

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成24年6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2011-520785(P2011-520785A)

【公表日】平成23年7月21日(2011.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2011-029

【出願番号】特願2011-504523(P2011-504523)

【国際特許分類】

C 0 7 C	229/58	(2006.01)
C 0 7 C	233/81	(2006.01)
C 0 7 C	311/29	(2006.01)
C 0 7 C	323/56	(2006.01)
C 0 7 C	237/40	(2006.01)
C 0 7 C	235/56	(2006.01)
C 0 7 C	323/37	(2006.01)
C 0 7 C	313/04	(2006.01)
C 0 7 C	309/77	(2006.01)
C 0 7 C	303/36	(2006.01)
C 0 7 C	315/02	(2006.01)
C 0 7 C	231/10	(2006.01)
C 0 7 C	1/34	(2006.01)
C 0 7 C	209/24	(2006.01)
C 0 7 C	1/20	(2006.01)
C 0 7 C	5/02	(2006.01)
C 0 7 C	51/15	(2006.01)
C 0 7 D	307/79	(2006.01)
C 0 7 D	213/74	(2006.01)
C 0 7 D	213/82	(2006.01)
C 0 7 D	213/81	(2006.01)
A 6 1 K	31/196	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 K	31/455	(2006.01)
A 6 1 K	31/195	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
C 0 7 D	257/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 39/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 C 0 7 C 227/18 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 229/58 C S P  
 C 0 7 C 233/81  
 C 0 7 C 311/29  
 C 0 7 C 323/56  
 C 0 7 C 237/40  
 C 0 7 C 235/56  
 C 0 7 C 323/37  
 C 0 7 C 313/04  
 C 0 7 C 309/77  
 C 0 7 C 303/36  
 C 0 7 C 315/02  
 C 0 7 C 231/10  
 C 0 7 C 1/34  
 C 0 7 C 209/24  
 C 0 7 C 1/20  
 C 0 7 C 5/02  
 C 0 7 C 51/15  
 C 0 7 D 307/79  
 C 0 7 D 213/74  
 C 0 7 D 213/82  
 C 0 7 D 213/81  
 A 6 1 K 31/196  
 A 6 1 K 31/343  
 A 6 1 K 31/44  
 A 6 1 K 31/455  
 A 6 1 K 31/195  
 A 6 1 K 31/41  
 C 0 7 D 257/04 B  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 5/00  
 A 6 1 P 7/06  
 A 6 1 P 7/10  
 A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 13/00  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 17/04  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 19/06  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 27/14  
 A 6 1 P 27/16  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 31/10  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 39/02  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 C 227/18

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年4月16日(2012.4.16)

## 【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

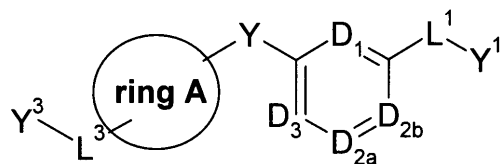
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ロイコトリエン  $C_4$  の合成の障害が望ましい及び / 又は必要である疾患の治療における使用のための、式 I :



[ 式中、

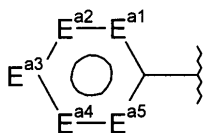
D<sub>2a</sub> 及び D<sub>2b</sub> のいずれか一方は D<sub>2</sub> を表し、他方は - C ( - L<sup>2</sup> - Y<sup>2</sup> ) = を表し ;

Y は、 - O - 又は - S ( O )<sub>m</sub> - を表し ;

D<sub>1</sub>、D<sub>2</sub> 及び D<sub>3</sub> の各々は、それぞれ - C ( R<sup>1a</sup> ) =、 - C ( R<sup>1b</sup> ) = 及び - C ( R<sup>1c</sup> ) = を表すか、又は D<sub>1</sub>、D<sub>2</sub> 及び D<sub>3</sub> の各々は、選択的に且つ独立して - N = を表し ;

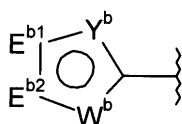
環 A は、

環 I )



