

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-534771(P2004-534771A)

【公表日】平成16年11月18日(2004.11.18)

【年通号数】公開・登録公報2004-045

【出願番号】特願2002-591441(P2002-591441)

【国際特許分類】

C 0 7 C 243/28 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 C 243/32 (2006.01)

C 0 7 C 311/16 (2006.01)

C 0 7 C 311/49 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/56 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 243/28

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 C 243/32

C 0 7 C 311/16

C 0 7 C 311/49

C 0 7 D 277/56

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月13日(2005.5.13)

【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

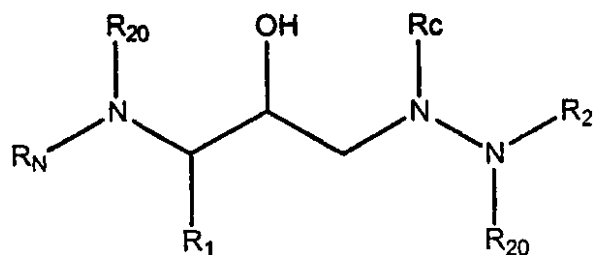
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IIの化合物：



(II)

またはその医薬として受容しうる塩、

式中 R_c は

(I) $-C_1-C_{10}$ アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-OC(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-S(=O)_{0-2}R_{1-a}$ 、 $-NR_{1-a}C(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、及び $-S(=O)_2NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から独立に選択された1, 2または3個の基で任意に置換されており、

その中の R_{1-a} 及び R_{1-b} は存在する毎にそれぞれ独立して H または C_1-C_6 アルキルであり、

(II) $-(CH_2)_{0-3}-(C_3-C_8)$ シクロアルキル、このシクロアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ アルキル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から独立に選択された1, 2または3個の基で任意に置換されることができ

(III) $-(CR_{c-x}R_{c-y})_{0-4}-R_c$ -アリール、その R_{c-x} 及び R_{c-y} は独立して下記からなる群より選択される、

$-H$

1または2個の $-OH$ で任意に置換された C_1-C_4 アルキル

1, 2, または3個のハロゲンで任意に置換された C_1-C_4 アルコキシ

$-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_8$ シクロアルキル

1または2個の二重結合を含む C_2-C_6 アルケニル

1または2個の三重結合、及びフェニルを含む C_2-C_6 アルキニル、及び

フェニル、

または

R_{c-x} 及び R_{c-y} は共に3, 4, 5, 6, または7炭素原子の炭素環を形成する炭素と結合し、そのひとつの炭素原子は任意に $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR_{N-2}$ 、及び R_c -アリール から選択された基で変換されており、その中の

R_c -アリール はフェニルであり、このフェニルは独立した下記の1, 2, または3個の基で任意に置換されている：

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2または3個の基で任意に置換され、

(2) $-OH$ 、

(3) $-NO_2$ 、

(4) ハロゲン、

(5) $-CO_2H$ 、

(6) $-C\equiv N$ 、

(7) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{N-2}R_{N-3}$

この R_{N-2} 及び R_{N-3} は下記の群から独立して選択される：

(a) -H

(b) $-C_1-C_6$ アルキル、このアルキルは下記群から選択した一つの置換基で任意に置換されている：

(i) -OH, 及び

(ii) $-NH_2$,

(c) $-C_1-C_6$ アルキル、このアルキルは独立して-F, -Cl, -Br, -I, またはOHである1, 2, または3個の基で任意に置換されている、

(d) $-C_3-C_7$ シクロアルキル ,

(e) $-(C_1-C_2 \text{ アルキル})-(C_3-C_7 \text{ シクロアルキル})$,

(f) $-(C_1-C_6 \text{ アルキル})-O-(C_1-C_3 \text{ アルキル})$,

(g) $-C_2-C_6$ アルケニル

(h) $-C_2-C_6$ アルキニル

(i) ひとつの二重結合及びひとつの三重結合をもつ $-C_1-C_6$ アルキル鎖、

(j) $-R_1$ -アリール, この R_1 -アリールは存在する毎に独立してフェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、またはテトラリニルであり、それぞれは独立に1, 2, 3または4個の下記の基で任意に置換されている：

(i) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-NR_{1-a}R_{1-b}$, -CN, $-CF_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは -F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) -F, -Cl, -Br及び-I、

(v) $-C_1-C_6$ アルコキシ、このアルコキシは1, 2, または3個の-Fで任意に置換されている、

(vi) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(vii) -OH,

(viii) $-C\equiv N$,

(ix) C_3-C_7 シクロアルキル ,

このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており、

(x) $-\text{CO}- (\text{C}_1-\text{C}_4 \text{ アルキル})$,

(xi) $-\text{SO}_2-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$,

(xii) $-\text{CO}-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, 又は

(xiii) $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4 \text{ アルキル})$,

(k) $-\text{R}_1$ -ヘテロアリール、この R_1 -ヘテロアリールは存在する毎に独立して、
 ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、
 ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリ
 ニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チ
 アゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベ
 ンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ト
 リアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリ
 ル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマ
 ニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラ
 ヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサ
 ズリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル
 、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル
 、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒド
 ロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベ
 ンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニ
 ル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジ
 ヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリ
 ニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキ
 サゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミジニル N-オキシド、ピリダジニル N-オ
 キシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、
 インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キ
 ノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イ
 ソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、イ
 ンドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド
 、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキ
 シド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキ
 シド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、か
 らなる群から選択され、

この R_1 -ヘテロアリール基は1, 2, 3, または4個の独立した下記基によって任意に置換
 されている:

(i) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$,
 $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, ま
 たは3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アル
 コキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意
 に置換されている、

(iii) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アル
 コキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任
 意に置換されている、

(iv) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, 及び $-\text{I}$ 、

(v) $-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシ、このアルコキシは1, 2, または3個の $-\text{F}$ で任意に置換されて

いる、

(vi) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$,

(vii) $-\text{OH}$,

(viii) $-\text{C}\equiv\text{N}$,

(ix) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{C}_3-\text{C}_7$ シクロアルキル ,

このシクロアルキルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ, 及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2または3個の基で任意に置換されている

(x) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{ アルキル})$,

(xi) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$,

(xii) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$,

(xiii) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{ アルキル})$,

(xiv) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-2})-\text{SO}_2-$, 及び

(xv) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-2})-\text{C}(\text{O})-$,

(8) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_{12} \text{ アルキル})$,

(9) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_2-\text{C}_{12} \text{ アルケニル})$,

(10) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_3-\text{C}_{12} \text{ アルキニル})$,

(11) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{CH}_2)_{0-4} (\text{C}_3-\text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$,

(12) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -アリール,

(13) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -ヘテロアリール,

(14) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -ヘテロサイクル、この R_1 -ヘテロサイクルはその存在毎にモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ペリリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、及びホモチオモルホリニル S-オキシド、からなる群から独立に選択され、

その R_1 -ヘテロサイクル基は、 R_1 -ヘテロサイクル基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_1 -ヘテロサイクル基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている:

(a) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(b) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(c) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{O}$

H, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₃アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(d) ハロゲン、

(e) C₁-C₆アルコキシ、

(f) -C₁-C₆アルコキシ、任意に1, 2, または3個の-Fで置換されている、

(g) -NR_{N-2}R_{N-3},

(h) -OH,

(i) -CN,

(j) (CH₂)₀₋₄-(C₃-C₇シクロアルキル)、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₃アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(k) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₄アルキル),

(l) -(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR_{1-a}R_{1-b},

(m) -(CH₂)₀₋₄-CO-NR_{1-a}R_{1-b},

(n) -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₆アルキル), 及び

(o) =O,

(p) -(CH₂)₀₋₄-N(R_{N-2})-SO₂-

(q) -(CH₂)₀₋₄-N(R_{N-2})-C(O)-

(15) -(CH₂)₀₋₄-CO-R_{N-4}、このR_{N-4}は存在毎にモルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジル N-オキシド、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピロリニル及びピロリジニルからなる群から独立に選択され、各基は独立してC₁-C₆アルキルである1, 2, 3, または4個の基で任意に置換されている、

(16) -(CH₂)₀₋₄-CO-R_{N-5}、このR_{N-5}は存在毎に下記からなる群から独立して選択されている：

- (a) C_1-C_6 アルキル,
- (b) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-アリール})$,
- (c) C_2-C_6 アルケニル,
- (d) C_2-C_6 アルキニル,
- (e) C_3-C_7 シクロアルキル, および
- (f) $-(CH_2)_{0-4}-(R_1\text{-ヘテロアリール})$,

- (17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$
- (18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_6\text{ アルキル})$,
- (19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}\text{ アルキル})$,
- (20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7\text{ シクロアルキル})$,
- (21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H\text{ 又は }R_{N-5})-CO_2-R_{N-5}$,
- (22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H\text{ 又は }R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (24) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H\text{ 又は }R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,
- (25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
- (27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6\text{ アルキル})$,

- (28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$, この R_{100} は独立して H または C_1-C_4 アルキル,
- (29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,
- (32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,
- (33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,

(34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6\text{ アルキル})$, このアルキル基は F, Cl, Br 及び I からなる群から独立して選択された 1, 2, 3, 4, または 5 個の置換基で任意に置換されている,

(35) $-(CH_2)_{0-4}-(C_3-C_8\text{ シクロアルキル})$,

(36) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシまたは $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている,

(37) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシまたは $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されており、そして

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H\text{ または }R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$;

(IV) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_C$ -ヘテロアリール、この R_C -ヘテロアリールはその存在毎に、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベ

ンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサニル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキサゾリノニル、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリヂル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミヂノニル、ジヒドロベンゾフラノニル、からなる群から選択され、

その R_C -ヘテロアリール基は、 R_C -ヘテロアリール基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_C -ヘテロアリール基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロアリールは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) -OH,

(3) -NO₂,

(4) -F, -Cl, -Br, -I,

(5) -CO-OH,

(6) -C≡N,

(V) C_2 - C_{10} アルケニル、このアルケニルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_6 アルコキシ、-O-フェニル及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VI) C_2 - C_{10} アルキニル、このアルキニルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_3 アルコキシ、-O-フェニル及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VII) -(C_1 - C_6 アルキル)-O-(C_1 - C_6 アルキル)-OH,

(VIII) -CH₂-NH-CH₂-CH(-O-CH₂-CH₃)₂,

(IX) -(CH₂)₀₋₆-C(=NR_{1-a})(NR_{1-a}R_{1-b});

式中 R_N は

(I) $R_{N-1}-X_N$ -, この X_N は-CO-, 及び R_{N-1} は下記の基から選択されている：

(A) フェニル、このフェニルは同じであっても異なってもよい下記置換基の1, 2, または3個で置換されている：

(1) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -

CN, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

この R_{1-a} 及び R_{1-b} は存在毎に独立してHまたは $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルであり、

(2) $-\text{OH}$,

(3) $-\text{NO}_2$,

(4) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$,

(5) $-\text{CO}_2\text{H}$,

(6) $-\text{C}\equiv\text{N}$,

(7) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{N-2}\text{R}_{N-3}$, この R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じまたは異なっており、下記の群から選択される:

(a) $-\text{H}$

(b) $-\text{C}_1\text{-C}_8$ アルキル、このアルキルは下記群から選択した一つの置換基で任意に置換されている;

(i) $-\text{OH}$,

(ii) $-\text{NH}_2$,

(iii) フェニル,

(c) $-\text{C}_1\text{-C}_8$ アルキル、このアルキルは独立して $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, または $-\text{I}$ である1, 2, または3個の基で置換されている、

(d) $-\text{C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル,

(e) $-(\text{C}_1\text{-C}_2 \text{ アルキル})-(\text{C}_3\text{-C}_8 \text{ シクロアルキル})$,

(f) $-(\text{C}_1\text{-C}_6 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_3 \text{ アルキル})$,

(g) $-\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル,

(h) $-\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル,

(i) $-\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル鎖(1個の二重結合及び1個の三重結合を有する)

(j) $-\text{R}_{1-\text{アリール}}$ 、この $\text{R}_{1-\text{アリール}}$ は存在する毎に独立してフェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、またはテトラリニルであり、下記の独立した1, 2, 3, または4個の基で任意に置換されている:

