

【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22年11月4日(2010.11.4)

【公表番号】特表2010-529991(P2010-529991A)

【公表日】平成22年9月2日(2010.9.2)

【年通号数】公開・登録公報2010-035

【出願番号】特願2010-512311(P2010-512311)

【国際特許分類】

C 07 D 257/04 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 7/02 (2006.01)
A 61 K 31/41 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
A 61 K 31/427 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/167 (2006.01)
A 61 K 31/4178 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 31/501 (2006.01)
A 61 K 31/4196 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/541 (2006.01)
A 61 K 31/4725 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
A 61 K 31/4245 (2006.01)
A 61 K 31/433 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
A 61 K 31/423 (2006.01)
A 61 K 31/5513 (2006.01)
A 61 K 31/55 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
A 61 K 31/428 (2006.01)
A 61 K 31/5415 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/498 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
C 07 D 498/04 (2006.01)
A 61 K 31/5383 (2006.01)
A 61 K 31/5365 (2006.01)
A 61 K 31/437 (2006.01)
C 07 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)
C 0 7 F 9/6524 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 257/04 C S P Z

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 K 31/41

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/4155

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/4196

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/4725

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/433

C 0 7 D 471/04 1 0 6 C

A 6 1 K 31/423

C 0 7 D 471/04 1 0 1

A 6 1 K 31/5513

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 409/12

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/5415

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/497

C 0 7 D 498/04

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 K 31/5365

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 1 3

C 0 7 D 487/04 1 4 4

C 0 7 F 9/6524

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月16日(2010.9.16)

【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

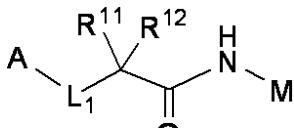
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

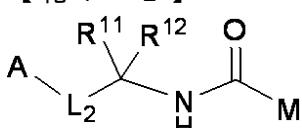
式(I)、(II)、または(III)：

【化1-1】



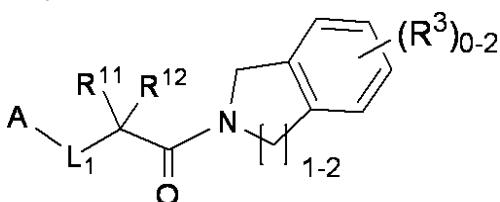
(I)

【化1-2】



(II)

【化1-3】



(III)

[式中、

Aは、0～3個のR¹でさらに置換されたC_{3～10}炭素環、または炭素原子とN、NR¹³、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む5～10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～3個のR¹で置換されており；

ただし、Aが1つまたは複数の窒素原子を含むヘテロ環である場合、Aは、A環上の窒素原子のいずれを介してもLと結合しておらず；

L₁は、-CH(R⁵)CH₂C(O)NH-、-CH(NR⁷R⁸)CH₂C(O)NH-、-C(R⁵)=CHC(O)NH-、-CH=C(R⁵)C(O)NH-、-C(R⁵)=C(R⁵)C(O)NH-、-CH₂C(O)NHCH₂-、-C(C)C(O)NH-、-CH₂NHC(O)NH-、-C(O)NHC₂CH₂-、-CH(R⁵)CH₂SO₂NH-、-C(R⁵)=CHSO₂NH-、-CH₂SO₂NHCH₂-、-SO₂NHCH₂C₂H₂-、-NHNHC(O)CH₂-、-CH₂C(O)NHNH-、-CH(R⁵)CH₂CH₂NR¹⁰-、-CH₂NHC(O)CH₂-、-NHC(O)CH₂CH₂-、-N(R⁷)CH₂C(O)NH-、-NHC(O)NHCH₂-、-NHC(O)OCH₂-、-CH₂NHSO₂CH₂-、-NHSO₂CH₂CH₂-、-CH₂OCC(O)NH-、-OCH₂C(O)NH-、または-S(O)_pCH₂C(O)NH-であり；

L₂は、-NHNHC(O)CH₂-、-CH(R⁵)CH₂NHC(O)-、-CH(NR⁷R⁸)CH₂NHC(O)-、-C(R⁵)=CHNHC(O)-、-CH₂NHC(O)CH₂-、-NHC(O)CH₂CH₂-、-CH(R⁵)CH₂-、-C(C)NHC(O)-、-NHC(O)CH₂CH₂-、-CH(R⁵)CH

C_2NHSO_2 - 、 - $\text{C}(\text{R}^5) = \text{CHNHSO}_2$ - 、 - $\text{CH}_2\text{NHSO}_2\text{CH}_2$ - 、 - $\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ - 、 - $\text{CH}_2\text{NHNHC(O)}$ - 、 - CONHNHC(O) - 、 または - $\text{COCH}_2\text{NHC(O)}$ - であり；

M は、0 ~ 3 個の R^3 で置換された - $(\text{CH}_2)_r - \text{C}_{3~10}$ 炭素環または炭素原子と N、 NR^{13} 、O、および S(O) _p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む - $(\text{CH}_2)_r - 5~12$ 員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ~ 3 個の R^3 で置換されており；

R^1 は、各々独立して、=O、F、Cl、Br、OCF₃、CF₃、CHF₂、OCF₃、CN、NO₂、- $(\text{CH}_2)_r \text{OR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{SR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)R}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)OR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{OC(O)R}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^7\text{R}^8$ 、- $\text{C}(\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)R}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)OR}^c$ 、- $\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、- $\text{NR}^8\text{C(O)NR}^8\text{R}^c$ 、- $\text{S(O)}_p \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)NR}^8\text{R}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{S(O)}_p \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{S(O)}_p \text{R}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{S(O)R}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{S(O)R}^c$ 、0 ~ 1 個の R^2 で置換された $\text{C}_{1~6}$ アルキル、0 ~ 2 個の R^{2a} で適宜置換された - $(\text{CH}_2)_r - 3~7$ 員の炭素環、または炭素原子と N、 NR^{13} 、O、および S(O) _p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む - $(\text{CH}_2)_r - 5~7$ 員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ~ 2 個の R^{2a} で置換されており；

R^2 は、F、OCF₃、CF₃、OR^a、SR^a、CN、- NR^7R^8 、- $\text{C(O)NR}^8\text{R}^9$ 、- $\text{NR}^8\text{C(O)R}^c$ 、- $\text{NR}^8\text{C(O)OR}^c$ 、- $\text{NR}^8\text{C(O)NR}^8\text{R}^c$ 、- $\text{S(O)}_p \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$ 、または - $(\text{CF}_2)_r \text{CF}_3$ であり；

R^{2a} は、各々独立して、=O、F、Br、Cl、OCF₃、CF₃、- $(\text{CH}_2)_r \text{OR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{SR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{CN}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^7\text{R}^8$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)OR}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{OC(O)R}^a$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)R}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)OR}^c$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{S(O)}_p \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$ 、 $\text{C}_{1~4}$ アルキルまたは - $(\text{CF}_2)_r \text{CF}_3$ であり；

R^3 は、各々独立して、=O、F、Cl、Br、I、OCF₃、CF₃、- $(\text{CH}_2)_r \text{C}$ N、NO₂、- $(\text{CH}_2)_r \text{OR}^{3b}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{SR}^{3b}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^7\text{R}^8$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NHC(O)NR}^8\text{R}^9$ 、- $\text{C}(\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{C}=\text{NH})\text{NHOR}^{3b}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)OR}^{3b}$ 、- $\text{C(O)C}_{1~4}$ アルキル、- $\text{SO}_2\text{NHR}^{3b}$ 、- $\text{SO}_2\text{NHCOR}^{3c}$ 、- $\text{SO}_2\text{NHC(O)R}^{3c}$ 、- $\text{CONHSO}_2\text{R}^{3c}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{C(O)R}^{3b}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{CO}_2\text{R}^{3c}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{S(O)}_p \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{NR}^8\text{S(O)}_p \text{R}^{3c}$ 、- NHSO_2CF_3 、- S(O)R^{3c} 、- $\text{S(O)}_2\text{R}^{3c}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{OC(O)R}^{3b}$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{C(O)(CH}_2)_r \text{NR}^8\text{R}^9$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{OC(O)NR}^8\text{R}^9$ 、- NHCOCF_3 、- CONHOR^{3b} 、- $(\text{CH}_2)_r \text{P(O)(OH)}_2$ 、- $(\text{CH}_2)_r \text{P(O)(OC}_{1~4}\text{アルキル)}_2$ 、 $\text{C}_{1~4}$ ハロアルキル、 $\text{C}_{1~4}$ ハロアルキルオキシ - 、 R^{3e} によって置換された $\text{C}_{1~6}$ アルキル、 R^{3e} によって置換された $\text{C}_{2~6}$ アルケニル、 R^{3e} によって置換された $\text{C}_{1~6}$ アルキニル、0 ~ 1 個の R^{3d} によって置換された $\text{C}_{3~6}$ シクロアルキル、0 ~ 3 個の R^{3d} によって置換された - $(\text{CH}_2)_r - \text{C}_{3~10}$ 炭素環もしくは炭素原子と N、O、および S(O) _p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む - $(\text{CH}_2)_r - 5~10$ 員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ~ 3 個の R^{3d} で置換されているか；

または、2 個の R^3 基が隣接原子上で置換されている場合、これらは、それらが結合している原子と一緒にになって、0 ~ 2 個の R^{3d} で置換された $\text{C}_{3~10}$ 炭素環、もしくは炭素原子と N、O、および S(O) _p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む 5 ~ 10 員のヘテロ環を形成することができ、前記ヘテロ環は、0 ~ 2 個の R^{3d} で置換されており；

R^{3b} は、各々独立して、H、0 ~ 2 個の R^{3d} で置換された $\text{C}_{1~6}$ アルキル、0 ~ 2 個の R^{3d} で置換された $\text{C}_{2~6}$ アルケニル、0 ~ 2 個の R^{3d} で置換された $\text{C}_{2~6}$ アルキニル、0 ~ 3 個の R^{3d} で置換された - $(\text{CH}_2)_r - \text{C}_{3~10}$ 炭素環、または炭素原子と N、O、および S(O) _p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む - $(\text{CH}_2)_r - 5~10$ 員

のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～3個のR^{3d}で置換されており；

R^{3c}は、各々独立して、0～2個のR^{3d}で置換されたC_{1～6}アルキル、0～2個のR^{3d}で置換されたC_{2～6}アルケニル、0～2個のR^{3d}で置換されたC_{2～6}アルキニル、0～3個のR^{3d}で置換された-(CH₂)_r-C_{3～10}炭素環、または炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む-(CH₂)_r-5～10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～3個のR^{3d}で置換されており；

