

【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4年6月16日(2022.6.16)

【国際公開番号】WO2020/002611

【公表番号】特表2021-528451(P2021-528451A)

【公表日】令和3年10月21日(2021.10.21)

【出願番号】特願2020-572372(P2020-572372)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

A 6 1 P 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 P 3 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 1 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 9 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 1 7 8 (2 0 0 6 . 0 1)

30

C 0 7 D 4 1 7 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 2 7 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 2 0 9 / 3 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 5 1 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 6 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 1 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

40

A 6 1 K 3 1 / 4 2 3 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 9 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 0 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4

A 6 1 P 1 / 1 6 Z N A

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

50

A 6 1 P 3 / 0 4
 A 6 1 P 3 / 1 0
 A 6 1 P 3 / 0 6
 A 6 1 P 1 3 / 1 2
 A 6 1 P 3 / 0 0
 A 6 1 P 9 / 0 0
 A 6 1 P 3 5 / 0 0
 A 6 1 P 3 1 / 1 2
 A 6 1 P 3 1 / 1 4
 A 6 1 P 2 9 / 0 0 1 0 1
 A 6 1 P 1 9 / 0 2
 A 6 1 P 1 / 0 4
 A 6 1 P 2 9 / 0 0
 A 6 1 P 1 1 / 0 6
 C 0 7 D 4 0 9 / 0 4 C S P
 A 6 1 K 3 1 / 4 0 4
 C 0 7 D 4 0 9 / 1 4
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9
 A 6 1 K 3 1 / 4 1 7 8
 C 0 7 D 4 1 7 / 1 4
 A 6 1 K 3 1 / 4 2 7
 C 0 7 D 2 0 9 / 3 0
 C 0 7 D 4 0 5 / 1 4
 A 6 1 K 3 1 / 4 5 4
 C 0 7 D 4 0 5 / 1 0
 C 0 7 D 4 5 1 / 0 2
 A 6 1 K 3 1 / 4 6
 C 0 7 D 4 0 3 / 1 0
 C 0 7 D 4 1 3 / 0 4
 A 6 1 K 3 1 / 4 2 3
 C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 Z
 A 6 1 K 3 1 / 4 3 7
 C 0 7 D 4 9 5 / 0 4 1 0 3
 A 6 1 K 3 1 / 4 0 7
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 6

10

20

30

40

【誤訳訂正書】
 【提出日】令和4年6月7日(2022.6.7)
 【誤訳訂正1】
 【訂正対象書類名】明細書
 【訂正対象項目名】0045
 【訂正方法】変更
 【訂正の内容】
 【0045】
 {式中、
 以下の：
 【化29】

は、6員アリアル又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員ヘテロアリアルを形成する縮合5～6員環であり、ここで、この環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、C₁₋₆-アルキル、オキソ、C₀₋₆-アルキレン-OR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CO₂R¹¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR¹¹R¹²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基により置換され、

10

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；並びに

ここで、任意選択でアリアル又はヘテロアリアル部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

20

ここで、新たに形成された環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3～6員シクロアルキル、ハロ-(3～6員シクロアルキル)、3～6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～3個の置換基により置換され；

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0047

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0047】

30

以下の：

【化31】

Ⓒ

は、6～10員アリアル又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～10員ヘテロアリアルから成る群から選択され、

ここで、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリアル及びヘテロアリアルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR³¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(6員アリアル)、C₀₋₆-アルキレン-(5～6員ヘテロアリアル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S(O)₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S(O)₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CO₂R³¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR³¹R³²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基に

40

50

より置換され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；

ここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する、5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～4個の置換基により置換され；

10

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0057

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0057】

任意の上記又は下記の実施形態と組み合わせた好ましい実施形態において、以下の：

20

【化36】

(A)

は、6員アリール又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員ヘテロアリールを形成する縮合5～6員環であり、ここで、この環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、C₁₋₆-アルキル、オキソ、C₀₋₆-アルキレン-OR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CO₂R¹¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR¹¹R¹²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基により置換され、

30

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；並びに

40

ここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、新たに形成された環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3～6員シクロアルキル、ハロ-(3～6員シクロアルキル)、3～6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～3個の置換基により置換される。

50

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0066

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【0066】

任意の上記又は下記の実施形態と組み合わせた好ましい実施形態において、以下の：

【化 49】

(C)

10

は、6～10員アリール又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～10員ヘテロアリールから成る群から選択され、

ここで、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR³¹、C₀₋₆-アルキレン-（3～6員シクロアルキル）、C₀₋₆-アルキレン-（3～6員ヘテロシクロアルキル）、C₀₋₆-アルキレン-（6員アリール）、C₀₋₆-アルキレン-（5～6員ヘテロアリール）、C₀₋₆-アルキレン-S（O）_nR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S（O）₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-S（O）₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S（O）₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CO₂R³¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR³¹R³²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基により置換され、

20

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH（CH₂）₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；

