

【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 0 7 D	257/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
C 0 7 D	403/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4155	(2006.01)
C 0 7 D	417/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	31/501	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/541	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
C 0 7 D	413/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/433	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/5513	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
C 0 7 D	409/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/428	(2006.01)
A 6 1 K	31/5415	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/498	(2006.01)
A 6 1 K	31/497	(2006.01)
C 0 7 D	498/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/5383	(2006.01)
A 6 1 K	31/5365	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
C 0 7 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

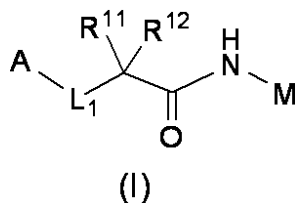
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

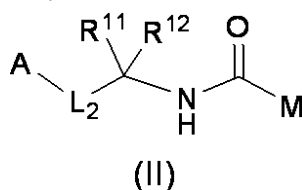
【請求項 1】

式 (I)、(II)、または (III)：

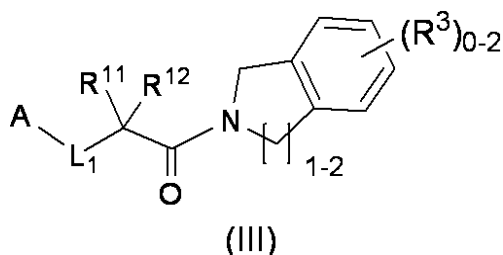
【化 1 - 1】



【化 1 - 2】



【化 1 - 3】



[ 式中、

A は、0 ～ 3 個の  $R^1$  でさらに置換された  $C_{3 \sim 10}$  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 5 ～ 10 員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0 ～ 3 個の  $R^1$  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；

$L_1$  は、 $-CH(R^5)CH_2C(O)NH-$ 、 $-CH(NR^7R^8)CH_2C(O)NH-$ 、 $-C(R^5)=CHC(O)NH-$ 、 $-CH=C(R^5)C(O)NH-$ 、 $-C(R^5)=C(R^5)C(O)NH-$ 、 $-CH_2C(O)NHCH_2-$ 、 $-C(R^5)CC(O)NH-$ 、 $-CH_2NHC(O)NH-$ 、 $-C(O)NHCH_2CH_2-$ 、 $-CH(R^5)CH_2SO_2NH-$ 、 $-C(R^5)=CHSO_2NH-$ 、 $-CH_2SO_2NHCH_2-$ 、 $-SO_2NHCH_2CH_2-$ 、 $-NHNHC(O)CH_2-$ 、 $-CH_2C(O)NHNH-$ 、 $-CH(R^5)CH_2CH_2NR^{10}-$ 、 $-CH_2NHC(O)CH_2-$ 、 $-NHC(O)CH_2CH_2-$ 、 $-N(R^7)CH_2C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)NHCH_2-$ 、 $-NHC(O)OCH_2-$ 、 $-CH_2NHCH_2SO_2CH_2-$ 、 $-NHCH_2SO_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OC(O)NH-$ 、 $-OCH_2C(O)NH-$ 、または  $-S(O)_pCH_2C(O)NH-$  であり；

$L_2$  は、 $-NHNHC(O)CH_2-$ 、 $-CH(R^5)CH_2NHC(O)-$ 、 $-CH(NR^7R^8)CH_2NHC(O)-$ 、 $-C(R^5)=CHNHC(O)-$ 、 $-CH_2NHC(O)CH_2-$ 、 $-C(R^5)CNHC(O)-$ 、 $-NHC(O)CH_2CH_2-$ 、 $-CH(R^5)CH$

${}^2\text{NHSO}_2-$ 、 $-C(R^5)=\text{CHNHSO}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHSO}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHNHC}(O)-$ 、 $-\text{CONHNHC}(O)-$ 、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、 $\text{NR}^{13}$ 、O、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含む $-(\text{CH}_2)_r-5\sim 12$ 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、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CHF}_2$ 、 $\text{OCF}_3$ 、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{OR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OC}(O)\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-C(=\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{R}^c$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{OR}^c$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})_2\text{R}^c$ 、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 $-(\text{CH}_2)_r-3\sim 7$ 員の炭素環、または炭素原子とN、 $\text{NR}^{13}$ 、O、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含む $-(\text{CH}_2)_r-5\sim 7$ 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、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OR}^a$ 、 $\text{SR}^a$ 、CN、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-C(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(O)\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(O)\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$ 、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、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{CN}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{OR}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OC}(O)\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{R}^c$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{OR}^c$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^c$ 、 $\text{C}_{1-4}$ 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、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NHC}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-C(=\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{C}=\text{NH})\text{NHOR}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)\text{OR}^{3b}$ 、 $-C(O)\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{NHR}^{3b}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCO}\text{R}^{3c}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCO}_2\text{R}^{3c}$ 、 $-\text{CONHSO}_2\text{R}^{3c}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{C}(O)\text{R}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{CO}_2\text{R}^{3c}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{3c}$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{3c}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{3c}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OC}(O)\text{R}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{C}(O)(\text{CH}_2)_r\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{OC}(O)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NHCOCF}_3$ 、 $-\text{CONHOR}^{3b}$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{P}(O)(\text{OH})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_r\text{P}(O)(\text{OC}_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 $\text{C}_{1-4}$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、0～3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、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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、0～3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 $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ 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 $-(CH_2)_r-5\sim 10$ 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、 $=O$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、 $-(CH_2)_rOR^a$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-S(O)_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8S(O)_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8S(O)_2R^c$ 、 $-S(O)_pR^c$ 、 $-(CF_2)_rCF_3$ 、 $-(CH_2)_rP(O)(OH)_2$ 、 $-(CH_2)_rP(O)(OC_{1-4}アルキル)_2$ 、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 $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ 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 $-(CH_2)_r-5\sim 10$ 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、 $-(CH_2)_rOR^a$ 、 $F$ 、 $=O$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-S(O)_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8S(O)_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8S(O)_2R^c$ 、 $-S(O)_pR^c$ 、 $-(CF_2)_rCF_3$ 、0～3個の $R^d$ で置換された $-(CH_2)_r-C_{3-10}$ 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 $-(CH_2)_r-5\sim 10$ 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；