R^{3d}は、各々独立して、=O、F、CN、NO₂、-(CH₂)_rNR⁷R⁸、-(CH₂)_rOR^a、-C(O)R^a、-C(O)OR^a、-OC(O)R^a、-NR⁸C(O)R^c、-C(O)NR⁸R⁹、-S(O)₂NR⁸R⁹、-NR⁸S(O)₂NR⁸R⁹、-NR⁸S(O)₂R^c、-S(O)_pR^c、-(CF₂)_rCF₃、-(CH₂)_rP(O)(OH)₂、-(CH₂)_rP(O)(OC_{1～4}アルキル)₂、0～2個のR^eで置換されたC_{1～6}アルキル、0～2個のR^eで置換されたC_{2～6}アルケニル、0～2個のR^eで置換されたC_{2～6}アルキニル、0～3個のR^dで置換された-(CH₂)_r-C_{3～10}炭素環、または炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む-(CH₂)_r-5～10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～3個のR^dで置換されており；

R^{3e}は、各々独立して、-(CH₂)_rOR^a、F、=O、CN、NO₂、-(CH₂)_rNR⁷R⁸、-C(O)R^a、-C(O)OR^a、-OC(O)R^a、-NR⁸C(O)R^c、-C(O)NR⁸R⁹、-S(O)₂NR⁸R⁹、-NR⁸S(O)₂NR⁸R⁹、-NR⁸S(O)₂R^c、-S(O)_pR^c、-(CF₂)_rCF₃、0～3個のR^dで置換された-(CH₂)_r-C_{3～10}炭素環、または炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む-(CH₂)_r-5～10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～3個のR^dで置換されており；

R⁵は、各々独立して、H、F、CF₃、-(CH₂)_rOR^a、-(CH₂)_rNR⁷R⁸、-S(O)_pNR⁸R⁹、-(CH₂)_rCO₂R^a、-(CH₂)_rCONR⁸R⁹、またはC_{1～4}アルキルであり；

R⁷は、各々独立して、H、C_{1～6}アルキル、-(CH₂)_n-C_{3～10}炭素環、-(CH₂)_n-(5～10員のヘテロアリール)、-C(O)R^c、-CHO、-C(O)₂R^c、-S(O)₂R^c、-CONR⁸R^c、-OC(=O)NR^c、-C(O)O-(C_{1～4}アルキル)OC(O)-C_{1～4}アルキル)、または-C(O)O-(C_{1～4}アルキル)OC(O)-C_{6～10}アリール)であり；前記アルキル、炭素環、ヘテロアリール、およびアリールは、0～2個のR^fで置換されており；前記ヘテロアリールは、炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含み；

R⁸は、各々独立して、H、C_{1～6}アルキル、-(CH₂)_n-フェニル、もしくは炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む5～10員のヘテロ環であり；前記アルキル、フェニルおよびヘテロ環は、0～2個のR^fで適宜置換されているか；

または、R⁷とR⁸は、同じ窒素と結合している場合は、合わさって、炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される0～3個の追加のヘテロ原子とを含む5～10員のヘテロ環を形成し、前記ヘテロ環は、0～2個のR^fで置換されており；

R⁹は、各々独立して、H、C_{1～6}アルキル、もしくは-(CH₂)_n-フェニルであり；前記アルキルおよびフェニルは、0～2個のR^fで適宜置換されているか；

または、R⁸とR⁹は、同じ窒素と結合している場合は、合わさって、炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される0～2個の追加のヘテロ原子とを含む5～12員のヘテロ環を形成し、前記ヘテロ環は、0～2個のR^dで置換されており；

R¹⁰は、各々独立して、Hまたは0～3個のR^{10a}で置換されたC_{1～6}アルキルであり；

R^{10a}は、各々独立して、H、=O、C_{1～4}アルキル、OR^a、SR^a、F、CF₃、CN、NO₂、-C(O)R^a、-C(O)OR^a、-C(O)NR⁸R⁹、-NR⁸C(O)R^c、-S(O)_pNR⁸R⁹、-NR⁸S(O)_pR^c、または-S(O)_pR^cであり；

R¹¹は、C_{1～4}ハロアルキル、-C(O)NR⁸R⁹、-CH₂C(O)NR⁸R⁹、-C

$\text{H}_2\text{C}\text{H}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $0 \sim 3$ 個の R^{11c} で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 3$ 個の R^{11a} で置換された $\text{C}_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $0 \sim 3$ 個の R^{11a} で置換された $\text{C}_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $0 \sim 3$ 個の R^{11b} で置換された $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 10}$ 炭素環、または炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、 $0 \sim 3$ 個の R^{11b} で置換されており；

R^{11a} は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 OR^a 、 SR^a 、 F 、 CF_3 、 CN 、 NO_2 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{CHO}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキルオキシ-、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換された $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 10}$ 炭素環、または炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含み、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であり；

R^{11b} は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}^8$ 、 OR^a 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 F 、 Cl 、 Br 、 C N 、 NO_2 、 CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})_2\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{2 \sim 6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2 \sim 6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキルオキシ-、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換された $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 10}$ 炭素環、もしくは炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含み、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であるか；

または、2 個の R^{11b} 基が隣接原子上の置換基である場合、これらは、それらが結合している原子と一緒にになって、炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含み、 $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されている、 $5 \sim 7$ 員のヘテロ環を形成してもよく；

R^{11c} は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 OR^a 、 SR^a 、 F 、 CF_3 、 CN 、 NO_2 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{CHO}$ 、 $-\text{NHC}(\text{NH}_2)=\text{N}(\text{NO}_2)$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ ハロアルキルオキシ-、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換された $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 10}$ 炭素環、または炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含み、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であり；

R^{12} は、各々独立して、 H 、 F 、または $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキルであり；

R^{13} は、各々独立して、 H 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、 CO_2R^a 、またはベンジルであり；

R^a は、各々独立して、 H 、 CF_3 、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{6 \sim 10}$ アリール、または炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記シクロアルキル、アリールまたはヘテロ環基は、 $0 \sim 2$ 個の R^f で適宜置換されており；

R^b は、各々独立して、 CF_3 、 OH 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルコキシ、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^d で置換された $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $-\text{C}_{3 \sim 10}$ 炭素環、または炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含み、 $0 \sim 3$ 個の R^d で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r$ 、 $5 \sim 10$ 員のヘテロ環であり；

R^c は、各々独立して、 CF_3 、 $0 \sim 2$ 個の R^f で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^f で置換された $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6 \sim 10}$ アリール、 $5 \sim 10$ 員のヘテロアリール、 $(\text{C}_{6 \sim 10}$ アリール) $-\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、または $(5 \sim 10$ 員のヘテロアリール) $-\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキルであり、前記アリールは $0 \sim 3$ 個の R^f で置換されており、前記ヘテロアリールは、炭素原子と N、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子と

を含み、0～3個のR^fで置換されており；

R^dは、各々独立して、H、=O、=N R⁸、O R^a、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、-NR⁷R⁸、-C(O)R^a、-C(O)OR^a、-OC(O)R^a、-NR⁸C(O)R^c、-C(O)NR⁸R⁹、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂-C₁～₄アルキル、-NR⁸SO₂CF₃、-NR⁸SO₂-フェニル、-S(O)₂CF₃、-S(O)_p-C₁～₄アルキル、-S(O)_p-フェニル、-(CF₂)_rCF₃、0～2個のR^eで置換されたC₁～₆アルキル、0～2個のR^eで置換されたC₂～₆アルケニル、または0～2個のR^eで置換されたC₂～₆アルキニルであり；

R^eは、各々独立して、=O、OR^a、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、-NR⁷R⁸、-C(O)R^a、-C(O)OR^a、-NR⁸C(O)R^c、-C(O)NR⁸R⁹、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂-C₁～₄アルキル、-NR⁸SO₂CF₃、-NR⁸SO₂-フェニル、-S(O)₂CF₃、-S(O)_p-C₁～₄アルキル、-S(O)_p-フェニル、または-(CF₂)_rCF₃であり；

R^fは、各々独立して、H、=O、-(CH₂)_rOR^g、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、-NR^gR^g、-C(O)R^g、-C(O)OR^g、-NR^gC(O)R^g、-C(O)NR^gR^g、-SO₂NR^gR^g、-NR^gSO₂NR^gR^g、-NR^gSO₂-C₁～₄アルキル、-NR^gSO₂CF₃、-NR^gSO₂-フェニル、-S(O)₂CF₃、-S(O)_p-C₁～₄アルキル、-S(O)_p-フェニル、または-(CF₂)_rCF₃、C₂～₆アルケニル、C₂～₆アルキニル、-(CH₂)_n-フェニル、または炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む-(CH₂)_n-5～10員のヘテロ環であり；