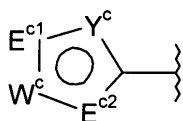
$E^{a1}$ 、 $E^{a2}$ 、 $E^{a3}$ 、 $E^{a4}$  及び  $E^{a5}$  の各々は、それぞれ  $-C(H)=$ 、 $-C(R^{2b})=$ 、 $-C(R^{2c})=$ 、 $-C(R^{2d})=$  及び  $-C(H)=$  を表すか、又は  $E^{a1}$ 、 $E^{a2}$ 、 $E^{a3}$ 、 $E^{a4}$  及び  $E^{a5}$  の各々は、選択的に且つ独立して  $-N=$  を表し；  
 $R^{2b}$ 、 $R^{2c}$  及び  $R^{2d}$  の 1 つは、必要な  $-L^3 - Y^3$  基を表し、その他は、独立して水素、 $-L^1a - Y^1a$ 、又は  $X^1$  から選択される置換基を表す；

環 I I )



$E^{b1}$  及び  $E^{b2}$  は、それぞれ  $-C(R^{3a})=$  及び  $-C(R^{3b})=$  を表し；  
 $Y^b$  は、 $-C(R^{3c})=$  又は  $-N=$  を表し；  
 $W^b$  は、 $-N(R^{3d})-$ 、 $-O-$  又は  $-S-$  を表し；  
 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  及び、存在する場合は、 $R^{3c}$  及び  $R^{3d}$  の 1 つは、必要な  $-L^3 - Y^3$  基を表し、残りの  $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$  及び（存在する場合は） $R^{3c}$  置換基は、独立して水素、 $-L^1a - Y^1a$ 、又は  $X^2$  から選択される置換基を表し、そして残りの  $R^{3d}$  置換基（存在する場合は）は、水素、又は  $R^{z1}$  から選択される置換基を表す；又は

環 I I I )



$E^{c1}$  及び  $E^{c2}$  の各々は、それぞれ  $-C(R^{4a})=$  及び  $-C(R^{4b})=$  を表し；  
 $Y^c$  は、 $-C(R^{4c})=$  又は  $-N=$  を表し；  
 $W^c$  は、 $-N(R^{4d})-$ 、 $-O-$  又は  $-S-$  を表し；  
 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$  及び、存在する場合は、 $R^{4c}$  及び  $R^{4d}$  の 1 つは、必要な  $-L^3 - Y^3$  基を表し、残りの  $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$  及び（存在する場合は） $R^{4c}$  置換基は、独立して水素、 $-L^1a - Y^1a$ 、又は  $X^3$  から選択される置換基を表し、そして残りの  $R^{4d}$  置換基（存在する場合は）は、水素、又は  $R^{z2}$  から選択される置換基を表す；  
 を表し、

$R^{z1}$  及び  $R^{z2}$  は、独立して  $Z^1a$  から選択される基を表し；

$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$  及び  $R^{1c}$  は、独立して、水素、又は  $Z^2a$  から選択される基、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-N(R^{6b})R^{7b}$ 、 $-N(R^{5d})C(O)R^{6c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{6d})R^{7d}$ 、 $-N(R^{5f})C(O)OR^{6e}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5g})S(O)_2N(R^{6f})R^{7f}$ 、 $-OR^{5h}$ 、 $-OC(O)N(R^{6g})R^{7g}$ 、 $-OS(O)_2R^{5i}$ 、 $-N(R^{5k})S(O)_2R^{5m}$ 、 $-OC(O)R^{5n}$ 、 $-OC(O)OR^{5p}$  若しくは  $-OS(O)_2N(R^{6i})R^{7i}$  を表し；

$X^1$ 、 $X^2$  及び  $X^3$  は、独立して、 $Z^2a$  から選択される基、又はハロゲン、 $-CN$ 、 $-N(R^{6b})R^{7b}$ 、 $-N(R^{5d})C(O)R^{6c}$ 、 $-N(R^{5e})C(O)N(R^{6d})$

)  $R^{7d}$ 、 $-N(R^{5f})C(O)OR^{6e}$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{5g})S(O)_2N(R^{6f})R^{7f}$ 、 $-OR^{5h}$ 、 $-OC(O)N(R^{6g})R^{7g}$ 、 $-OS(O)_2R^{5i}$ 、 $-N(R^{5k})S(O)_2R^{5m}$ 、 $-OC(O)R^{5n}$ 、 $-OC(O)OR^{5p}$  若しくは  $-OS(O)_2N(R^{6i})R^{7i}$  を表し；