(i) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、このアルキルは $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, 及び $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、からなる群から独立して選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており

(ii) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル、このアルキニルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, 及び $-\text{I}$,

(v) $-C_1-C_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の-Fで置換されている、

(vi) $-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(vii) $-OH$,

(viii) $-CN$,

(ix) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, $-C_1$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(x) $-CO-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(xi) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(xii) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$, 及び

(xiii) $-SO_2-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(k) $-R_1$ -ヘテロアリール、この R_1 -ヘテロアリールは存在する毎に独立して
 ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、
 ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリ
 ニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チ
 アゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベ
 ンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ト
 リアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリ
 ル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマ
 ニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラ
 ヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサ
 ズリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル
 、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル
 、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒド
 ロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベ
 ンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニ
 ル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジ
 ヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリ
 ニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキ
 サゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミジニル N-オキシド、ピリダジニル N-オ
 キシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、
 インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キ
 ノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イ
 ソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、イ
 ンドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド
 、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキ
 シド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキ
 シド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、か
 らなる群から選択され、

この R_1 -ヘテロアリール基は下記の基の1, 2, 3または4個で任意に置換されている：

(i) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-N$
 $R_{1-a}R_{1-b}$, $-CN$, $-CF_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシ、からなる群から独立して選択された1, 2

、または3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2,または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2,または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) -F, -Cl, -Br, 及び -I、

(v) $-C_1 - C_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の -Fで置換されている、

(vi) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(vii) -OH,

(viii) $-C\equiv N$,

(ix) $(CH_2)_{0-4} - C_3 - C_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2,または3個の置換基で任意に置換されている、

(x) $(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,

(xi) $(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(xii) $(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(xiii) $(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,

(xiv) $(CH_2)_{0-4}-N(R_{M-2})-SO_2-$, 及び

(xv) $(CH_2)_{0-4}-N(R_{M-2})-C(O)-$,

(1) $-R_1$ -ヘテロサイクル、この R_1 -ヘテロサイクルは存在する毎に独立してモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリザニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、及びホモチオモルホリニル S-オキシドからなる群から選択され、

その R_1 -ヘテロサイクル 基は、 R_1 -ヘテロサイクル 基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_1 -ヘテロサイクル 基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(a) $C_1 - C_6$ アルキル、このアルキルは $C_1 - C_3$ アルキル、ハロゲン、-OH, -SH, $-NR_{1-a}R_{1-b}$ -CN, -CF₃, 及び $C_1 - C_3$ アルコキシ、からなる群から独立して選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(b) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2,または3個の置換基で任意に置換されている、

(c) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、-F, -Cl, -OH

, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₃アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(d) ハロゲン ,

(e) C₁-C₆ アルコキシ ,

(f) -C₁-C₆アルコキシ、任意に1, 2, または3個の -Fで置換されている、

(g) -NR_{N-2}R_{N-3} ,

(h) -OH ,

(i) -C≡N ,

(j) (CH₂)₀₋₄-(C₃-C₈ シクロアルキル) ,

このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₆アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(k) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₄ アルキル) ,

(l) -(CH₂)₀₋₄-SO₂-NR_{1-a}R_{1-b} ,

(m) -(CH₂)₀₋₄-CO-NR_{1-a}R_{1-b} ,

(n) -(CH₂)₀₋₄-SO₂-(C₁-C₆ アルキル) , 及び

(o) =O ,

(p) -(CH₂)₀₋₄-N(R_{N-2})-SO₂-

(q) -(CH₂)₀₋₄-N(R_{N-2})-C(O)-

(8) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₁-C₁₂ アルキル) ,

(9) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂ アルケニル) ,

(10) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₂-C₁₂ アルキニル) ,

(11) -(CH₂)₀₋₄-CO-(C₃-C₈ シクロアルキル) ,

(12) -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁- アリール ,

(13) -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁- ヘテロアリール ,

(14) -(CH₂)₀₋₄-CO-R₁- ヘテロサイクル ,

(15) -(CH₂)₀₋₄-CO-R_{N-4}、このR_{N-4}はフェニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピロリニル、チエニル、ピラゾリル、ピリジニル N-オキシド、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、及びピロリジニルからなる群から選択されており、各基は任意に1, 2, 3, または4個の独立したC₁-C₆アルキルによって置換されている、

(16) -(CH₂)₀₋₄-CO-O-R_{N-5}、このR_{N-5}は下記の群から選択されている：

- (a) C_1-C_6 アルキル,
- (b) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-アリール})$,
- (c) C_2-C_6 アルケニル,
- (d) C_2-C_6 アルキニル,
- (e) $-(CH_2)_{0-2}-C_3-C_8$ シクロアルキル,
- (f) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-ヘテロアリール})$, 及び
- (g) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-ヘテロサイクル})$,

- (17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8\text{ アルキル})$,
- (19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12}\text{ アルキル})$,
- (20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_8\text{ シクロアルキル})$,
- (21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H\text{ 又は }R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$,
- (22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H\text{ 又は }R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H\text{ 又は }R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,
- (25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
- (27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6\text{ アルキル})$,

(28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$, この R_{100} は存在する毎に独立して $-H$ または C_1-C_4 アルキルであり、

- (29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,
- (32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,
- (33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,

(34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6\text{ アルキル})$, このアルキルは任意に1, 2, 3, 4, または5個の $-F$ で置換されている、

(35) C_3-C_8 シクロアルキル

(36) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(37) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(38) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{\text{M}-5})-\text{SO}_2-\text{R}_{\text{M}-2},$

(39) $-(\text{CH}_2)_{1-4}-(\text{C}_3-\text{C}_8 \text{ シクロアルキル }),$

(B) $-\text{R}_{\text{N}}$ -ヘテロアリール、この R_{N} -ヘテロアリール は
 ピリジニル、インドリル、インドリニル、イソインドリル、イミダゾリル、イソオキサゾ
 リル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、及びイソクロマニル、からなる群か
 ら選択され、

その R_{N} -ヘテロアリール 基は、 R_{N} -ヘテロアリール 基との新しい結合が水素原子をその
 結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_{N} -ヘテロアリール 基の
 いずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4
 個の基で置換されている：

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2, または3
 個の置換基で任意に置換されている

- (2) $-\text{OH}$,
- (3) $-\text{NO}_2$,
- (4) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$,
- (5) $-\text{CO}_2\text{H}$,
- (6) $-\text{C}\equiv\text{N}$,
- (7) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$,
- (8) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_{12} \text{ アルキル})$,
- (9) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_2-\text{C}_{12} \text{ アルケニル})$,
- (10) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_2-\text{C}_{12} \text{ アルキニル})$,
- (11) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_3-\text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$,
- (12) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -アリール,
- (13) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -ヘテロアリール,
- (14) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1$ -ヘテロサイクル,
- (15) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_{\text{N}-4}$
- (16) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-5}$
- (17) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-\text{NR}_{\text{M}-2}\text{R}_{\text{M}-3}$,
- (18) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_8 \text{ アルキル})$,
- (19) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_{12} \text{ アルキル})$,
- (20) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-(\text{C}_3-\text{C}_8 \text{ シクロアルキル})$,
- (21) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{\text{M}-5})-\text{CO}-\text{O}-\text{R}_{\text{N}-5}$,
- (22) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{\text{M}-5})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-5})_2$,
- (23) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}-\text{CS}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-5})_2$,
- (24) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(-\text{H} \text{ 又は } \text{R}_{\text{M}-5})-\text{CO}-\text{R}_{\text{M}-2}$,
- (25) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{NR}_{\text{M}-2}\text{R}_{\text{M}-3}$,
- (26) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{R}_{\text{M}-4}$,
- (27) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{ アルキル})$,
- (28) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{P}(\text{O})-(\text{OR}_{100})_2$,
- (29) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{CO}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-5})_2$,
- (30) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-\text{CS}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-5})_2$,
- (31) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{R}_{\text{M}-5})$,
- (32) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{R}_{\text{M}-5})-\text{COOH}$,
- (33) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{S}-(\text{R}_{\text{N}-5})$,

(34) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、このアルキルは任意に1, 2, 3, 4、または5個の-Fで置換されている、

(35) C_3-C_8 シクロアルキル

(36) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは C_1-C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(37) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは C_1-C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H \text{ or } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$,

(39) $-(CH_2)_{1-4}-C_3-C_8$ シクロアルキル,

(C) R_N -アリール-W- R_N -アリール,

(D) R_N -アリール-W- R_N -ヘテロアリール,

(E) R_N -アリール-W- R_1 -ヘテロサイクル,

(F) R_N -ヘテロアリール-W- R_N -アリール,

(G) R_N -ヘテロアリール-W- R_N -ヘテロアリール,

(H) R_N -ヘテロアリール-W- R_{N-1} -ヘテロサイクル,

(I) R_N -ヘテロサイクル-W- R_N -アリール

(J) R_N -ヘテロサイクル-W- R_N -ヘテロアリール,

(K) R_N -ヘテロサイクル-W- R_{N-1} -ヘテロサイクル,

この W は

(19) $-(CH_2)_{1-4}-$,

(20) $-O-$,

(21) $-S(O)_{0-2}-$,

(22) $-N(R_{N-3})-$,

(23) $-CO-$; or

(24) a 結合;

(II) $-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})-M-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、この M は S, SO または SO₂ であり、各アルキルは非置換または下記の群から独立に選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている:

(A) $-NH-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,

(B) $-NH-CO-O-R_{N-8}$,

(C) $-NR_{N-2}R_{N-3}$;

式中 R_1 は

$-(CH_2)_{n_1}$ -フェニル、この n_1 は零または 1 であり、フェニル環上に下記の置換基を 1, 2, 3, または 4 個任意に置換している:

(A) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から選択された 1, 2, または 3

個の置換基で任意に置換されている

(B) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1 または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(C) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1 または2個の三重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(D) -F, -Cl, -Br, -I,

(F) $-C_1 - C_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の -Fで置換されている、

(G) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義される、

(H) -OH,

(I) -CN,

(J) $C_3 - C_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(K) $-\text{CO}-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$,

(L) $-\text{SO}_2 - NR_{1-a}R_{1-b}$,

(M) $-\text{CO} - NR_{1-a}R_{1-b}$,

(N) $-\text{SO}_2 - (C_1 - C_4 \text{ アルキル})$; 及び

式中 R_2 は

(I) $-(Z) - C_1 - C_6$ アルキル、このZは結合、 $-C(0)-$, $-CO_2-$, または $-SO_2-$ であり、このアルキル基は $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_7$ アルキル ($C_1 - C_3$ アルキル及び $C_1 - C_3$ アルコキシで任意に置換されている)、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、この R_{1-a} 及び R_{1-b} は独立して-Hまたは $C_1 - C_6$ アルキル、及び $-OC=O NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており、

(II) $-(Z) - CH_2 - S(O)_{0-2} - (C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、

(III) $-(Z) - CH_2 - CH_2 - S(O)_{0-2} - (C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、

(IV) $-(Z) - C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1 または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(V) $-(Z) - C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1 または2個の三重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VI) $-(Z) - (CH_2)_{n_1} - (R_{1-\text{アリール}})$ 、このZは結合、CO, CO₂, または SO₂ であり、この n_1 は零または1であり、そしてこの $R_{1-\text{アリール}}$ はフェニル、1-ナフチル、2-ナフチル及びインダニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、またはテトラリニルであり、そのアリール環上1, 2, または3個の下記置換基で置換されている：

(A) $C_1 - C_6$ アルキル、このアルキルは $C_1 - C_3$ アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている：

(B) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1 または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(C) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1 または2個の三重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(D) -F, -Cl, -Br, -I,

(F) -C₁-C₆アルコキシ、任意に1, 2, または3個の -Fで置換されている、

(G) -NR_{N-2}R_{N-3}、このR_{N-2}及びR_{N-3}は後に定義される、

(H) -OH,

(I) -CN,

(J) C₃-C₇シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₃アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(K) -CO-(C₁-C₄ アルキル),