30

ここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する、5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH（CH₂）₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～4個の置換基により置換される。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】 特許請求の範囲

【訂正対象項目名】 全文

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

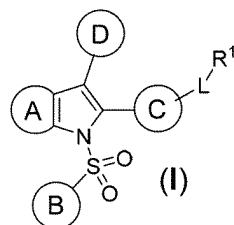
【請求項 1】

式 (I) により表される化合物：

40

50

【化 1】



そのグリシンコンジュゲート、タウロコンジュゲート、エナンチオマー、ジアステレオマー、互変異性体、N-オキシド、溶媒和物、及び医薬として許容し得る塩：

10

{式中、

以下の：

【化 2】

(A)

は、6員アリアル又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員ヘテロアリアルを形成する縮合5～6員環であり、ここで、この環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、C₁₋₆-アルキル、オキソ、C₀₋₆-アルキレン-OR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹S(O)₂NR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R¹¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-COR¹¹、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR¹¹R¹²、C₀₋₆-アルキレン-NR¹¹-CO₂R¹¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR¹¹R¹²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基により置換され、

20

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；並びに

30

ここで、任意選択でアリアル又はヘテロアリアル部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、新たに形成された環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3～6員シクロアルキル、ハロ-(3～6員シクロアルキル)、3～6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～3個の置換基により置換され；

40

以下の：

【化 3】

(B)

は、3～10員シクロアルキル、N、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する3～10員ヘテロシクロアルキル、6～14員アリアル、並びにN、O及びSから

50

独立して選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5～14員ヘテロアリールから成る群から選択され、

ここで、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR²¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR²¹、C₀₋₆-アルキレン-NR²¹S(O)₂R²¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR²¹R²²、C₀₋₆-アルキレン-NR²¹S(O)₂NR²¹R²²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R²¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R²¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR²¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR²¹R²²、C₀₋₆-アルキレン-NR²¹-COR²¹、C₀₋₆-アルキレン-NR²¹-CONR²¹R²²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR²¹R²²、C₀₋₆-アルキレン-NR²¹-CO₂R²¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR²¹R²²から成る群から独立して選択される1～6個の置換基により置換され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～6個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5～8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～4個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5～6員不飽和環を形成し、

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1～4個の置換基により置換され；

以下の：

【化4】

Ⓒ

は、6～10員アリール又はN、O及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を含有する5～10員ヘテロアリールから成る群から選択され、

ここで、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR³¹、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3～6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(6員アリール)、C₀₋₆-アルキレン-(5～6員ヘテロアリール)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S(O)₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹S(O)₂NR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R³¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-COR³¹、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR³¹R³²、C₀₋₆-アルキレン-NR³¹-CO₂R³¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR³¹R³²から成る群から独立して選択される1～4個の置換基に

より置換され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、 CO_2H 、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、ハロ- $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{O-Halo-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から独立して選択される1~6個の置換基により置換され；

ここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を任意選択で含有する、5~8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、 CO_2H 、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、ハロ- $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{O-Halo-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から独立して選択される1~4個の置換基により置換され；

以下の：

【化5】

(D)

は、3~10員シクロアルキル、N、O及びSから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を含有する3~10員ヘテロシクロアルキル、6~14員アリール、並びにN、O及びSから独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5~14員ヘテロアリールから成る群から選択され、

ここで、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、 SF_5 、 NO_2 、オキソ、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-OR}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-(3~6員シクロアルキル)}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-(3~6員ヘテロシクロアルキル)}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-S(O)}_n\text{R}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{S(O)}_2\text{R}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-S(O)}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{S(O)}_2\text{NR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-CR}^{41}(=\text{N-OR}^{41})$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-CO}_2\text{R}^{21}$ 、 $\text{O-C}_{1-6}\text{-アルキレン-CO}_2\text{R}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-O-COR}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-CONR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{-COR}^{21}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{-CONR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-O-CONR}^{21}\text{R}^{22}$ 、 $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{-CO}_2\text{R}^{21}$ 及び $\text{C}_{0-6}\text{-アルキレン-NR}^{21}\text{R}^{22}$ から成る群から独立して選択される1~6個の置換基により置換され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、 CO_2H 、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{CO-OC}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、ハロ- $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{O-Halo-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から独立して選択される1~6個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でアリール又はヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5~8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、 CO_2H 、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、ハロ- $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{O-Halo-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から独立して選択される1~4個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5~6員不飽和環を形成し、

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、 CO_2H 、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$

10

20

30

40

50

ル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~4個の置換基により置換され；

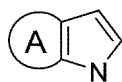
式中、

【化6】

(D)

は、

【化7】



に面する接続に関して1,2-配向で先の置換基を有するか、又は1,2-配向で追加の縮合環を有し；

Lは、結合、C₁₋₆-アルキレン、C₂₋₆-アルケニレン、C₂₋₆-アルキニレン、3~10員シクロアルキレン、N、O及びSから独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含有する3~10員ヘテロシクロアルキレン、6~10員アリーレン、並びにN、O及びSから独立して選択される1~4個のヘテロ原子を含有する5~10員ヘテロアリーレンから成る群から選択され、