$Z^{1a}$  及び  $Z^{2a}$  は、独立して  $-R^{5a}$ 、 $-C(O)R^{5b}$ 、 $-C(O)OR^{5c}$ 、 $-C(O)N(R^{6a})R^{7a}$ 、 $-S(O)_mR^{5j}$  又は  $-S(O)_2N(R^{6h})R^{7h}$  を表し；

$R^{5b} \sim R^{5h}$ 、 $R^{5j}$ 、 $R^{5k}$ 、 $R^{5n}$ 、 $R^{6a} \sim R^{6i}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{7d}$  及び  $R^{7f} \sim R^{7i}$  は、独立して H 又は  $R^{5a}$  を表すか；又は

$R^{6a}$  と  $R^{7a}$ 、 $R^{6b}$  と  $R^{7b}$ 、 $R^{6d}$  と  $R^{7d}$ 、 $R^{6f}$  と  $R^{7f}$ 、 $R^{6g}$  と  $R^{7g}$ 、 $R^{6h}$  と  $R^{7h}$  又は  $R^{6i}$  と  $R^{7i}$  の対のいずれかは、共に連結して、それらが結合している原子と共に 3～6 員環を形成してもよく、前記環は、場合により、これらの置換基が必然的に結合している窒素原子に加えてさらなるヘテロ原子（窒素又は酸素など）を含み、また前記環は、場合により F、Cl、=O、 $-OR^{5h}$  及び  $R^{5a}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されており；

$R^{5i}$ 、 $R^{5m}$  及び  $R^{5p}$  は、独立して  $R^{5a}$  を表し；

$R^{5a}$  は、場合によりハロ、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、=O、 $-OR^{8a}$ 、 $-N(R^{8b})R^{8c}$ 、 $-S(O)_nR^{8d}$ 、 $-S(O)_2N(R^{8e})R^{8f}$  及び  $OS(O)_2N(R^{8g})R^{8h}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された  $C_{1-6}$  アルキルを表し；

$n$  は 0、1 又は 2 を表し；

$R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^{8d}$ 、 $R^{8e}$  及び  $R^{8g}$  は、独立して H 又は、場合によりハロ、=O、 $-OR^{11a}$ 、 $-N(R^{12a})R^{12b}$  及び  $-S(O)_2-M^1$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された  $C_{1-6}$  アルキルを表し；

$R^{8c}$ 、 $R^{8f}$  及び  $R^{8h}$  は、独立して H、 $-S(O)_2CH_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$  又は、場合により F、Cl、=O、 $-OR^{13a}$ 、 $-N(R^{14a})R^{14b}$  及び  $-S(O)_2-M^2$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された  $C_{1-6}$  アルキルを表すか；又は

