁶³ の基（式中、R⁶³ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである）、

- (vi) 式 $-NR^{64}R^{65}$ の基 (式中、 R^{64} 及び R^{65} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R^{64} 及び R^{65} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 $-CONR^{66}R^{67}$ の基 (式中、 R^{66} 及び R^{67} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{66} 及び R^{67} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 $-OR^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-SR^{69}$ の基 (式中、 R^{69} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または
- (xii) 式



のアミジノ基

(式中、 R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルであり、また R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、
または

(xiv) ハロゲン

で置換されていてもよい)、

- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{62} で一置換されていてもよい)、
- (C) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、
- (D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (E) 式 $-\text{NR}^{74}\text{R}^{75}$ の基 (式中、 R^{74} 及び R^{75} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R^{74} 及び R^{75} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{74} 及び R^{75} の一つが更に基 R^{62} であってもよい)、

- (F) 式 $-\text{CONR}^{76}\text{R}^{77}$ の基 (式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{76} 及び R^{77} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{76} 及び R^{77} の一つが更に基 R^{62} であってもよい)、
- (G) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} は水素原子、1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{62} である)、
- (H) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (I) 式 $-\text{SR}^{80}$ の基 (式中、 R^{80} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (J) シアノ、
- (K) ニトロ、または
- (L) ハロゲン

で置換されており、

R^4 は Cl またはトリフルオロメチルであり、かつ

R^5 及び R^6 は夫々独立に水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子もしくはヨウ素原子、メチルまたはトリフルオロメチルである]

3.

Y が酸素原子または硫黄原子であり、

Z が酸素原子または硫黄原子であり、

X が式 $>\text{CHR}^1$ 、 $>\text{NR}^1$ 、 $>\text{CHSO}_2\text{R}^1$ 、もしくは $>\text{NSO}_2\text{R}^1$ の2価の基、または酸素原子もしくは硫黄原子であり、

式中、 R^1 が

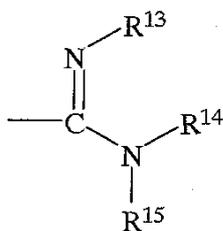
- (A) 水素原子、
- (B) 1～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基は
- (i) ハロゲン、
 - (ii) オキソ、
 - (iii) フェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリール

〔前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) -COOH、
- (c) -SO₂OH、
- (d) -PO(OH)₂、
- (e) 式 -COOR⁷ の基（式中、R⁷ は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (f) 式 -NR⁸R⁹ の基（式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキル、3～6個の炭素原子のシクロアルキルもしくは1～7個の炭素原子

のアシルであり、または R^8 及び R^9 はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、

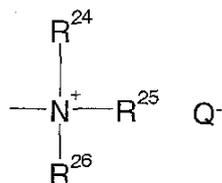
- (g) 式 $-\text{CONR}^{10}\text{R}^{11}$ の基 (式中、 R^{10} 及び R^{11} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{10} 及び R^{11} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (h) 式 $-\text{OR}^{12a}$ の基 (式中、 R^{12a} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 $-\text{SR}^{12b}$ の基 (式中、 R^{12b} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、または
- (k) 式



のアミジノ基 (式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)

で置換されていてもよい)、

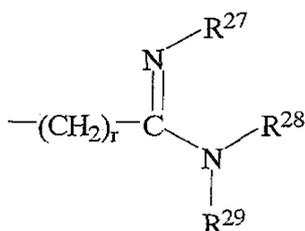
- (iv) 式 $-\text{COOR}^{16}$ の基 (式中、 R^{16} は 1~7 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (v) シアノ、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{17}\text{R}^{18}$ の基 (式中、 R^{17} 及び R^{18} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{17} 及び R^{18} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 $-\text{OR}^{19}$ の基 (式中、 R^{19} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (viii) 式 $-\text{SR}^{20}$ の基 (式中、 R^{20} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ の基 (式中、 R^{21} 及び R^{22} は夫々独立に
- (a) 水素原子、
 - (b) 1~7 個の炭素原子のアルキルもしくはアシルまたは 3~7 個の炭素原子のシクロアルキル、
 - (c) 式 $-(\text{CH}_2)_m\text{COOH}$ の基 (式中、 m は 0、1 または 2 である)、または
 - (d) 式 $-(\text{CH}_2)_n\text{COOR}^{23}$ の基 (式中、 n は 0、1 または 2 であり、 R^{23} は 1~6 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルである) であり、または
- R^{21} 及び R^{22} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、または
- (x) 式



の四級基（式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々独立に 1~7 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキル基であり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである）

で一置換されていてもよい）、

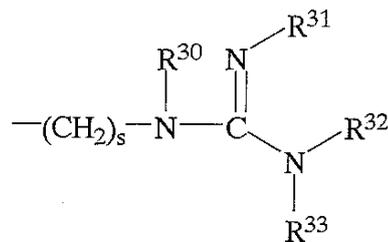
- (C) 3~6 個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、
- (D) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、
- (E) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、
- (F) 式



のアミノ基

（式中、 r は 2、3、4、5 または 6 であり、かつ R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい）、

- (G) 式



のグアニジノ基

(式中、sは2、3、4、5または6であり、かつ R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R³⁰、R³¹、R³² 及び R³³ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、または

(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
 - (ii) 2~7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
 - (iii) 2~5個の炭素原子のカルボン酸基、
 - (iv) 1~6個の炭素原子のホスホン酸基、または
 - (v) 1~6個の炭素原子のスルホン酸基
- で置換されていてもよい) であり、

R²は

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

R³は式 -CH₂R⁴¹の基であり、

式中、

R⁴¹は

フェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾ

リル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフエニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、

前記アリアル基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

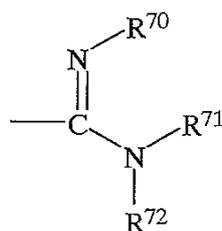
- (A) R⁶² [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフエニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフエニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾ

リル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、

前記アリアル基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) 1~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、
- (v) 式 -COOR⁶³ の基（式中、R⁶³ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (vi) 式 -NR⁶⁴R⁶⁵ の基（式中、R⁶⁴ 及び R⁶⁵ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁶⁴ 及び R⁶⁵ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する）、

- (vii) 式 $-\text{CONR}^{66}\text{R}^{67}$ の基 (式中、 R^{66} 及び R^{67} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{66} 及び R^{67} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-\text{SR}^{69}$ の基 (式中、 R^{69} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または
- (xii) 式



のアミジノ基

(式中、 R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルであり、また R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、
または

(xiii) ハロゲン

で置換されていてもよい]、

- (B) メチル（これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{62} で一置換されていてもよい）、
- (C) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基（式中、 R^{73} は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (E) 式 $-\text{NR}^{74}\text{R}^{75}$ の基（式中、 R^{74} 及び R^{75} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R^{74} 及び R^{75} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{74} 及び R^{75} の一つが更に基 R^{62} であってもよい）、
- (F) 式 $-\text{CONR}^{76}\text{R}^{77}$ の基（式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{76} 及び R^{77} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{76} 及び R^{77} の一つが更に基 R^{62} であってもよい）、

- (G) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} は水素原子、1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5 個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{62} である)、
- (H) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (I) 式 $-\text{SR}^{80}$ の基 (式中、 R^{80} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (J) シアノ、
- (K) ニトロ、または
- (L) ハロゲンで置換されており、

R^4 は Cl またはトリフルオロメチルであり、かつ

R^5 及び R^6 は夫々独立に水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子もしくはヨウ素原子、メチルまたはトリフルオロメチルである請求の範囲第 2 項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

4.

Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

X が式 $>\text{CHR}^1$ または $>\text{NR}^1$ の 2 価の基であり、

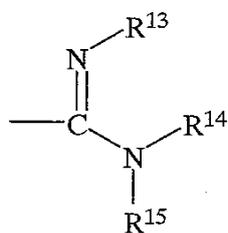
式中、 R^1 が

- (A) 水素原子、
- (B) 1~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基は
 - (i) オキソ、
 - (ii) フェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、

イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル及びトリアジニルからなるクラスから選ばれたアリアル

〔前記アリアル基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) -COOH、
- (c) -SO₂OH、
- (d) -PO(OH)₂、
- (e) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 -NH₂ の基、
- (g) 式 -CONH₂ の基
- (h) 式 -OR^{12a} の基 (式中、R^{12a} は水素原子またはメチルである)、
- (i) 式



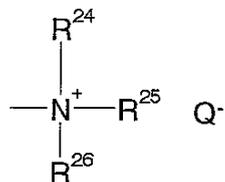
のアミノ基 (式中、R¹³、R¹⁴ 及び R¹⁵ は夫々水素原子である)

で置換されていてもよい]

- (iii) 式 -COOR¹⁶ の基 (式中、R¹⁶ は1～7個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキルである)、

(iv) 式 $-OR^{19}$ の基 (式中、 R^{19} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、

(v) 式



の四級基 (式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々メチルであり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである)

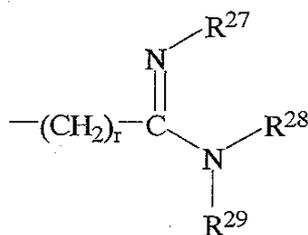
で一置換されているもよい)、

(C) 3~6 個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、

(D) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、

(E) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、

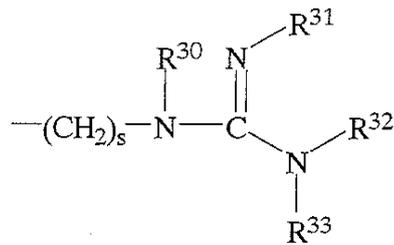
(F) 式



のアミジノ基

(式中、 r は 2、3、4、5 または 6 であり、かつ R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々水素原子である)、

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、sは2、3、4、5または6であり、かつ
R³⁰、R³¹、R³²及びR³³は夫々水素原子である)、または

(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
 - (ii) 2~7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
 - (iii) 2~5個の炭素原子のカルボン酸基、
 - (iv) 1~6個の炭素原子のホスホン酸基、または
 - (v) 1~6個の炭素原子のスルホン酸基
- で置換されていてもよい) であり、

R²が

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

R³が式 -CH₂R⁴¹の基であり、

式中、

R⁴¹は

フェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル及びトリアジニルからなるクラスから選ばれたアリアルであり、
前記アリアル基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

(A) R^{62} [これはフェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル及びトリアジニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) メチル、
- (ii) $-\text{COOH}$ 、
- (iii) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
- (iv) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、
- (v) 式 $-\text{COOR}^{63}$ の基 (式中、 R^{63} はメチルである)、
- (vi) 式 $-\text{NR}^{64}\text{R}^{65}$ の基 (式中、 R^{64} 及び R^{65} は夫々独立に水素原子またはメチルである)、
- (vii) 式 $-\text{CONR}^{66}\text{R}^{67}$ の基 (式中、 R^{66} 及び R^{67} は夫々独立に水素原子またはメチルである)、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子またはメチルである)、
- (ix) 式 $-\text{SR}^{69}$ の基 (式中、 R^{69} は水素原子またはメチルである)、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または
- (xii) ハロゲン

で置換されていてもよい]、

- (B) メチル（これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{62} で一置換されていてもよい）、
- (C) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (D) 式 $-COOR^{73}$ の基（式中、 R^{73} はメチルである）、
- (E) 式 $-NR^{74}R^{75}$ の基（式中、 R^{74} 及び R^{75} は夫々独立に水素原子またはメチルであり、また R^{74} 及び R^{75} の一つが更に基 R^{62} であってもよい）、
- (F) 式 $-CONR^{76}R^{77}$ の基（式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々独立に水素原子またはメチルであり、また R^{76} 及び R^{77} の一つが更に基 R^{62} であってもよい）、
- (G) 式 $-COR^{78}$ の基（式中、 R^{78} は水素原子、メチルまたは R^{62} である）、
- (H) 式 $-OR^{79}$ の基（式中、 R^{79} は水素原子、メチルまたは R^{62} である）、
- (I) 式 $-SR^{80}$ の基（式中、 R^{80} は水素原子、メチルまたは R^{62} である）、
- (J) シアノ、
- (K) ニトロ、または
- (L) ハロゲンで置換されており、

R^4 が Cl またはトリフルオロメチルであり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R^6 が Cl、またはトリフルオロメチルである請求の範囲第3項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

5.