(L) -SO₂-NR_{1-a}R_{1-b},

(M) -CO-NR_{1-a}R_{1-b},

(N) -SO₂-(C₁-C₄ アルキル),

(VII) - (Z)-(CH₂)_{n₁}-(R₁-ヘテロアリール)、このn₁はすでに定義したとおりであり、このR₁-ヘテロアリールは

ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキサゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミダニル N-オキシド、ピリダジニル N-オキシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、インドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキシド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキシド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、からなる群から選択され、

このR₁-ヘテロアリールは、R₁-ヘテロアリール基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元のR_N-ヘテロアリール基のいずれかの環構成原子によって-(CH₂)_{n₁}-と結合し、そのヘテロアリールは任意に下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C₁-C₆アルキル、このアルキルはC₁-C₃アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -

CN, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(3) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(4) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$ または $-\text{I}$,

(6) $-\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ、1, 2, または3個の $-\text{F}$ で任意に置換されている、

(7) $-\text{NR}_{N-2}\text{R}_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義するとおり、

(8) $-\text{OH}$,

(9) $-\text{CN}$

(10) $\text{C}_3\text{-C}_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(11) $-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ アルキル})$,

(12) $-\text{SO}_2\text{-NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$,

(13) $-\text{CO}\text{-NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, 又は

(14) $-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4 \text{ アルキル})$,

その前提として n_1 は零で、 $\text{R}_1\text{-ヘテロアリール}$ は窒素により炭素鎖と結合していない、または

(VIII) $-(\text{Z})-(\text{CH}_2)_{n_1}-(\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル})$ 、この n_1 は既に定義したとおりであり、 $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ は：

モルホリニル、チオモルホルニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ペリリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、ホモチオモルホリニル S-オキシド、からなる群から選択され、

この $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基は、 $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、このアルキルは $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(3) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(4) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$ または $-\text{I}$,

(5) C_1-C_6 アルコキシ

(6) $-C_1-C_6$ アルコキシ、1, 2, または3個の $-F$ で任意に置換されている、

(7) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義するとおり、

(8) $-OH$,

(9) $-CN$

(10) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(11) $-CO-(C_1-C_4$ アルキル),

(12) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(13) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(14) $-SO_2-(C_1-C_4$ アルキル),

(15) $=0$ 、前提として n_1 は零で R_1 -ヘテロサイクル基は窒素原子で炭素と結合していない；そして

式中 R_{20} は H または C_1-C_6 アルキルである。

【請求項 2】

R_C が $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_{C-アリール}$ であり、その R_{C-x} 及び R_{C-y} は下記からなる群から独立して選択され、

$-H$,

C_1-C_4 アルキル、1または2個の $-OH$ で任意に置換されている、

C_1-C_4 アルコキシ、1, 2, または3個のハロゲンで任意に置換されている、

$-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_8$ シクロアルキル、

C_2-C_6 アルケニル、1または2個の二重結合を含む、

C_2-C_6 アルキニル、1または2個の三重結合を含む、そして

フェニル、

または

R_{C-x} 及び R_{C-y} はともに炭素と結合して3, 4, 5, 6, または7炭素原子の炭素環を形成し、その一つの炭素原子は $-O-$, $-S-$, $-SO_2-$, $-NR_{N-2}-$ 及び $R_{C-アリール}$ から選択した基によって任意に置換されており、

この $R_{C-アリール}$ はフェニルであり、それは下記の独立した基の1, 2, または3個で任意に置換されている、

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) $-OH$,

(3) $-NO_2$,

(4) ハロゲン,

(5) $-CO_2H$,

(6) $-C\equiv N$.

請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

R_C が $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_C$ -アリールであり、その R_{C-x} 及び R_{C-y} は下記からなる群から独立して選択され、

-H、

C_1-C_4 アルキル、1または2個の-OHで任意に置換されている、

C_1-C_4 アルコキシ、1, 2, または3個のハロゲンで任意に置換されている、

$-(CH_2)_{0-4}-C_3-C_8$ シクロアルキル、

C_2-C_6 アルケニル、1または2個の二重結合を含む、

C_2-C_6 アルキニル、1または2個の三重結合を含む、そして

フェニル、

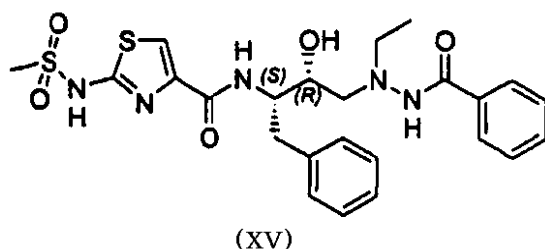
または

R_{C-x} 及び R_{C-y} はともに炭素と結合して3, 4, 5, 6, または7炭素原子の炭素環を形成し、その一つの炭素原子は-O-, -S-, -SO₂-, -NR_{N-2}- 及び R_C -アリールから選択した基によって任意に置換されており、そのなかの

$-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_C$ -ヘテロアリールはピリジルニル、インドリル、インドリニル、イソインドリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル及びイソクロマニルからなる群から選択されている請求項1に記載の化合物。

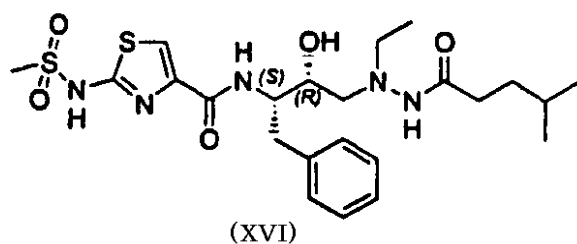
【請求項4】

下記式の請求項1に記載の化合物：



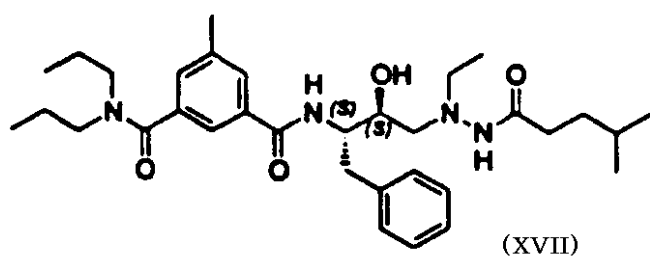
【請求項5】

下記式の請求項1に記載の化合物：



【請求項6】

下記式の請求項1に記載の化合物：



【請求項7】

下記式の請求項1に記載の化合物：

CCN(CC)C(=O)c1ccc(cc1)C(=O)N[C@H](C(F)(F)c2ccc(F)c(F)c2)[C@H](O)CN(CC)C(=O)CC(C)CC

(XVIII)

【請求項 8】

下記式の請求項1に記載の化合物：

(XIX)

【請求項 9】

式 III の化合物：

$$\begin{array}{c}
 \text{R}_a \\
 \diagup \\
 \text{C}_6\text{H}_4 \\
 \diagdown \\
 \text{R}_b
 \end{array}
 \text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_1)\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{N}(\text{R}_c)\text{N}(\text{R}_{20})\text{C}(=\text{O})\text{R}_d$$

(III)

またはその医薬として受容しうる塩、式中

R₁はフェニル（C₁-C₆）アルキルを示しこのフェニルはハロゲン、ヒドロキシ、C₁-C₂アルキル、C₁-C₂アルコキシ、アミノ、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、モノ（C₁-C₂）アルキルアミノ及びジ（C₁-C₂）アルキルアミノから独立して選択された3個までの基で任意に置換されており；

そしてR_a及びR_bは独立して水素、ヒドロキシ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆アルコキシ、C₃-C₇シクロアルキル、C₃-C₇シクロアルキル(C₁-C₆)アルキル、C₃-C₇シクロアルキル(C₁-C₆)アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ、モノまたはジ(C₁-C₆)アルキルアミノスルホニル、C₁-C₆アルキルスルホニルアミノ、C₂-C₆アルケニル、C₂-C₆アルキニル、トリフルオロメチル、モノ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニル、またはジ(C₁-C₆)アルキルアミノカルボニルを示しそしてR_a及びR_bは同時に水素でないことが条件であり；

R_cは水素、C₁-C₆アルキル、C₂-C₆アルケニル、またはC₂-C₆アルキニルを示し、それぞれはハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノまたはトリフルオロメチルで任意に置換されている；

R_d は

フェニルを示し、これはヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、モノまたはジ (C_1 - C_6) アルキルアミノスルホニル、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルで任意に置換されており；または
 C_1 - C_6 アルキル、これはヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルまたはトリフルオロメチルで任意に置換されており；そして
 R_{20} は水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルまたはトリフルオロメチルを示す。

【請求項 10】

式中 R_1 はフェニルが任意に置換されたベンジルである請求項9に記載の化合物。

【請求項 11】

式中フェニルがハロゲン、ヒドロキシ、 C_1 - C_3 アルキル、アミノ、及びトリフルオロメチルから独立に選択された1または2個の基で置換されている請求項10に記載の化合物。

【請求項 12】

式中フェニルがハロゲン、ヒドロキシ及びトリフルオロメチルから独立して選択された2個の基により置換されている請求項11に記載の化合物。

【請求項 13】

式中フェニルがハロゲンで2置換されている請求項12に記載の化合物。

【請求項 14】

R_1 が3,5-ジフルオロベンジルである請求項13に記載の化合物。

【請求項 15】

式中 R_a および R_b は異なりそして R_b がモノーまたはジ (C_1 - C_6) アルキルアミノカルボニルを示す請求項12に記載の化合物。

【請求項 16】

式中 R_d が C_1 - C_3 アルキル、 C_1 - C_3 アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、またはハロゲンで任意に置換されたフェニルである請求項12に記載の化合物。

【請求項 17】

式中 R_c が水素または C_1 - C_4 アルキルである請求項12に記載の化合物。

【請求項 18】

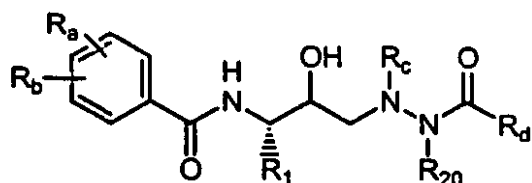
式中 R_c が C_1 - C_3 アルキルである請求項17に記載の化合物。

【請求項 19】

式中 R_d が C_1 - C_6 低級アルキルでありそして R_{20} が水素である請求項12に記載の化合物。

【請求項 20】

式IVを有する請求項12に記載の化合物：



(IV)

【請求項 21】

式中

R_1 はフェニルがクロロまたはフロロで2置換されているベンジルであり；

R_c が C_1 - C_3 アルキルであり；

R_d が C_1 - C_6 低級アルキルであり；

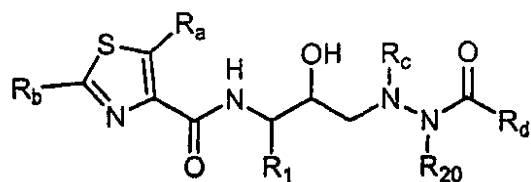
R_{20} が水素または C_1 - C_6 アルキルであり；

R_b がフェニル基の3位に結合したジ (C_1 - C_6) アルキルアミノカルボニルである

請求項20に記載の化合物。

【請求項 2 2】

式Vの化合物：



(V)

またはその医薬として受容しうる塩、式中

R_1 はフェニル (C_1 - C_6) アルキルを示しこのフェニルはハロゲン、ヒドロキシ、 C_1 - C_2 アルキル、 C_1 - C_2 アルコキシ、アミノ、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、モノ (C_1 - C_2) アルキルアミノ及びジ (C_1 - C_2) アルキルアミノから独立して選択された3個までの基で任意に置換されており；

R_a 及び R_b は独立して水素、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、モノまたはジ (C_1 - C_6) アルキルアミノスルホニル、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、トリフルオロメチル、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノカルボニル、またはジ (C_1 - C_6) アルキルアミノカルボニルを示しそして R_a 及び R_b は同時に水素でないことが条件であり；

R_c は水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、または C_2 - C_6 アルキニルを示し、それぞれはハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノまたはトリフルオロメチルで任意に置換されている；

R_d は

フェニルを示し、これはヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル (C_1 - C_6) アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、モノまたはジ (C_1 - C_6) アルキルアミノスルホニル、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルで任意に置換されており；または

C_1 - C_6 アルキル、これはヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、モノ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1 - C_6) アルキルアミノ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルまたはトリフルオロメチルで任意に置換されており；そして