R^gは、各々独立して、H、C₁～₆アルキル、または-(CH₂)_n-フェニルであり；

nは、各々、0、1、2、3、および4から選択され；

pは、各々、0、1、および2から選択され；

rは、各々、0、1、2、3、および4から選択される】

の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩。

【請求項2】

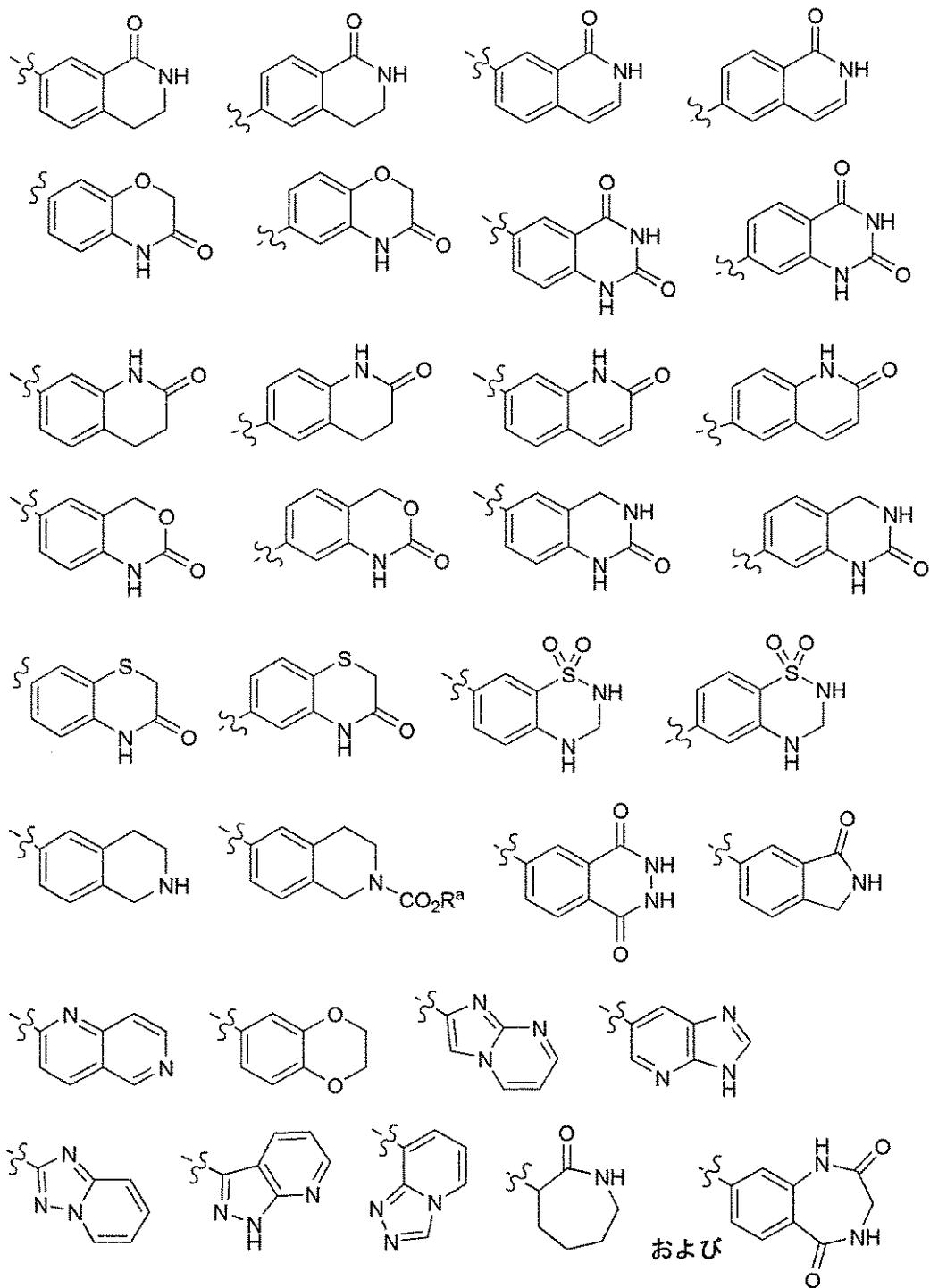
L₁が、-CH(R⁵)CH₂C(O)NH-、-CH(NR⁷R⁸)CH₂C(O)NH-、-C(R⁵)=CHC(O)NH-、-CH=C(R⁵)C(O)NH-、-C(C)C(O)NH-、-CH₂NHC(O)NH-、-NHNHC(O)CH₂-、-CH(R⁵)CH₂CH₂NR¹⁰-、-CH₂NHC(O)CH₂-、-NHC(O)OCH₂-、OCH₂C(O)NH-、または-S(O)_pCH₂C(O)NH-であり；

L₂が、-CH(R⁵)CH₂NHC(O)-、-C(R⁵)=CHNHC(O)-、-CH₂NHC(O)CH₂-、-C(C)NHC(O)-、-CH₂NHNHC(O)-、-C(O)NHNHC(O)-、または-COCH₂NHC(O)-であり；

Aが、0～3個のR¹で置換されており、C₃～₇シクロアルキル、フェニル、ナフチル、1,2,3,4-テトラヒドロナフチル、ピロリジニル、ピリジル、インダゾリル、インドリル、イミダゾリル、フラニル、チエニル、ベンズイミダゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチオフェニル、3,4-メチレンジオキシ-フェニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、およびピラゾリルからなる群から選択され；

Mが、0～3個のR³で置換されており、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、インドリル、インドリニル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンズイソオキサゾリル、テトラヒドロイソキノリニル、ジヒドロイソキノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、キノリニル、

【化 2】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項3】

L_1 が、 $-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{C}(\text{Me})=\text{CHC}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{C}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHC}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{C}(\text{CC}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHC}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{NHNHC}(\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHNH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^{10}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHC}(\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{O}\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ 、 または $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}-$ であり；

L_2 が、 $-CH(Me)CH_2NHCO$ - 、 CH_2CH_2NHCO - 、 $-CH=CHNHCO$ - 、 $-C(Me)=CHNHCO$ - 、 $-CH_2NHNHCO$ - 、

- C H₂N H C (O) C H₂ - 、 - C C N H C (O) - 、 - C O N H N H C (O) - 、 または - C O C H₂N H C (O) - であり；

R¹が、各々独立して、F、Cl、Br、C F₃、O C F₃、NO₂、CN、- (C H₂)_rOR^a、- (C H₂)_rSR^a、- (C H₂)_rCOR^a、- (C H₂)_rC (O) OR^a、- (C H₂)_rC (O) NR⁸R⁹、- C (=NH) NH₂、- (C H₂)_rNR⁸C (O) R^c、- (C H₂)_rNR⁸C (O) OR^c、- C O₂(C H₂)₂NR⁷R⁸、- (C H₂)_rNR⁸C (O) NR⁸R^c、- (C H₂)_rS (O)_pNR⁸R⁹、- (C H₂)_rNR⁸S O₂R^c、- (C H₂)_rNR⁷R⁸、- (C H₂)_rS (O) R^c、- (C H₂)_rS (O)₂R^c、0 ~ 1個のR^{1a}で置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、または炭素原子とN、NR¹³、O、およびS (O)_pから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子とを含む5 ~ 7員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ~ 2個のR^{1b}で置換されており；

R¹¹が、C_{1 ~ 4}ハロアルキル、- C H₂C (O) NR⁸R⁹、- C H₂C H₂C (O) NR⁸R⁹、- C H₂C (O) R^a、- C H₂C H₂C (O) R^a、- C H₂C (O) OR^a、- C H₂C H₂C (O) OR^a、0 ~ 2個のR^{11c}で置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、0 ~ 2個のR^{11b}で置換された- (C H₂)_r- C_{3 ~ 7}シクロアルキル、0 ~ 2個のR^{11b}で置換された- (C H₂)_r- インダニル、0 ~ 2個のR^{11b}で置換された- (C H₂)_r- インデニル、0 ~ 2個のR^{11b}で置換された- (C H₂)_r- ナフチル、または炭素原子とN、O、およびS (O)_pから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子とを含む- (C H₂)_r- 5 ~ 10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ~ 2個のR^{11b}で置換されており；

R¹²が、Hである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

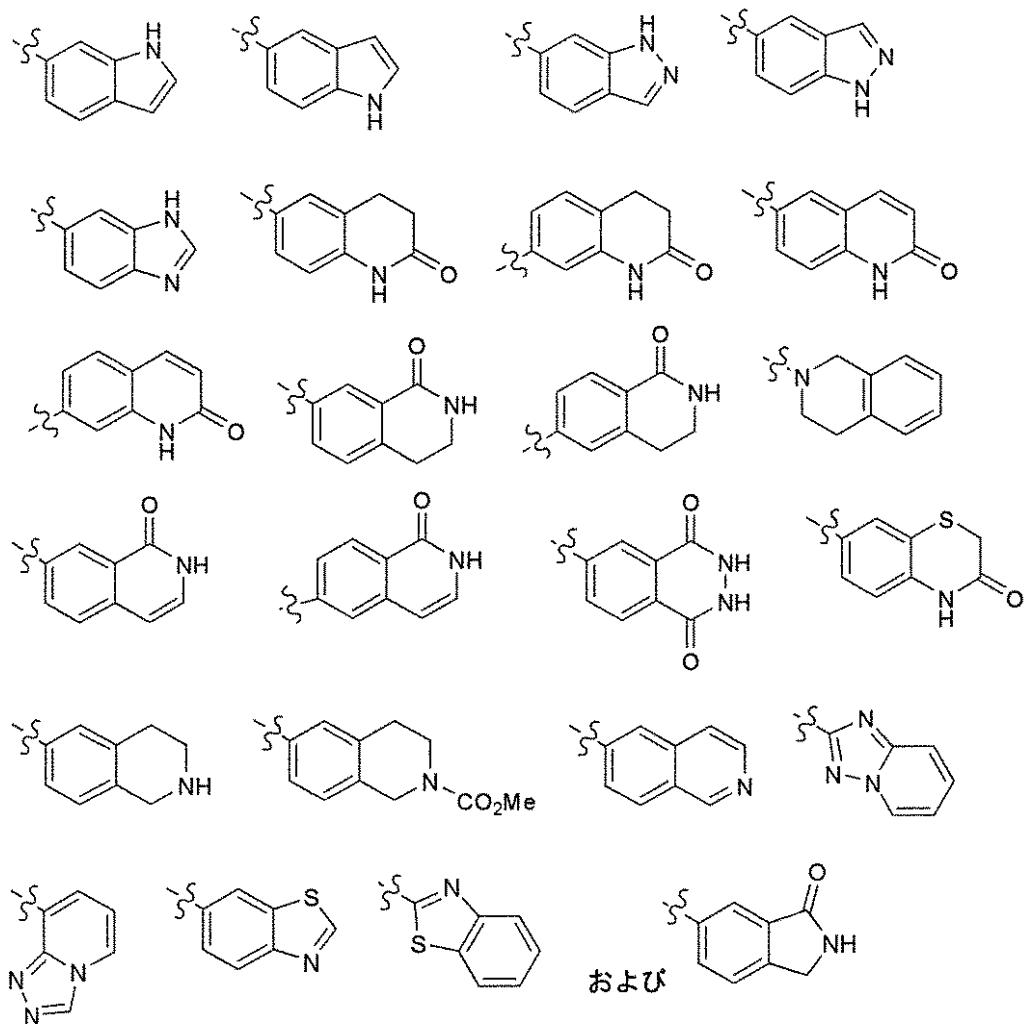
Aが、0 ~ 3個のR¹で置換されたフェニルであり；

L₁が、- C H₂C H₂C (O) NH-、- C H = C H C (O) NH-、- C C C (O) NH-、- C H₂N H C (O) NH-、- O C H₂C (O) NH-、- S C H₂C (O) NH-、- S (O) C H₂C (O) NH-、または- S (O)₂C H₂C (O) NH- であり；

L₂が、- C H₂C H₂N H C (O) - または- C H = C H N H C (O) - であり；

Mが、0 ~ 2個のR³で置換されており、シクロヘキシル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、チアゾリル、

【化 3】



からなる群から選択され；

R^1 が、各々独立して、F、Cl、Br、 CF_3 、 OCF_3 、 OR^a 、 SR^a 、- CH_2OR^a 、- CH_2SR^a 、 SO_2Me 、 SO_2NH_2 、CN、 NR^7R^8 、- $CH_2NR^7R^8$ 、 NO_2 、 COR^a 、 $C(O)OR^a$ 、- $CH_2C(O)OR^a$ 、- $C(=NH)NH_2$ 、- $C(O)NR^8R^9$ 、- $CH_2C(O)NR^8R^9$ 、- $NR^8C(O)R^c$ 、- $CH_2NR^8C(O)R^c$ 、- $NR^8C(O)OR^c$ 、- $CH_2NR^8C(O)OR^c$ 、- $CO_2(CH_2)_2NR^7R^8$ 、- $NR^8C(O)NR^8R^c$ 、- $CH_2NR^8C(O)NR^8R^c$ 、- $NR^8SO_2R^c$ 、- CH_2NR^8S O_2R^c 、0~1個の R^{1a} で置換された $C_{1~6}$ アルキル、または炭素原子とN、 NR^{13} 、O、および $S(O)_p$ から選択される1~4個のヘテロ原子とを含む5~7員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0~2個の R^{1b} で置換されており；