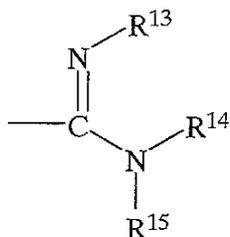
Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

X が式 $>CHR^1$ または $>NR^1$ の 2 価の基であり、

式中、 R^1 が

- (A) 水素原子、
- (B) 1～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基は
 - (i) オキソ、
 - (ii) フェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル及びトリアジニルからなるクラスから選ばれたアリール
 - 〔前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に
 - (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
 - (b) $-\text{COOH}$ 、
 - (c) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
 - (d) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、
 - (e) 式 $-\text{COOR}^7$ の基（式中、 R^7 は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
 - (f) 式 $-\text{NH}_2$ の基、
 - (g) 式 $-\text{CONH}_2$ の基
 - (h) 式 $-\text{OR}^{12a}$ の基（式中、 R^{12a} は水素原子またはメチルである）、
 - (i) 式



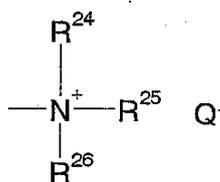
のアミジノ基（式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々水素原子である）

で置換されていてもよい）、

(iii) 式 —COOR^{16} の基（式中、 R^{16} は1～7個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキルである）、

(iv) 式 —OR^{19} の基（式中、 R^{19} は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である）、

(v) 式

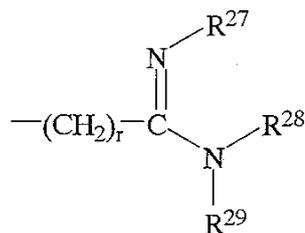


の四級基（式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々メチルであり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである）

で一置換されていてもよい）、

- (C) 3～6個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、
- (D) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、
- (E) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、

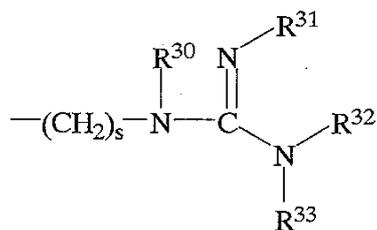
(F) 式



のアミノ基

(式中、 r は2、3、4、5または6であり、かつ
 R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々水素原子である)、

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、 s は2、3、4、5または6であり、かつ
 R^{30} 、 R^{31} 、 R^{32} 及び R^{33} は夫々水素原子である)、または

(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
 - (ii) 2~7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
 - (iii) 2~5個の炭素原子のカルボン酸基、
 - (iv) 1~6個の炭素原子のホスホン酸基、または
 - (vi) 1~6個の炭素原子のスルホン酸基
- で置換されていてもよい) であり、

 R^2 が

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

 R^3 が式 $\text{---CH}_2\text{R}^{41}$ の基であり、

式中、

R⁴¹は

フェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、及びピラジニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

- (A) R⁶²〔これはフェニル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、及びピラジニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に
- (i) メチル、
 - (ii) -COOH、
 - (iii) 式-COOR⁶³の基（式中、R⁶³はメチルである）、
 - (iv) 式-OR⁶⁸の基（式中、R⁶⁸は水素原子またはメチルである）、または
 - (v) ハロゲン
- で置換されていてもよい〕、
- (B) メチル（これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、またはR⁶²で一置換されていてもよい）、
- (C) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキ

ル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、

- (D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} はメチルである)、
- (E) 式 $-\text{CONR}^{76}\text{R}^{77}$ の基 (式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々メチルであり、また R^{76} 及び R^{77} の一つがメチルであり、かつ別の基が基 R^{62} である)、
- (F) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (G) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (H) シアノ、
- (I) ニトロ、または
- (J) ハロゲンで置換されており、

R^4 が Cl またはトリフルオロメチルであり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R^6 が Cl、またはトリフルオロメチルである請求の範囲第4項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

6.

Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

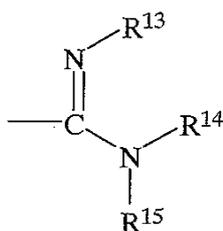
X が式 $>\text{CHR}^1$ または $>\text{NR}^1$ の2価の基であり、

式中、 R^1 が

- (A) 水素原子、
- (B) 1～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基は
 - (i) オキソ、
 - (ii) フェニルまたはピリジルからなるクラスから選ばれたアリール

〔前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

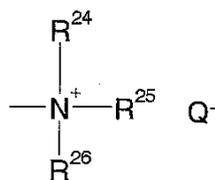
- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) -COOH、
- (c) -SO₂OH、
- (d) -PO(OH)₂、
- (e) 式 -OR^{12a} の基 (式中、R^{12a} は水素原子またはメチルである)、
- (f) 式



のアミノ基 (式中、R¹³、R¹⁴ 及び R¹⁵ は夫々水素原子である)

で置換されていてもよい)

- (iii) 式 -OR¹⁹ の基 (式中、R¹⁹ は水素原子、または1～7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または
- (iv) 式

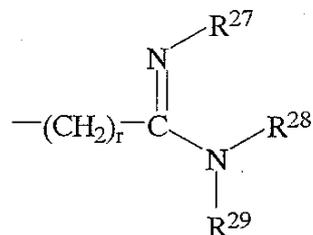


の四級基 (式中、R²⁴、R²⁵ 及び R²⁶ は夫々メチルであり、かつ Q⁻ は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである)