R_{20} は水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニルまたはトリフルオロメチルを示す。

【請求項 2 3】

式中 R_1 はフェニルが任意に置換されているベンジルである請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

式中フェニルがハロゲン、ヒドロキシ、 C_1 - C_3 アルキル、アミノ及びトリフルオロメチルから独立に選択された1または2個の基で置換されている請求項23に記載の化合物。

【請求項 2 5】

式中フェニルがハロゲン、ヒドロキシおよびトリフルオロから独立して選択された2個の基で置換されている請求項24に記載の化合物。

【請求項 2 6】

式中フェニルがハロゲンで2置換されている請求項25に記載の化合物。

【請求項27】

式中 R_1 が3,5-ジフルオロベンジルである請求項26に記載の化合物。

【請求項28】

式中 R_a および R_b は異なりそして R_b が(C_1 - C_6)アルキルスルホニルアミノを示す請求項25に記載の化合物。

【請求項29】

式中 R_d が C_1 - C_3 アルキル、 C_1 - C_3 アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、またはハロゲンで任意に置換されたフェニルである請求項25に記載の化合物。

【請求項30】

式中 R_c が水素または C_1 - C_4 アルキルである請求項25に記載の化合物。

【請求項31】

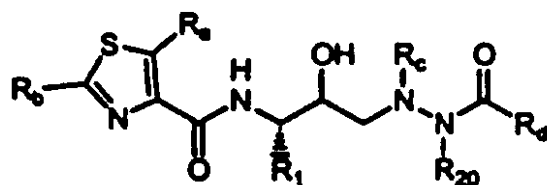
式中 R_c が C_1 - C_3 アルキルである請求項30に記載の化合物。

【請求項32】

式中 R_d が C_1 - C_6 低級アルキルそして R_{20} が水素である請求項25に記載の化合物。

【請求項33】

式VIを有する請求項25に記載の化合物：



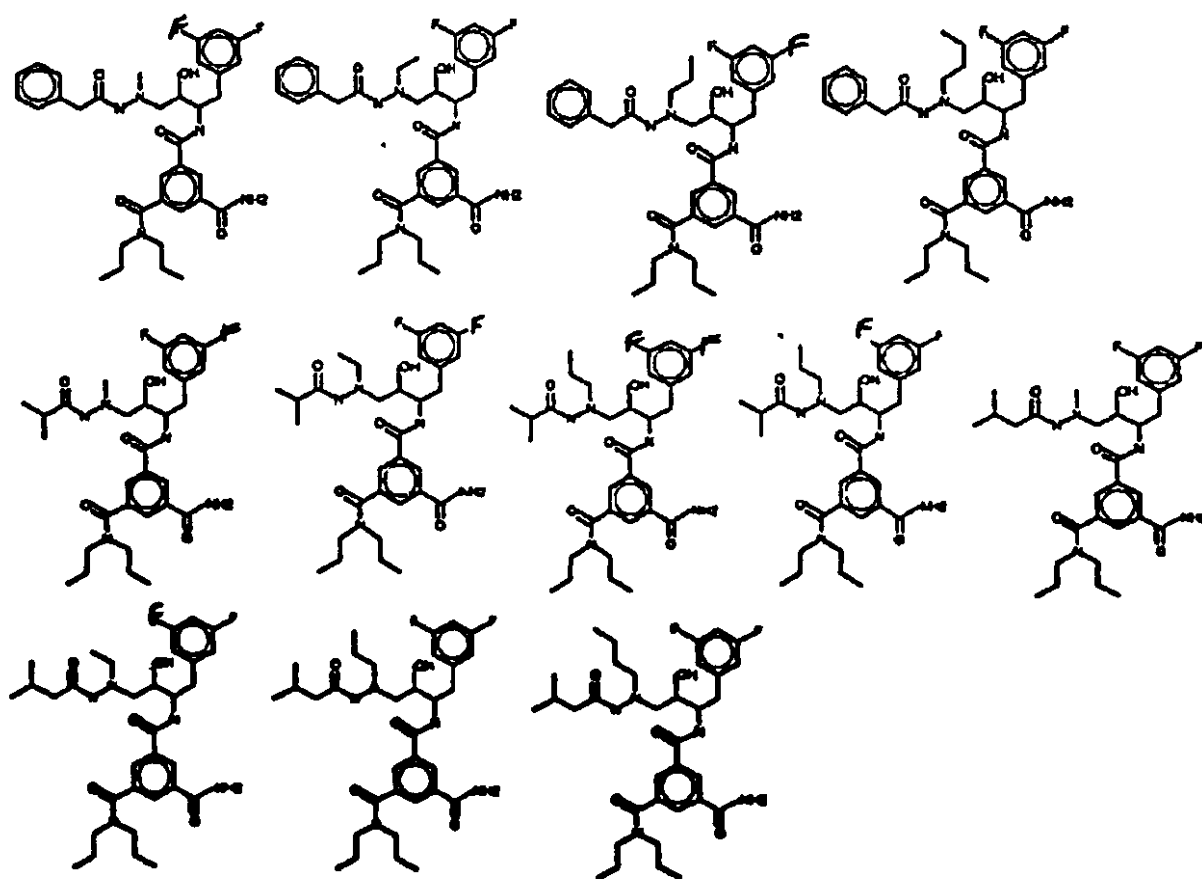
(VI)

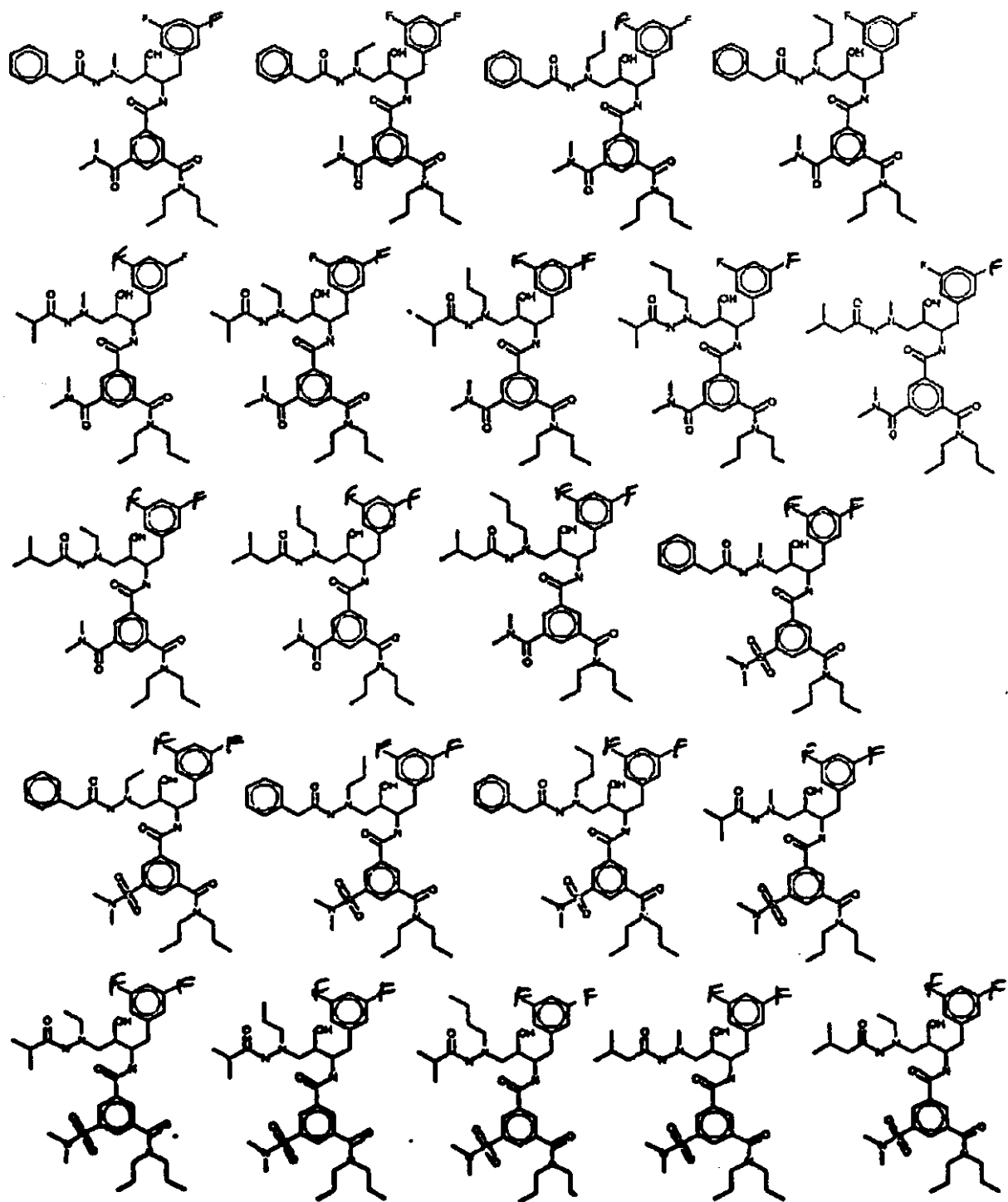
【請求項34】

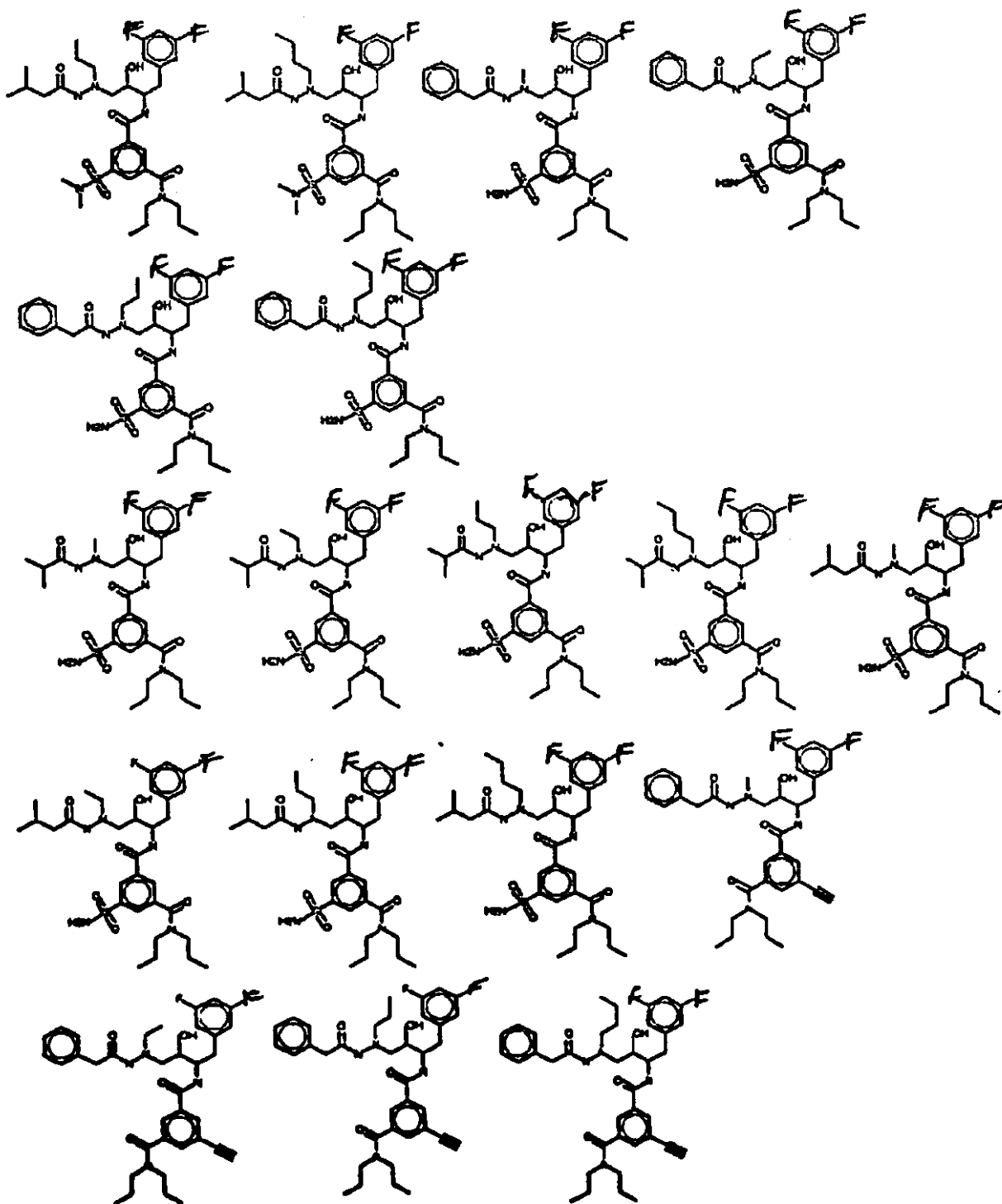
式中 R_1 はフェニルがクロロまたはフロロで2置換されているベンジルであり；
 R_c が C_1 - C_3 アルキルであり；
 R_d が C_1 - C_6 低級アルキルであり；
 R_{20} が水素または C_1 - C_6 アルキルであり；
 R_b がチアゾリル基の2位に結合したアルキルスルホニルアミノである
 請求項33に記載の化合物。