R^3 が、各々独立して、=O、F、Cl、Br、OCF₃、CF₃、CN、-CH₂CN、OR^{3b}、-CH₂OR^{3b}、SR^{3b}、-CH₂SR^{3b}、-C(O)C_{1~4}アルキル、-OC(O)(C_{1~4}アルキル)、-(CH₂)_rC(O)OR^{3b}、-(CH₂)_rNR⁷R⁸、C(O)NR⁸R⁹、-CH₂C(O)NR⁸R⁹、-NR⁸C(O)R^{3b}、-CH₂NR⁸C(O)R^{3b}、-NR⁸CO₂R^{3c}、-CH₂NR⁸CO₂R^{3c}、-(C=NH)NH₂、-(C=NH)NHOH、-NHC(O)NR⁸R⁹、-CH₂NHC(O)NR⁸R⁹、-SO₂NR⁸R⁹、-NHSO₂R^{3c}、-CONHSO₂R^{3c}、P(O)(OH)₂、P(O)(OC_{1~4}アルキル)₂、-CH₂P(O)(OH)₂、-CH₂P(O)(OC_{1~4}アルキル)₂、C_{1~4}アルキル、または炭素原子とN、O、およびS(O)_pから選択される1~4個のヘテロ原子とを含む-(CH₂)_r-5~6員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0~1個のR^{3d}で置換されている。

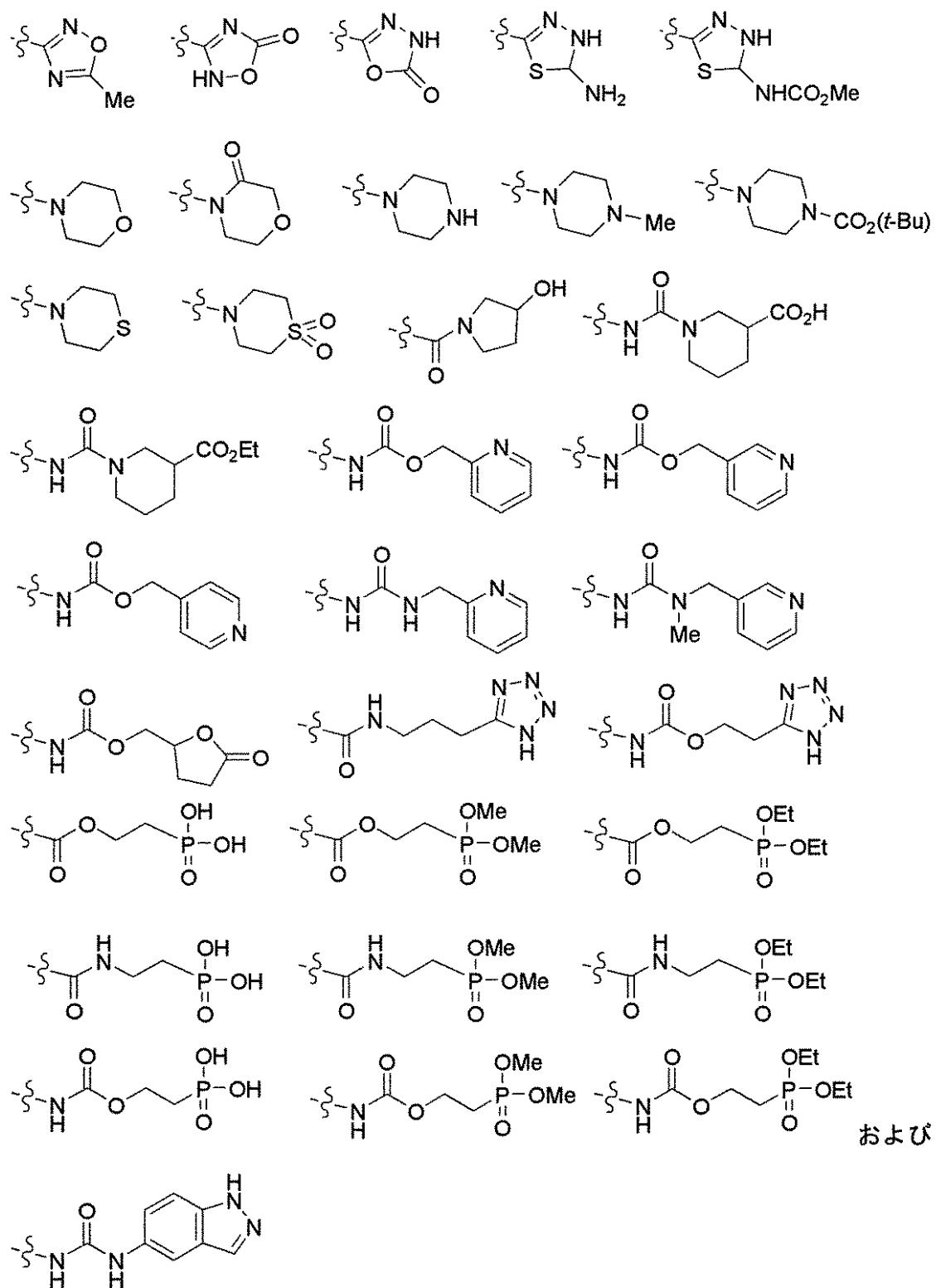
請求項 2 または請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が、各々独立して、F、Cl、Br、Me、Et、OMe、CF₃、OCF₃、CN、NH₂、CO₂H、CO₂Me、CO₂Et、CO₂(t-Bu)、C(O)Me、-CH₂CO₂H、-CH₂CO₂Me、-CH₂CO₂Et、-CH₂NH₂、-CONH₂、-CONHMe、-NHCOME、-NHCO₂Me、-NHCO₂(t-Bu)、-CO₂(CH₂)₂NEt₂、-NHCO₂(CH₂)₂N(Me)₂、-SO₂NH₂、-C(=NH)NH₂、ピラゾール-1-イル、3-カルボキシ-ピラゾール-1-イル、4-カルボキシ-ピラゾール-1-イル、4-(エトキシカルボニル)-ピラゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,3,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-2-イル、4-カルボキシ-1,2,3-トリアゾール-1-イル、4-(エトキシカルボニル)-1,2,3-トリアゾール-1-イル、テトラゾール-1-イル、テトラゾール-5-イル、5-Me-テトラゾール-1-イル、5-CF₃-テトラゾール-1-イル、5-NH₂-テトラゾール-1-イル、5-NH₂-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル、2-オキソ-1,3,4-トリザオリル-5-イル、4-アミノカルボニル-1,2,3-トリアゾール-1-イル、4-ジメチルアミノカルボニル-1,2,3-トリアゾール-1-イル、または4-ヒドロキシメチル-1,2,3-トリアゾール-1-イルであり；

R^3 が、各々独立して、F、Cl、Me、CF₃、OCF₃、OH、CN、NH₂、CO₂H、CO₂Me、CO₂Et、CO₂(t-Bu)、-CH₂CO₂H、-CH₂CO₂Me、-CH₂CO₂Et、-CONH₂、-CON(Me)₂、-NHCOME、-NHCO₂Me、-NHCO₂(t-Bu)、-(C=NH)NH₂、-(C=NH)NHOH、-CONH₂CO₂H、-CON(Me)CH₂CO₂H、-CONH(CH₂)₂CO₂H、-CONH(CH₂)₂CO₂Et、-CONH(CH₂)₃CO₂H、-CONH(CH₂)₃CO₂Et、-CO₂(CH₂)₂NEt₂、-CO₂(CH₂)₃N(Bu)₂、-CH₂NHCO₂Me、-NHCO₂(CH₂)₂OME、-CH₂NHCO₂(CH₂)₂OME、-NHCO₂(CH₂)₂CO₂H、-NHCO₂(CH₂)₂CO₂Me、-NHCO₂(CH₂)₂CO₂Et、-NHCO₂(CH₂)₂N(Me)₂、-CH₂NHCONH₂、-NHCONH(CH₂)₂CO₂H、-NHCONH(CH₂)₂CO₂Me、-NHCONH(CH₂)₃CO₂Me、-CONHSO₂Me、-SO₂NH₂、P(O)(OH)₂、P(O)(OEt)₂、-CH₂P(O)(OH)₂、-CH₂P(O)(OEt)₂、2-(N,N-ジメチルアミノメチル)-フェニル、ピリジン-4-イル-、テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ-、2-オキソ-ピペリジン-1-イル、2-オキソ-2H-ピリジン-1-イル、イミダゾール-1-イル、2-(N,N-ジメチルアミノメチル)-イミダゾール-1-イル、テトラゾール-1-イル、テトラゾール-5-イル、

【化 4】

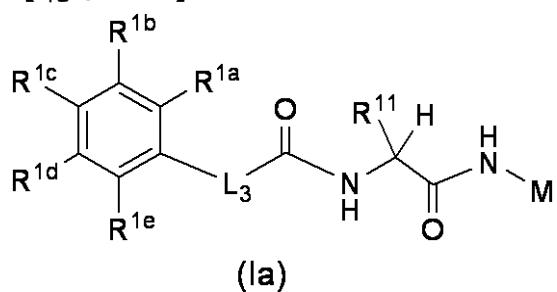


である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

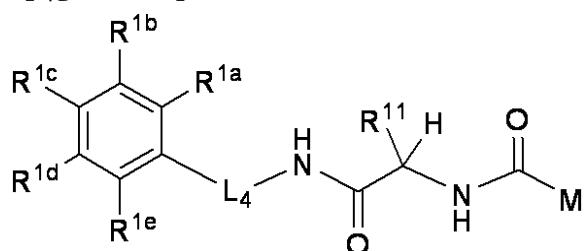
【請求項 6】

式 (I a) または (I I a) :