$R^5$ は、各々独立して、 $H$ 、 $F$ 、 $CF_3$ 、 $-(CH_2)_rOR^a$ 、 $-(CH_2)_rNR^7R^8$ 、 $-S(O)_pNR^8R^9$ 、 $-(CH_2)_rCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_rCONR^8R^9$ 、または $C_{1-4}$ アルキルであり；

$R^7$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 炭素環、 $-(CH_2)_n-(5\sim 10$ 員のヘテロアリール)、 $-C(O)R^c$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)_2R^c$ 、 $-S(O)_2R^c$ 、 $-CONR^8R^c$ 、 $-OCONHR^c$ 、 $-C(O)O-(C_{1-4}アルキル)OC(O)-(C_{1-4}アルキル)$ 、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；

$R^8$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $-(CH_2)_n$ -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 $-(CH_2)_n-5\sim 10$ 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、 $R^7$ と $R^8$ 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；

$R^9$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $-(CH_2)_n$ -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、 $R^8$ と $R^9$ 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；

$R^{10}$ 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、 $OR^a$ 、 $SR^a$ 、 $F$ 、 $CF_3$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-S(O)_pNR^8R^9$ 、 $-NR^8S(O)_pR^c$ 、または $-S(O)_pR^c$ であり；

$R^{11}$ は、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-CH_2C(O)NR^8R^9$ 、 $-C$

$\text{H}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、0～3個の $\text{R}^{11c}$ で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～3個の $\text{R}^{11a}$ で置換された $\text{C}_2\sim 6$ アルケニル、0～3個の $\text{R}^{11a}$ で置換された $\text{C}_2\sim 6$ アルキニル、0～3個の $\text{R}^{11b}$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、0～3個の $\text{R}^{11b}$ で置換されており；

$\text{R}^{11a}$ は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 $\text{OR}^a$ 、 $\text{SR}^a$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{CHO}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_1\sim 4$ 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、0～3個の $\text{R}^d$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含み、0～3個の $\text{R}^d$ で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり；

$\text{R}^{11b}$ は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}^8$ 、 $\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^7\text{C}(\text{O})\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})_2\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_1\sim 6$ 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、0～3個の $\text{R}^d$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含み、0～3個の $\text{R}^d$ 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 $\text{R}^{11b}$ 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、炭素原子とN、O、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含み、0～2個の $\text{R}^9$ で置換されている、5～7員のヘテロ環を形成してもよく；

$\text{R}^{11c}$ は、各々独立して、 $=\text{O}$ 、 $\text{OR}^a$ 、 $\text{SR}^a$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $-\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(\text{O})\text{OR}^c$ 、 $-\text{NR}^8\text{CHO}$ 、 $-\text{NHC}(\text{NH}_2)=\text{N}(\text{NO}_2)$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^8)\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^c$ 、 $\text{C}_1\sim 4$ 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、0～3個の $\text{R}^d$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含み、0～3個の $\text{R}^d$ で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり；

$\text{R}^{12}$ は、各々独立して、 $\text{H}$ 、 $\text{F}$ 、または $\text{C}_1\sim 4$ アルキルであり；

$\text{R}^{13}$ は、各々独立して、 $\text{H}$ 、 $\text{C}_1\sim 4$ アルキル、 $\text{CO}_2\text{R}^a$ 、またはベンジルであり；

$\text{R}^a$ は、各々独立して、 $\text{H}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1\sim 6$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、0～2個の $\text{R}^f$ で適宜置換されており；

$\text{R}^b$ は、各々独立して、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OH}$ 、 $\text{C}_1\sim 4$ アルコキシ、 $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～2個の $\text{R}^d$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1～4個のヘテロ原子とを含み、0～3個の $\text{R}^d$ で置換されている、 $-(\text{CH}_2)_r-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり；