で置換されていてもよい)、

- (C) 3～6個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、

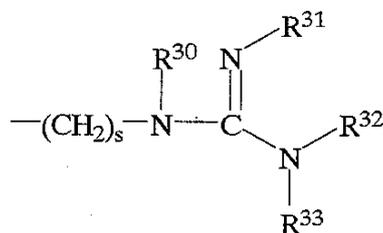
- (D) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、
 (E) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、
 (F) 式



のアミノ基

(式中、rは2、3、4、5または6であり、かつ
 R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々水素原子である)、

- (G) 式



のグアニジノ基

(式中、sは2、3、4、5または6であり、かつ
 R^{30} 、 R^{31} 、 R^{32} 及び R^{33} は夫々水素原子である)、または

- (H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により
 (i) 1～3個の炭素原子のアルキル、
 (ii) 2～7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
 (iii) 2～5個の炭素原子のカルボン酸基、
 (iv) 1～6個の炭素原子のホスホン酸基、または
 (vii) 1～6個の炭素原子のスルホン酸基
 で置換されていてもよい) であり、

R^2 が

- (A) 水素原子、または

(B) メチルであり、
 R^3 が式 $-\text{CH}_2R^{41}$ の基であり、
 式中、

R^{41} は

フェニルまたはピリジルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

(A) R^{62} [これはフェニル、またはピリジルからなるクラスから選ばれたアリールであり、
 前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

(i) メチル、

(ii) $-\text{COOH}$ 、

(iii) 式 $-\text{COOR}^{63}$ の基 (式中、 R^{63} はメチルである)、

(iv) 式 $-\text{OR}^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子またはメチルである)、または

(v) ハロゲン

で置換されていてもよい)、

(B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、または R^{62} で一置換されていてもよい)、

(C) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はフッ素またはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、

(D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} はメチルである)、

- (E) 式 $-\text{CONR}^{76}\text{R}^{77}$ の基 (式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々メチルであり、また R^{76} 及び R^{77} の一つがメチルであり、かつ別の基が基 R^{62} である)、
- (F) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (G) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (H) シアノ、
- (I) ニトロ、または
- (J) ハロゲンで置換されており、

R^4 が塩素原子またはトリフルオロメチルであり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R^6 が塩素原子、またはトリフルオロメチルである請求の範囲第5項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

7.

Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

X が式 $>\text{CHR}^1$ または $>\text{NR}^1$ の2価の基であり、

式中、 R^1 が

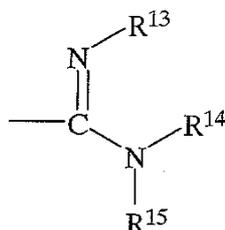
- (A) 水素原子、
- (B) 1～2個の炭素原子のアルキル (これは
 - (i) オキソ、
 - (ii) フェニルまたはピリジルからなるクラスから選ばれたアリール

[前記アリール基の一つの水素原子は必要により

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) $-\text{COOH}$ 、
- (c) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
- (d) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、

(e) 式 $-OR^{12a}$ の基 (式中、 R^{12a} は水素原子またはメチルである)、または

(f) 式



のアミノ基 (式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々水素原子である)

で置換されていてもよい)、または

(iii) 式 $-OR^{19}$ の基 (式中、 R^{19} は水素原子またはメチルである)

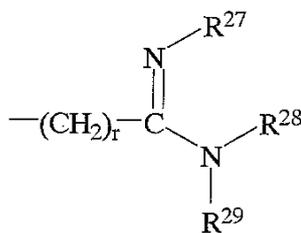
で一置換されていてもよい)、

(C) 3~6個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、

(D) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、

(E) 2~6個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、

(F) 式

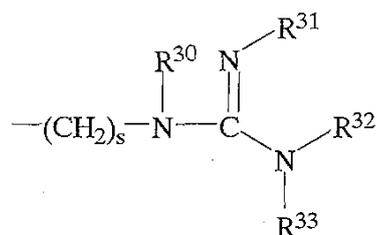


のアミノ基

(式中、 r は 2、3、4、5 または 6 であり、かつ

R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々水素原子である)、または

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、sは2、3、4、5または6であり、
R³⁰、R³¹、R³²及びR³³は夫々水素原子である)
であり、

R²が

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

R³が式-CH₂R⁴¹の基であり、

式中、

R⁴¹は

フェニルであり、

前記フェニル基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

- (A) R⁶² [これはフェニル、またはピリジルからなるクラスから選ばれたアリールであり、
前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に
 - (i) メチル、
 - (ii) 式-COOR⁶³の基 (式中、R⁶³はメチルである)、
 - (iii) 式-OR⁶⁸の基 (式中、R⁶⁸は水素原子またはメチルである)、または
 - (iv) ハロゲン
 で置換されているもよい]、

- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、または R^{62} で一置換されていてもよい)、
- (C) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} はメチルである)、
- (D) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} はメチルまたは R^{62} である)、
- (E) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (F) シアノ、
- (G) ニトロ、または
- (H) ハロゲンで置換されており、

R^4 が塩素原子またはトリフルオロメチルであり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R^6 が塩素原子、またはトリフルオロメチルである請求の範囲第6項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

8.

Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

X が式 $>\text{NR}^1$ の2価の基であり、

式中、 R^1 が

- (A) 水素原子、
- (B) メチルもしくはエチル、または
- (C) $-\text{COCH}_3$ であり、

R^2 が

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

R^3 が式 $-\text{CH}_2\text{R}^{41}$ の基であり、

式中、

R^{41} は

フェニルであり、

前記フェニル基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

- (A) R^{62} [これはフェニル、またはピリジルからなるクラスから選ばれたアリールであり、
前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に
(i) メチル、
(ii) $-COOR^{63}$ の基 (式中、 R^{63} はメチルである)、
(iii) 式 $-OR^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子またはメチルである)、または
(iv) ハロゲン
で置換されていてもよい]、
- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、または R^{62} で一置換されていてもよい)、
- (C) 式 $-COOR^{73}$ の基 (式中、 R^{73} はメチルである)、
- (D) 式 $-COR^{78}$ の基 (式中、 R^{78} はメチルまたは R^{62} である)、
- (E) 式 $-OR^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、メチルまたは R^{62} である)、
- (F) シアノ、
- (G) ニトロ、または
- (I) ハロゲンで置換されており、

R^4 が塩素原子またはトリフルオロメチルであり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R^6 が塩素原子、またはトリフルオロメチルである請求の範囲第7項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

9.

