

【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】令和2年10月22日(2020.10.22)

【公表番号】特表2020-502058(P2020-502058A)

【公表日】令和2年1月23日(2020.1.23)

【年通号数】公開・登録公報2020-003

【出願番号】特願2019-526217(P2019-526217)

【国際特許分類】

C 07D 231/56	(2006.01)
C 07D 409/12	(2006.01)
A 61K 31/416	(2006.01)
A 61K 31/4439	(2006.01)
C 07D 401/12	(2006.01)
C 07D 403/12	(2006.01)
A 61K 31/506	(2006.01)
A 61K 31/4178	(2006.01)
C 07D 405/12	(2006.01)
C 07D 495/08	(2006.01)
C 07D 487/04	(2006.01)
A 61K 31/519	(2006.01)
A 61K 31/4196	(2006.01)
C 07D 413/12	(2006.01)
A 61K 31/422	(2006.01)
C 07D 417/12	(2006.01)
A 61K 31/433	(2006.01)
A 61K 31/4245	(2006.01)
A 61K 31/554	(2006.01)
A 61K 31/5377	(2006.01)
C 07D 401/04	(2006.01)
C 07D 409/14	(2006.01)
C 07D 417/14	(2006.01)
A 61K 31/427	(2006.01)
A 61P 1/16	(2006.01)
A 61P 3/10	(2006.01)
A 61P 3/04	(2006.01)
A 61P 3/06	(2006.01)
A 61P 9/10	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)
C 07D 413/14	(2006.01)

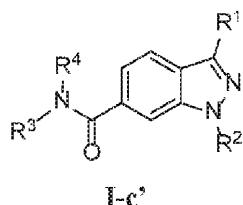
【F I】

C 07D 231/56	C S P B
C 07D 409/12	
A 61K 31/416	
A 61K 31/4439	
C 07D 401/12	
C 07D 403/12	
A 61K 31/506	
A 61K 31/4178	
C 07D 405/12	

C 0 7 D	495/08	
C 0 7 D	487/04	1 4 4
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/4196	
C 0 7 D	413/12	
A 6 1 K	31/422	
C 0 7 D	417/12	
A 6 1 K	31/433	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/554	
A 6 1 K	31/5377	
C 0 7 D	401/04	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	417/14	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	413/14	

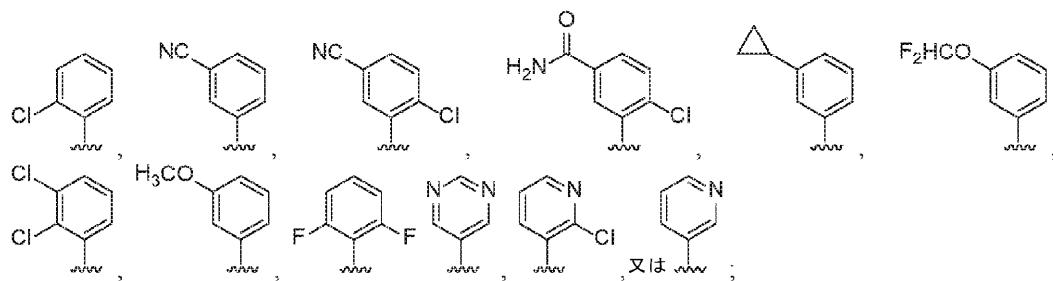
【手続補正書】**【提出日】**令和2年9月14日(2020.9.14)**【手続補正1】****【補正対象書類名】**特許請求の範囲**【補正対象項目名】**全文**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【特許請求の範囲】****【請求項1】**