【化5-1】



【化5-2】



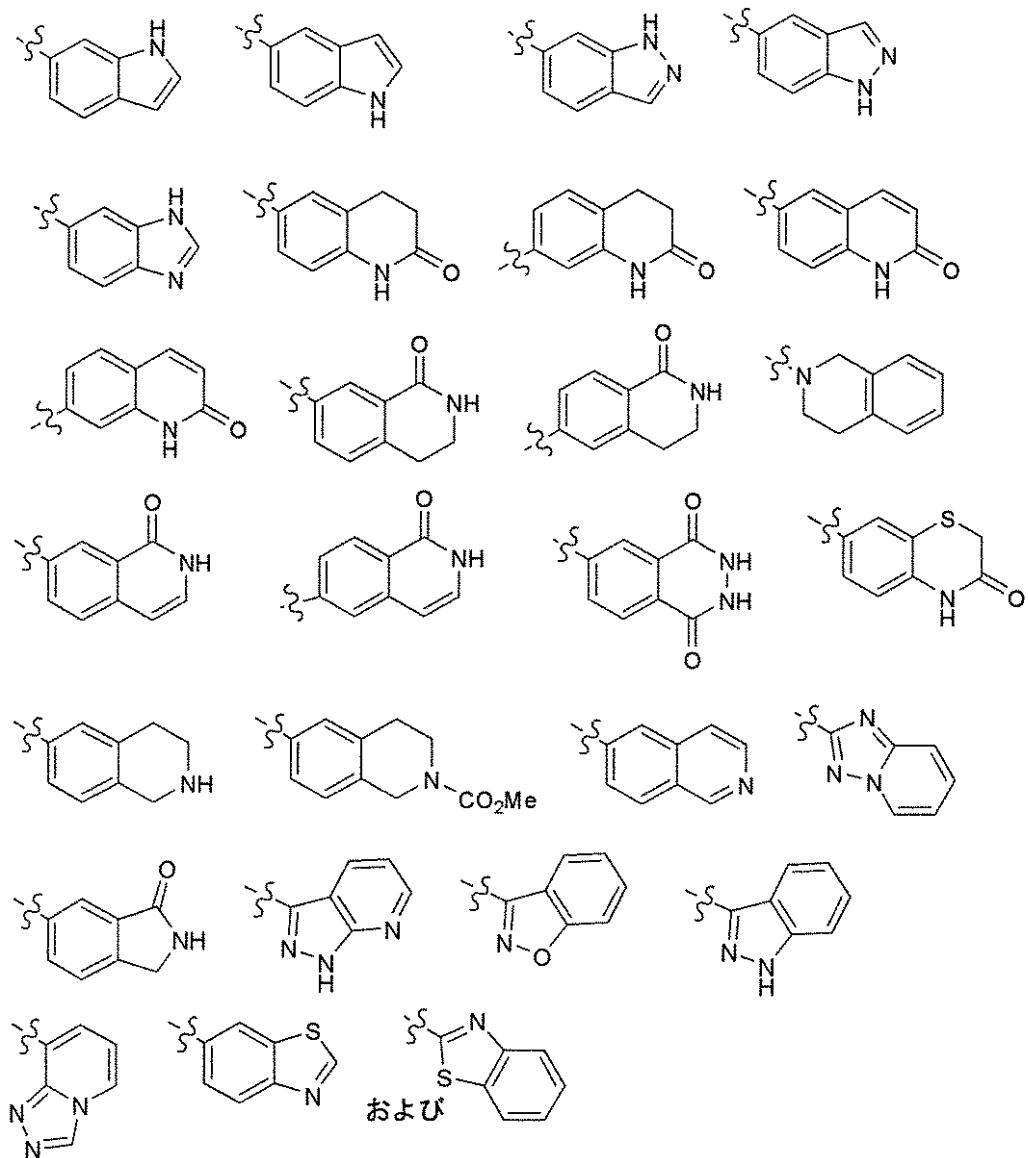
[式中、

L_3 は、-CH₂CH₂-、-CH=CH-、-C-C-または-S(O)CH₂-であり；

L_4 は、-CH₂CH₂-、-CH=CH-、-C-C-、-CONH-、または-COCH₂-であり；

Mは、0~2個のR³で置換されており、シクロヘキシリル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニルチアゾリル、

【化6】



からなる群から選択され；

R^{1a} は、各々独立して、H、F、C(O)Me、-CH₂NH₂、1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル、1, 3, 4-トリアゾール-1-イル、1, 2, 3-トリアゾール-2-イル、4-カルボキシ-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、4-(エトキシカルボニル)-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル、テトラゾール-1-イル、テトラゾール-5-イル、5-Me-テトラゾール-1-イル、または5-CF₃-テトラゾール-1-イルであり；

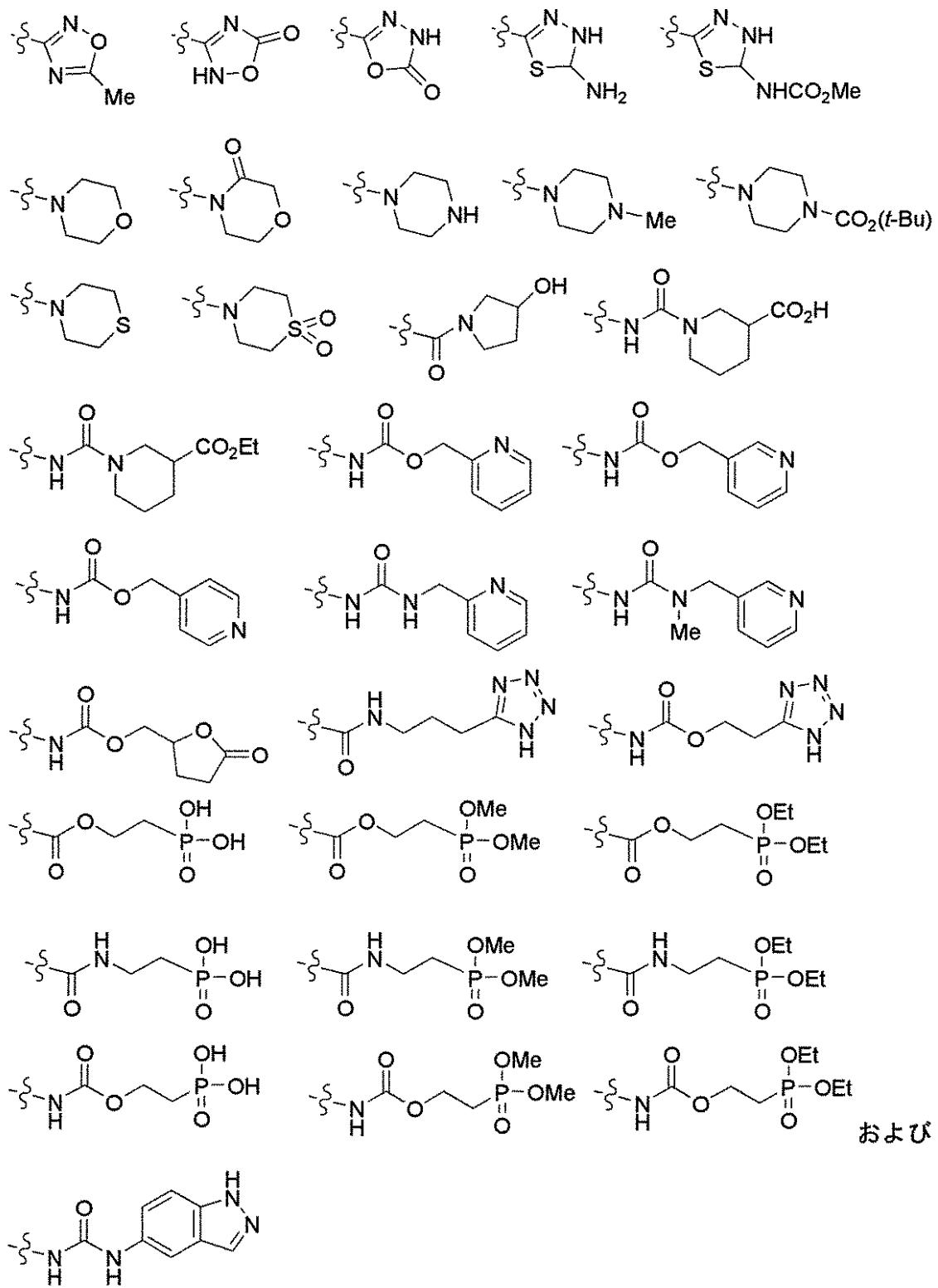
R^{1b} 、 R^{1c} 、 R^{1d} は、各々独立して、H、F、Cl、Br、Me、Et、OMe、CF₃、OCF₃、CN、NH₂、CO₂H、CO₂Me、CO₂Et、CO₂(t-Bu)、C(O)Me、-CH₂CO₂H、-CH₂CO₂Me、-CH₂CO₂Et、-CH₂NH₂、-CONH₂、-NHCOMe、-NHCO₂Me、-NHCO₂(t-Bu)、-CO₂(CH₂)₂Ne_t₂、-NHCO₂(CH₂)₂N(Me)₂、-SO₂NH₂、-C(=NH)NH₂であり；

R^{1e} は、各々独立して、HまたはFであり；

R^3 は、各々独立して、F、Cl、Me、CF₃、OCF₃、OH、CN、NH₂、CO₂H、CO₂Me、CO₂Et、CO₂(t-Bu)、-CH₂CO₂H、-CH₂CO₂Me、-CH₂CO₂Et、-CONH₂、-CON(Me)₂、-NHCOMe、-NHCO₂M

e、 - N H C O₂ (t - B u)、 - (C = N H) N H₂、 - (C = N H) N H O H、 - C O N H C H₂ C O₂ H、 - C O N (M e) C H₂ C O₂ H、 - C O N H (C H₂)₂ C O₂ H、 - C O N H (C H₂)₂ C O₂ E t、 - C O N H (C H₂)₃ C O₂ H、 - C O N H (C H₂)₃ C O₂ E t、 - C O₂ (C H₂)₂ N E t₂、 - C O₂ (C H₂)₃ N (B u)₂、 - C H₂ N H C O₂ M e、 - N H C O₂ (C H₂)₂ O M e、 - C H₂ N H C O₂ (C H₂)₂ O M e、 - N H C O₂ (C H₂)₂ C O₂ H、 - N H C O₂ (C H₂)₂ C O₂ M e、 - N H C O₂ (C H₂)₂ C O₂ E t、 - N H C O₂ (C H₂)₂ N (M e)₂、 - C H₂ N H C O N H₂、 - N H C O N H (C H₂)₂ C O₂ H、 - N H C O N H (C H₂)₂ C O₂ M e、 - C O N H S O₂ M e、 - S O₂ N H₂、 P (O) (O H)₂、 P (O) (O E t)₂、 - C H₂ P (O) (O H)₂、 - C H₂ P (O) (O E t)₂、 2 - (N , N - ジメチルアミノメチル) - フェニル、 ピリジン - 4 - イル - 、 テトラヒドロフラン - 2 - イルメトキシ - 、 2 - オキソ - ピペリジン - 1 - イル、 2 - オキソ - 2 H - ピリジン - 1 - イル、 イミダゾール - 1 - イル、 2 - (N , N - ジメチルアミノメチル) - イミダゾール - 1 - イル、 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル、 テトラゾール - 1 - イル、 テトラゾール - 5 - イル、