Y が酸素原子であり、

Z が酸素原子であり、

X が式 $>NR^1$ の 2 価の基であり、

式中、 R^1 が

- (A) 水素原子、
- (B) メチルもしくはエチル、または
- (C) $-COCH_3$ であり、

R^2 が

- (A) 水素原子、または
- (B) メチルであり、

R^3 が式 $-CH_2R^{41}$ の基であり、

式中、

R^{41} は

フェニルであり、

前記フェニル基の水素原子の一つ以上が必ず独立に

- (A) R^{62} [これはフェニル、またはピリジルからなるクラスから選ばれたアリールであり、前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) メチル、または
- (ii) ハロゲン

で置換されていてもよい]、

- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよい)、

- (C) 式 $-COR^{78}$ の基 (式中、 R^{78} はメチルまたは R^{62} である)、

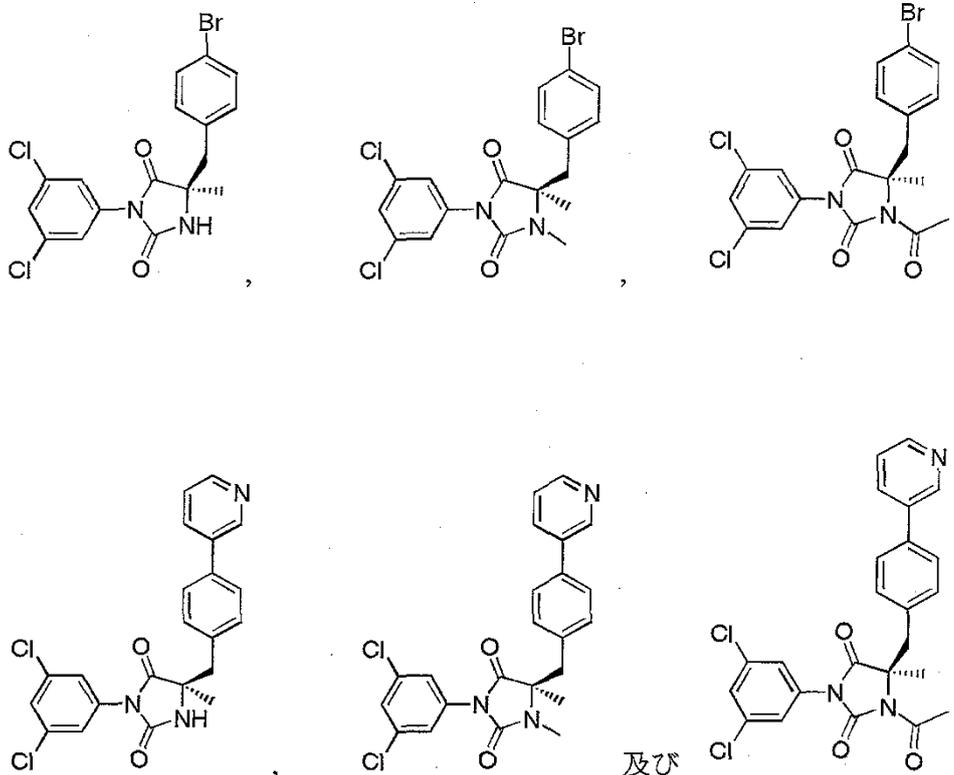
- (D) ハロゲンで置換されており、

R^4 が塩素原子であり、

R^5 が水素原子であり、かつ

R⁶ が塩素原子である請求の範囲第 8 項に記載の式 I の化合物またはその医薬上許される塩。

10.



からなる群から選ばれた化合物並びにこれらの医薬上許される塩。

11. 請求の範囲第 2 項、第 3 項、第 4 項、第 5 項、第 6 項、第 7 項、第 8 項、第 9 項または第 10 項に記載の化合物を含有することを特徴とする炎症性疾患、免疫細胞介在性疾患または症状の治療または予防用医薬組成物。

12. 疾患または症状が成人呼吸困難症候群、ショック、酸素毒、敗血症に二次的な多発性臓器損傷症候群、トラウマに二次的な多発性臓器損傷症候群、心肺バイパス、心筋梗塞または血栓崩壊剤による使用のための組織の再灌流損傷、急性腎炎、脈管炎、反応性関節炎、急性炎症性成分による皮膚炎、卒中、熱的損傷、血液透析、白血球搬出、潰瘍性大腸炎、壊死性全腸炎及び顆粒細胞移入関連症候群からなる群から選ばれる請求の範囲第 1 項または第 11 項に記載の医薬組成物。

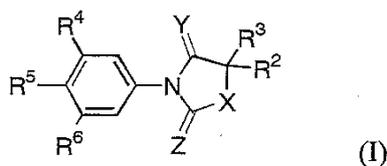
13. 疾患または症状が乾癬、臓器／組織移植片拒絶、移植片対宿主反応及びレイノー症候群を含む自己免疫疾患、自己免疫甲状腺炎、皮膚炎、多発性硬化症、

慢性関節リウマチ、インスリン依存性真性糖尿病、ブドウ膜炎、クローン病及び潰瘍性大腸炎を含む炎症性腸疾患、及び全身性エリテマトーデスからなる群から選ばれる請求の範囲第1項または第11項に記載の医薬組成物。