ここで、アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、シクロアルキレン、ヘテロシクロアルキレン、アリーレン及びヘテロアリーレンは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-(3~6員シクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-(3~6員ヘテロシクロアルキル)、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹S(O)₂R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-S(O)₂NR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹S(O)₂NR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R⁴¹、O-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-COR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CO₂R⁴¹及びC₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹R⁴²から成る群から独立して選択される1~6個の置換基により置換され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~6個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でアリーレン及びヘテロアリーレン部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5~8員部分的不飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~4個の置換基により置換され；

R¹は、H、ハロゲン、CN、SF₅、NO₂、オキソ、C₁₋₄-アルキル、C₀₋₆-アルキレン-OR⁴¹、Y-C₀₋₆-アルキレン-(3~6員シクロアルキル)、Y-C₀₋₆-アルキレン-(3~6員ヘテロシクロアルキル)、Y-C₀₋₆-アルキレン-(6員アリアル)、Y-C₀₋₆-アルキレン-(5~6員ヘテロアリアル)、C₀₋₆-アルキレン-S(=O)(-R⁴¹)=N-R⁷⁵、X-C₁₋₆-アルキレン-S(=O)(-R⁴¹)=N-R⁷⁵、C₀₋₆-アルキレン-S(O)_nR⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-S(O)_nR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-S(=NR⁷¹)R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-S(=NR⁷¹)R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-S

10

20

30

40

50

(O) (=NR⁷¹) R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-S (O) (=NR⁷¹) R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-S (=NR⁷¹) R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-S (=NR⁷¹) R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹S (O) R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-NR⁴¹S (O) R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-S (O) NR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-S (O) NR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹S (O) NR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-NR⁴¹S (O) NR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-SO₃R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-SO₃R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-CO₂R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-O-COR⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-O-COR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹OR⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-CONR⁴¹OR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹SO₂R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-CONR⁴¹SO₂R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-COR⁴¹、X-C₁₋₆-C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-COR⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-O-CONR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-O-CONR⁴¹R⁴²、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CO₂R⁴¹、X-C₁₋₆-アルキレン-NR⁴¹-CO₂R⁴¹、C₀₋₆-アルキレン-NR⁴¹R⁴²、X-C₁₋₆-アルキレン-NR⁴¹R⁴²から成る群から選択され、

ここで、アルキル、アルキレン、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、ヒドロキシ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~6個の置換基により置換され；

更にここで、任意選択でアリール及びヘテロアリール部分の2つの隣接する置換基は、O、S又はNから独立して選択される1~3個のヘテロ原子を任意選択で含有する5~8員部分的な飽和環を形成し、並びに

ここで、この追加の環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、オキソ、OH、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~4個の置換基により置換され；

R¹¹、R¹²、R²¹、R²²、R³¹、R³²、R⁴¹、R⁴²、R⁵¹は、H及びC₁₋₄-アルキルから独立して選択されるか、

ここで、アルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3~6員シクロアルキル、ハロ-(3~6員シクロアルキル)、3~6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3~6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、SO₃H、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~3個の置換基により置換され；

或いはR¹¹とR¹²、R²¹とR²²、R³¹とR³²、R⁴¹とR⁴²はそれぞれ、それらが結合した窒素と一緒にする場合、炭素原子を含有し、且つ、O、S又はNから独立して選択される1又は2個のヘテロ原子を任意選択で含有する3~6員環を完成し；並びに

ここで、新たに形成された環は、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3~6員シクロアルキル、ハロ-(3~6員シクロアルキル)、3~6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3~6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H、CO₂-C₁₋₄-アルキル、CONHCH₂CO₂H、CONH(CH₂)₂SO₃H、SO₃H、O-C₁₋₄-アルキル及びO-ハロ-C₁₋₄-アルキルから独立して選択される1~3個の置換基により置換され；

R⁷¹は、H、CN；NO₂、C₁₋₄-アルキル及びC(O)-OC₁₋₄-アルキルから独立して選択され、

ここで、アルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、CN、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、3~6員シクロアルキル、ハロ-(3~6員シクロアルキル)、3~6員ヘテロシクロアルキル、ハロ-(3~6員ヘテロシクロアルキル)、OH、オキソ、CO₂H

、 $\text{CO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 SO_3H 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{O-ハロ-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から独立して選択される1～3個の置換基により置換され；

R^{75} は、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、3～6員シクロアルキル、3～6員ヘテロシクロアルキル、6員アリール及び5～6員ヘテロアリールから独立して選択され、

ここで、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは、非置換であるか、又はハロゲン、 CN 、 Me 、 Et 、 CHF_2 、 CF_3 、 OH 、オキソ、 CO_2H 、 $\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{SO}_3\text{H}$ 、 SO_3H 、 OMe 、 OEt 、 OCHF_2 及び OCF_3 から独立して選択される1～3個の置換基により置換され；