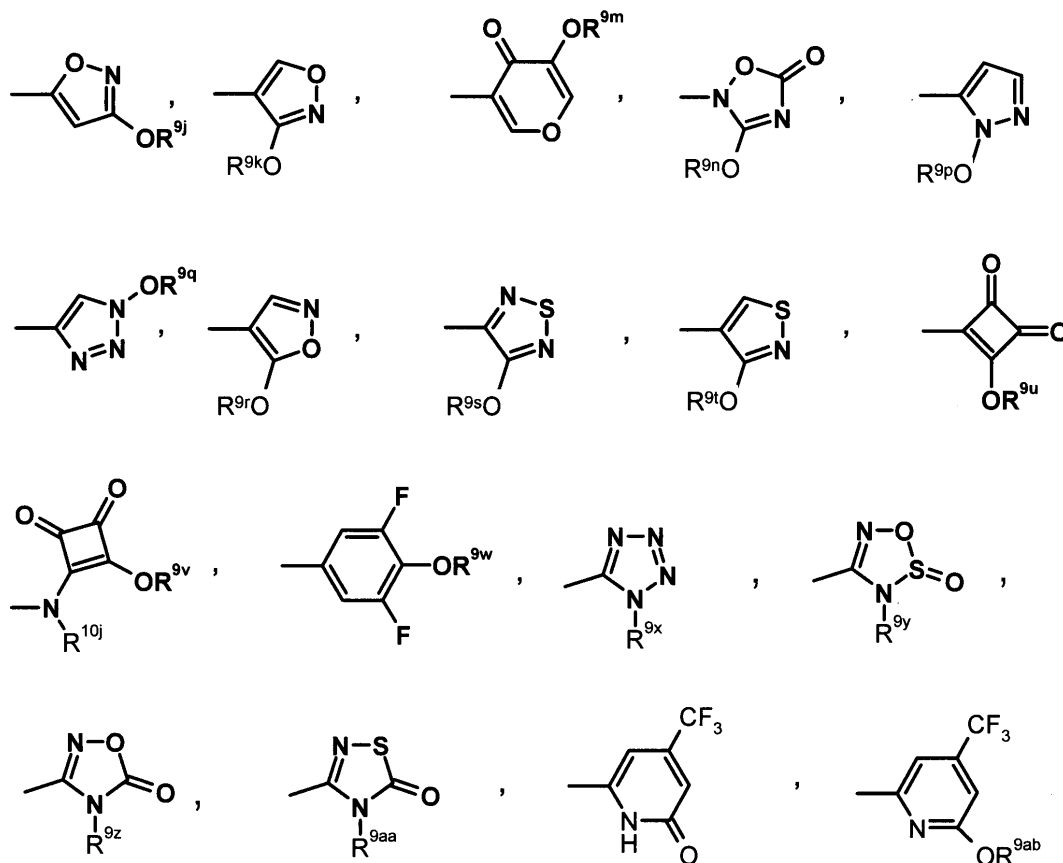
$R^{8b}$  と  $R^{8c}$ 、 $R^{8e}$  と  $R^{8f}$  又は  $R^{8g}$  と  $R^{8h}$  は、共に連結して、それらが結合している原子と共に 3～6 員環を形成してもよく、前記環は、場合により、これらの置換基が必然的に結合している窒素原子に加えてさらなるヘテロ原子（窒素又は酸素など）を含み、また前記環は、場合により、F、Cl、=O 及び、場合により =O 及びフルオロから選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された  $C_{1-3}$  アルキルから選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換され；

$M^1$  及び  $M^2$  は、独立して  $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CF_3$  又は  $-N(R^{15a})R^{15b}$  を表し；

$R^{11a}$  及び  $R^{13a}$  は、独立して H、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CF_3$  又は  $-CHF_2$  を表し；

$R^{12a}$ 、 $R^{12b}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{15a}$  及び  $R^{15b}$  は、独立して H、 $-CH_3$  又は  $-CH_2CH_3$  を表し；

$Y^1$  及び  $Y^{1a}$  は、独立して、 $-N(H)SO_2R^{9a}$ 、 $-C(H)(CF_3)OH$ 、 $-C(O)CF_3$ 、 $-C(OH)_2CF_3$ 、 $-C(O)OR^{9b}$ 、 $-S(O)_3R^{9c}$ 、 $-P(O)(OR^{9d})_2$ 、 $-P(O)(OR^{9e})N(R^{10f})R^{9f}$ 、 $-P(O)(N(R^{10g})R^{9g})_2$ 、 $-B(OR^{9h})_2$ 、 $-C(CF_3)_2OH$ 、 $-S(O)_2N(R^{10i})R^{9i}$  又は以下の基：



のいずれか 1 つを表し；

$R^{9a}$  は、場合により  $G^1$  及び / 又は  $Z^1$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、 $C_1 \sim 8$  アルキル、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基を表し；

$R^{9b} \sim R^{9z}$ 、 $R^{9aa}$ 、 $R^{9ab}$ 、 $R^{10f}$ 、 $R^{10g}$ 、 $R^{10i}$  及び  $R^{10j}$  は、独立して、その両方が場合により  $G^1$  及び / 又は  $Z^1$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、 $C_1 \sim 8$  アルキル又はヘテロシクロアルキル基を表すか；又は

$R^{9b} \sim R^{9z}$ 、 $R^{9aa}$ 、 $R^{9ab}$ 、 $R^{10f}$ 、 $R^{10g}$ 、 $R^{10i}$  及び  $R^{10j}$  は、独立して水素を表すか；又は

$R^{9f}$  と  $R^{10f}$ 、 $R^{9g}$  と  $R^{10g}$  及び  $R^{9i}$  と  $R^{10i}$  のいずれかの対は、共に連結して、それらが結合している原子と共に 3 ~ 6 員環を形成してもよく、前記環は、場合により、これらの置換基が必然的に結合している窒素原子に加えてさらなるヘテロ原子（窒素又は酸素など）を含み、また前記環は、場合により  $F$ 、 $Cl$ 、 $=O$ 、 $-OR^{5h}$  及び  $R^{5a}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されており；