$\text{R}^c$ は、各々独立して、 $\text{CF}_3$ 、0～2個の $\text{R}^f$ で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～2個の $\text{R}^f$ 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、5～10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(5～10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0～3個の $\text{R}^f$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、 $H$ 、 $=O$ 、 $=NR^8$ 、 $OR^a$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8SO_2-C_{1-4}$ アルキル、 $-NR^8SO_2CF_3$ 、 $-NR^8SO_2$ -フェニル、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-S(O)_p-C_{1-4}$ アルキル、 $-S(O)_p$ -フェニル、 $-(CF_2)_rCF_3$ 、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、または0～2個の $R^e$ で置換された $C_{2-6}$ アルキニルであり；

$R^e$ は、各々独立して、 $=O$ 、 $OR^a$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8SO_2NR^8R^9$ 、 $-NR^8SO_2-C_{1-4}$ アルキル、 $-NR^8SO_2CF_3$ 、 $-NR^8SO_2$ -フェニル、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-S(O)_p-C_{1-4}$ アルキル、 $-S(O)_p$ -フェニル、または $-(CF_2)_rCF_3$ であり；

$R^f$ は、各々独立して、 $H$ 、 $=O$ 、 $-(CH_2)_rOR^g$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-NR^9R^g$ 、 $-C(O)R^g$ 、 $-C(O)OR^g$ 、 $-NR^9C(O)R^g$ 、 $-C(O)NR^9R^g$ 、 $-SO_2NR^9R^g$ 、 $-NR^9SO_2NR^9R^g$ 、 $-NR^9SO_2-C_{1-4}$ アルキル、 $-NR^9SO_2CF_3$ 、 $-NR^9SO_2$ -フェニル、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-S(O)_p-C_{1-4}$ アルキル、 $-S(O)_p$ -フェニル、 $-(CF_2)_rCF_3$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $-(CH_2)_n$ -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 $-(CH_2)_n-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり；

$R^g$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、または $-(CH_2)_n$ -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】

$L_1$ が、 $-CH(R^5)CH_2C(O)NH-$ 、 $-CH(NR^7R^8)CH_2C(O)NH-$ 、 $-C(R^5)=CHC(O)NH-$ 、 $-CH=C(R^5)C(O)NH-$ 、 $-C(R^5)CC(O)NH-$ 、 $-CH_2NHC(O)NH-$ 、 $-NHNHC(O)CH_2-$ 、 $-CH(R^5)CH_2CH_2NR^{10}-$ 、 $-CH_2NHC(O)CH_2-$ 、 $-NHC(O)OCH_2-$ 、 $OCH_2C(O)NH-$ 、または $-S(O)_pCH_2C(O)NH-$ であり；

$L_2$ が、 $-CH(R^5)CH_2NHC(O)-$ 、 $-C(R^5)=CHNHC(O)-$ 、 $-CH_2NHC(O)CH_2-$ 、 $-C(R^5)CNHC(O)-$ 、 $-CH_2NHNHC(O)-$ 、 $-CONHNHC(O)-$ 、または $-COCH_2NHC(O)-$ であり；

$A$ が、0～3個の $R^1$ で置換されており、 $C_{3-7}$ 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、ピリジニル、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 $R^3$ で置換されており、シクロヘキシル、フェニル、ベンジル、ピリジニル、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、

【請求項 3】

$L_2$ が、 $-CH(Me)CH_2NHC(O)-$ 、 $CH_2CH_2NHC(O)-$ 、 $-CH=CHNHC(O)-$ 、 $-C(Me)=CHNHC(O)-$ 、 $-CH_2NHNHC(O)-$ 、



-CH<sub>2</sub>NHC(O)CH<sub>2</sub>-、-C CNHC(O)-、-CONHNHC(O)-、または-COCH<sub>2</sub>NHC(O)-であり；

R<sup>1</sup>が、各々独立して、F、Cl、Br、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、CN、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>a</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>a</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>COR<sup>a</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>C(O)OR<sup>a</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-C(=NH)NH<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>c</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>c</sup>、-CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>c</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>c</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>S(O)R<sup>c</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>S(O)<sub>2</sub>R<sup>c</sup>、0～1個のR<sup>1a</sup>で置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、または炭素原子とN、NR<sup>13</sup>、O、およびS(O)<sub>p</sub>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<sup>1b</sup>で置換されており；

R<sup>11</sup>が、C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>ハロアルキル、-CH<sub>2</sub>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>C(O)R<sup>a</sup>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)R<sup>a</sup>、-CH<sub>2</sub>C(O)OR<sup>a</sup>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)OR<sup>a</sup>、0～2個のR<sup>11c</sup>で置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-C<sub>3</sub>～<sub>7</sub>シクロアルキル、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-インダニル、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-インデニル、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-フェニル、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換された-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-ナフチル、または炭素原子とN、O、およびS(O)<sub>p</sub>から選択される1～4個のヘテロ原子とを含む-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-5～10員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0～2個のR<sup>11b</sup>で置換されており；