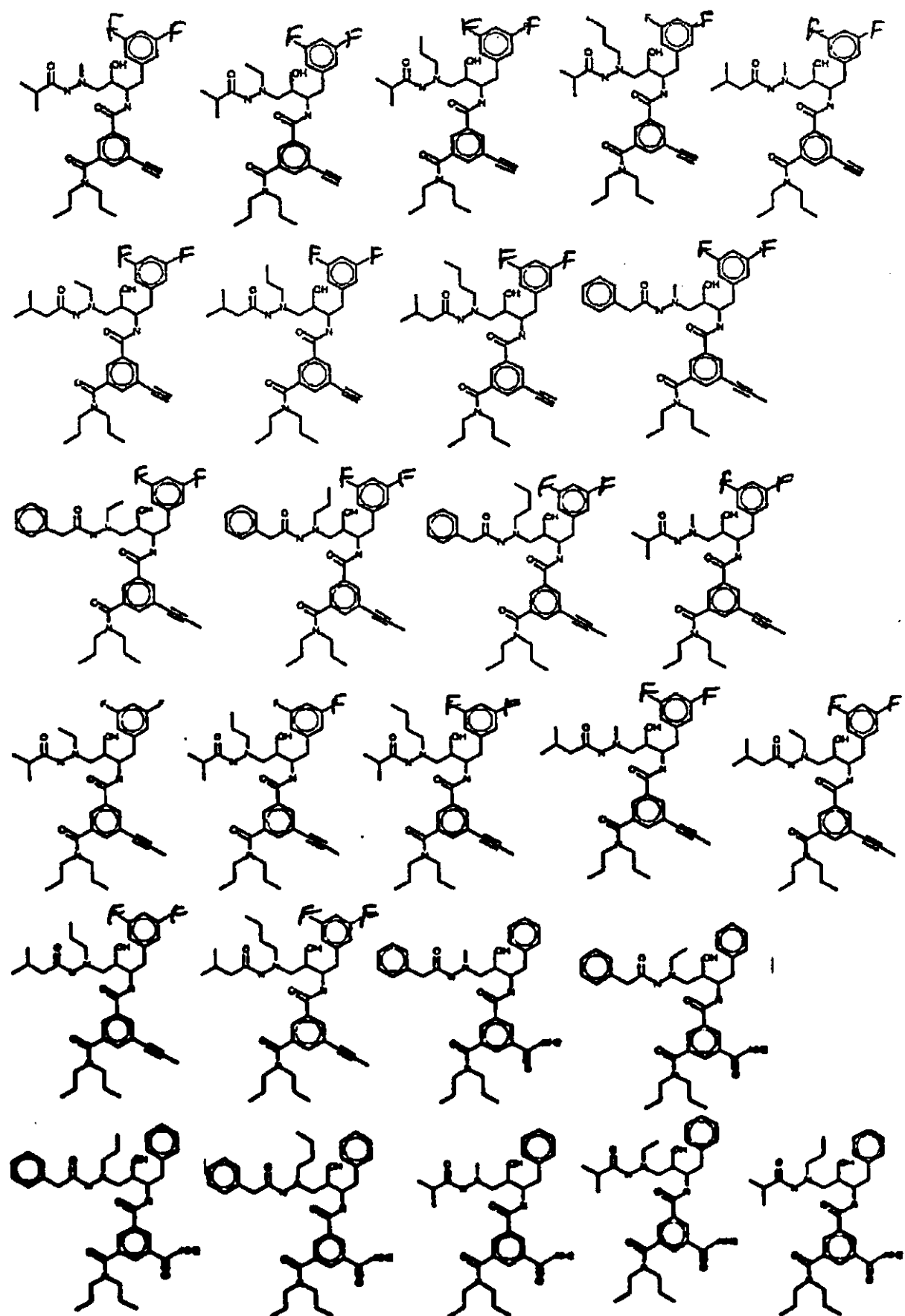
【請求項35】

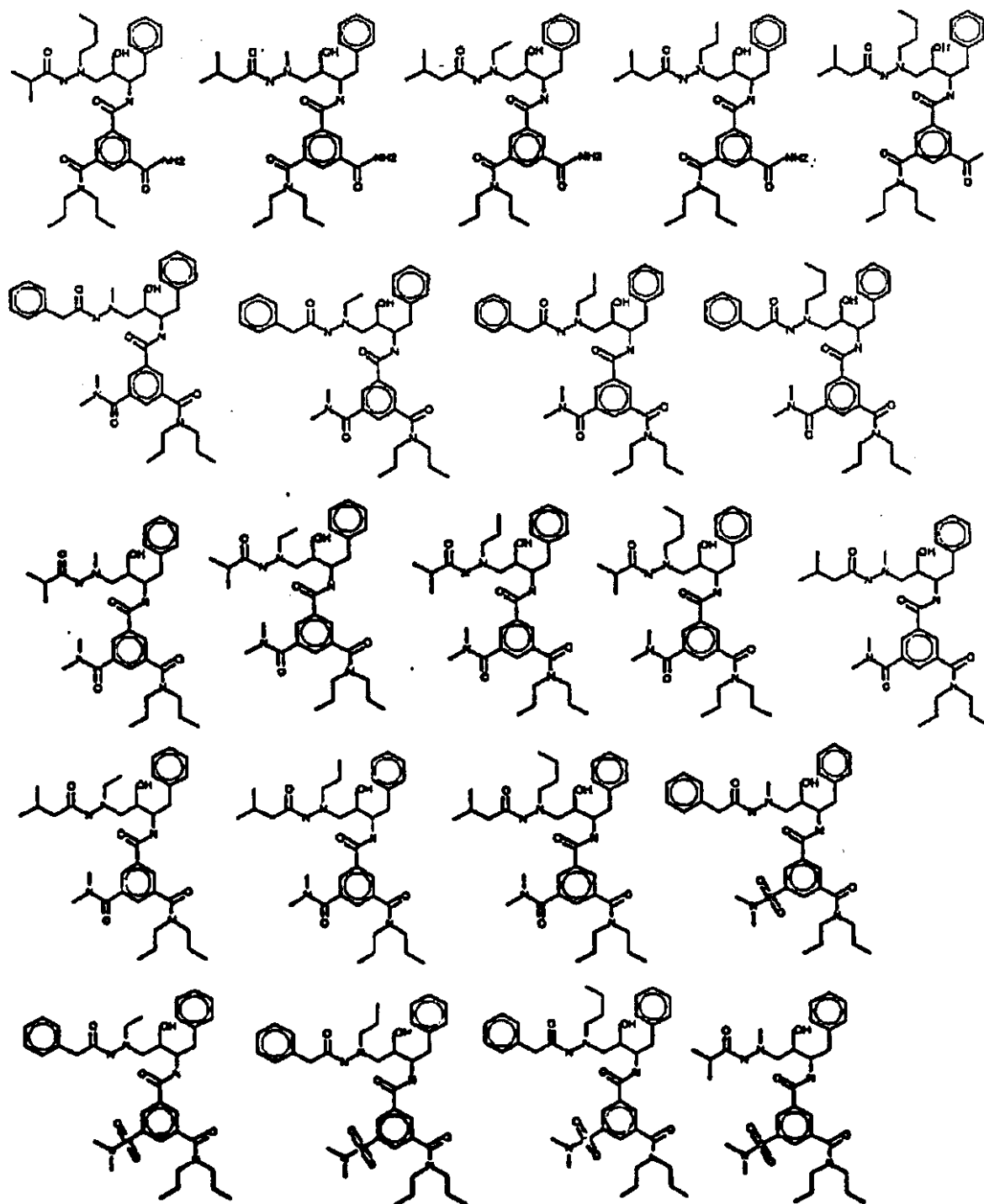
下記からなる群から選択された請求項1に記載の化合物：

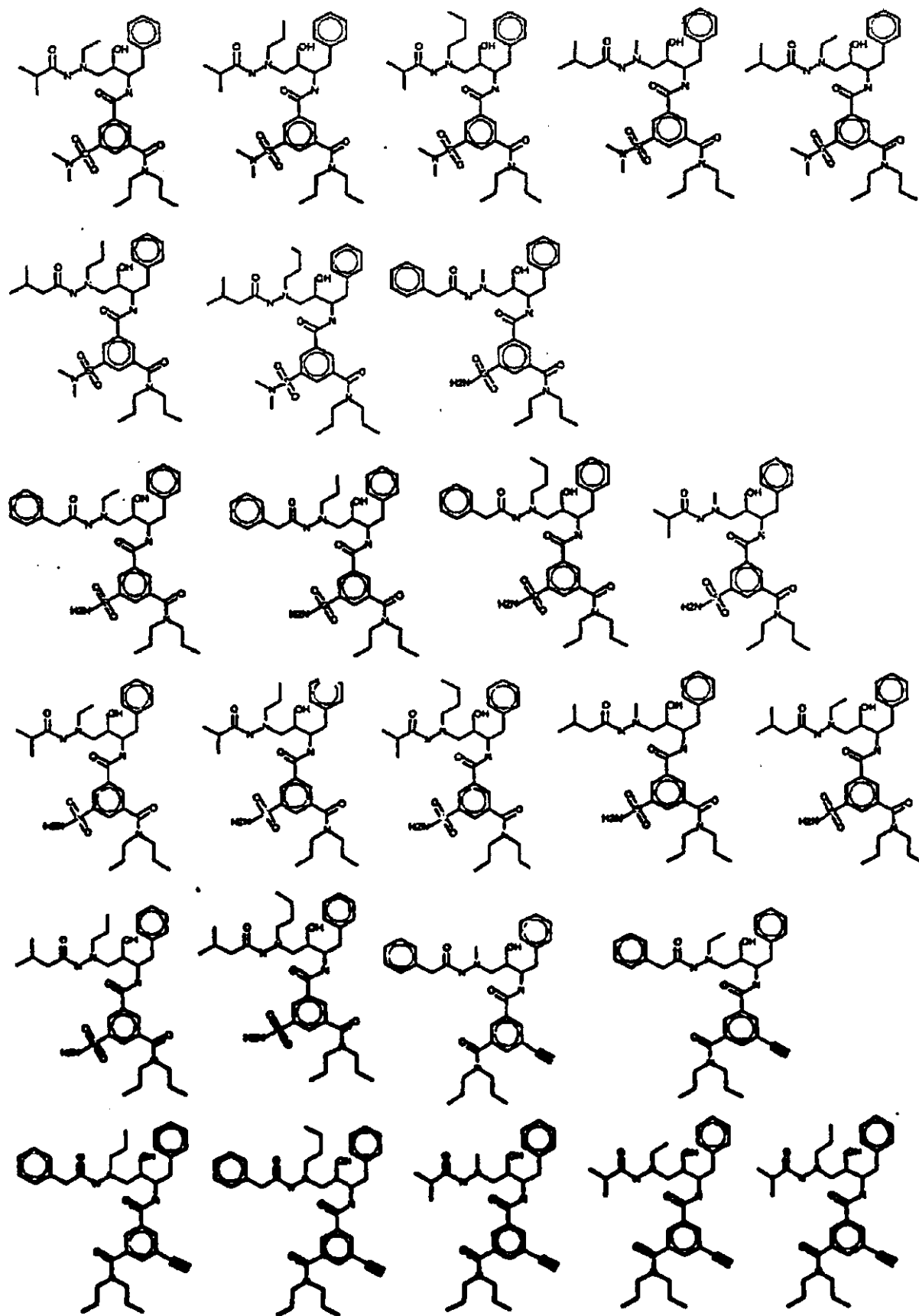


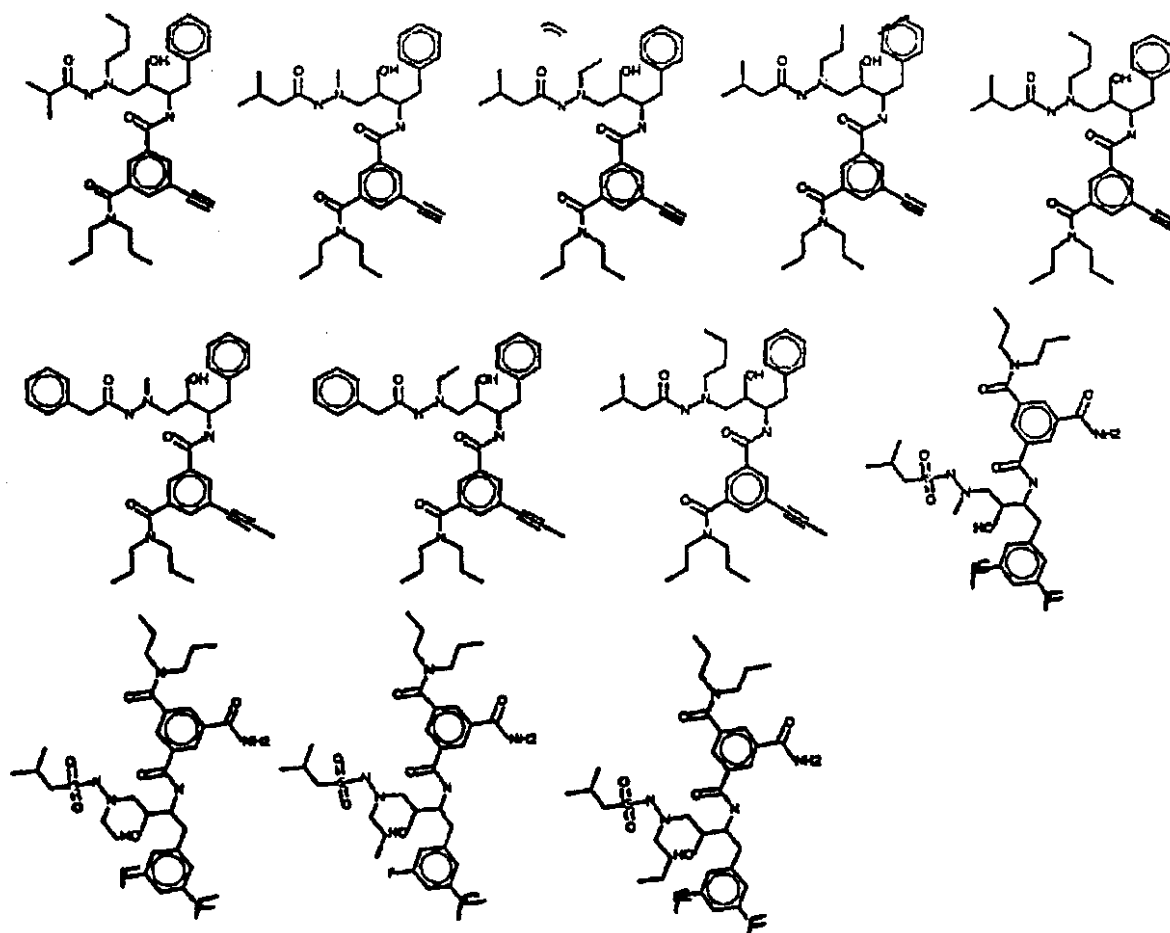








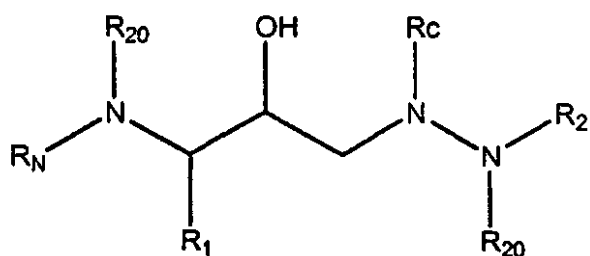




XX

【請求項 36】

式IIの化合物を有効成分として含有する医薬組成物であって、式I Iの化合物は、下記式I I



(II)

またはその医薬として受容しうる塩、
式中RCは

(I) $-C_1-C_{10}$ アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-OC(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-S(=O)_{0-2}R_{1-a}$ 、 $-NR_{1-a}C(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、 $-C(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ 、及び $-S(=O)_2NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から独立に選択された1、2または3個の基で任意に置換されており、

その中の R_{1-a} 及び R_{1-b} は存在する毎にそれぞれ独立してHまたは C_1-C_6 アルキルであり、
(II) $-(CH_2)_{0-3}-(C_3-C_8)$ シクロアルキル、このシクロアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 C_1-C_6 アルコキシ、 $-O$ -フェニル、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-(C_1-C_4)$ アルキル、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から独立に選択された1、2または3個の基で任意

に置換されることができ

(III) $-(\text{CR}_{c-x}\text{R}_{c-y})_{0-4}-\text{R}_{c-}$ アリール、その R_{c-x} 及び R_{c-y} は独立して下記からなる群より選択される、

-H

1または2個の-OHで任意に置換された C_1-C_4 アルキル

1, 2, または3個のハロゲンで任意に置換された C_1-C_4 アルコキシ

$-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{C}_3-\text{C}_8$ シクロアルキル

1または2個の二重結合を含む C_2-C_6 アルケニル

1または2個の三重結合を含む C_2-C_6 アルキニル、及び

フェニル、

または

R_{c-x} 及び R_{c-y} は共に3, 4, 5, 6, または7炭素原子の炭素環を形成する炭素と結合し、そのひとつの炭素原子は任意に-O-, -S-, $-\text{SO}_2$ -, $-\text{NR}_{N-2}$ -及び R_{c-} アリールから選択された基で変換されており、その中の

R_{c-} アリールはフェニルであり、このフェニルは独立した下記の1, 2, または3個の基で任意に置換されている：

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、-OH, -SH, -CN, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ, 及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, からなる群から選択された1, 2または3個の基で任意に置換され、

(2) -OH,

(3) $-\text{NO}_2$,

(4) ハロゲン,

(5) $-\text{CO}_2\text{H}$,

(6) $-\text{C}\equiv\text{N}$,

(7) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{N-2}\text{R}_{N-3}$

この R_{N-2} 及び R_{N-3} は下記の群から独立して選択される：

(a) -H

(b) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは下記群から選択した一つの置換基で任意に置換されている：

(i) -OH, 及び

(ii) $-\text{NH}_2$,

(c) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは独立して-F, -Cl, -Br, -I, またはOHである1, 2, または3個の基で任意に置換されている、

(d) $-\text{C}_1-\text{C}_7$ シクロアルキル,

(e) $-(\text{C}_1-\text{C}_2\text{アルキル})-(\text{C}_3-\text{C}_7\text{シクロアルキル})$,

(f) $-(\text{C}_1-\text{C}_6\text{アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_3\text{アルキル})$,

(g) $-\text{C}_2-\text{C}_6$ アルケニル

(h) $-\text{C}_2-\text{C}_6$ アルキニル

(i) ひとつの二重結合及びひとつの三重結合をもつ C_1-C_6 アルキル鎖、

(j) $-\text{R}_1$ -アリール、この R_1 -アリールは存在する毎に独立してフェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、またはテトラリニルであり、それぞれは独立

した1, 2, 3または4個の下記の基で任意に置換されている：

(i) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-NR_{1-a}R_{1-b}$, -CN, -CF₃, 及び C_1-C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは -F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) -F, -Cl, -Br及び-I,

(v) $-C_1-C_6$ アルコキシ、このアルコキシは1, 2, または3個の-Fで任意に置換されている、

(vi) $-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(vii) -OH,

(viii) $-C\equiv N$,

(ix) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており、

(x) $-CO-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(xi) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(xii) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$, 又は

(xiii) $-SO_2-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(k) $-R_1$ -ヘテロアリール、この R_1 -ヘテロアリールは存在する毎に独立して、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキサゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミダニル N-オキシド、ピリダジニル N-オ

キシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、インドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキシド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキシド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、からなる群から選択され、

この R_1 -ヘテロアリール基は1, 2, 3, または4個の独立した下記基によって任意に置換されている:

(i) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, $-NR_{1-a}R_{1-b}$, -CN, $-CF_3$, 及び C_1 - C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) C_2 - C_6 アルケニル、このアルケニルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1 - C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) C_2 - C_6 アルキニル、このアルキニルは -F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1 - C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) -F, -Cl, -Br, 及び -I、