$Y^2$  及び  $Y^3$  は、独立して、その両方の基が場合により  $A$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、アリール基又はヘテロアリール基を表し；

$A$  は、

I) その両方が場合により  $B$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、アリール基又はヘテロアリール基；

II) その両方が場合により  $G^1$  及び / 又は  $Z^1$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、 $C_1 \sim 8$  アルキル又はヘテロシクロアルキル基；又は

III)  $G^1$  基を表し；

$G^1$  は、ハロ、シアノ、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-ONO_2$  又は  $-A^1-R^{16a}$  を表し；  
[ 式中、 $A^1$  は、単結合又は  $-C(O)A^2-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)_rA^3-$ 、 $-N(R$

<sup>1 7 a</sup>) A<sup>4</sup> - 若しくは - O A<sup>5</sup> - から選択されるスペーサー基を表し；  
 A<sup>2</sup> は、単結合、- O -、- N ( R<sup>1 7 b</sup> ) - 又は - C ( O ) - を表し；  
 A<sup>3</sup> は、単結合、- O - 又は - N ( R<sup>1 7 c</sup> ) - を表し；  
 A<sup>4</sup> 及び A<sup>5</sup> は、独立して、単結合、- C ( O ) -、- C ( O ) N ( R<sup>1 7 d</sup> ) -、  
 - C ( O ) O -、- S ( O )<sub>r</sub> - 又は - S ( O )<sub>r</sub> N ( R<sup>1 7 e</sup> ) - を表す]  
 Z<sup>1</sup> は、= O、= S、= N O R<sup>1 6 b</sup>、= N S ( O )<sub>2</sub> N ( R<sup>1 7 f</sup> ) R<sup>1 6 c</sup>、= N  
 C N 又は = C ( H ) N O<sub>2</sub> を表し；

B は、

I) その両方が場合により G<sup>2</sup> から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、アリール基又はヘテロアリール基；

II) その両方が場合により G<sup>2</sup> 及び / 又は Z<sup>2</sup> から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、C<sub>1</sub> ~ 8 アルキル又はヘテロシクロアルキル基；又は

III) G<sup>2</sup> 基  
 を表し；

G<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、- N<sub>3</sub>、- N O<sub>2</sub>、- O N O<sub>2</sub> 又は - A<sup>6</sup> - R<sup>1 8 a</sup> を表し；  
 [ 式中、A<sup>6</sup> は、単結合又は - C ( O ) A<sup>7</sup> -、- S -、- S ( O )<sub>r</sub> A<sup>8</sup> -、- N ( R<sup>1 9 a</sup> ) A<sup>9</sup> - 若しくは - O A<sup>1 0</sup> - から選択されるスペーサー基を表し；  
 A<sup>7</sup> は、単結合、- O -、- N ( R<sup>1 9 b</sup> ) - 又は - C ( O ) - を表し；  
 A<sup>8</sup> は、単結合、- O - 又は - N ( R<sup>1 9 c</sup> ) - を表し；  
 A<sup>9</sup> 及び A<sup>1 0</sup> は、独立して、単結合、- C ( O ) -、- C ( O ) N ( R<sup>1 9 d</sup> ) -、  
 - C ( O ) O -、- S ( O )<sub>r</sub> - 又は - S ( O )<sub>r</sub> N ( R<sup>1 9 e</sup> ) - を表す]  
 Z<sup>2</sup> は、= O、= S、= N O R<sup>1 8 b</sup>、= N S ( O )<sub>2</sub> N ( R<sup>1 9 f</sup> ) R<sup>1 8 c</sup>、= N  
 C N 又は = C ( H ) N O<sub>2</sub> を表し；