R<sup>12</sup>が、Hである、

請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

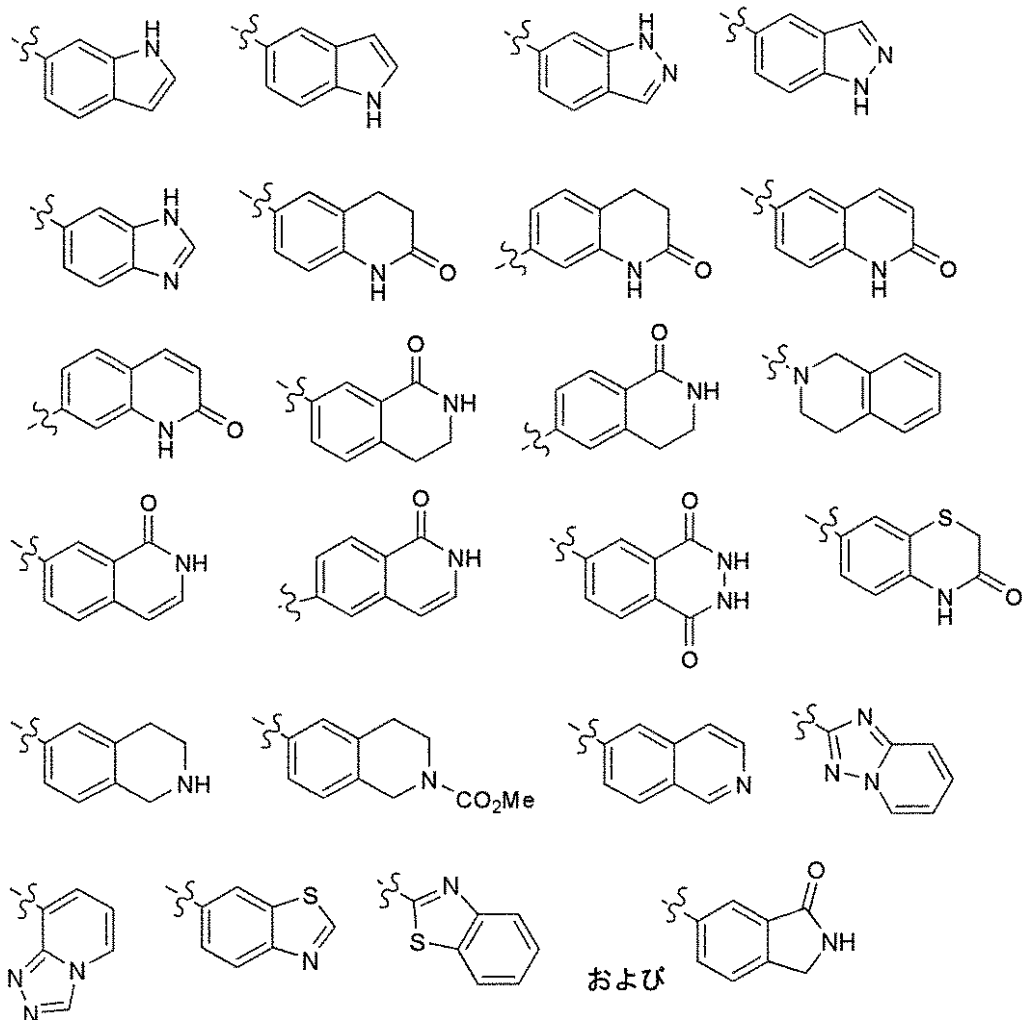
Aが、0～3個のR<sup>1</sup>で置換されたフェニルであり；

L<sub>1</sub>が、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH-、-CH=CHC(O)NH-、-C CC(O)NH-、-CH<sub>2</sub>NHC(O)NH-、-OCH<sub>2</sub>C(O)NH-、-SCH<sub>2</sub>C(O)NH-、-S(O)CH<sub>2</sub>C(O)NH-、または-S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH-であり；

L<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(O)-または-CH=CHNHC(O)-であり；

Mが、0～2個のR<sup>3</sup>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、 $NR^7R^8$ 、 $-CH_2NR^7R^8$ 、 $NO_2$ 、 $COR^a$ 、 $C(O)OR^a$ 、 $-CH_2C(O)OR^a$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-C(O)NR^8R^9$ 、 $-CH_2C(O)NR^8R^9$ 、 $-NR^8C(O)R^c$ 、 $-CH_2NR^8C(O)R^c$ 、 $-NR^8C(O)OR^c$ 、 $-CH_2NR^8C(O)OR^c$ 、 $-CO_2(CH_2)_2NR^7R^8$ 、 $-NR^8C(O)NR^8R^c$ 、 $-CH_2NR^8C(O)NR^8R^c$ 、 $-NR^8SO_2R^c$ 、 $-CH_2NR^8SO_2R^c$ 、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<sup>3</sup>が、各々独立して、= O、F、Cl、Br、OCF<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>、CN、-CH<sub>2</sub>CN、OR<sup>3b</sup>、-CH<sub>2</sub>OR<sup>3b</sup>、SR<sup>3b</sup>、-CH<sub>2</sub>SR<sup>3b</sup>、-C(O)C<sub>1~4</sub>アルキル、-OC(O)(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>C(O)OR<sup>3b</sup>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>3b</sup>、-CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>3b</sup>、-NR<sup>8</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>3c</sup>、-CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>3c</sup>、-(C=NH)NH<sub>2</sub>、-(C=NH)NHOH、-NHC(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-CH<sub>2</sub>NHC(O)NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>3c</sup>、-CONH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>3c</sup>、P(O)(OH)<sub>2</sub>、P(O)(OC<sub>1~4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>P(O)(OH)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>P(O)(OC<sub>1~4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1~4</sub>アルキル、または炭素原子とN、O、およびS(O)<sub>p</sub>から選択される1~4個のヘテロ原子とを含む-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>-5~6員のヘテロ環であり、前記ヘテロ環は、0~1個のR<sup>3d</sup>で置換されている、