下記構造式 I - c' を有する化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【化1】

[式中、
R¹ は

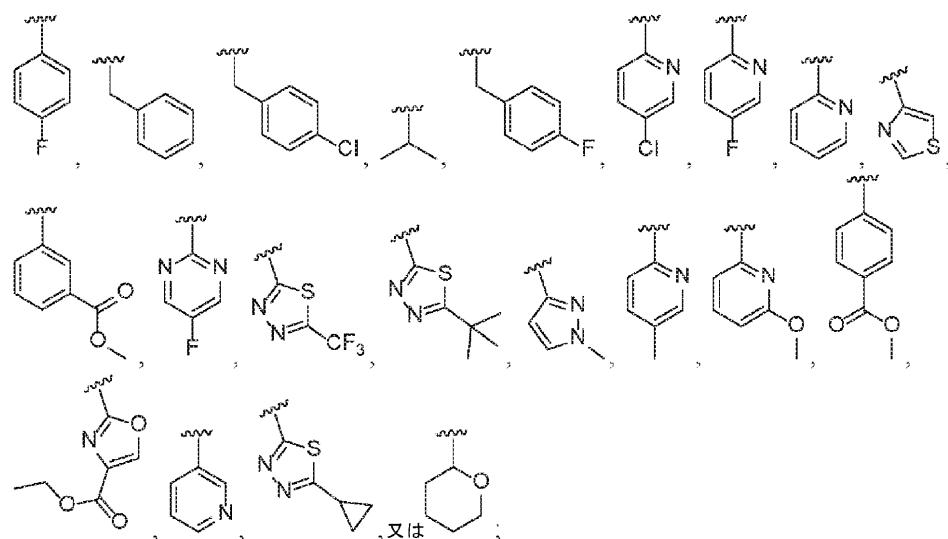
【化 2】



であり；

R^2 は

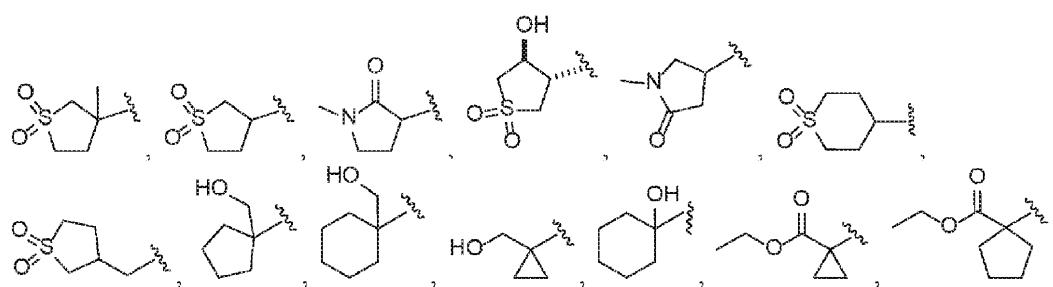
【化 3】

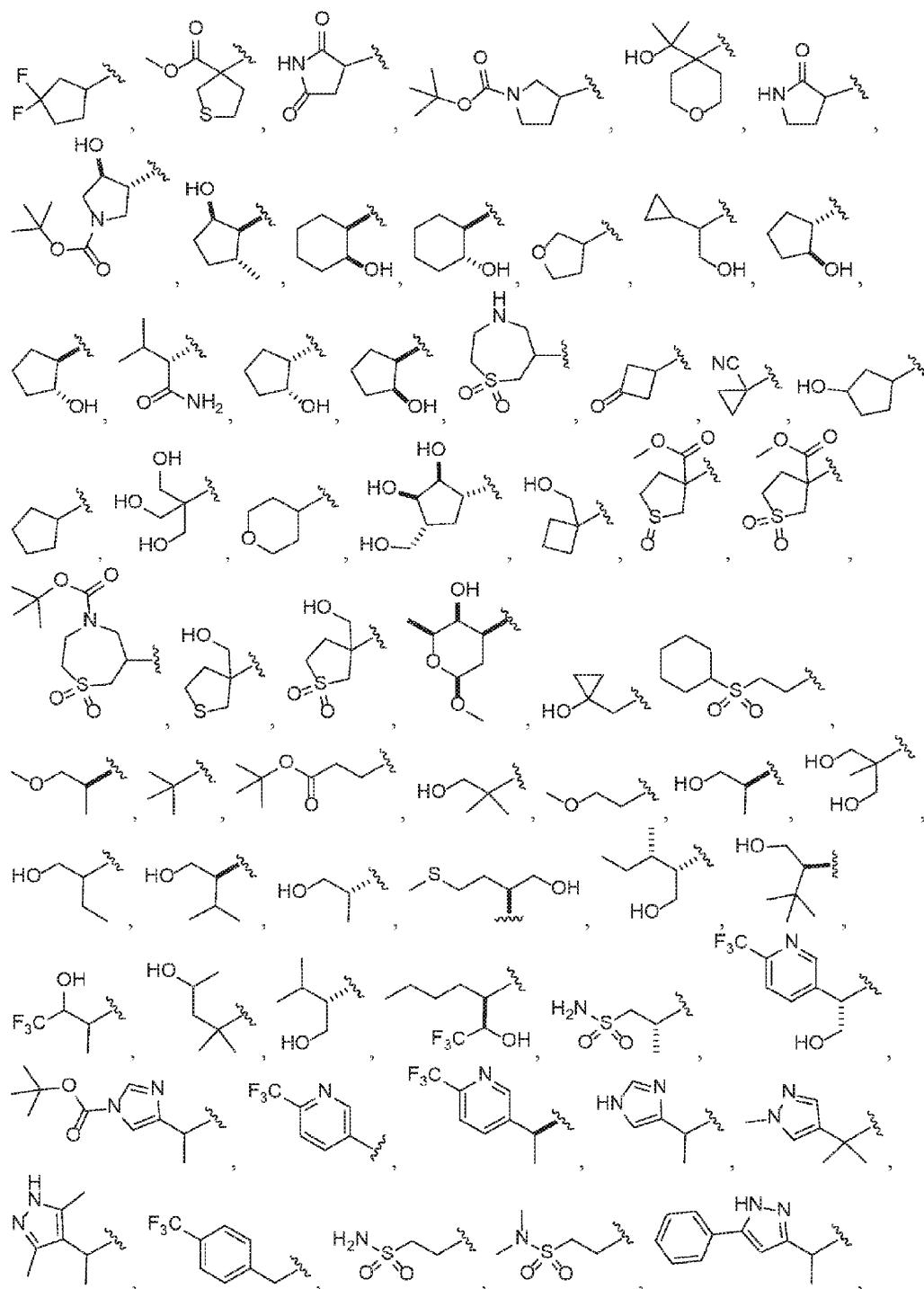


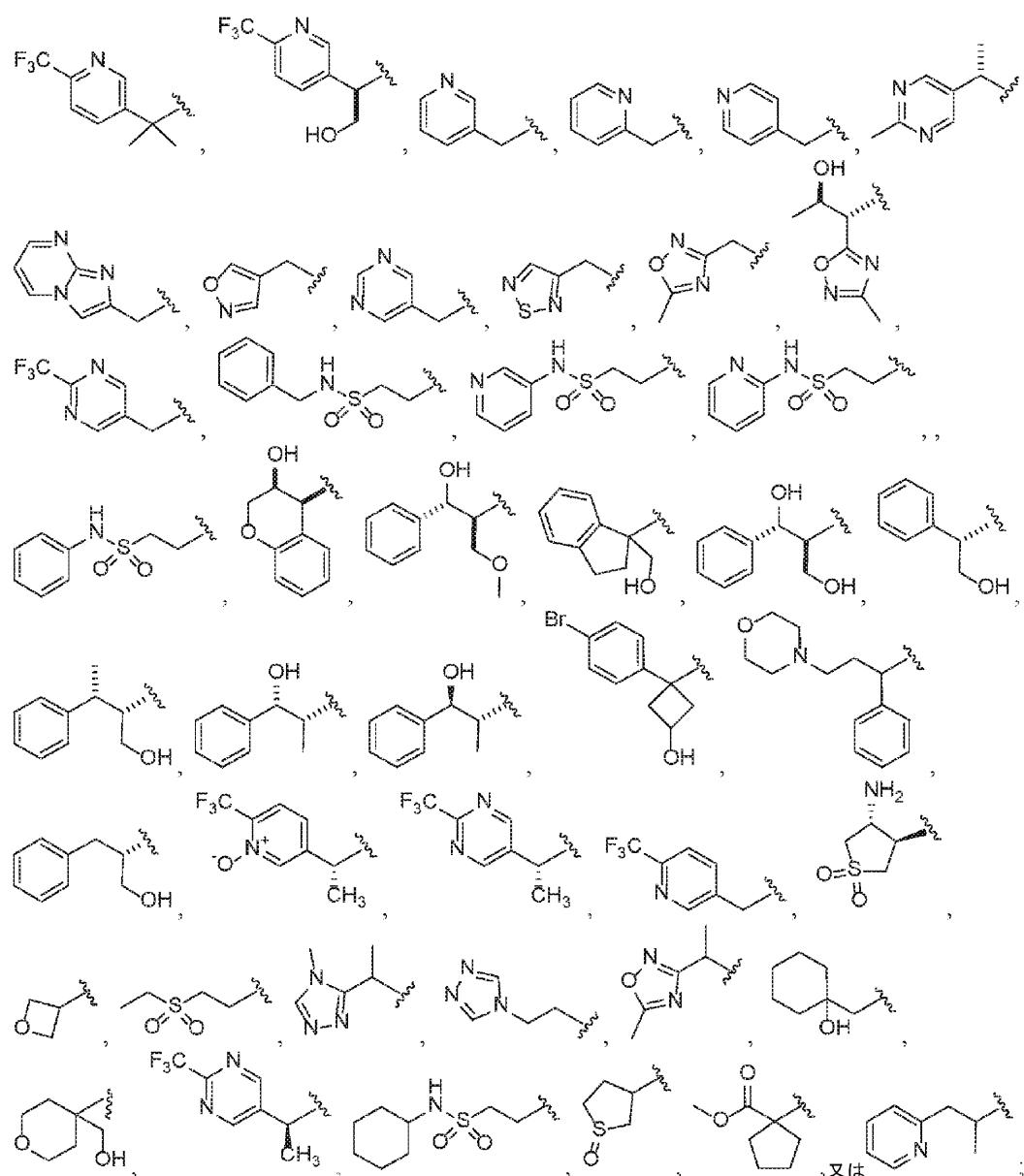
であり；

R^3 は

【化 4】







であり；

R⁴ は

(1) 水素、または

(2) (C₁ - 3) アルキル、

であり、

又は、R³ 及び R⁴ は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 7 員单環式若しくは 6 ~ 10 員二環式複素環を形成しており、ここで、当該複素環は、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁶ によって置換されており；そして、

R⁶ は、

- (1) (C₁ -₃) アルキル、
- (2) ハロ (C₁ -₃) アルキル - 、
- (3) オキソ、
- (4) (C₃ -₆) シクロアルキル、
- (5) - C (O) O - (C₁ -₄) アルキル、
- (6) NH₂ 、
- (7) ヒドロキシ、

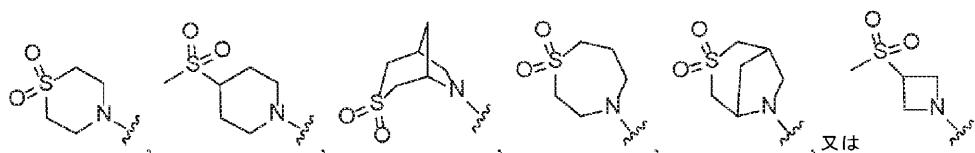
- (8) 置換されていないかハロによって置換されているフェニル、
 (9) ヒドロキシ(C₁ - 3)アルキル - 、
 (10) シアノ、
 (11) ハロ、又は
 (12) - S(O)₂ - (C₁ - 3)アルキル

である。】

【請求項 2】

R³ 及び R⁴ が、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、

【化 5】

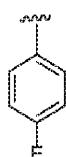


を形成している、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R² が

【化 6】

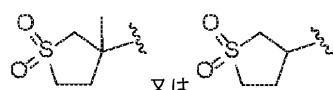


である、請求項 1 又は 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4】

R³ が

【化 7】



である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

(1) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(2) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { 1 - [1 - オキシド - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(4) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { 1 - [2 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 5 - イル] エチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { (1 S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(6) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (1 - メチル - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (7) t e r t - ブチル 4 - [1 - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) エチル] - 1 H - イミダゾール - 1 - カルボキシレート、
 (8) N - [(3 R , 4 R) - 4 - アミノ - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (9) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [4 - ヒドロキシ - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (10) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (11) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { (1 R) - 1 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (12) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S) - 2 - メトキシ - 1 - メチルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (13) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { (1 S) - 1 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (14) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (1 H - イミダゾール - 4 - イル) エチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (15) N - t e r t - ブチル - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (16) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - メチル - 1 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) エチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (17) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [1 - (3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) エチル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (18) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] メチル } - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (19) t e r t - ブチル N - { [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } - - アラニネート、
 (20) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - スルファモイルエチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (21) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - オキセタン - 3 - イル - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (22) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (1 - メチル - 5 - オキソピロリジン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (23) 3 - (2 - クロロフェニル) - 6 - [(3 , 3 - ジオキシド - 3 - チア - 6 - アザビシクロ [3 . 2 . 1] オクタ - 6 - イル) カルボニル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール、
 (24) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2 H - チオピラン - 4 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
 (25) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [2 - (ジメチルスルファモイル) エチル

] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(2 6) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [2 - (エチルスルホニル) エチル] - 1
- (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(2 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - メチル -
N - [1 - (5 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) エチル] - 1 H - インダゾー
ル - 6 - カルボキサミド、
(2 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { 1 - メ
チル - 1 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル } - 1 H - インダ
ゾール - 6 - カルボキサミド、
(2 9) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [(1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオ
フェン - 3 - イル) メチル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6
- カルボキサミド、
(3 0) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - { (1 R
) - 2 - ヒドロキシ - 1 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] エチル }
- 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 1) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (ピリジ
ン - 3 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (ピリジ
ン - 2 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (ピリジ
ン - 4 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 4) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S
) - 1 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) エチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カル
ボキサミド、
(3 5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (イミダ
ゾ [1 , 2 - a] ピリミジン - 2 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサ
ミド、
(3 6) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (4
- メチル - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル) エチル] - 1 H - インダゾー
ル - 6 - カルボキサミド、
(3 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (イソオ
キサゾール - 4 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (ピリミ
ジン - 5 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(3 9) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - (4 H
- 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル) エチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カル
ボキサミド、
(4 0) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (1 , 2
, 5 - チアシアゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(4 1) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (5
- メチル - 1 , 2 , 4 - オキサシアゾール - 3 - イル) エチル] - 1 H - インダゾール
- 6 - カルボキサミド、
(4 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - ヒ
ドロキシ - 1 , 1 - ジメチルエチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(4 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (1
- ヒドロキシメチル) シクロペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(4 4) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 -
ヒドロキシシクロヘキシリ) メチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(4 5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - メ
トキシエチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(46) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 1 - (ヒドロキシメチル) - 1 - メチルエチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(47) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [4 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(48) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1R, 2S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - (3 - メチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) プロピル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(49) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - {[2 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 5 - イル] メチル} - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(50) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - {[(1S) - 1 - [2 - (トリフルオロメチル) ピリミジン - 5 - イル] エチル} - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(51) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1R) - 1 - メチル - 2 - スルファモイルエチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(52) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (2 - オキソピロリジン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(53) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [2 - (シクロヘキシルスルファモイル) エチル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(54) N - [2 - (ベンジルスルファモイル) エチル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(55) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - (ピリジン - 2 - イルスルファモイル) エチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(56) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - (フェニルスルファモイル) エチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(57) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (2, 5 - ジオキソピロリジン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(58) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (1 - オキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(59) メチル 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル} アミノ) テトラヒドロチオフェン - 3 - カルボキシレート、

(60) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - (ピリジン - 3 - イルスルファモイル) エチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(61) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(62) エチル 1 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル} アミノ) シクロプロパンカルボキシレート、

(63) メチル 1 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル} アミノ) シクロペンタンカルボキシレート、

(64) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3, 3 - ジフルオロシクロペンチル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(6 5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (ヒドロキシメチル) プロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(6 6) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド (シス)、
(6 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド (トランス)、
(6 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(6 9) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルプロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 0) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [4 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 1) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [3 - ヒドロキシ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - クロメン - 4 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 5 - メチルシクロペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシエチル) ペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 4) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 1 - (メトキシメチル) - 2 - フェニルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (ヒドロキシメチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 6) tert - ブチル 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) - 4 - ヒドロキシロリジン - 1 - カルボキシレート、
(7 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 - シクロプロピル - 2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(7 9) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 0) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 - フェニルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 1) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルプロピル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシ - 1 - フェニルエチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - ヒドロキシシクロペンチル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 4) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - シクロペンチル - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(8 5) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒ

ドロキシ - 1 , 1 - ビス (ヒドロキシメチル) エチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(8 6) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(8 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - [2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (ヒドロキシメチル) シクロペンチル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(8 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (ヒドロキシメチル) シクロブチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(8 9) メチル 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) テトラヒドロチオフェン - 3 - カルボキシレート 1 - オキシド、

(9 0) メチル 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) テトラヒドロチオフェン - 3 - カルボキシレート 1 , 1 - ジオキシド、

(9 1) tert - ブチル 6 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) - 1 , 4 - チアゼパン - 4 - カルボキシレート 1 , 1 - ジオキシド、

(9 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [3 - (ヒドロキシメチル) - 1 , 1 - ジオキシド テトラヒドロチオフェン - 3 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 3 - (メチルスルファニル) プロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 4) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシシクロペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 5) N - [1 - カルバモイル - 2 - メチルプロピル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 6) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [2 - ヒドロキシシクロペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 7) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S , 2 S) - 2 - ヒドロキシシクロペンチル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 8) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [3 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロチオフェン - 3 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(9 9) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 , 2 - ジメチルプロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(1 0 0) tert - ブチル (3 S) - 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) ピロリジン - 1 - カルボキシレート、

(1 0 1) tert - ブチル (3 R) - 3 - ({ [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] カルボニル } アミノ) ピロリジン - 1 - カルボキシレート、

(1 0 2) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシド - 1 , 4 - チアゼパン - 6 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(1 0 3) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 S , 2 S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルブチル] - 1 H - インダゾール - 6

- カルボキサミド、

(104) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - オキソシクロプロチル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(105) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 - シアノシクロプロピル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(106) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1R, 2S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 2 - フェニルエチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(107) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1R, 2R) - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチル - 2 - フェニルエチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(108) N - [1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - ヒドロキシシクロプロチル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(109) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - モルホリン - 4 - イル - 1 - フェニルプロピル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(110) N - [(1S) - 1 - ベンジル - 2 - ヒドロキシエチル] - 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(111) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - ((2S, 3S, 4S, 6S) - 3 - ヒドロキシ - 6 - メトキシ - 2 - メチルテトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(112) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (1 - メチル - 2 - ピリジン - 2 - イルエチル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(113) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - ヒドロキシ - 1, 1 - ジメチルブチル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(114) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1 - ヒドロキシシクロプロピル) メチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(115) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1R, 2S) - 2 - ヒドロキシシクロベンチル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(167) 1 - ベンジル - 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(168) 1 - (4 - クロロベンジル) - 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(169) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (1 - メチルエチル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(170) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロベンジル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(171) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(172) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(173) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - N