【化 7】

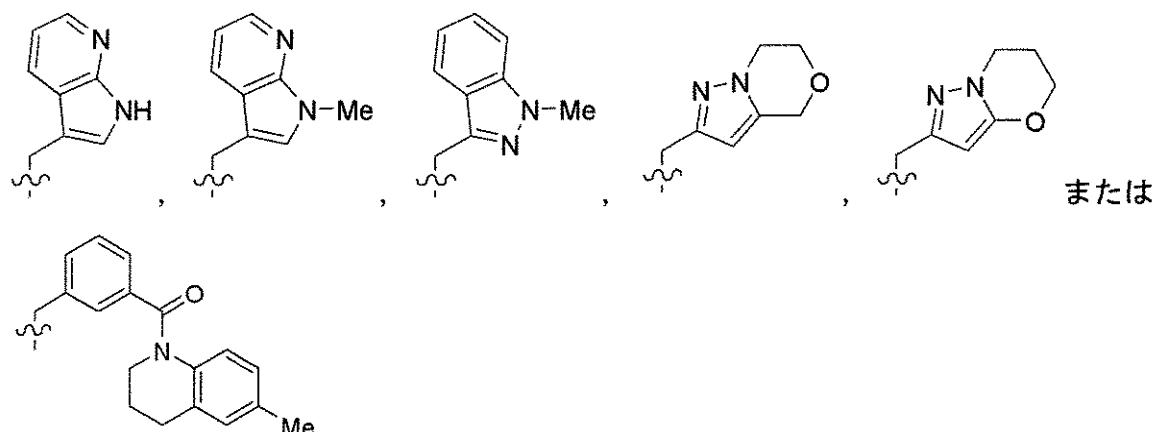


であり；

R^{11} は、メチル、エチル、ネオペンチル、-CH₂CO₂H、-CH₂CO₂Me、-CH₂CONMe、-CH₂CF₃、-CH₂CH₂CF₃、-CH₂CH₂SM₂、-CH₂S(t-Bu)、-CH₂CH₂S(O)Me、-CH₂CH₂S(O)₂Me、-(CH₂)₄N(Me)₂、-CH₂C(O)N(Me)(CH₂)₂N(Me)₂、-(CH₂)₃NHC(NH₂)=N(NO₂)、(2-モルホリノエチル)カルバモイルメチル、フェニルカルバモイルメチル、ベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベ

ンジル、3, 5 - ジフルオロベンジル、3 - カルボキシベンジル、3 - カルバモイルベンジル、3 - (N - メチルカルバモイル) - ベンジル、3 - メトキシカルボニルベンジル、3 - メチルカルボニルアミノ - ベンジル、3 - (イソプロピル - メチル - カルバモイル) - ベンジル、3 - (メチル - フェニル - カルバモイル) - ベンジル、3 - (N, N - ジメチルカルバモイル) - ベンジル、3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル) ベンジル、フェネチル、チエン - 2 - イルメチル、(ジメチルアミノ) - カルボニルメチル、ベンジルオキシメチル、ベンジルチオメチル、1 - ナフチルメチル、2 - ナフチルメチル、チアゾール - 2 - イルメチル、チアゾール - 4 - イルメチル、ピリド - 2 - イルメチル、ピリド - 3 - イルメチル、ピリド - 4 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 2 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 3 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 4 - イルメチル、(2 - ヒドロキシ - ピリド - 5 - イル) メチル、(ベンジルオキシカルボニル) メチル、(1 - メチルピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - メチルピラゾール - 5 - イル) メチル、(3 - メチルピラゾール - 5 - イル) メチル、(1 - エチルピラゾール - 3 - イル) メチル、3 - ピラゾリルメチル、[1 - (4 - メトキシベンジル) - ピラゾール - 3 - イル] メチル、(1, 5 - ジメチルピラゾール - 3 - イル) メチル、(1, 3 - ジメチルピラゾール - 5 - イル) メチル、[1 - (4 - メトキシベンジル) - 5 - メチル - ピラゾール - 3 - イル] メチル、(3 - トリフルオロメチルピラゾール - 5 - イル) メチル、[1 - (4 - メトキシベンジル) - 3 - トリフルオロメチルピラゾール - 5 - イル] メチル、(1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - メチル - 5 - (メチルスルフィニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル) メチル、1H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イルメチル、アゼチジン - 3 - イルメチル、(1 - アセチル - アゼチジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - アゼチジン - 3 - イル) メチル、ピロリジン - 2 - イルメチル、ピロリジン - 3 - イルメチル、(1 - アセチル - ピロリジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - ピロリジン - 3 - イル) メチル、(3 - (2 - エトキシエトキシ) ピロリジン - 1 - イル) カルボニルメチル、(1 - ベンゾイルピロリジン - 3 - イル) メチル、ピロリジン - 1 - イルカルボニルメチル、2 - メトキシピロリジン - 1 - イルカルボニルメチル、ピペリジン - 3 - イルメチル、ピペリジン - 4 - イルメチル、ピペリジン - 4 - イルエチル、(1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イル) エチル、(1 - CO₂Me - ピペリジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - ピペリジン - 4 - イル) メチル、(2 - メトキシピリジン - 3 - イル) メチル、(2 - メトキシピリジン - 5 - イル) メチル、(4 - (メトキシカルボニル) - オキサゾール - 2 - イル) メチル、モルホリン - 4 - イルカルボニルメチル、(2, 6 - ジメチル - モルホリン - 4 - イル) カルボニルメチル、N - ((5 - メチルピラジン - 2 - イル) メチル) - アミノカルボニルメチル、4 - メチルピペラジン - 1 - イルカルボニルメチル、ピペラジン - 1 - イルカルボニルメチル、4 - メチルカルボニルピペラジン - 1 - イルカルボニルメチル、テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イルメチル、(1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホリン - 4 - イル) メチル、(1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホリン - 4 - イル) カルボニルメチル、N - (ピラジン - 2 - イルメチル) アミノカルボニルメチル、1H - インドール - 3 - イル、キノキサリン - 2 - イルメチル、

【化 8】



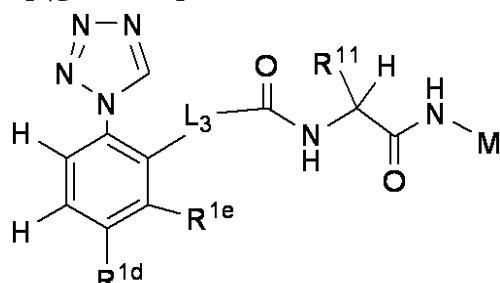
である]

を有する化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩である、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

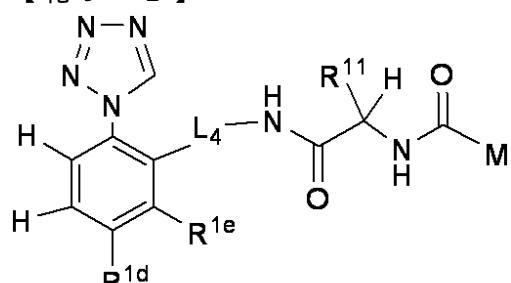
式 (I b) または (II b) :

【化 9 - 1】



(Ib)

【化 9 - 2】



(IIb)

[式中、

R^{1d} は、各々独立して、C1 または M e であり；

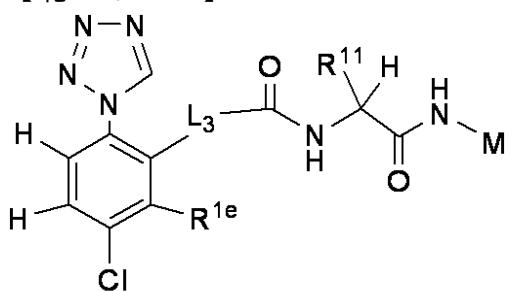
R^{1e} は、各々独立して、H または F である]

を有する化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

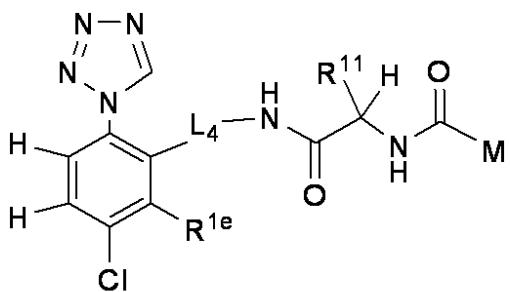
式 (I c) または (II c) :

【化10-1】



(Ic)

【化10-2】



(IIc)

[式中、R^{1e}は、各々独立して、HまたはFである]

を有する化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩である、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物。