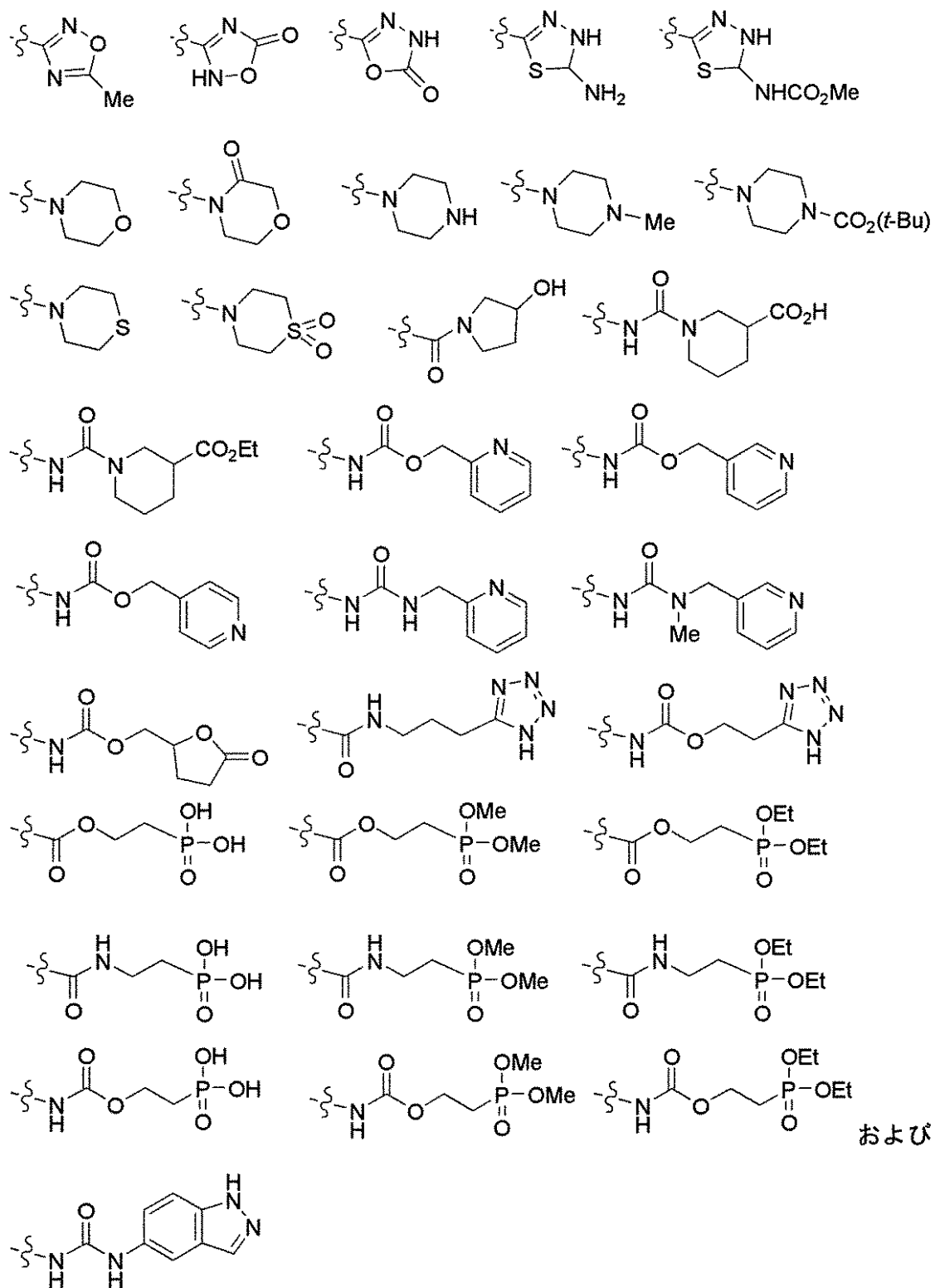
請求項 2 または請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^1$  が、各々独立して、F、Cl、Br、Me、Et、OMe、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、CN、NH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(t-Bu)、C(O)Me、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、-CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-CONHMe、-NHCOMe、-NHCO<sub>2</sub>Me、-NHCO<sub>2</sub>(t-Bu)、-CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NEt<sub>2</sub>、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-C(=NH)NH<sub>2</sub>、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-CF<sub>3</sub>-テトラゾール-1-イル、5-NH<sub>2</sub>-テトラゾール-1-イル、5-NH<sub>2</sub>-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、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、CN、NH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(t-Bu)、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、-CONH<sub>2</sub>、-CON(Me)<sub>2</sub>、-NHCOMe、-NHCO<sub>2</sub>Me、-NHCO<sub>2</sub>(t-Bu)、-(C=NH)NH<sub>2</sub>、-(C=NH)NHOH、-CONHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CON(Me)CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、-CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>H、-CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>Et、-CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NEt<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>N(Bu)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>NHCO<sub>2</sub>Me、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OMe、-CH<sub>2</sub>NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OMe、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、-NHCO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-NHCONH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-NHCONH(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>Me、-CONHSO<sub>2</sub>Me、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、P(O)(OH)<sub>2</sub>、P(O)(OEt)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>P(O)(OH)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>P(O)(OEt)<sub>2</sub>、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、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 4】