(v) - C_1 - C_6 アルコキシ、このアルコキシは1, 2, または3個のFで任意に置換されている、

(vi) - $(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,

(vii) -OH,

(viii) - $C\equiv N$,

(ix) - $(CH_2)_{0-4}-C_3-C_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, $-CF_3$, C_1 - C_3 アルコキシ, 及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2または3個の基で任意に置換されている、

(x) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{ アルキル})$,

(xi) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-\text{NR}_{\text{M}-2}\text{R}_{\text{M}-3}$,

(xii) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{\text{M}-2}\text{R}_{\text{M}-3}$,

(xiii) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6$

アルキル),

(xiv) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-3})-\text{SO}_2-$,

及び

(xv) $(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{M}-2})-\text{C}(\text{O})-$,

(8) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_{12} \text{ アルキル})$,

(9) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_2-\text{C}_{12} \text{ アルケニル})$,

(10) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_2-\text{C}_{12} \text{ アルキニル})$,

(11) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{CH}_2)_{0-4} (\text{C}_3-\text{C}_7 \text{ シクロアルキル})$,

(12) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1\text{-アリール}$,

(13) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1\text{-ヘテロアリール}$,

(14) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$

この $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ はその存在毎にモルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリヂニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、及びホモチオモルホリニル S-オキシド、からなる群から独立に選択され、

その $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基は、 $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の $\text{R}_1\text{-ヘテロサイクル}$ 基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている:

(a) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシからなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(b) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(c) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(d) ハロゲン、

(e) C_1-C_6 アルコキシ、

(f) $-\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の $-\text{F}$ で置換されている、

(g) $-\text{NR}_{\text{N}-2}\text{R}_{\text{N}-3}$,

(h) $-\text{OH}$,

(i) $-\text{C}\equiv\text{N}$,

(j) $(\text{CH}_2)_{0-4} - (\text{C}_3-\text{C}_7 \text{シクロアルキル})$ 、このシクロアルキルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(k) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_4 \text{アルキル})$,

(l) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$,

(m) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$,

(n) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6 \text{アルキル})$, 及び

(o) $=\text{O}$,

(p) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-2})-\text{SO}_2-$

(q) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{N}(\text{R}_{\text{N}-2})-\text{C}(\text{O})-$

(15) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{R}_{\text{N}-4}$ 、この $\text{R}_{\text{N}-4}$ は存在毎にモルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、ピロリル、ピラゾリル、チエニル、ピリジル N-オキシド、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピロリニル及びピロリジニルからなる群から独立に選択され、各基は独立して C_1-C_6 アルキルである1, 2, 3, または4個の基で任意に置換されている、

(16) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}_2-\text{R}_{\text{N}-5}$ 、この $\text{R}_{\text{N}-5}$ は存在毎に下記からなる群から独立して選択されている：

- (a) C_1-C_6 アルキル,
- (b) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-アリール})$,
- (c) C_2-C_6 アルケニル,
- (d) C_2-C_6 アルキニル,
- (e) C_3-C_7 シクロアルキル, 及び
- (f) $-(CH_2)_{0-4}-(R_1\text{-ヘテロアリール})$,
- (17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$
- (18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,
- (19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12} \text{ アルキル})$,
- (20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_7 \text{ シクロアルキル})$,
- (21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO_2-R_{N-5}$,
- (22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (24) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,
- (25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
- (27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,
- (28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ ここで R_{100} は独立にH又は
 C_1-C_4 アルキルであり,
- (29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,
- (32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,
- (33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,