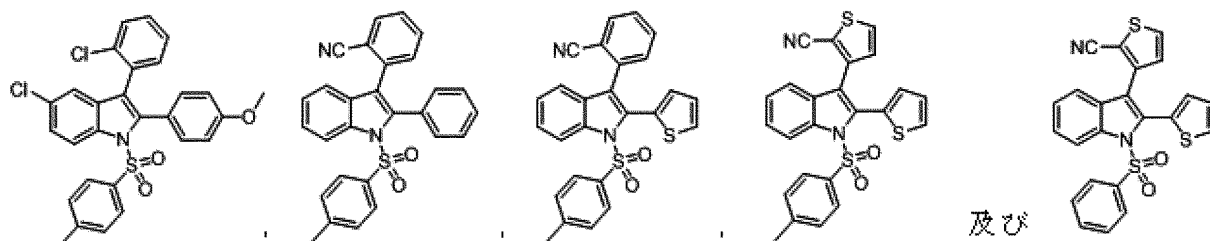
X は、 O 、 NR^{51} 、 $\text{S}(\text{O})_n$ 、 $\text{S}(=\text{NR}^{71})$ 、 $\text{S}(\text{O})(=\text{NR}^{71})$ 及び $\text{S}(=\text{NR}^{71})_2$ から独立して選択され；

Y は、結合、 O 、 NR^{51} 、 $\text{S}(\text{O})_n$ 、 $\text{S}(=\text{NR}^{71})$ 、 $\text{S}(\text{O})(=\text{NR}^{71})$ 及び $\text{S}(=\text{NR}^{71})_2$ から独立して選択され；

n は、0～2から独立して選択され；

そして、但し、以下の構造：

【化8】

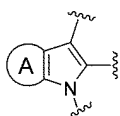


は除外される}。

【請求項2】

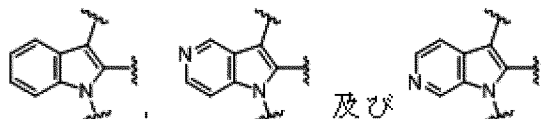
前記：

【化9】



が、以下の：

【化10】



から選択される、請求項1に記載の化合物：

{式中、

以下の：

【化11】



は、非置換であるか、又は F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 OH オキソ、 $\text{C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{ハロ-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{O-ハロ-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 NH_2 、 $\text{NHC}_{1-4}\text{-アルキル}$ 、 $\text{N}(\text{C}_{1-4}\text{-アルキル})_2$ 、 $\text{SO}_2\text{-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ 及び $\text{SO}_2\text{-ハロ-C}_{1-4}\text{-アルキル}$ から成る群から独立して選択される1～3個の置換基により置換される}。

【請求項 3】

前記：

【化 1 2】

(B)

が、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピリミジニル、チオフェニル、チアゾリル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ビスシクロ [1.1.1] ペンチル、ビスシクロ [2.2.2] オクチル、ビスシクロ [2.2.1] ヘプチル、ペンタシクロ [4.2.0.0^{2,5}.0^{3,8}.0^{4,7}] オクチル及びピペリジニルから成る群から選択され、

ここで、該環が、非置換であるか、又は F、Cl、Br、CN、OH、オキソ、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル、O-ハロ-C₁₋₄-アルキル、C₁₋₄-アルキル-OH 及びハロ-C₁₋₄-アルキル-OH から成る群から独立して選択される 1～3 個の置換基により置換され；更にここで、任意選択でフェニル環の 2 つの隣接する置換基が、-(CH₂)₃、-(CH₂)₄、-OCF₂O- 及び -OCH₂O- 基と一緒に形成する、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

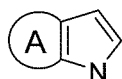
前記：

【化 1 3】

(C)

が、フェニル、ピリジル及びチオフェニルから選択され；ここで、フェニル、ピリジル及びチオフェニルが、非置換であるか、又は F、Cl、CN、OH オキソ、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル及び O-ハロ-C₁₋₄-アルキルから成る群から独立して選択される 1～3 個の置換基により置換され；更にここで、残基-L-R¹ が、以下の：

【化 1 4】

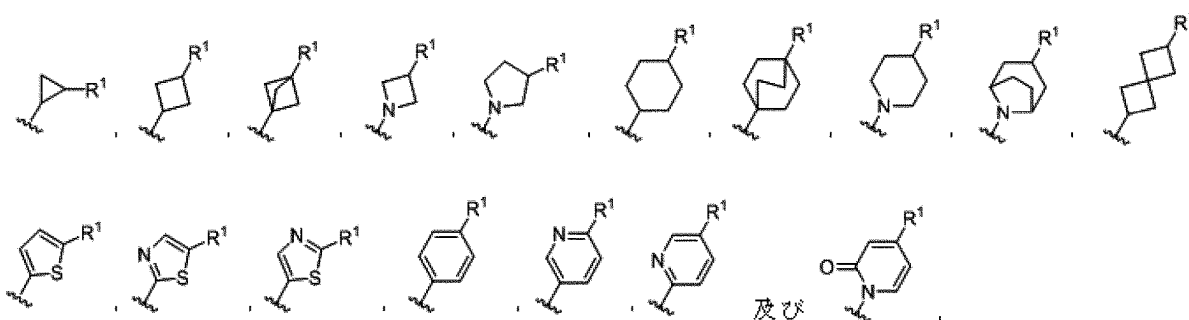


に面した接続に関して 1,3-配向で連結され、且つ、L が結合ではない、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