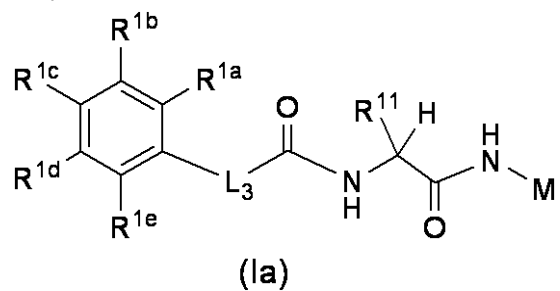


である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

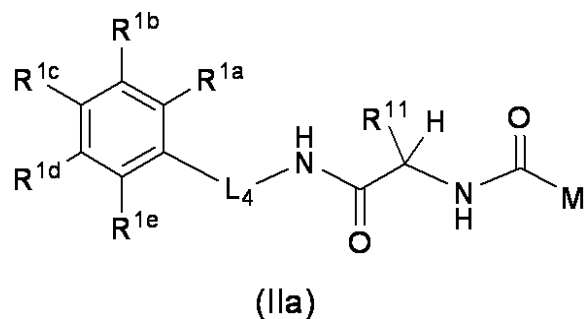
**【請求項 6】**

式 ( I a ) または ( I I a ) :

## 【化 5 - 1】



## 【化 5 - 2】



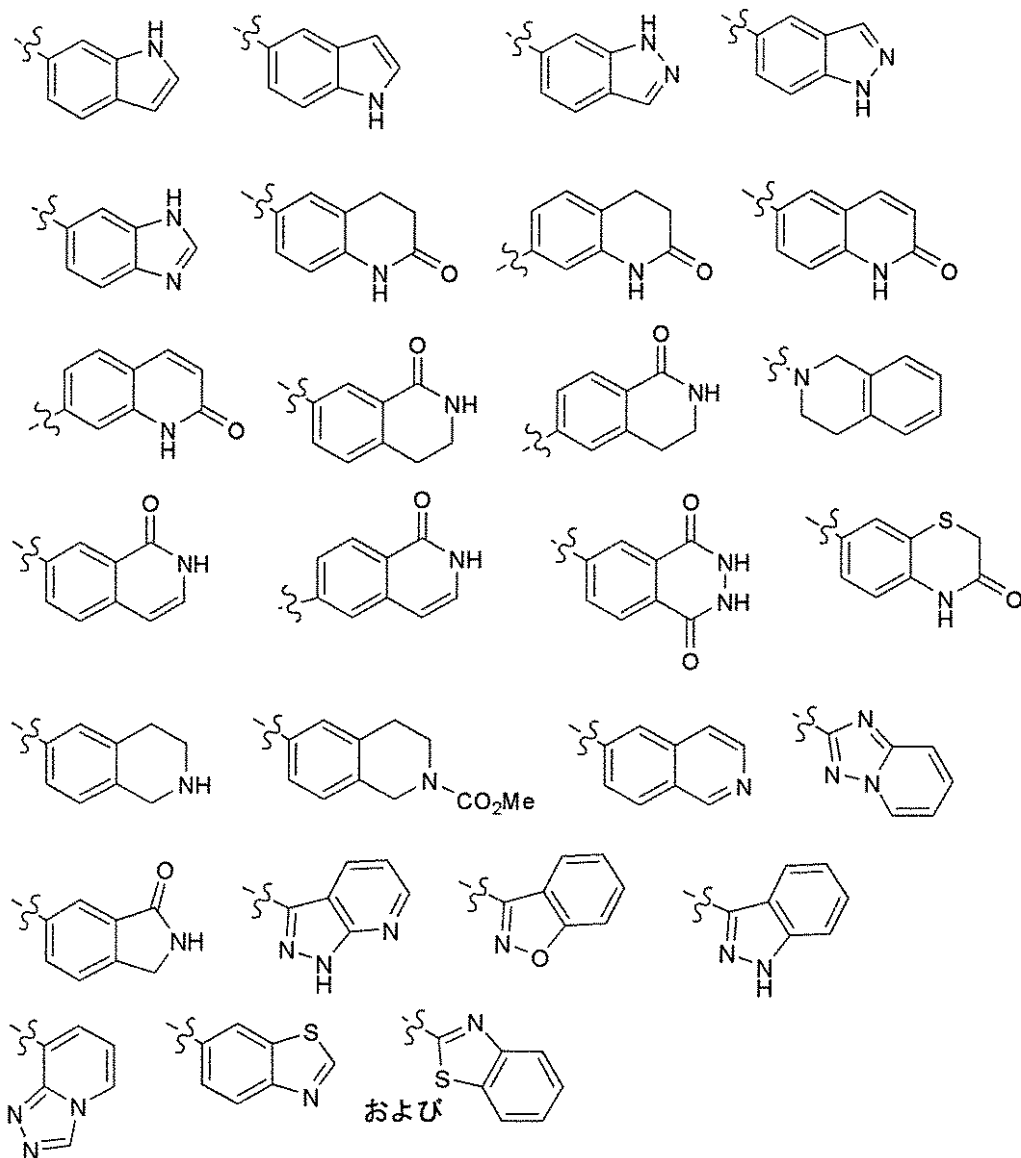
[ 式中、

$L_3$  は、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C \equiv C-$  または  $-S(O)CH_2-$  であり；

$L_4$  は、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C \equiv C-$ 、 $-CONH-$ 、または  $-COCH_2-$  であり；

M は、0 ～ 2 個の  $R^3$  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 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、 $-CH_2NH_2$ 、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-CF<sub>3</sub>-テトラゾール-1-イルであり；

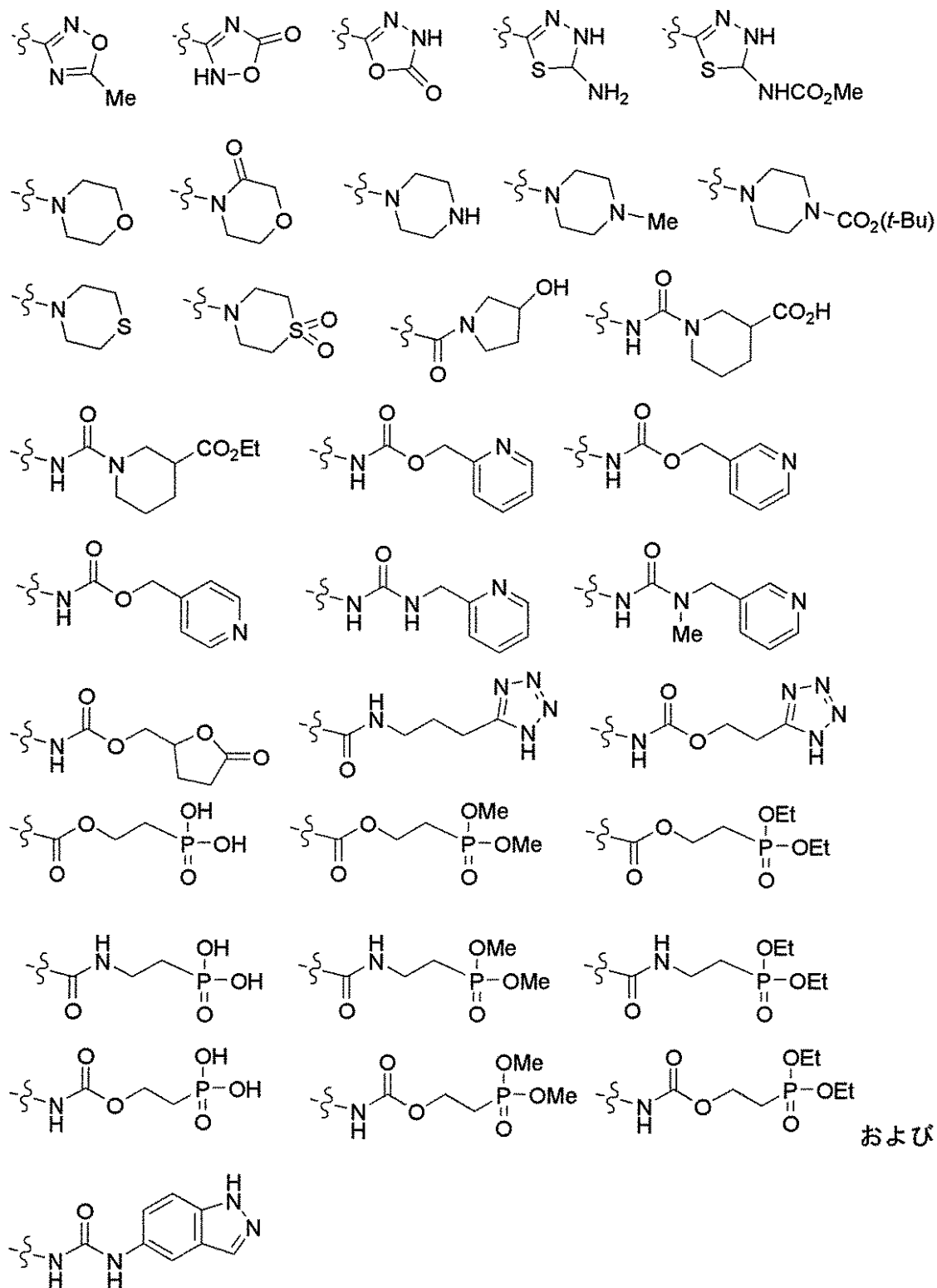
$R^{1b}$ 、 $R^{1c}$ 、 $R^{1d}$ は、各々独立して、H、F、Cl、Br、Me、Et、OMe、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、CN、NH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(t-Bu)、C(O)Me、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2Et$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONHMe$ 、 $-NHCOMe$ 、 $-NHCO_2Me$ 、 $-NHCO_2(t-Bu)$ 、 $-CO_2(CH_2)_2NEt_2$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(Me)_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 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、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、CN、NH<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>(t-Bu)、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2Et$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(Me)_2$ 、 $-NHCOMe$ 、 $-NHCO_2M$