- (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6
- カルボキサミド、
(174) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - ピリジン - 2 - イル - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(175) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - ピリジン - 2 - イル - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(176) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(179) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (チアゾール - 4 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(180) メチル 3 - { 3 - (2 - クロロフェニル) - 6 - [(3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) カルバモイル] - 1 H - インダゾール - 1 - イル } ベンゾエート、
(181) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (5 - フルオロピリミジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(182) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(183) 1 - (5 - tert - ブチル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(184) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(185) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (5 - メチルピリジン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(186) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (6 - メトキシピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(187) メチル 4 - { 3 - (2 - クロロフェニル) - 6 - [(3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) カルバモイル] - 1 H - インダゾール - 1 - イル } ベンゾエート、
(188) エチル 2 - { 3 - (2 - クロロフェニル) - 6 - [(3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) カルバモイル] - 1 H - インダゾール - 1 - イル } - 1 , 3 - オキサゾール - 4 - カルボキシレート、
(189) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - ピリジン - 3 - イル - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(190) 3 - (2 - クロロフェニル) - 1 - (5 - シクロプロビル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、及び
(191) 3 - (2 - クロロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド

からなる群から選択される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 6】

(116) 3 - (3 - シアノフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(117) 3 - (3 - シアノフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(118) 3 - (2 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(119) 3 - (2 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(120) 3 - (2 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(121) 3 - (5 - カルバモイル - 2 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(122) 3 - (5 - カルバモイル - 2 - クロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(123) 3 - (2 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(1S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルプロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(124) 3 - (3 - シクロプロピルフェニル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - N - [(1S) - 1 - (ヒドロキシメチル) - 2 - メチルプロピル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(125) 3 - (3 - シクロプロピルフェニル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(126) 3 - (3 - シクロプロピルフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(127) 3 - (2 - クロロ - 5 - シアノフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(128) 3 - [3 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(129) 3 - (3 - シアノフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(130) 3 - (2, 3 - ジクロロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテラヒドロ - チオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(131) N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (3 - メトキシフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(132) 3 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロ - チオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(133) N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ピリミジン - 5 - イル - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(134) N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ピリジン - 3 - イル - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(135) 3 - (2 - クロロピリジン - 3 - イル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(136) 3 - [3 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(137) 3 - (5 - クロロ - 2 - メトキシピリジン - 4 - イル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(138) 3 - (5 - クロロ - 2 - メトキシピリジン - 3 - イル) - N - (1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(139) 3 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(140) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - メトキシピリジン - 4 - イル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(141) 3 - (5 - クロロ - 2 - メトキシピリジン - 4 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(142) 3 - (5 - クロロ - 2 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(143) 3 - [3 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(144) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (3 - メトキシフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(145) 3 - (3 - シクロプロビルフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(146) 3 - (5 - シアノピリジン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(147) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - [3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル] - 1H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(148) 3 - [3 - (ジメチルカルバモイル)フェニル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1, 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) -

1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(149) 3 - (3 - カルバモイルフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N -
(3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(150) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - [3 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) フェニル] - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(151) 3 - (5 - シアノ - 2 - フルオロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(152) 3 - (6 - クロロ - 2 - フルオロピリジン - 3 - イル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(153) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (5 - フルオロピリジン - 3 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(154) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (2 - フルオロピリジン - 3 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(155) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(156) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - (3 - メチルフェニル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(157) 3 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(158) 3 - (3 - クロロフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(159) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - [2 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(160) 3 - [2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(161) 3 - (5 - シアノ - 2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(162) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - フェニル - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(163) 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (1 - メチル - 1 H - ベンゾトリアゾール - 6 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(164) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - [3 - (5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) フェニル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、
(165) 1 - (4 - フルオロフェニル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテ

トラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 3 - [3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) フェニル] - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、

(166) 3 - (6 - ((1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) カルバモイル) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル) ピリジン 1 - オキシド、

(177) 3 - (3 - シアノフェニル) - N - (1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド、及び

(178) - (3 - シアノフェニル) - 1 - (5 - フルオロピリジン - 2 - イル) - N - (3 - メチル - 1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボキサミド

からなる群から選択される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

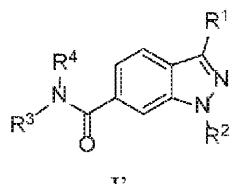
【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩、及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 8】

処置を必要とする哺乳動物での D G A T 2 の拮抗作用に応答する障害、症状若しくは疾患の治療に有用な医薬の調製のための、下記構造式 I を有する化合物又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【化 8】



[式中、

R¹ は、

(1) 置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁵ によって置換されている 6 員アリール、又は

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 , 6 若しくは 9 員ヘテロアリール又は 9 員二環式複素環 [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁵ によって置換されている。]

であり；

R² は、

(1) 置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁷ によって置換されている 6 員アリール、

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁷ によって置換されている。]、

(3) (C_{1 - 6}) アルキル、

(4) 独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員複素環、又は

(5) - C H₂ - 6 員アリール [当該アリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁷ によって置換されている。]

であり；

R³ は、

(1) 独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 7 員複素環、

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5

若しくは 6 員ヘテロアリール、

(3) - (C₁ - 6) アルキル - ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員ヘテロアリールである。]、

(4) - (C₁ - 6) アルキル - 6 員アリール、

(5) - (C₁ - 6) アルキル - 複素環 [当該複素環は、独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 3 ~ 6 員環である。]、

(6) (C₁ - 6) アルキル、

(7) - (C₁ - 6) アルキル - C(O)O - (C₁ - 4) アルキル、

(8) - (C₁ - 6) アルキル - S(O)₂ - NR^{9a}R^{9b}、

(9) - (C₁ - 6) アルキル - S(O)₂ - (C₁ - 3) アルキル、

(10) - (C₁ - 3) アルキル - ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは 8 ~ 10 員縮合環であり、ここで、当該ヘテロアリールは、独立に N、O 及び S から選択される 1、2、3 若しくは 4 個のヘテロ原子を含む。]、

(11) - (C₁ - 6) アルキル - S(O)₂ - (C₃ - 6) シクロアルキル、

(12) - (C₁ - 6) アルキル - S(O)₂ - NR^{9a} - (C₃ - 6) シクロアルキル、

(13) - (C₁ - 6) アルキル - (C₃ - 6) シクロアルキル、

(14) (C₃ - 6) シクロアルキル、又は

(15) 9 ~ 10 員縮合アリール

であり、

各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又は複素環は、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁶ によって置換されており、ここで、各アルキルは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁸ によって置換されており；

R⁴ は、

(1) 水素、

(2) (C₁ - 3) アルキル

であり、

又は、R³ 及び R⁴ は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 7 員单環式若しくは 6 ~ 10 員二環式複素環を形成しており、ここで、当該複素環は、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁶ によって置換されており；

R⁵ は、

(1) シアノ、

(2) ハロ、

(3) (C₁ - 6) アルキル、

(4) - C(O)NH₂、

(5) - C(O)NR^{10a}R^{10b}、

(6) (C₃ - 6) シクロアルキル、

(7) ヒドロキシ、

(8) ヒドロキシ (C₁ - 3) アルキル - 、

(9) (C₁ - 6) アルコキシ - 、

(10) - NR^{10a}R^{10b}、

(11) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 員ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 2 個の R⁷ によって置換されている。]、

(12) ハロ (C₁ - 6) アルキル - 、又は

(13) ハロ (C₁ - 6) アルコキシ -

であり；

R⁶ は、

- (1) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (2) ハロ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (3) オキソ、
- (4) (C_{3 - 6}) シクロアルキル、
- (5) - C (O) O - (C_{1 - 4}) アルキル、
- (6) NH₂ 、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) 置換されていないかハロによって置換されているフェニル、
- (9) ヒドロキシ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (10) (C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (11) ハロ (C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (12) シアノ、又は
- (13) ハロ

であり；

R⁷ は、

- (1) (C_{1 - 6}) アルキル、
- (2) ハロ、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ハロ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (5) (C_{3 - 6}) シクロアルキル、又は
- (6) - C (O) O - (C_{1 - 3}) アルキル

であり；

R⁸ は、

- (1) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (2) ヒドロキシ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ヒドロキシ、
- (5) ハロ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (6) (C_{1 - 3}) アルキル - S - 、
- (7) - C (O) - N R^{9 a} R^{9 b} 、又は
- (8) フェニル

であり；

R^{9 a} 及び R^{9 b} は独立に、

- (1) 水素、
- (2) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (3) - (C_{1 - 3}) アルキル - フェニル、
- (4) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5
若しくは 6 員ヘテロアリール、又は
- (5) フェニル

であり；

R^{10 a} 及び R^{10 b} は独立に、

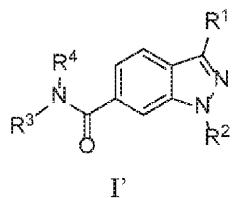
- (1) 水素、又は
- (2) (C_{1 - 3}) アルキル

である。】

【請求項 9】

肝脂肪変性、アテローム性動脈硬化症、2型糖尿病、肥満、高脂血症又は高コレステロール血症の治療用の医薬の製造のための、下記構造式 I を有する化合物又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【化9】



[式中、

R¹ は、

(1) 置換されていないか1～3個のR⁵によって置換されている6員アリール、又は

(2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5、6若しくは9員ヘテロアリール又は9員二環式複素環〔当該ヘテロアリールは、置換されていないか1～3個のR⁵によって置換されている。〕

であり；

R² は、

(1) 置換されていないか1～3個のR⁷によって置換されている6員アリール、

(2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリール〔当該ヘテロアリールは、置換されていないか1～3個のR⁷によって置換されている。〕、

(3) (C₁～₆)アルキル、

(4) 独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～6員複素環、又は

(5) -CH₂-6員アリール〔当該アリールは、置換されていないか1～3個のR⁷によって置換されている。〕

であり；

R³ は、

(1) 独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4～7員複素環、

(2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリール、

(3) -(C₁～₆)アルキル-ヘテロアリール〔当該ヘテロアリールは、独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリールである。〕、

(4) -(C₁～₆)アルキル-6員アリール、

(5) -(C₁～₆)アルキル-複素環〔当該複素環は、独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む3～6員環である。〕、

(6) (C₁～₆)アルキル、

(7) -(C₁～₆)アルキル-C(O)O-(C₁～₄)アルキル、

(8) -(C₁～₆)アルキル-S(O)₂-NR^{9a}R^{9b}、

(9) -(C₁～₆)アルキル-S(O)₂-(C₁～₃)アルキル、

(10) -(C₁～₃)アルキル-ヘテロアリール〔当該ヘテロアリールは8～10員縮合環であり、ここで、当該ヘテロアリールは、独立にN、O及びSから選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含む。〕、

(11) -(C₁～₆)アルキル-S(O)₂-(C₃～₆)シクロアルキル、

(12) -(C₁～₆)アルキル-S(O)₂-NR^{9a}-(C₃～₆)シクロアルキル、

(13) -(C₁～₆)アルキル-(C₃～₆)シクロアルキル、

(14) (C₃～₆)シクロアルキル、又は

(15) 9 ~ 10 員縮合アリール

であり、

各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又は複素環は、置換されていないか1~3個のR⁶によって置換されており、ここで、各アルキルは、置換されていないか1~3個のR⁸によって置換されており；

R⁴は、

- (1) 水素、
- (2) (C_{1~3})アルキル

であり、

又は、R³及びR⁴は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~7員單環式若しくは6~10員二環式複素環を形成しており、ここで、当該複素環は、置換されていないか1~3個のR⁶によって置換されており；

R⁵は、

- (1) シアノ、
- (2) ハロ、
- (3) (C_{1~6})アルキル、
- (4) -C(O)NH₂、
- (5) -C(O)NR^{1~0a}R^{1~0b}、
- (6) (C_{3~6})シクロアルキル、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) ヒドロキシ(C_{1~3})アルキル-、
- (9) (C_{1~6})アルコキシ-、
- (10) -NR^{1~0a}R^{1~0b}、

(11) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5員ヘテロアリール[当該ヘテロアリールは、置換されていないか1~2個のR⁷によって置換されている。]、