前記-L-R¹が、以下の：

【化 1 5】



{式中、環は、非置換であるか、又は F、Cl、Br、CN、OH オキソ、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル、O-ハロ-C₁₋₄-アルキル、C₁₋₄-アルキル-OH、ハロ-C₁₋₄-アルキル-OH、SO₂-C₁₋₄-アルキル及び SO₂-ハロ-C

1-4-アルキルから成る群から独立して選択される1~4個の置換基により置換され；更にここで、任意選択でフェニル環の2つの隣接する置換基が、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-(CH_2)_4-$ 、 $-OCF_2O-$ 及び $-OCH_2O-$ 基と一緒に形成する}から選択される、請求項1~4のいずれか一項に記載の化合物。

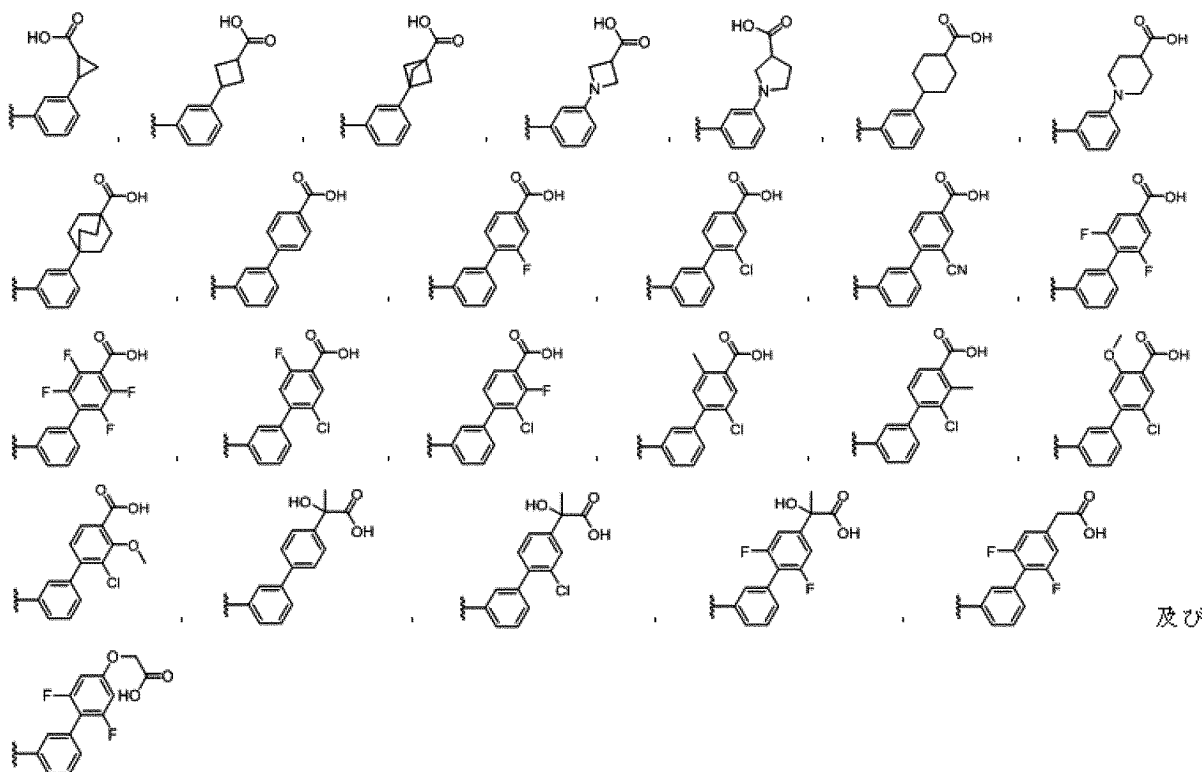
【請求項6】

前記R¹が、CO₂H、テトラゾール、CH₂CO₂H、OCH₂CO₂H、SO₂CH₂CO₂H、CHMeCO₂H、CMe₂CO₂H、C(OH)MeCO₂H、CONHSO₂Me及びCONH(OH)；並びに任意選択でそのグリシンコンジュゲート及びタウロコンジュゲートから選択される、請求項1~5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

前記-L-R¹が、以下の：

【化16】



；並びに任意選択でそのグリシンコンジュゲート及びタウロコンジュゲートから選択される、請求項1~6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