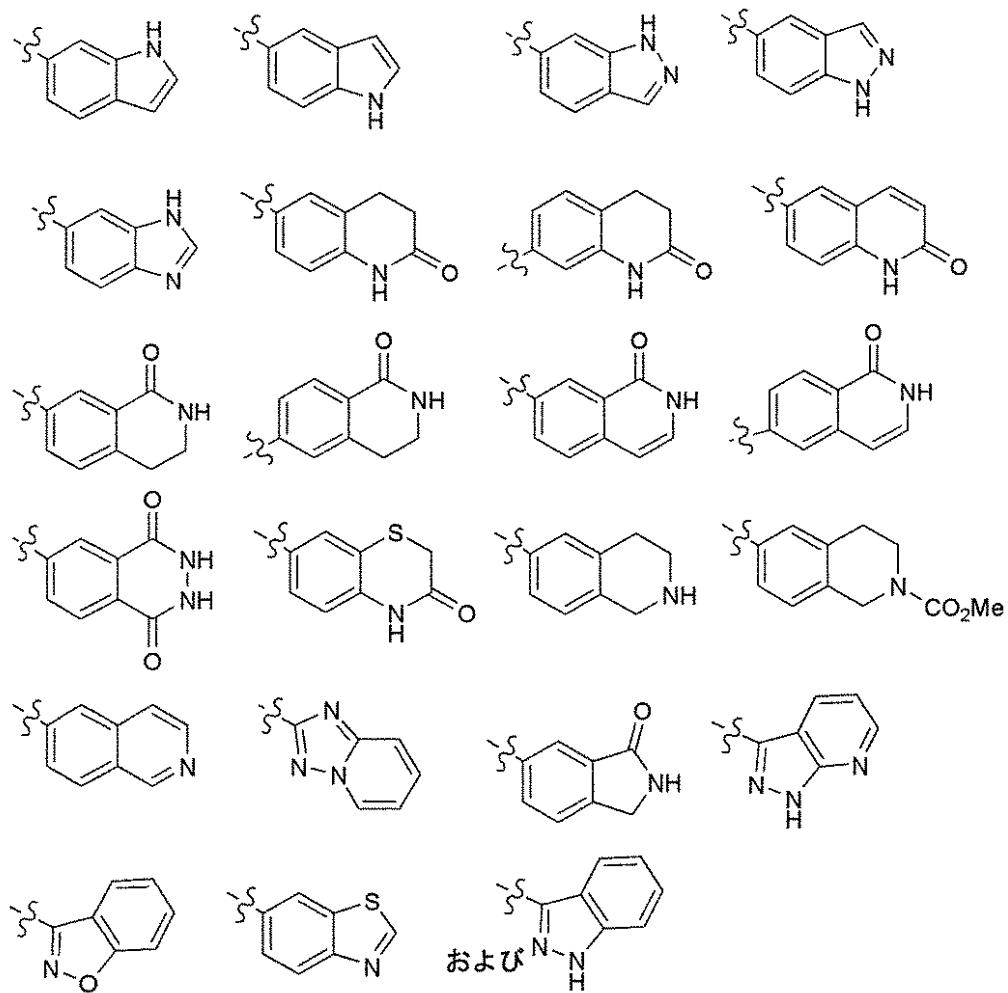
【請求項9】

L₃が、-CH₂CH₂-、-CH=CH-、-C-C-または-S(=O)CH₂-であり；

L₄が、-CH₂CH₂-、-CH=CH-、または-COCH₂-であり；

Mが、0~2個のR³で置換されており、フェニル、ピリジル、チエニル、

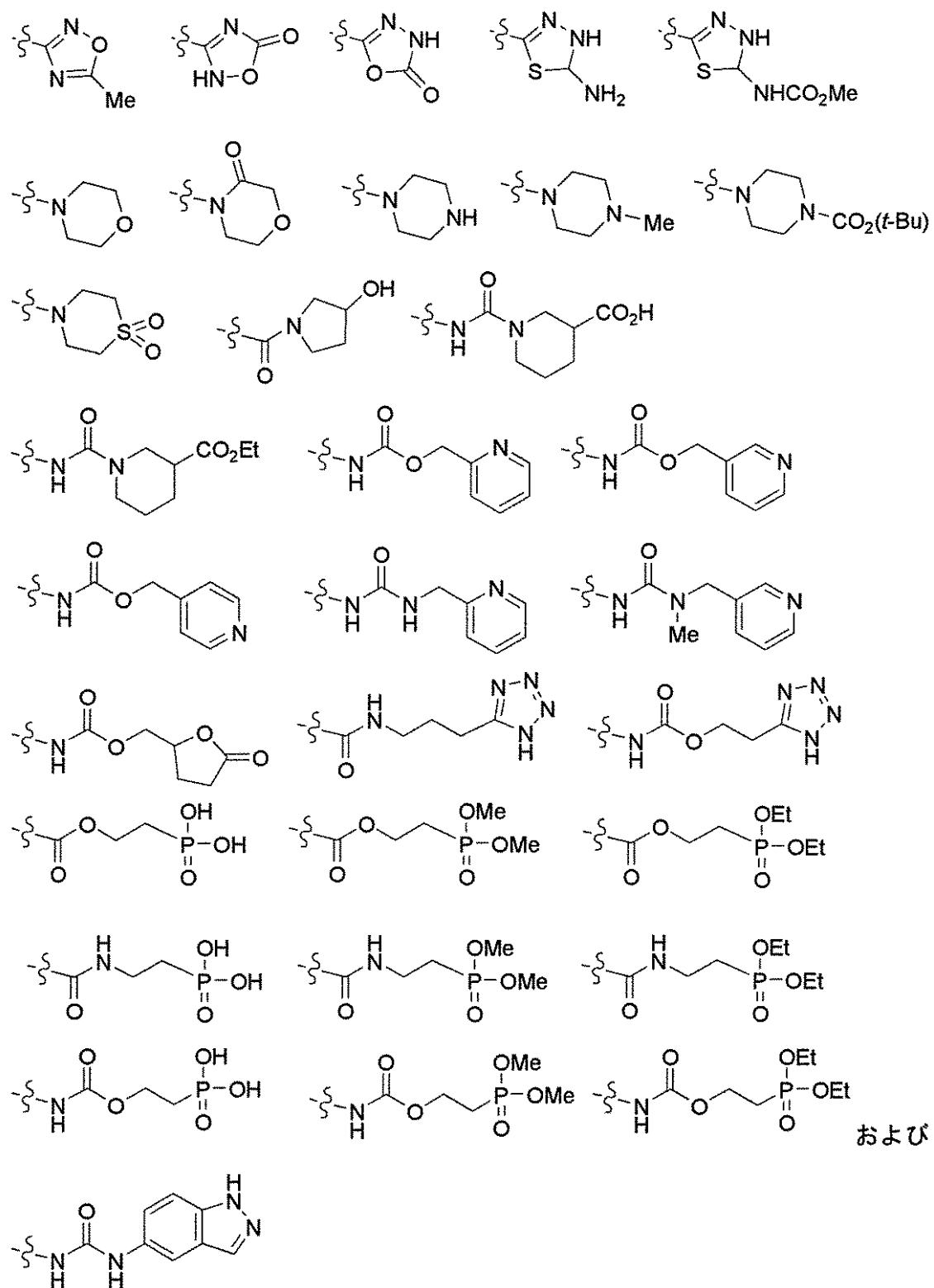
【化11】



からなる群から選択され；

R^3 が、各々独立して、F、Cl、Me、 CF_3 、OH、CN、 NH_2 、 CO_2H 、 CO_2Me 、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2Et$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(Me)_2$ 、 $-NHCOMe$ 、 $-NHCO_2Me$ 、 $-(C=NH)NHOH$ 、 $-CONHC_2H_5CO_2H$ 、 $-CON(Me)CH_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_2CO_2Et$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2Et$ 、 $-CO_2(CH_2)_2N(Et)_2$ 、 $-CO_2(CH_2)_3N(Bu)_2$ 、 $-CH_2NHCO_2Me$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-CH_2NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2Et$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(Me)_2$ 、 $-CH_2NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHCONH(CH_2)_3CO_2Me$ 、 $-CONHSO_2Me$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $P(O)(OH)_2$ 、 $P(O)(OEt)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OH)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OEt)_2$ 、ピリジン-4-イル-、テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ-、2-オキソ-ピペリジン-1-イル、イミダゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、テトラゾール-1-イル、テトラゾール-5-イル、

【化12】

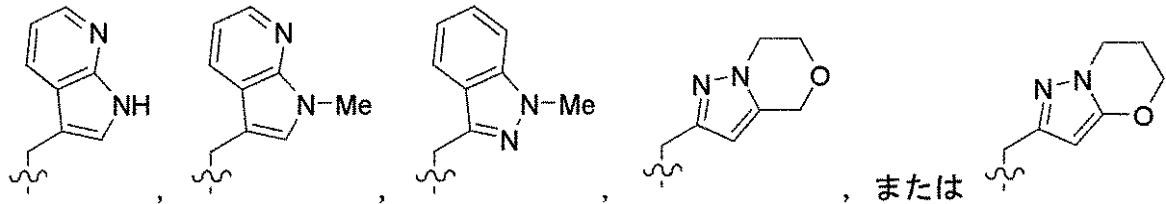


であり；

R^{11} が、ネオペンチル、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2Me$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CH_2SMe$ 、 $-CH_2S(t-Bu)$ 、 $-CH_2CH_2S(O)Me$ 、 $-CH_2CH_2S(O)_2Me$ 、 $-(CH_2)_4N(Me)_2$ 、 $-CH_2C(O)N(Me)(CH_2)_2N(Me)_2$ 、 $-(CH_2)_3NH_2C(NH_2)=N(NO_2)$ 、フェニルカルバモイルメチル、ベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、3,5-ジフルオロベンジル、3-カルボキシベンジル、3-カルバモイルベ

ンジル、3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル) ベンジル、フェネチル、(ジメチルアミノ) - カルボニルメチル、3 - (N, N - ジメチルカルバモイル) - ベンジル、チエン - 2 - イルメチル、(1 - メチルピラゾール - 3 - イル) メチル、(1, 3 - ジメチルピラゾール - 5 - イル) メチル、(1, 5 - ジメチルピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - エチルピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 5 - メチル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - メチル - 5 - (メチルスルフィニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル) メチル、(1 - メチル - 5 - (メチルスルホニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル) メチル、チアゾール - 2 - イルメチル、チアゾール - 4 - イルメチル、1H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イルメチル、アゼチジン - 3 - イルメチル、(1 - アセチル - アゼチジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - アゼチジン - 3 - イル) メチル、ピロリジン - 2 - イルメチル、ピロリジン - 3 - イルメチル、(1 - アセチル - ピロリジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - ピロリジン - 3 - イル) メチル、(3 - (2 - エトキシエトキシ) ピロリジン - 1 - イル) カルボニルメチル、(1 - ベンゾイルピロリジン - 3 - イル) メチル、ピペリジン - 3 - イルメチル、ピペリジン - 4 - イルメチル、ピペリジン - 4 - イルエチル、(1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イル) エチル、(1 - CO₂Me - ピペリジン - 3 - イル) メチル、(1 - CO₂Me - ピペリジン - 4 - イル) メチル、テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イルメチル、ピリド - 2 - イルメチル、ピリド - 3 - イルメチル、ピリド - 4 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 2 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 3 - イルメチル、N - オキシド - ピリド - 4 - イルメチル、(2 - ヒドロキシ - ピリド - 5 - イル) メチル、モルホリン - 4 - イルカルボニルメチル、4 - メチルピペラジン - 1 - イルカルボニルメチル、4 - メチルカルボニルピペラジン - 1 - イルカルボニルメチル、(1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホリン - 4 - イル) メチル、(1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホリン - 4 - イル) カルボニルメチル、N - (ピラジン - 2 - イルメチル) アミノカルボニルメチル、1H - インドール - 3 - イル、キノキサリン - 2 - イルメチル、