- (12) ハロ(C_{1~6})アルキル-、又は
- (13) ハロ(C_{1~6})アルコキシ-

であり；

R⁶は、

- (1) (C_{1~3})アルキル、
- (2) ハロ(C_{1~3})アルキル-、
- (3) オキソ、
- (4) (C_{3~6})シクロアルキル、
- (5) -C(O)O-(C_{1~4})アルキル、
- (6) NH₂、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) 置換されていないハロによって置換されているフェニル、
- (9) ヒドロキシ(C_{1~3})アルキル-、
- (10) (C_{1~6})アルコキシ-、
- (11) ハロ(C_{1~6})アルコキシ-、
- (12) シアノ、又は
- (13) ハロ

であり；

R⁷は、

- (1) (C_{1~6})アルキル、
- (2) ハロ、
- (3) (C_{1~3})アルコキシ-、
- (4) ハロ(C_{1~3})アルキル-、

- (5) (C₃~₆)シクロアルキル、又は
 (6) -C(O)O-(C₁~₃)アルキル

であり；

R⁸は、

- (1) (C₁~₃)アルキル、
 (2) ヒドロキシ(C₁~₃)アルキル-、
 (3) (C₁~₃)アルコキシ-、
 (4) ヒドロキシ、
 (5) ハロ(C₁~₃)アルキル-、
 (6) (C₁~₃)アルキル-S-、
 (7) -C(O)-NR^{9a}R^{9b}、又は
 (8) フェニル

であり；

R^{9a}及びR^{9b}は独立に、

- (1) 水素、
 (2) (C₁~₃)アルキル、
 (3) -(C₁~₃)アルキル-フェニル、
 (4) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5

若しくは6員ヘテロアリール、又は

- (5) フェニル

であり；

R^{10a}及びR^{10b}は独立に、

- (1) 水素、又は
 (2) (C₁~₃)アルキル

である。】

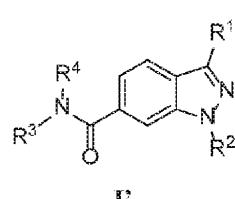
【請求項10】

アテローム性動脈硬化症の治療のためである、請求項9に記載の使用。

【請求項11】

治療において使用するための、下記構造式Iを有する化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【化10】



[式中、

R¹は、

(1) 置換されていないか1~3個のR⁵によって置換されている6員アリール、又は

(2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5，6若しくは9員ヘテロアリール又は9員二環式複素環[当該ヘテロアリールは、置換されていないか1~3個のR⁵によって置換されている。]

であり；

R²は、

(1) 置換されていないか1~3個のR⁷によって置換されている6員アリール、
 (2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリール[当該ヘテロアリールは、置換されていないか1~3個のR

⁷によって置換されている。]、

(3) (C₁~6)アルキル、

(4) 独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~6員複素環、又は

(5) -CH₂-6員アリール[当該アリールは、置換されていないか1~3個のR

⁷によって置換されている。]

であり；

R³は、

(1) 独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~7員複素環、

(2) 独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリール、

(3) -(C₁~6)アルキル-ヘテロアリール[当該ヘテロアリールは、独立にN、O及びSから選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子を含む5若しくは6員ヘテロアリールである。]

(4) -(C₁~6)アルキル-6員アリール、

(5) -(C₁~6)アルキル-複素環[当該複素環は、独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む3~6員環である。]、

(6) (C₁~6)アルキル、

(7) -(C₁~6)アルキル-C(O)O-(C₁~4)アルキル、

(8) -(C₁~6)アルキル-S(O)₂-NR^{9a}R^{9b}、

(9) -(C₁~6)アルキル-S(O)₂-(C₁~3)アルキル、

(10) -(C₁~3)アルキル-ヘテロアリール[当該ヘテロアリールは、8~10員縮合環であり、ここで、当該ヘテロアリールは、独立にN、O及びSから選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含む。]

(11) -(C₁~6)アルキル-S(O)₂-(C₃~6)シクロアルキル、

(12) -(C₁~6)アルキル-S(O)₂-NR^{9a}-(C₃~6)シクロアルキル、

(13) -(C₁~6)アルキル-(C₃~6)シクロアルキル、

(14) (C₃~6)シクロアルキル、又は

(15) 9~10員縮合アリール

であり、

各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又は複素環は、置換されていないか1~3個のR⁶によって置換されており、ここで、各アルキルは、置換されていないか1~3個のR⁸によって置換されており；

R⁴は、

(1) 水素、

(2) (C₁~3)アルキル

であり、

又は、R³及びR⁴は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、独立にN、O及びSから選択される1若しくは2個のヘテロ原子を含む4~7員单環式若しくは6~10員二環式複素環を形成しており、ここで、当該複素環は、置換されていないか1~3個のR⁶によって置換されており；

R⁵は、

(1) シアノ、

(2) ハロ、

(3) (C₁~6)アルキル、

(4) -C(O)NH₂、

(5) -C(O)NR^{10a}R^{10b}、

(6) (C₃~6)シクロアルキル、

- (7) ヒドロキシ、
- (8) ヒドロキシ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (9) (C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (10) - N R^{1 0 a} R^{1 0 b} 、

(11) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 員ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 2 個の R⁷ によって置換されている。] 、

- (12) ハロ(C_{1 - 6}) アルキル - 、又は
- (13) ハロ(C_{1 - 6}) アルコキシ -

であり；

R⁶ は、

- (1) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (2) ハロ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (3) オキソ、
- (4) (C_{3 - 6}) シクロアルキル、
- (5) - C(O) O - (C_{1 - 4}) アルキル、
- (6) NH₂ 、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) 置換されていないハロによって置換されているフェニル、
- (9) ヒドロキシ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (10) (C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (11) ハロ(C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (12) シアノ、又は
- (13) ハロ

であり；

R⁷ は、

- (1) (C_{1 - 6}) アルキル、
- (2) ハロ、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ハロ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (5) (C_{3 - 6}) シクロアルキル、又は
- (6) - C(O) O - (C_{1 - 3}) アルキル

であり；

R⁸ は、

- (1) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (2) ヒドロキシ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ヒドロキシ、
- (5) ハロ(C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (6) (C_{1 - 3}) アルキル - S - 、
- (7) - C(O) - N R^{9 a} R^{9 b} 、又は
- (8) フェニル