14. 疾患または症状が喘息である請求の範囲第1項または第11項に記載の医薬組成物。

15. 症状がサイトカイン療法と関連する毒性である請求の範囲第1項または第11項に記載の医薬組成物。

16. 医薬上許される担体及び式 I



の化合物を含むことを特徴とする医薬組成物。

〔式中、

Y は酸素原子または硫黄原子であり、

Z は酸素原子または硫黄原子であり、

X は式 $>CHR^1$ 、 $>NR^1$ 、 $>CHSO_2R^1$ 、もしくは $>NSO_2R^1$ の 2 価の基、または酸素原子もしくは硫黄原子であり、

式中、 R^1 は

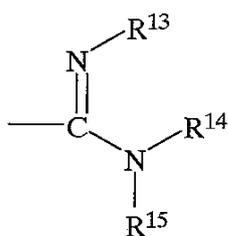
- (A) 水素原子、
- (B) 1~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル〔そのアルキル基またはシクロアルキル基は
 - (i) ハロゲン、
 - (ii) オキシ、
 - (iii) アリール〔これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニ

ル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリアル基の一つ以上の水素原子は必要により独立に

- (a) 1～3個の炭素原子のアルキル、
- (b) -COOH,
- (c) -SO₂OH,
- (d) -PO(OH)₂,
- (e) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1～5個の炭素原子の直鎖もしくは分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 -NR⁸R⁹ の基 (式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキル、3～6個の炭素原子のシクロアルキルもしくは1～7個の炭素原子のアシルであり、または R⁸ 及び R⁹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (g) 式 -CONR¹⁰R¹¹ の基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキルもしくは3～6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R¹⁰ 及び R¹¹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、

- (h) 式 $-OR^{12a}$ の基 (式中、 R^{12a} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 $-SR^{12b}$ の基 (式中、 R^{12b} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、または
- (k) 式

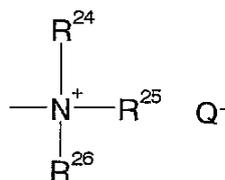


のアミノ基 (式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)

で置換されていてもよい]、

- (iv) 式 $-COOR^{16}$ の基 (式中、 R^{16} は 1~7 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (v) シアノ、
- (vi) 式 $-CONR^{17}R^{18}$ の基 (式中、 R^{17} 及び R^{18} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{17} 及び R^{18} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、

- (vii) 式 $-OR^{19}$ の基 (式中、 R^{19} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (viii) 式 $-SR^{20}$ の基 (式中、 R^{20} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-NR^{21}R^{22}$ の基 (式中、 R^{21} 及び R^{22} は夫々独立に
- 水素原子、
 - 1~7 個の炭素原子のアルキルもしくはアシルまたは 3~7 個の炭素原子のシクロアルキル、
 - 式 $-(CH_2)_mCOOH$ の基 (式中、 m は 0、1 または 2 である)、または
 - 式 $-(CH_2)_nCOOR^{23}$ の基 (式中、 n は 0、1 または 2 であり、 R^{23} は 1~6 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルである) であり、または
- R^{21} 及び R^{22} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (x) 式

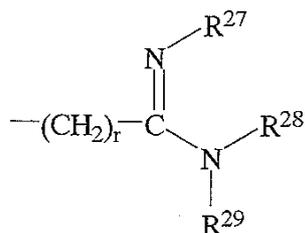


の四級基 (式中、 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は夫々独立に 1~7 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキル基であり、かつ Q^- は塩素対イオン、臭素対イオンまたはヨウ素対イオンである)

で一置換または多置換されていてもよい)、

- 3~6 個の炭素原子の分岐または非分岐カルボン酸基、
- 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐ホスホン酸基、
- 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐スルホン酸基、

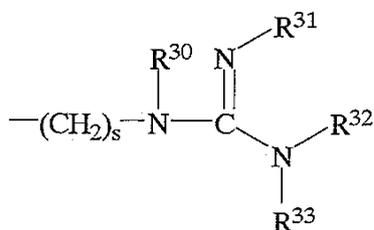
(F) 式



のアミノ基

(式中、 r は2、3、4、5または6であり、かつ R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R^{27} 、 R^{28} 及び R^{29} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

(G) 式



のグアニジノ基

(式中、 s は2、3、4、5または6であり、かつ R^{30} 、 R^{31} 、 R^{32} 及び R^{33} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R^{30} 、 R^{31} 、 R^{32} 及び R^{33} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

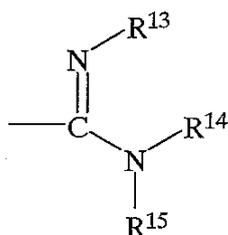
(H) ピペリジル (前記基の窒素原子は必要により

- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
- (ii) 2~7個の炭素原子のカルボン酸エステル基、
- (iii) 2~5個の炭素原子のカルボン酸基、
- (iv) 1~6個の炭素原子のホスホン酸基、または

- (v) 1~6個の炭素原子のスルホン酸基
で置換されていてもよい)、
- (I) アリール〔これはフェニル、ナフチル、インドリル、チオフェニル、ピリジル、ピリミジニル、フリル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イミダゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、インドリジニル、イソインドリル、ベンゾ[b]フラニル、ベンゾ[b]チオフェニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、イソキノリニル、プリニル、キノリジニル、シノリニル、フタラニニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、プテリジニル及びキナゾリニルからなるクラスから選ばれ、
前記アリール基の一つ以上の水素原子は必要により独立に
- (i) 1~3個の炭素原子のアルキル、
- (ii) -COOH、
- (iii) -SO₂OH、
- (iv) -PO(OH)₂、
- (v) 式 -COOR⁷ の基 (式中、R⁷ は1~5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (vi) 式 -NR⁸R⁹ の基 (式中、R⁸ 及び R⁹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキル、3~6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1~7個の炭素原子のアシルであり、または R⁸ 及び R⁹ はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 -CONR¹⁰R¹¹ の基 (式中、R¹⁰ 及び R¹¹ は夫々独立に水素原子、1~6個の炭素原子のアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R¹⁰ 及び R¹¹ はそれ