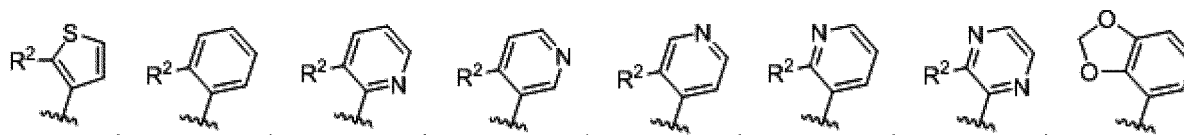
前記：

【化17】

Ⓓ

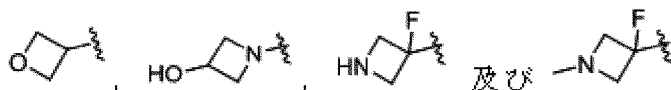
が、以下の

【化18】



{式中、R²は、Me、F、Cl、CN、Me、CHO、CHF₂、CF₃、SO₂Me、

【化 1 9】



から選択される} から成る群から選択され；並びに
前記：

【化 2 0】

(D)

が任意選択で、F、Cl、CN、Me、OMe、CHO、CHF₂及びCF₃から成る群から選択される1～2個の置換基により更に置換される、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

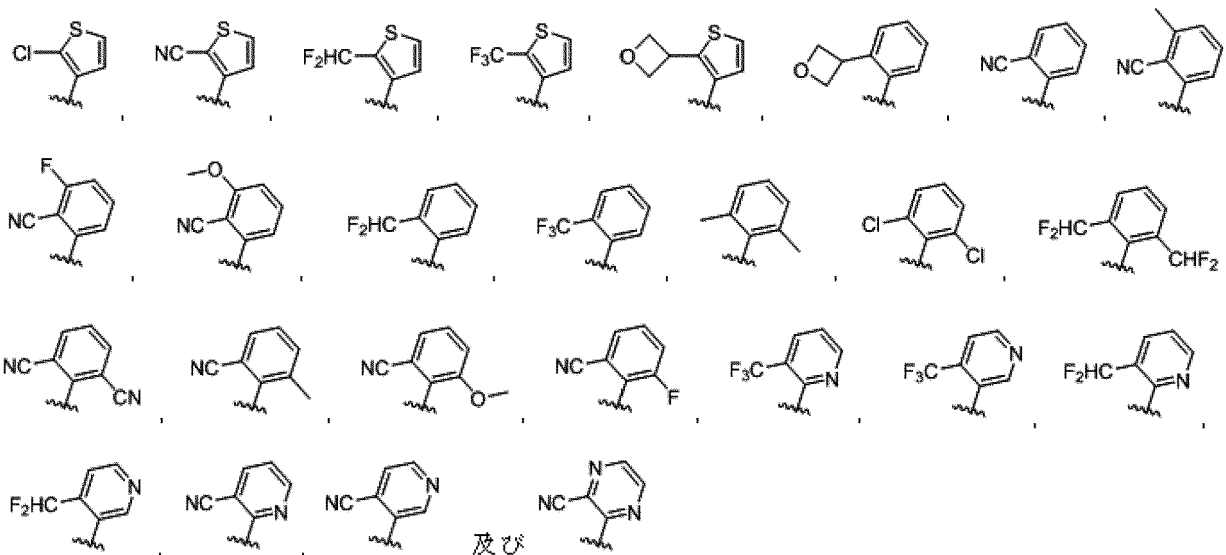
前記：

【化 2 1】

(D)

が、以下の：

【化 2 2】



から成る群から選択される、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

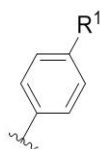
【請求項 1 0】

前記式 (I) が、CO₂H、テトラゾール、CONHSO₂Me及びCONH(OH)；並びに任意選択でそのグリシンコンジュゲート及びタウロコンジュゲートから成る群から選択される置換基を含有する、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 1】

前記-L-R¹が、以下の：

【化 2 3】



10

20

30

40

50

{式中、環は、非置換であるか、又はF、Cl、Br、CN、OHオキソ、C₁₋₄-アルキル、ハロ-C₁₋₄-アルキル、O-C₁₋₄-アルキル、O-ハロ-C₁₋₄-アルキル、C₁₋₄-アルキル-OH、ハロ-C₁₋₄-アルキル-OH、SO₂-C₁₋₄-アルキル及びSO₂-ハロ-C₁₋₄-アルキルから成る群から独立して選択される1~4個の置換基により更に置換され；ここで、任意選択でフェニル環の2つの隣接する置換基が、-(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -OCF₂O-及び-OCH₂O-基を一緒に形成する}
である、請求項1~10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

前記R¹が、C₀₋₆-アルキレン-CO₂R⁴¹又はC₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹R⁴²、又はそのグリシンコンジュゲート若しくはタウロコンジュゲートである、請求項1~11のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項13】