であり；

R^{9 a} 及び R^{9 b} は独立に、

- (1) 水素、
- (2) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (3) - (C_{1 - 3}) アルキル - フェニル、
- (4) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 員ヘテロアリール、又は
- (5) フェニル

であり；

R^{1-0} ^a 及び R^{1-0} ^b は独立に、

(1) 水素、又は

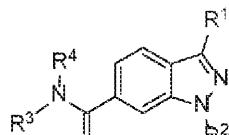
(2) (C_{1-3}) アルキル

である。】

【請求項 12】

治療上有効量の下記構造式 I を有する化合物又は薬学的に許容されるその塩を含む、処置を必要とする患者におけるアテローム性動脈硬化症、肝脂肪変性、アテローム性動脈硬化症、2型糖尿病、肥満、高脂血症又は高コレステロール血症の治療用の医薬組成物。

【化 11】



I'

[式中、

R^1 は、

(1) 置換されていないか 1 ~ 3 個の R^5 によって置換されている 6 員アリール、又は

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5, 6 若しくは 9 員ヘテロアリール又は 9 員二環式複素環 [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R^5 によって置換されている。]

であり；

R^2 は、

(1) 置換されていないか 1 ~ 3 個の R^7 によって置換されている 6 員アリール、

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R^7 によって置換されている。]

(3) (C_{1-6}) アルキル、

(4) 独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員複素環、又は

(5) - $C H_2$ - 6 員アリール [当該アリールは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R^7 によって置換されている。]

であり；

R^3 は、

(1) 独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 7 員複素環、

(2) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員ヘテロアリール、

(3) - (C_{1-6}) アルキル - ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 若しくは 6 員ヘテロアリールである。]

(4) - (C_{1-6}) アルキル - 6 員アリール、

(5) - (C_{1-6}) アルキル - 複素環 [当該複素環は、独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 3 ~ 6 員環である。]、

(6) (C_{1-6}) アルキル、

(7) - (C_{1-6}) アルキル - $C(O)O - (C_{1-4})$ アルキル、

(8) - (C_{1-6}) アルキル - $S(O)_2 - NR^{9a}R^{9b}$ 、

(9) - (C₁ -₆) アルキル - S(O)₂ - (C₁ -₃) アルキル、
 (10) - (C₁ -₃) アルキル - ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは 8 ~ 10 員縮合環であり、ここで、当該ヘテロアリールは、独立に N、O 及び S から選択される 1、2、3 若しくは 4 個のヘテロ原子を含む。]、
 (11) - (C₁ -₆) アルキル - S(O)₂ - (C₃ -₆) シクロアルキル、
 (12) - (C₁ -₆) アルキル - S(O)₂ - N R⁹^a - (C₃ -₆) シクロアルキル、
 (13) - (C₁ -₆) アルキル - (C₃ -₆) シクロアルキル、
 (14) (C₃ -₆) シクロアルキル、又は
 (15) 9 ~ 10 員縮合アリール

であり、

各アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又は複素環は、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁶ によって置換されており、ここで、各アルキルは、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁸ によって置換されており；

R⁴ は、

- (1) 水素、
- (2) (C₁ -₃) アルキル

であり、

又は、R³ 及び R⁴ は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、独立に N、O 及び S から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 7 員單環式若しくは 6 ~ 10 員二環式複素環を形成しており、ここで、当該複素環は、置換されていないか 1 ~ 3 個の R⁶ によって置換されており；

R⁵ は、

- (1) シアノ、
- (2) ハロ、
- (3) (C₁ -₆) アルキル、
- (4) - C(O) NH₂、
- (5) - C(O) NR¹⁰^a R¹⁰^b、
- (6) (C₃ -₆) シクロアルキル、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) ヒドロキシ (C₁ -₃) アルキル - 、
- (9) (C₁ -₆) アルコキシ - 、
- (10) - NR¹⁰^a R¹⁰^b、

(11) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 員ヘテロアリール [当該ヘテロアリールは、置換されていないか 1 ~ 2 個の R⁷ によって置換されている。]、

- (12) ハロ (C₁ -₆) アルキル - 、又は
- (13) ハロ (C₁ -₆) アルコキシ -

であり；

R⁶ は、

- (1) (C₁ -₃) アルキル、
- (2) ハロ (C₁ -₃) アルキル - 、
- (3) オキソ、
- (4) (C₃ -₆) シクロアルキル、
- (5) - C(O) O - (C₁ -₄) アルキル、
- (6) NH₂、
- (7) ヒドロキシ、
- (8) 置換されていないハロによって置換されているフェニル、
- (9) ヒドロキシ (C₁ -₃) アルキル - 、
- (10) (C₁ -₆) アルコキシ - 、

- (1 1) ハロ (C_{1 - 6}) アルコキシ - 、
- (1 2) シアノ、又は
- (1 3) ハロ

であり；

R⁷ は、

- (1) (C_{1 - 6}) アルキル、
- (2) ハロ、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ハロ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (5) (C_{3 - 6}) シクロアルキル、又は
- (6) - C (O) O - (C_{1 - 3}) アルキル

であり；

R⁸ は、

- (1) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (2) ヒドロキシ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (3) (C_{1 - 3}) アルコキシ - 、
- (4) ヒドロキシ、
- (5) ハロ (C_{1 - 3}) アルキル - 、
- (6) (C_{1 - 3}) アルキル - S - 、
- (7) - C (O) - N R^{9 a} R^{9 b} 、又は
- (8) フェニル

であり；

R^{9 a} 及び R^{9 b} は独立に、

- (1) 水素、
- (2) (C_{1 - 3}) アルキル、
- (3) - (C_{1 - 3}) アルキル - フェニル、
- (4) 独立に N、O 及び S から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子を含む 5
若しくは 6 員ヘテロアリール、又は
- (5) フェニル

であり；

R^{10 a} 及び R^{10 b} は独立に、

- (1) 水素、又は
- (2) (C_{1 - 3}) アルキル

である。】

【請求項 13】

アテローム性動脈硬化症を治療するための請求項 1 2 に記載の医薬組成物。