R<sup>1 6 a</sup>、R<sup>1 6 b</sup>、R<sup>1 6 c</sup>、R<sup>1 7 a</sup>、R<sup>1 7 b</sup>、R<sup>1 7 c</sup>、R<sup>1 7 d</sup>、R<sup>1 7 e</sup>、  
 R<sup>1 7 f</sup>、R<sup>1 8 a</sup>、R<sup>1 8 b</sup>、R<sup>1 8 c</sup>、R<sup>1 9 a</sup>、R<sup>1 9 b</sup>、R<sup>1 9 c</sup>、R<sup>1 9 d</sup>、  
 R<sup>1 9 e</sup> 及び R<sup>1 9 f</sup> は、独立して、

i) 水素；

ii) その両方が場合により G<sup>3</sup> から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、アリール基又はヘテロアリール基；

iii) その両方が場合により G<sup>3</sup> 及び / 又は Z<sup>3</sup> から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、C<sub>1</sub> ~ 8 アルキル又はヘテロシクロアルキル基  
 から選択されるか；又は

R<sup>1 6 a</sup> ~ R<sup>1 6 c</sup> と R<sup>1 7 a</sup> ~ R<sup>1 7 f</sup>、及び / 又は R<sup>1 8 a</sup> ~ R<sup>1 8 c</sup> と R<sup>1 9 a</sup> ~ R<sup>1 9 f</sup> のいずれかの対は、共に連結して、それらの原子又は他の関連する原子と共に、  
 場合により 1 ~ 3 個のヘテロ原子及び / 又は 1 ~ 3 の二重結合を含む、さらなる 3 ~ 8  
 員環を形成してもよく、前記環は、場合により G<sup>3</sup> 及び / 又は Z<sup>3</sup> から選択される 1 又は  
 それ以上の置換基によって置換されており；

G<sup>3</sup> は、ハロ、シアノ、- N<sub>3</sub>、- N O<sub>2</sub>、- O N O<sub>2</sub> 又は - A<sup>1 1</sup> - R<sup>2 0 a</sup> を表し  
 ；

[ 式中、A<sup>1 1</sup> は、単結合又は - C ( O ) A<sup>1 2</sup> -、- S -、- S ( O )<sub>r</sub> A<sup>1 3</sup> -、  
 - N ( R<sup>2 1 a</sup> ) A<sup>1 4</sup> - 若しくは - O A<sup>1 5</sup> - から選択されるスペーサー基を表し；  
 A<sup>1 2</sup> は、単結合、- O -、- N ( R<sup>2 1 b</sup> ) - 又は - C ( O ) - を表し；  
 A<sup>1 3</sup> は、単結合、- O - 又は - N ( R<sup>2 1 c</sup> ) - を表し；  
 A<sup>1 4</sup> 及び A<sup>1 5</sup> は、独立して、単結合、- C ( O ) -、- C ( O ) N ( R<sup>2 1 d</sup> ) -  
 、- C ( O ) O -、- S ( O )<sub>r</sub> - 又は - S ( O )<sub>r</sub> N ( R<sup>2 1 e</sup> ) - を表す]  
 Z<sup>3</sup> は、= O、= S、= N O R<sup>2 0 b</sup>、= N S ( O )<sub>2</sub> N ( R<sup>2 1 f</sup> ) R<sup>2 0 c</sup>、= N  
 C N 又は = C ( H ) N O<sub>2</sub> を表し；

各々の r は、独立して、ここで使用される各々の場合に、1 又は 2 を表し；

R<sup>2 0 a</sup>、R<sup>2 0 b</sup>、R<sup>2 0 c</sup>、R<sup>2 1 a</sup>、R<sup>2 1 b</sup>、R<sup>2 1 c</sup>、R<sup>2 1 d</sup>、R<sup>2 1 e</sup>  
 及び R<sup>2 1 f</sup> は、独立して、

i) 水素；

ii) その両方の基が、場合によりハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-N(R^{22a})R^{23a}$ 、 $-OR^{22b}$  及び  $=O$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、 $C_1 \sim 6$  アルキル又はヘテロシクロアルキル基；並びに

iii) その両方が、場合によりハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル（場合により  $=O$ 、フルオロ及びクロロから選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）、 $-N(R^{22c})R^{23b}$  及び  $-OR^{22d}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換された、アリール基又はヘテロアリール基から選択されるか、又は

$R^{20a} \sim R^{20c}$  と  $R^{21a} \sim R^{21f}$  のいずれかの対は、共に連結して、それらの原子又は他の関連する原子と共に、場合により 1 ～ 3 個のヘテロ原子及び / 又は 1 若しくは 2 の二重結合を含む、さらなる 3 ～ 8 員環を形成してもよく、前記環は、場合によりハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $-N(R^{22e})R^{23c}$ 、 $-OR^{22f}$  及び  $=O$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されており；