前記R¹が、COOH又はそのグリシンコンジュゲート若しくはタウロコンジュゲートである、請求項1~12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

前記R¹が、C₀₋₆-アルキレン-CONR⁴¹R⁴²である、請求項1~12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項15】

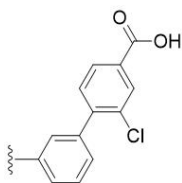
前記R⁴¹及びR⁴²はH及びC₁₋₄-アルキルから独立して選択され、ここで前記C₁₋₄-アルキルは非置換であるか又はCO₂Hにより置換される、請求項14に記載の化合物。

20

【請求項16】

前記-L-R¹が、以下の：

【化24】



又はそのグリシンコンジュゲート若しくはタウロコンジュゲートである、請求項1~11のいずれか一項に記載の化合物。

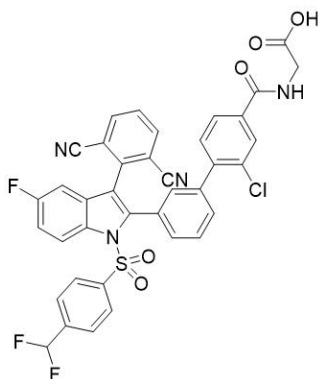
30

【請求項17】

前記化合物はグリシンコンジュゲートである、請求項1~16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

【化25】



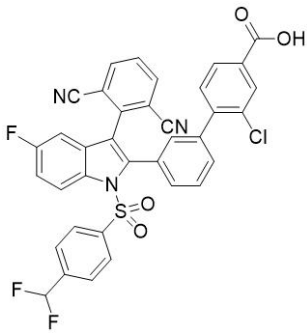
40

である、請求項1~17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項19】

50

【化 2 6】



10

又はそのグリシンコンジュゲートである、請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

以下の：

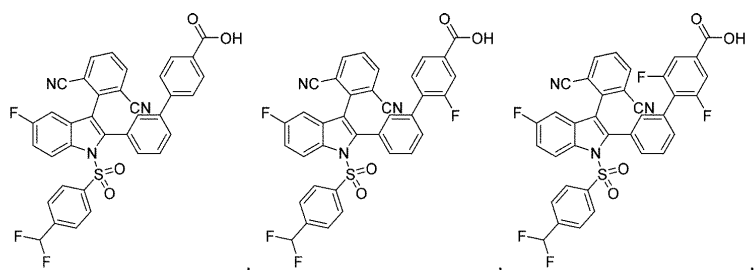
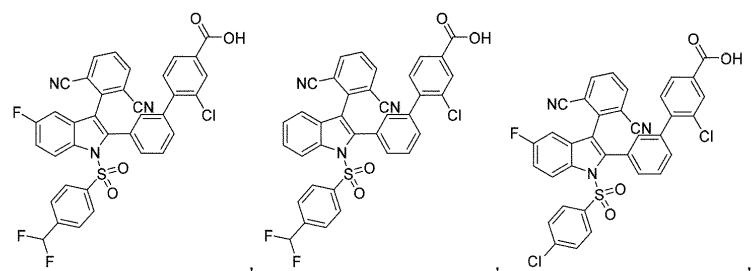
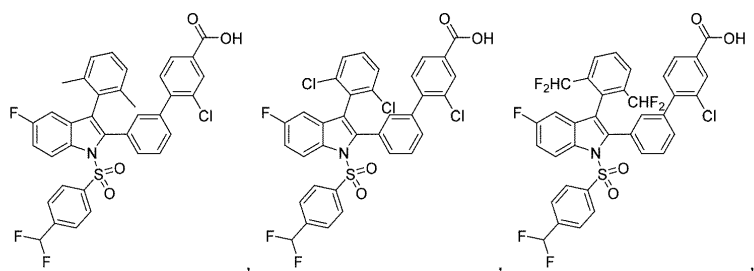
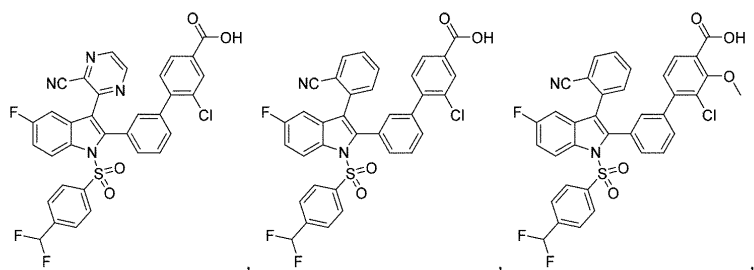
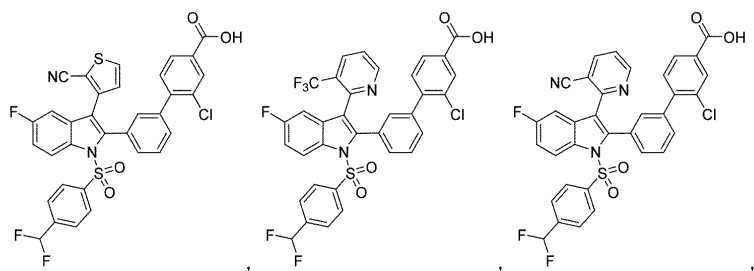
20