らの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、

- (viii) 式 $-OR^{12a}$ の基 (式中、 R^{12a} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (ix) 式 $-SR^{12b}$ の基 (式中、 R^{12b} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、または
- (xi) 式



のアミノ基

(式中、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)

で置換されていてもよい]

であり、

R^2 は

- (A) 水素原子、
- (B) 1~3個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキル (前記アルキル基またはシクロアルキル基は必要により
 - (i) 式 $-OR^{34}$ の基 (式中、 R^{34} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または

- (ii) 式 $-NR^{35}R^{36}$ の基 (式中、 R^{35} 及び R^{36} は夫々独立に水素原子、1~2個の炭素原子のアルキル、または1~2個の炭素原子のアシルである)

で置換されていてもよい)

であり、

R^3 は式 $-(CR^{37}R^{38})_x(CR^{39}R^{40})_yR^{41}$ の基であり、

式中、

x 及び y は夫々独立に0または1であり、

R^{37} 、 R^{38} 及び R^{39} は夫々独立に

- (A) 水素原子、
 (B) 式 $-OR^{42}$ の基 (式中、 R^{42} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、または
 (C) 1~3個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルもしくは3~5個の炭素原子のシクロアルキル

であり、

R^{40} は

- (A) 水素原子、
 (B) 式 $-OR^{42}$ の基 (式中、 R^{42} は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基もしくはアシル基である)、
 (C) 1~3個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3~5個の炭素原子のシクロアルキル、または
 (D) アリール [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル]

ル、3-または4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, 3-, 6-または7-インドリジニル、2-, 3-, 5-または6-イソインドリル、2-, 3-, 5-または6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5-または6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5-または6-インダゾリル、2-, 5-または6-ベンゾチアゾリル、2-, 5-または6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6-または7-キノリニル、3-, 6-または7-イソキノリニル、2-または8-プリニル、2-, 3-, 7-または8-キノリジニル、3-, 6-または7-シノリニル、6-または7-フタラニニル、2-, 3-, 6-または7-キノキサリニル、2-, 3-, 6-または7-ナフチリジニル、2-, 6-または7-プテリジニル及び2-, 6-または7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれ、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

- (i) R⁴³ (これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5-または6-インドリル、2-または3-チオフェニル、2-, 3-または4-ピリジル、2-, 4-または5-ピリミジニル、2-または3-フリル、1-, 2-または3-ピロリル、2-, 4-または5-オキサゾリル、2-, 4-または5-チアゾリル、1-, 3-, 4-または5-ピラゾリル、3-, 4-または5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4-または5-イミダゾリル、3-, 4-または5-イソチアゾリル、4-または5-オキサジアゾリル、1-, 4-または5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3-または4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, 3-, 6-または7-インドリジニル、2-, 3-, 5-または6-イソインドリル、2-, 3-, 5-または6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5-または6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5-または6-インダゾリル、2-, 5-または6-ベンゾチアゾリル、2-, 5-または6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6-または7-キノリニル、3-, 6-または7-イソキノリニル、

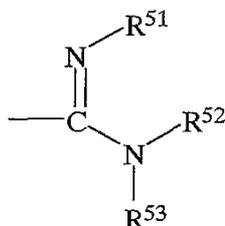
2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、
3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、
2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-
ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル 及び 2-,
6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれ
たアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により
独立に

- (a) 1~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキル
または 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル
(そのアルキル基またはシクロアルキル基は
ハロゲンまたはオキソで一置換または多置換
されていてもよい)、
- (b) -COOH、
- (c) -SO₂OH、
- (d) -PO(OH)₂、
- (e) 式 -COOR⁴⁴ の基 (式中、R⁴⁴ は 1~5 個の炭
素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5
個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (f) 式 -NR⁴⁵R⁴⁶ の基 (式中、R⁴⁵ 及び R⁴⁶ は
夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のア
ルキルまたはフルオロアルキル、3~6 個の炭
素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素
原子のアシルであり、または R⁴⁵ 及び R⁴⁶ は
それらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成
する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッ
ジを構成する)、
- (g) 式 -CONR⁴⁷R⁴⁸ の基 (式中、R⁴⁷ 及び R⁴⁸ は
夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のア

ルキルまたはフルオロアルキルまたは3~6個の炭素原子のシクロアルキルであり、またはR⁴⁷及びR⁴⁸はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、

- (h) 式 -OR⁴⁹ の基 (式中、R⁴⁹ は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (i) 式 -SR⁵⁰ の基 (式中、R⁵⁰ は水素原子、または1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (j) シアノ、
- (k) ニトロ、
- (l) 式



のアミノ基

(式中、R⁵¹、R⁵² 及び R⁵³ は夫々独立に水素原子または1~3個の炭素原子のアルキルであり、また R⁵¹、R⁵² 及び R⁵³ の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3~5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、または

- (m) ハロゲン、
で置換されていてもよい)、

- (ii) メチル（これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{43} で一置換されていてもよい）、
- (iii) 2～6個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキル（そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい）、
- (iv) 式 $-\text{COOR}^{54}$ の基（式中、 R^{54} は1～5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは3～5個の炭素原子のシクロアルキルである）、
- (v) 式 $-\text{NR}^{55}\text{R}^{56}$ の基（式中、 R^{55} 及び R^{56} は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3～6個の炭素原子のシクロアルキルまたは1～7個の炭素原子のアシルであり、または R^{55} 及び R^{56} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{55} 及び R^{56} の一つは更に基 R^{43} であってもよい）、
- (vi) 式 $-\text{CONR}^{57}\text{R}^{58}$ の基（式中、 R^{57} 及び R^{58} は夫々独立に水素原子、1～6個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは3～6個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{57} 及び R^{58} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する3～5個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{57} 及び R^{58} の一つは更に基 R^{43} であってもよい）、
- (vii) 式 $-\text{COR}^{59}$ の基（式中、 R^{59} は水素原子、1～5個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3～5個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{43} である）、