(34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、このアルキル基はF, Cl, Br及びIからなる群から独立して選択された1, 2, 3, 4, または5個の置換基で任意に置換されている、

(35) $-(CH_2)_{0-4}-(C_3-C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(36) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは C_1-C_3 アルキル、ハロゲン、 $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシまたは $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(37) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシまたは $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されており、そして

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H \text{ または } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$;

(IV) $-(CR_{C-x}R_{C-y})_{0-4}-R_C$ -ヘテロアリール、この R_C -ヘテロアリールはその存在毎に、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベ

ンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサニル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキサゾリノニル、イミダゾピラゾリル、キナゾリノニル、ピラゾピリヂル、ベンゾオキサジアゾリル、ジヒドロピリミヂノニル、ジヒドロベンゾフラノニル、からなる群から選択され、

その R_C -ヘテロアリール基は、 R_C -ヘテロアリール基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_C -ヘテロアリール基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロアリールは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) -OH,

(3) -NO₂,

(4) -F, -Cl, -Br, -I,

(5) -CO-OH,

(6) -C≡N,

(V) C_2 - C_{10} アルケニル、このアルケニルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_3 アルコキシ、-O-フェニル及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VI) C_2 - C_{10} アルキニル、このアルキニルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_6 アルコキシ、-O-フェニル及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VII) -(C_1 - C_6 アルキル)-O-(C_1 - C_6 アルキル)-OH,

(VIII) -CH₂-NH-CH₂-CH(-O-CH₂-CH₃)₂,

(IX) -(CH₂)₀₋₆-C(=NR_{1-a})(NR_{1-a}R_{1-b});

式中 R_N は

(I) R_{N-1} -X_N-, このX_Nは-CO-, 及び R_{N-1} は下記の基から選択されている：

(A) フェニル、このフェニルは同じであっても異なってもよい下記置換基の1, 2, または3個で置換されている：

(1) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN

, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$, からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

この R_{1-a} 及び R_{1-b} は存在毎に独立してHまたは $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルであり、

- (2) $-\text{OH}$,
- (3) $-\text{NO}_2$,
- (4) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$,
- (5) $-\text{CO}_2\text{H}$,
- (6) $-\text{C}\equiv\text{N}$,

(7) $-(\text{CH}_2)_{0-4}-\text{CO}-\text{NR}_{N-2}\text{R}_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は同じまたは異なっており、下記の群から選択される：

(a) $-\text{H}$

(b) $-\text{C}_1\text{-C}_8$ アルキル、このアルキルは下記群から選択した一つの置換基で任意に置換されている；

- (i) $-\text{OH}$,
- (ii) $-\text{NH}_2$,
- (iii) フェニル ,

(c) $-\text{C}_1\text{-C}_8$ アルキル、このアルキルは独立して $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, または $-\text{I}$ である1, 2, または3個の基で置換されている、

- (d) $-\text{C}_3\text{-C}_8$ シクロアルキル ,
- (e) $-(\text{C}_1\text{-C}_2 \text{ アルキル})-(\text{C}_3\text{-C}_8 \text{ シクロアルキル})$,
- (f) $-(\text{C}_1\text{-C}_6 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_3 \text{ アルキル})$,
- (g) $-\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル ,
- (h) $-\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル ,

(i) 一つの二重結合及び一つの三重結合を有する $-\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル鎖

(j) $-\text{R}_1\text{-アリール}$ 、この $\text{R}_1\text{-アリール}$ は存在する毎に独立してフェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、ジヒドロナフチル、またはテトラリニルであり、下記の独立した1, 2, 3, または4個の基で任意に置換されている：

(i) $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、このアルキルは $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキル、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{I}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, 及び $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、からなる群から独立して選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており

(ii) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iii) $\text{C}_2\text{-C}_6$ アルキニル、このアルキニルは $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CN}$, $-\text{CF}_3$, $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルコキシ、及び $-\text{NR}_{1-a}\text{R}_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(iv) $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, 及び $-\text{I}$,

(v) $-\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の $-\text{F}$ で置換されている、

(vi) $-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(vii) $-OH$,

(viii) $-CN$,

(ix) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(x) $-CO-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(xi) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(xii) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$, 又は

(xiii) $-SO_2-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(k) $-R_1$ -ヘテロアリール、この R_1 -ヘテロアリールは存在する毎に独立して
 ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、
 ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリ
 ニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チ
 アゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベ
 ンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ト
 リアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリ
 ル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマ
 ニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラ
 ヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサ
 ズリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル
 、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル
 、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒド
 ロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベ
 ンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニ
 ル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジ
 ヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリ
 ニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキ
 サゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミヂニル N-オキシド、ピリダジニル N-オ
 キシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、
 インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キ
 ノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イ
 ソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、イ
 ンドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド
 、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキ
 シド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキ
 シド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、か
 らなる群から選択され、

この R_1 -ヘテロアリール基は下記の基の1, 2, 3または4個で任意に置換されている：

(i) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-N$
 $R_{1-a}R_{1-b}-CN$, $-CF_3$, 及び C_1-C_3 アルコキシ、からなる群から独立して選択された1, 2,
 または3個の置換基で任意に置換されている、

(ii) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている、

(iii) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている、

(iv) $-F$, $-Cl$, $-Br$, 及び $-I$ 、

(v) $-C_1 - C_6$ アルコキシ、任意に 1, 2, または 3 個の $-F$ で置換されている、

(vi) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(vii) $-OH$,

(viii) $-C\equiv N$,

(ix) $(CH_2)_{0-4}-C_3 - C_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている、

(x) $(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$,

(xi) $(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(xii) $(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{M-2}R_{M-3}$,

(xiii) $(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$,

(xiv) $(CH_2)_{0-4}-N(R_{M-2})-SO_2-$, 及び

(xv) $(CH_2)_{0-4}-N(R_{M-2})-C(O)-$,

(1) $-R_1$ -ヘテロサイクル、この R_1 -ヘテロサイクルは存在する毎に独立して モルホリニル、チオモルホリニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ペリリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモペリリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、及びホモチオモルホリニル S-オキシドからなる群から選択され、

その R_1 -ヘテロサイクル基は、 R_1 -ヘテロサイクル基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_1 -ヘテロサイクル基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の 1, 2, 3, または 4 個の基で置換されている：

(a) $C_1 - C_6$ アルキル、このアルキルは $C_1 - C_3$ アルキル、ハロゲン、 $-OH$, $-SH$, $-NR_{1-a}R_{1-b}$, $-CN$, $-CF_3$, 及び $C_1 - C_3$ アルコキシ、からなる群から独立して選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている、

(b) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは 1 または 2 個の二重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された 1, 2, または 3 個の置換基で任意に置換されている、

(c) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは 1 または 2 個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択され

た1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(d) ハロゲン

(e) C_1-C_6 アルコキシ、

(f) $-C_1-C_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の $-F$ で置換されている、

(g) $-NR_{N-3}R_{N-3}$,

(h) $-OH$,

(i) $-C\equiv N$,

(j) $(CH_2)_{0-4}-(C_3-C_8$ シクロアルキル)、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から独立に選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(k) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_4$ アルキル),

(l) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(m) $-(CH_2)_{0-4}-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(n) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_6$ アルキル), 及び

(o) $=O$,

(p) $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{N-2})-SO_2-$

(q) $-(CH_2)_{0-4}-N(R_{N-2})-C(O)-$

(8) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_1-C_{12}$ アルキル),

(9) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ アルケニル),

(10) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_2-C_{12}$ アルキニル),

(11) $-(CH_2)_{0-4}-CO-(C_3-C_8$ シクロアルキル),

(12) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ - アリール,

(13) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ - ヘテロアリール,

(14) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_1$ - ヘテロサイクル,

(15) $-(CH_2)_{0-4}-CO-R_{N-4}$ 、この R_{N-4} はフェニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモチオモルホリニル、ホモチオモルホリニル S -オキシド、ホモチオモルホリニル S,S -ジオキシド、ピロリニル、チエニル、ピラゾリル、ピリジニル N -オキシド、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、及びピロリジニルからなる群から選択されており、各基は任意に1, 2, 3, または4個の独立した C_1-C_6 アルキルによって置換されている、

(16) $-(CH_2)_{0-4}-CO-O-R_{N-5}$ 、この R_{N-5} は下記の群から選択されている：

- (a) C_1-C_6 アルキル ,
- (b) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-アリール})$,
- (c) C_2-C_6 アルケニル ,
- (d) C_2-C_6 アルキニル ,
- (e) $-(CH_2)_{0-2}-C_3-C_8$ シクロアルキル ,
- (f) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-ヘテロアリール})$, 及び
- (g) $-(CH_2)_{0-2}-(R_1\text{-ヘテロサイクル})$,

- (17) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (18) $-(CH_2)_{0-4}-SO-(C_1-C_8 \text{ アルキル})$,
- (19) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_1-C_{12} \text{ アルキル})$,
- (20) $-(CH_2)_{0-4}-SO_2-(C_3-C_8 \text{ シクロアルキル})$,
- (21) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-O-R_{N-5}$,
- (22) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (23) $-(CH_2)_{0-4}-N-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (24) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ 又は } R_{N-5})-CO-R_{N-2}$,
- (25) $-(CH_2)_{0-4}-NR_{N-2}R_{N-3}$,
- (26) $-(CH_2)_{0-4}-R_{N-4}$,
- (27) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-(C_1-C_6 \text{ アルキル})$,

(28) $-(CH_2)_{0-4}-O-P(O)-(OR_{100})_2$ 、この R_{100} は存在する毎に独立して-Hまたは C_1-C_4 アルキルであり、

- (29) $-(CH_2)_{0-4}-O-CO-N(R_{N-5})_2$,
- (30) $-(CH_2)_{0-4}-O-CS-N(R_{N-5})_2$,
- (31) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})$,
- (32) $-(CH_2)_{0-4}-O-(R_{N-5})-COOH$,
- (33) $-(CH_2)_{0-4}-S-(R_{N-5})$,

(34) $-(CH_2)_{0-4}-O-(C_1-C_6 \text{ アルキル、このアルキルは任意に1, 2, 3, 4、または5個の-Fで置換されている})$ 、

(35) C_3-C_8 シクロアルキル

(36) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは C_1-C_3 アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-CN、-CF₃、 C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(37) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは C_1-C_3 アルキル、-F、-Cl、-Br、-I、-OH、-SH、-CN、-CF₃、 C_1-C_3 アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(H \text{ または } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(39) $-(CH_2)_{1-4}-(C_3-C_8 \text{ シクロアルキル})$ 、

(B) $-R_N$ -ヘテロアリール、この R_N -ヘテロアリールは

ピリジニル、インドリル、インドリニル、イソインドリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、及びイソクロマニル、からなる群から選択され、

その R_N -ヘテロアリール基は、 R_N -ヘテロアリール基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_N -ヘテロアリール基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C_1 - C_6 アルキル、このアルキルは C_1 - C_3 アルキル、-F, -Cl, -Br, -I, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1 - C_3 アルコキシ及び-NR_{1-a}R_{1-b}、からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている

- (2) -OH,
- (3) -NO₂,
- (4) -F, -Cl, -Br, -I,
- (5) -CO₂H,
- (6) -C≡N,
- (7) - (CH₂)₀₋₄-CO-NR_{N-2}R_{N-3},
- (8) - (CH₂)₀₋₄-CO- (C₁-C₁₂ アルキル) ,
- (9) - (CH₂)₀₋₄-CO- (C₂-C₁₂ アルケニル) ,
- (10) - (CH₂)₀₋₄-CO- (C₂-C₁₂ アルキニル) ,
- (11) - (CH₂)₀₋₄-CO- (C₃-C₈ シクロアルキル) ,
- (12) - (CH₂)₀₋₄-CO-R₁- アリール ,
- (13) - (CH₂)₀₋₄-CO-R₁- ヘテロアリール ,
- (14) - (CH₂)₀₋₄-CO-R₁- ヘテロサイクル ,
- (15) - (CH₂)₀₋₄-CO-R_{M-4}
- (16) - (CH₂)₀₋₄-CO-O-R_{N-5}
- (17) - (CH₂)₀₋₄-SO₂-NR_{M-2}R_{M-3},
- (18) - (CH₂)₀₋₄-SO- (C₁-C₈ アルキル) ,
- (19) - (CH₂)₀₋₄-SO₂- (C₁-C₁₂ アルキル) ,
- (20) - (CH₂)₀₋₄-SO₂- (C₃-C₈ シクロアルキル) ,
- (21) - (CH₂)₀₋₄-N(H 又は R_{M-5}) -CO-O-R_{M-5},
- (22) - (CH₂)₀₋₄-N(H 又は R_{M-5}) -CO-N(R_{M-5})₂ ,
- (23) - (CH₂)₀₋₄-N-CS-N(R_{M-5})₂,
- (24) - (CH₂)₀₋₄-N(-H 又は R_{M-5}) -CO-R_{M-2},
- (25) - (CH₂)₀₋₄-NR_{M-2}R_{M-3},
- (26) - (CH₂)₀₋₄-R_{M-4},
- (27) - (CH₂)₀₋₄-O-CO- (C₁-C₆ アルキル) ,
- (28) - (CH₂)₀₋₄-O-P(O) - (OR₁₀₀)₂,
- (29) - (CH₂)₀₋₄-O-CO-N(R_{N-5})₂,
- (30) - (CH₂)₀₋₄-O-CS-N(R_{N-5})₂,
- (31) - (CH₂)₀₋₄-O- (R_{N-5}) ,
- (32) - (CH₂)₀₋₄-O- (R_{N-5}) -COOH,
- (33) - (CH₂)₀₋₄-S- (R_{N-5}) ,

(34) - (CH₂)₀₋₄-O- (C₁-C₆ アルキル)、このアルキルは任意に1, 2, 3, 4、または5個の-Fで置換されている、

(35) C₃-C₈ シクロアルキル

(36) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(37) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、または $-NR_{1-a}R_{1-b}$ で任意に置換されている、

(38) $-(CH_2)_{0-4}-N(-H \text{ 又は } R_{N-5})-SO_2-R_{N-2}$ 、

(39) $-(CH_2)_{1-4}-C_3-C_8 \text{ cycloalkyl}$ 、

(C) R_M -アリール $-W-R_N$ -アリール、

(D) R_M -アリール $-W-R_N$ -ヘテロアリール、

(E) R_M -アリール $-W-R_1$ -ヘテロサイクル、

(F) R_M -ヘテロアリール $-W-R_N$ -アリール、

(G) R_M -ヘテロアリール $-W-R_N$ -ヘテロアリール、

(H) R_M -ヘテロアリール $-W-R_M-1$ -ヘテロサイクル、

(I) R_M -ヘテロサイクル $-W-R_M$ -アリール、

(J) R_M -ヘテロサイクル $-W-R_M$ -ヘテロアリール、

(K) R_M -ヘテロサイクル $-W-R_M-1$ -ヘテロサイクル、

ここで W は

(25) $-(CH_2)_{1-4}-$ 、

(26) $-O-$ 、

(27) $-S(O)_{0-2}-$ 、

(28) $-N(R_{N-3})-$ 、

(29) $-CO-$ ；又は

(30) a 結合；

(II) $-CO-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})-M-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、この M は S 、 SO または SO_2 であり、各アルキルは非置換であるかまたは下記の群から独立に選択された1、2、または3個の置換基で任意に置換されている：

(A) $-NH-CO-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、

(B) $-NH-CO-O-R_{N-8}$ 、

(C) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ ；

式中 R_1 は

$-(CH_2)_{n_1}$ -フェニル、この n_1 は零または1であり、フェニル環上に下記の置換基を1、2、3、または4個任意に置換している：

(A) $C_1 - C_6$ アルキル、このアルキルは $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から選択された1、2、または3個の置換基で任意に置換されている

(B) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-CF_3$ 、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1、2、

または3個の置換基で任意に置換されている、

(C) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(D) $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$,

(F) $-C_1 - C_6$ アルコキシ、任意に1, 2, または3個の $-F$ で置換されている、

(G) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義される、

(H) $-OH$,

(I) $-CN$,

(J) $C_3 - C_7$ シクロアルキル、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(K) $-CO-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$,

(L) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(M) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(N) $-SO_2-(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$;

式中 R_2 は

(I) $-(Z)-C_1 - C_6$ アルキル、この Z は結合、 $-C(O)-$, $-CO_2-$, または $-SO_2-$ であり、このアルキル基は $C_1 - C_3$ アルキル、 $C_1 - C_7$ アルキル ($C_1 - C_3$ アルキル及び $C_1 - C_3$ アルコキシで任意に置換されている)、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、この R_{1-a} 及び R_{1-b} は独立して $-H$ または $C_1 - C_6$ アルキル、及び $-OC(=O)NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されており、

(II) $-(Z)-CH_2-S(O)_{0-2}-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$,

(III) $-(Z)-CH_2-CH_2-S(O)_{0-2}-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$,

(IV) $-(Z)-C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(V) $-(Z)-C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(VI) $-(Z)-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-アリール})$ 、この Z は結合、 CO , CO_2 , または SO_2 であり、この n_1 は零または1であり、そしてこの $R_{1-アリール}$ はフェニル、1-ナフチル、2-ナフチル及びインダニル、インデニル、ジヒドロナフタリル、またはテトラリニルであり、そのアリール環上1, 2, または3個の下記置換基で置換されている：

(A) $C_1 - C_6$ アルキル、このアルキルは $C_1 - C_3$ アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている：

(B) $C_2 - C_6$ アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(C) $C_2 - C_6$ アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, $C_1 - C_3$ アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2,

または3個の置換基で任意に置換されている、

(D) -F, -Cl, -Br, -I,

(F) -C₁-C₆アルコキシ、任意に1, 2, または3個の -Fで置換されている、

(G) -NR_{N-2}R_{N-3}、このR_{N-2}及びR_{N-3}は後に定義される、

(H) -OH,

(I) -CN,

(J) C₃-C₇シクロアルキル、このシクロアルキルは-F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C₁-C₃アルコキシ、及び-NR_{1-a}R_{1-b}からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(K) -CO-(C₁-C₄ アルキル),

(L) -SO₂-NR_{1-a}R_{1-b},

(M) -CO-NR_{1-a}R_{1-b},

(N) -SO₂-(C₁-C₄ アルキル),

(VII)-(Z)-(CH₂)_{n₁}-(R₁-ヘテロアリール)、このn₁はすでに定義したとおりであり、このR₁-ヘテロアリールは

ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、インドリニル、ピリダジニル、ピラジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、インドリジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、フラニル、チエニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、イソクロマニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキサソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソオキサジニル、ベンズイソオキサジニル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロモニル、クロマノニル、ピリジニル-N-オキシド、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾオキサゾリノニル、ピロリル N-オキシド、ピリミヂニル N-オキシド、ピリダジニル N-オキシド、ピラジニル N-オキシド、キノリニル N-オキシド、インドリル N-オキシド、インドリニル N-オキシド、イソキノリル N-オキシド、キナゾリニル N-オキシド、キノキサリニル N-オキシド、フタラジニル N-オキシド、イミダゾリル N-オキシド、イソオキサゾリル N-オキシド、オキサゾリル N-オキシド、チアゾリル N-オキシド、インドリジニル N-オキシド、インダゾリル N-オキシド、ベンゾチアゾリル N-オキシド、ベンズイミダゾリル N-オキシド、ピロリル N-オキシド、オキサジアゾリル N-オキシド、チアジアゾリル N-オキシド、トリアゾリル N-オキシド、テトラゾリル N-オキシド、ベンゾチオピラニル S-オキシド、及びベンゾチオピラニル S,S-ジオキシド、からなる群から選択され、

このR₁-ヘテロアリールは、R₁-ヘテロアリール基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元のR_N-ヘテロアリール基のいずれかの環構成原子によって-(CH₂)_{n₁}-と結合し、そのヘテロアリールは任意に下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(3) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(4) $-F$, $-Cl$, $-Br$ または $-I$,

(6) $-C_1-C_6$ アルコキシ、1, 2, または3個の $-F$ で任意に置換されている、

(7) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義するとおり、

(8) $-OH$,

(9) $-CN$

(10) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(11) $-CO-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(12) $-SO_2-NR_{1-a}R_{1-b}$,

(13) $-CO-NR_{1-a}R_{1-b}$, 又は

(14) $-SO_2-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

その前提として n_1 は零で、 R_{1-} ヘテロアリールは窒素により炭素鎖と結合していない、または

(VIII) $-(Z)-(CH_2)_{n_1}-(R_{1-} \text{ ヘテロサイクル})$ 、この n_1 は既に定義したとおりであり、 R_{1-} ヘテロサイクルは：

モルホリニル、チオモルホルニル、チオモルホリニル S-オキシド、チオモルホリニル S,S-ジオキシド、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、ホモピペリジニル、ホモモルホリニル、ホモモルホリニル S-オキシド、ホモチオモルホリニル S,S-ジオキシド、オキサゾリジノニル、ジヒドロピラゾリル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラジニル、ジヒドロピリジニル、ジヒドロピリミジニル、ジヒドロフリル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル S-オキシド、テトラヒドロチエニル S,S-ジオキシド、ホモチオモルホリニル S-オキシド、からなる群から選択され、

この R_{1-} ヘテロサイクル基は、 R_{1-} ヘテロサイクル基との新しい結合が水素原子をその結合で置き換えるように、水素原子によって置換されている元の R_{1-} ヘテロサイクル基のいずれかの原子と結合し、そのヘテロサイクルは任意に独立した下記の1, 2, 3, または4個の基で置換されている：

(1) C_1-C_6 アルキル、このアルキルは C_1-C_3 アルキル、 $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ 、からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(2) C_2-C_6 アルケニル、このアルケニルは1または2個の二重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(3) C_2-C_6 アルキニル、このアルキニルは1または2個の三重結合を有し、 $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-SH$, $-CN$, $-CF_3$, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2

、または3個の置換基で任意に置換されている、

(4) -F, -Cl, -Brまたは-I,

(5) C_1-C_6 アルコキシ

(6) - C_1-C_6 アルコキシ、1, 2, または3個の -Fで任意に置換されている、

(7) $-NR_{N-2}R_{N-3}$ 、この R_{N-2} 及び R_{N-3} は後に定義するとおり、

(8) -OH,

(9) -CN

(10) C_3-C_7 シクロアルキル、このシクロアルキルは -F, -Cl, -OH, -SH, -CN, -CF₃, C_1-C_3 アルコキシ、及び $-NR_{1-a}R_{1-b}$ からなる群から選択された1, 2, または3個の置換基で任意に置換されている、

(11) $-\text{CO}-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(12) $-\text{SO}_2-\text{NR}_{1-a}R_{1-b}$,

(13) $-\text{CO}-\text{NR}_{1-a}R_{1-b}$,

(14) $-\text{SO}_2-(C_1-C_4 \text{ アルキル})$,

(15)=0、前提として n_1 は零で R_1 -ヘテロサイクル 基は窒素原子で炭素と結合していない；そして

式中 R_{20} はHまたは C_1-C_6 アルキルまたはアルケニルである、

で表される化合物である医薬組成物。

【請求項 37】

アルツハイマー病、アルツハイマー病の発症を予防または遅延させることを補助するため、軽度認識障害 (MCI) の患者を治療しそしてMCIからADに進展するであろう患者においてアルツハイマー病の発症を予防または遅延させるため、ダウン症候群を治療するため、ダッチタイプアミロイドーシスを有する家族性脳出血のヒトを治療するため、脳のアミロイド血管疾患の治療及びその潜在的転帰、すなわち単回及び回帰性葉出血、を防ぐため、パーキンソン病を伴う痴呆、進行性スプラヌクレア麻痺を伴う痴呆、皮質基底の退行を伴う痴呆、またはアルツハイマー病のびまん性Lewy体型及びその治療を必要とする人を含む血管性及び退行性の混合型痴呆を含む退行性痴呆を治療するため、からなる群から選択された病気または状態の治療またはそうなることを予防するための請求項 36 の医薬組成物。