30

40

50

【化 2 7】



10

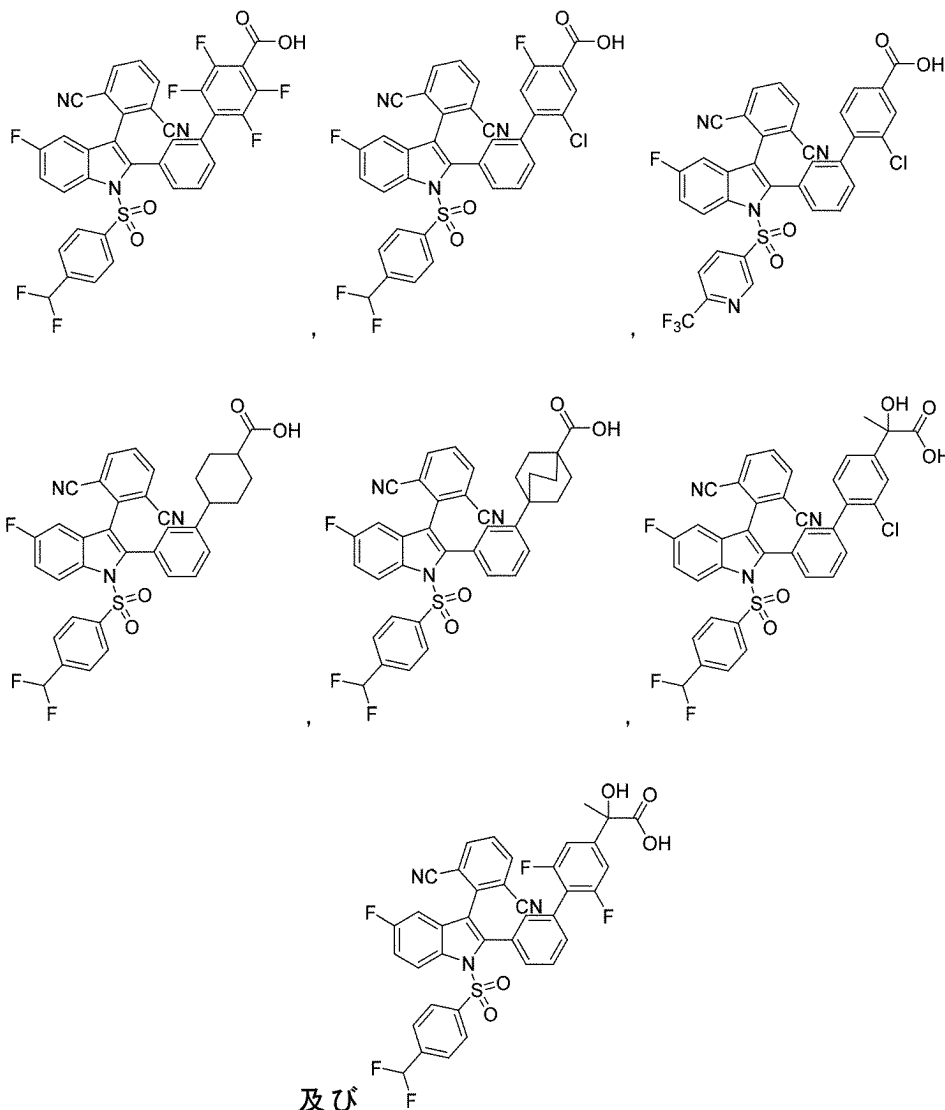
20

30

40

50

【化 2 8】



10

20

30

；又はそのグリシンコンジュゲート若しくはタウロコンジュゲート；並びに
 そのエナンチオマー、ジアステレオマー、互変異性体、N-オキシド、溶媒和物、及び医
 薬として許容し得る塩、
 から選択される、請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

医薬品としての、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 2】

LXRモジュレーターを用いた治療が可能な疾患の予防及び／又は治療に使用するための
 、請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項 2 3】

前記疾患が、非アルコール性脂肪肝疾患、非アルコール性脂肪性肝炎、肝炎症、肝線維症
 、肥満、インスリン抵抗性、II型糖尿病、家族性高コレステロール血症、ネフローゼ症候
 群における高コレステロール血症、メタボリックシンドローム、心脂肪症、癌、ウイルス
 性心筋炎、C型肝炎ウイルス感染症又はその合併症、並びに関節リウマチ、炎症性腸疾患
 及び喘息などの疾患の長期のグルココルチコイド治療の望ましくない副作用から選択され
 る、請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

請求項1～20のいずれか一項に記載の化合物、及び医薬として許容し得る担体又は賦形

50

剤を含む医薬組成物。

10

20

30

40

50