- (viii) 式 $-OR^{60}$ の基 (式中、 R^{60} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である)、
 - (ix) 式 $-SR^{61}$ の基 (式中、 R^{61} は水素原子、1~7個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{43} である)、
 - (x) シアノ、
 - (xi) ニトロ、または
 - (xii) ハロゲン、
- で置換されていてもよい] であり、

R^{41} は

フェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフエニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, -3, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフエニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-,

6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

(A) R^{62} [これはフェニル、2-ナフチル、2-, 3-, 5- または 6-インドリル、2- または 3-チオフェニル、2-, 3- または 4-ピリジル、2-, 4- または 5-ピリミジニル、2- または 3-フリル、1-, 2- または 3-ピロリル、2-, 4- または 5-オキサゾリル、2-, 4- または 5-チアゾリル、1-, 3-, 4- または 5-ピラゾリル、3-, 4- または 5-イソオキサゾリル、1-, 2-, 4- または 5-イミダゾリル、3-, 4- または 5-イソチアゾリル、4- または 5-オキサジアゾリル、1-, 4- または 5-トリアゾリル、2-チアジアゾリル、3- または 4-ピリダジニル、2-ピラジニル、2-トリアジニル、2-, 3-, 6- または 7-インドリジニル、2-, 3-, 5- または 6-イソインドリル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]フラニル、2-, 3-, 5- または 6-ベンゾ[b]チオフェニル、3-, 5- または 6-インダゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾチアゾリル、2-, 5- または 6-ベンゾイミダゾリル、2-, 3-, 6- または 7-キノリニル、3-, 6- または 7-イソキノリニル、2- または 8-プリニル、2-, 3-, 7- または 8-キノリジニル、3-, 6- または 7-シノリニル、6- または 7-フタラニニル、2-, 3-, 6- または 7-キノキサリニル、2-, 3-, 6- または 7-ナフチリジニル、2-, 6- または 7-プテリジニル及び 2-, 6- または 7-キナゾリニルからなるクラスから選ばれたアリールであり、

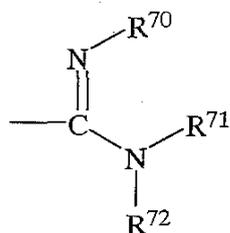
前記アリール基の水素原子の一つ以上が必要により独立に

(i) 1~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル

(そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されているとしてもよい)、

- (ii) $-\text{COOH}$ 、
- (iii) $-\text{SO}_2\text{OH}$ 、
- (iv) $-\text{PO}(\text{OH})_2$ 、
- (v) 式 $-\text{COOR}^{63}$ の基 (式中、 R^{63} は 1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (vi) 式 $-\text{NR}^{64}\text{R}^{65}$ の基 (式中、 R^{64} 及び R^{65} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6 個の炭素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素原子のアシルであり、または R^{64} 及び R^{65} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (vii) 式 $-\text{CONR}^{66}\text{R}^{67}$ の基 (式中、 R^{66} 及び R^{67} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{66} 及び R^{67} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成する)、
- (viii) 式 $-\text{OR}^{68}$ の基 (式中、 R^{68} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、

- (ix) 式 $-SR^{69}$ の基 (式中、 R^{69} は水素原子、または 1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基である)、
- (x) シアノ、
- (xi) ニトロ、または
- (xii) 式



のアミノ基

(式中、 R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} は夫々独立に水素原子または 1~3 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルであり、また R^{70} 、 R^{71} 及び R^{72} の二つはそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを更に構成してもよい)、

- (xiii) ハロゲン
で置換されていてもよい]、
- (B) メチル (これはフッ素原子で一置換または多置換されていてもよく、更に R^{62} で一置換されていてもよい)、
- (C) 2~6 個の炭素原子の分岐または非分岐アルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキル (そのアルキル基またはシクロアルキル基はハロゲンまたはオキソで一置換または多置換されていてもよい)、

- (D) 式 $-\text{COOR}^{73}$ の基 (式中、 R^{73} は 1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキルまたは 3~5 個の炭素原子のシクロアルキルである)、
- (E) 式 $-\text{NR}^{74}\text{R}^{75}$ の基 (式中、 R^{74} 及び R^{75} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキル、3~6 個の炭素原子のシクロアルキルまたは 1~7 個の炭素原子のアシルであり、または R^{74} 及び R^{75} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{74} 及び R^{75} の一つが更に基 R^{62} であってもよい)、
- (F) 式 $-\text{CONR}^{76}\text{R}^{77}$ の基 (式中、 R^{76} 及び R^{77} は夫々独立に水素原子、1~6 個の炭素原子のアルキルもしくはフルオロアルキルまたは 3~6 個の炭素原子のシクロアルキルであり、または R^{76} 及び R^{77} はそれらの間の窒素原子と一緒に複素環を形成する 3~5 個の炭素原子の飽和炭化水素ブリッジを構成し、また R^{76} 及び R^{77} の一つが更に基 R^{62} であってもよい)、
- (G) 式 $-\text{COR}^{78}$ の基 (式中、 R^{78} は水素原子、1~5 個の炭素原子の直鎖または分岐アルキル、3~5 個の炭素原子のシクロアルキルまたは R^{62} である)、
- (H) 式 $-\text{OR}^{79}$ の基 (式中、 R^{79} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (I) 式 $-\text{SR}^{80}$ の基 (式中、 R^{80} は水素原子、1~7 個の炭素原子のアルキル基、フルオロアルキル基もしくはアシル基、または R^{62} である)、
- (J) シアノ、
- (K) ニトロ、または

(L)ハロゲンで置換されていてもよく、

R⁴はClまたはトリフルオロメチルであり、かつ

R⁵及びR⁶は夫々独立に水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子もしくはヨウ素原子、メチルまたはトリフルオロメチルである]

17. 医薬上許される担体及び請求の範囲第2項、第3項、第4項、第5項、第6項、第7項、第8項、第9項または第10項に記載の化合物を含むことを特徴とする医薬組成物。