【化13】

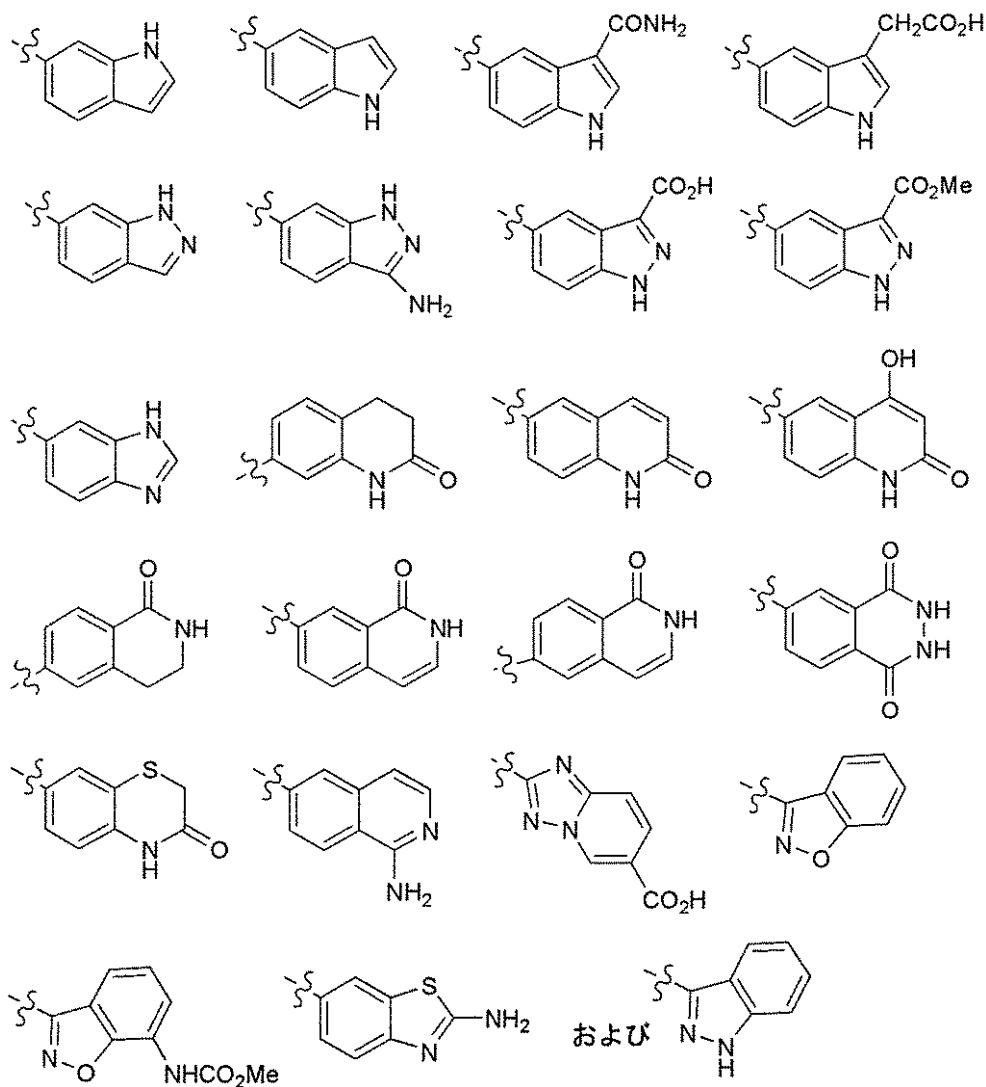


である、請求項7または請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

Mが、0 ~ 2個のR³で置換されており、フェニル、ピリジル、チエニル、

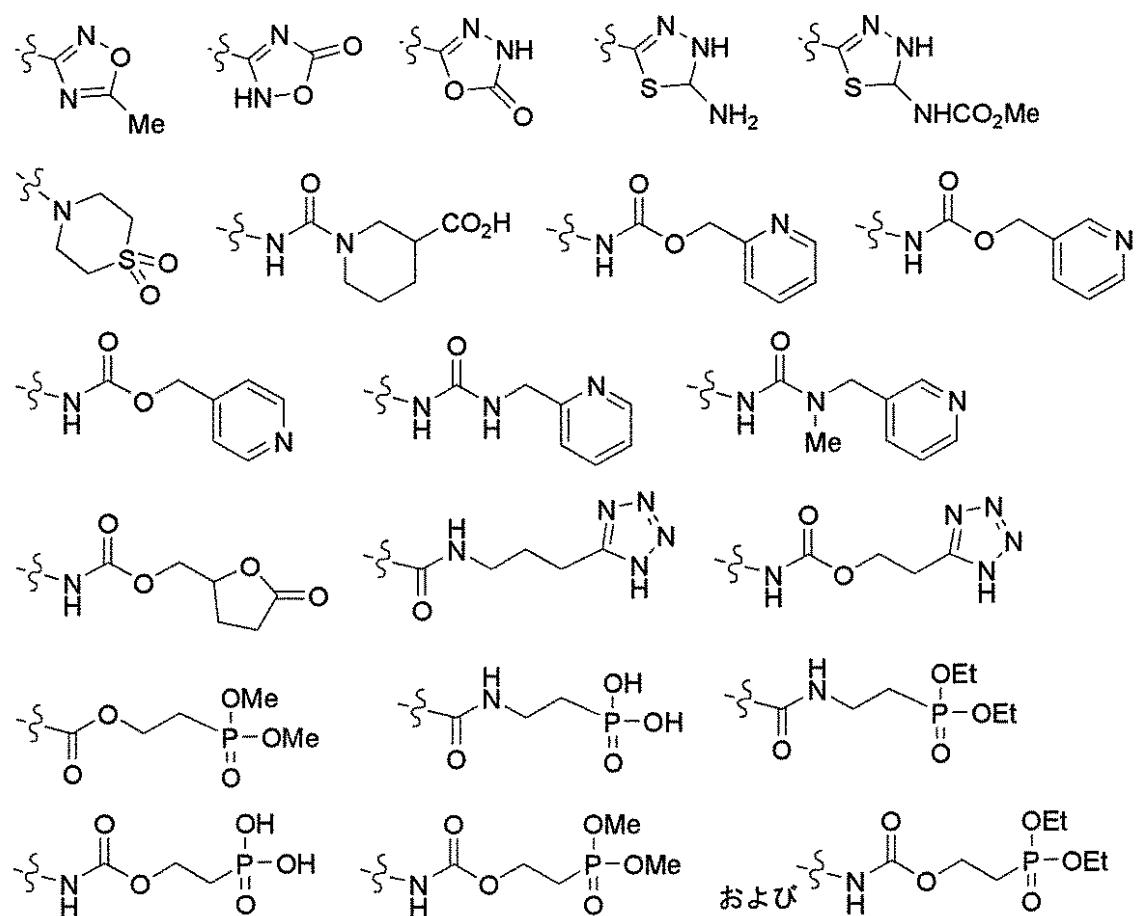
【化 1 4】



からなる群から選択され；

R³が、各々独立して、F、Cl、CN、CO₂H、CO₂Me、-CH₂CO₂H、-CONH₂、-NHCO₂Me、-(C=NH)NHOH、-CONHCH₂CO₂H、-CONH(CH₂)₂CO₂H、-CONH(CH₂)₃CO₂H、-CONH(CH₂)₃CO₂Et、-CH₂NHCO₂Me、-NHCO₂(CH₂)₂OMe、-CH₂NHCO₂(CH₂)₂OME、-NHCO₂(CH₂)₂CO₂H、-NHCO₂(CH₂)₂CO₂Me、-NHC₂(CH₂)₂CO₂Et、-CH₂NHCONH₂、-NHCONH(CH₂)₂CO₂H、-NHCONH(CH₂)₂CO₂Me、-NHCONH(CH₂)₃CO₂Me、-CONHSO₂Me、P(O)(OH)₂、P(O)(OEt)₂、-CH₂P(O)(OH)₂、-CH₂P(O)(OEt)₂、ピリジン-4-イル-、テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ-、イミダゾール-1-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、テトラゾール-1-イル、テトラゾール-5-イル、

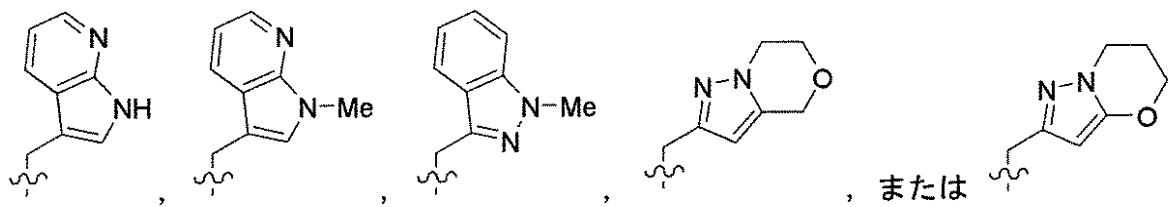
【化15】



であり；

R^{11} が、-CH₂CO₂Me、-CH₂CH₂CF₃、-CH₂CH₂SM₂、-CH₂CH₂S(O)Me、-CH₂CH₂S(O)₂Me、-(CH₂)₄N(Me)₂、-(CH₂)₃NHC(NH₂)=N(NO₂)、ベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、3,5-ジフルオロベンジル、3-カルボキシベンジル、3-カルバモイルベンジル、3-(モルホリン-4-イルカルボニル)ベンジル、(ジメチルアミノ)-カルボニルメチル、チエン-2-イルメチル、(1-メチルピラゾール-3-イル)メチル、(1,3-ジメチルピラゾール-5-イル)メチル、(1,5-ジメチルピラゾール-3-イル)メチル、(1-エチルピラゾール-3-イル)メチル、(1-(2-ヒドロキシエチル)-5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル、チアゾール-2-イルメチル、チアゾール-4-イルメチル、1H-イミダゾール-4-イルメチル、1-メチル-1H-イミダゾール-5-イルメチル、アゼチジン-3-イルメチル、(1-アセチル-アゼチジン-3-イル)メチル、(1-CO₂Me-アゼチジン-3-イル)メチル、(3-(2-エトキシエトキシ)ピロリジン-1-イル)カルボニルメチル、(1-ベンゾイルピロリジン-3-イル)メチル、ピペリジン-3-イルメチル、ピペリジン-4-イルメチル、ピペリジン-4-イルエチル、(1-アセチル-ピペリジン-4-イル)エチル、(1-CO₂Me-ピペリジン-3-イル)メチル、(1-CO₂Me-ピペリジン-4-イル)メチル、テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルメチル、ピリド-2-イルメチル、ピリド-3-イルメチル、ピリド-4-イルメチル、(2-ヒドロキシ-ピリド-5-イル)メチル、(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)メチル、(1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリン-4-イル)カルボニルメチル、N-(ピラジン-2-イルメチル)アミノカルボニルメチル、1H-インドール-3-イル、キノキサリン-2-

イルメチル、
【化16】



である、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

医薬上許容される担体および請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項12】

請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩を含む、血栓塞栓性障害の治療剤および/または予防剤。

【請求項13】

血栓塞栓性障害が、動脈心血管性血栓塞栓性障害、静脈心血管性血栓塞栓性障害、および心房または末梢循環中の血栓塞栓性障害からなる群から選択される、請求項12に記載の薬剤。

【請求項14】

血栓塞栓性障害が、不安定狭心症、急性冠血管症候群、心房細動、心筋梗塞、一過性虚血性発作、脳卒中、アテローム性動脈硬化症、末梢動脈閉塞性疾患、静脈血栓症、深部静脈血栓症、血栓性静脈炎、動脈塞栓症、冠動脈血栓症、大脳動脈血栓症、大脳塞栓症、腎臓塞栓症、肺性塞栓形成、および血液が血栓症を促進する人工表面に曝される医療移植片、装置、または手順から生じる血栓症から選択される、請求項12に記載の薬剤。

【請求項15】

血栓塞栓性障害を治療する医薬品を製造するための、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、もしくは医薬上許容される塩の使用。