$L^1$  及び  $L^{1a}$  は、独立して、単結合又は、炭素原子のいずれか 1 個が Q によって置換されてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキレンを表し；

Q は、 $-C(R^{y1})(R^{y2})-$ 、 $-C(O)-$  又は  $-O-$  を表し；

$R^{y1}$  及び  $R^{y2}$  は、独立して H、F 又は  $X^4$  を表すか；又は

$R^{y1}$  と  $R^{y2}$  は、共に連結して 3 ～ 6 員環を形成してもよく、前記環は、場合によりヘテロ原子を含み、また前記環は、場合により F、Cl、 $=O$  及び  $X^5$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されており；

$L^2$  及び  $L^3$  は、独立して、単結合又は  $-(CH_2)_p-C(R^{y3})(R^{y4})-(CH_2)_q-A^{16}$ 、 $-(CH_2)_p-C(O)A^{17}$ 、 $-(CH_2)_p-S-$ 、 $-(CH_2)_p-SC(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-(CH_2)_p-S(O)A^{21}$ 、 $-(CH_2)_p-S(O)_2A^{18}$ 、 $-(CH_2)_p-N(R^w)A^{19}$  - 若しくは  $-(CH_2)_p-OA^{20}$  - から選択されるスペーサー基を表し；

[式中、 $A^{16}$  は、単結合、 $-O-$ 、 $-N(R^w)-$ 、 $-C(O)-$  又は  $-S(O)_m-$  を表し；

$A^{17}$ 、 $A^{18}$  及び  $A^{21}$  は、独立して、単結合、 $-C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-(O)-$ 、 $-N(R^w)-$  又は  $-N(R^w)SO_2-$  を表し；

$A^{19}$  及び  $A^{20}$  は、独立して、単結合、 $-C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)C(R^{y3})(R^{y4})-$ 、 $-C(O)N(R^w)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-S(O)_2-$  又は  $-S(O)_2N(R^w)-$  を表す]

p 及び q は、独立して 0、1 又は 2 を表し；

m は 0、1 又は 2 を表し；

$R^{y3}$  及び  $R^{y4}$  は、独立して H、F 又は  $X^6$  を表すか；又は

$R^{y3}$  と  $R^{y4}$  は、共に連結して 3 ～ 6 員環を形成してもよく、前記環は、場合によりヘテロ原子を含み、また前記環は、場合により F、Cl、 $=O$  及び  $X^7$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されており；

$R^w$  は、H 又は  $X^8$  を表し；

$X^4 \sim X^8$  は、独立して、 $C_1 \sim 6$  アルキル（場合によりハロ、 $-CN$ 、 $-N(R^{24a})R^{25a}$ 、 $-OR^{24b}$ 、 $=O$ 、アリール及びヘテロアリール（最後の 2 つの基は、場合によりハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル（場合によりフルオロ、クロロ及び  $=O$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）、 $-N(R^{24c})R^{25b}$  及び  $OR^{24d}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）、アリール又はヘテロアリール（最後の 2 つの基は、場合によりハロ、 $C_1 \sim 4$  アルキル（場合によりフルオロ、クロロ及び  $=O$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）、 $-N(R^{26a})R^{26b}$ 、 $-OR^{26c}$  及び  $-C(O)R^{26d}$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）を表し；



$R^{22a}$ 、 $R^{22b}$ 、 $R^{22c}$ 、 $R^{22d}$ 、 $R^{22e}$ 、 $R^{22f}$ 、 $R^{23a}$ 、 $R^{23b}$ 、 $R^{23c}$ 、 $R^{24a}$ 、 $R^{24b}$ 、 $R^{24c}$ 、 $R^{24d}$ 、 $R^{25a}$ 、 $R^{25b}$ 、 $R^{26a}$ 、 $R^{26b}$ 、 $R^{26c}$  及び  $R^{26d}$  は、独立して、水素及び  $C_{1-4}$  アルキル（後者の基は、場合によりフルオロ、クロロ及び  $=O$  から選択される 1 又はそれ以上の置換基によって置換されている）から選択される] の化合物、又は医薬的に許容されるその塩。