e、 $-\text{NHCO}_2(\text{t-Bu})$ 、 $-(\text{C}=\text{NH})\text{NH}_2$ 、 $-(\text{C}=\text{NH})\text{NHOH}$ 、 $-\text{CONHCH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CON}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{CONH}(\text{CH}_2)_3\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CONH}(\text{CH}_2)_3\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{NEt}_2$ 、 $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{N}(\text{Bu})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHCO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OMe}$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OMe}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{Me})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHCONH}_2$ 、 $-\text{NHCONH}(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{NHCONH}(\text{CH}_2)_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{NHCONH}(\text{CH}_2)_3\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CONHSO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{P}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{P}(\text{O})(\text{OEt})_2$ 、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、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】



および

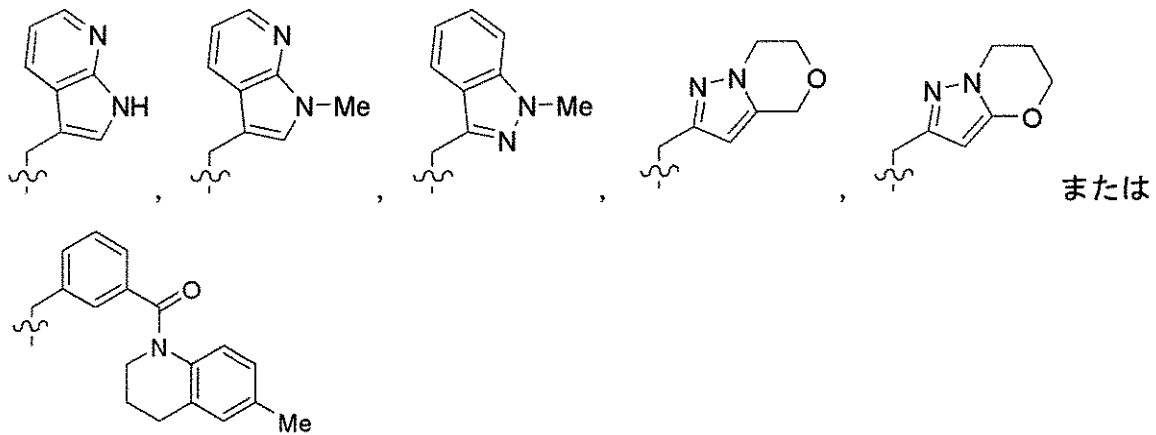
であり；

R<sup>11</sup>は、メチル、エチル、ネオペンチル、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-CH<sub>2</sub>CONMe、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SM e、-CH<sub>2</sub>S(t-Bu)、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)Me、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)<sub>2</sub>Me、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>C(O)N(Me)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(NH<sub>2</sub>)=N(NO<sub>2</sub>)、(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、(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、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 - CO<sub>2</sub>Me - 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 - CO<sub>2</sub>Me - 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 - CO<sub>2</sub>Me - ピペリジン - 3 - イル)メチル、(1 - CO<sub>2</sub>Me - 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 - 1<sup>6</sup> - チオモ  
 ルホリン - 4 - イル)メチル、(1, 1 - ジオキソ - 1<sup>6</sup> - 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】



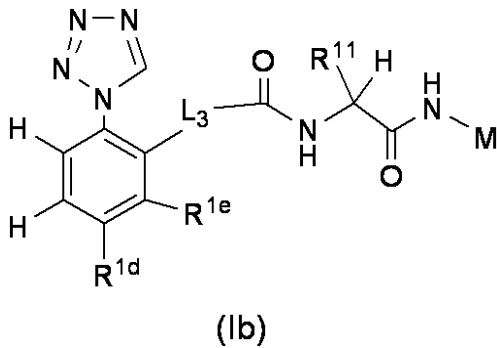
である]

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。

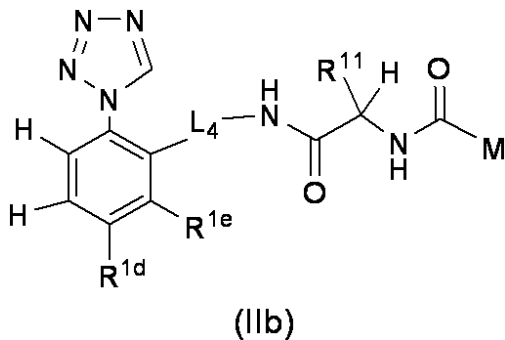
## 【請求項 7】

式 (I b) または (II b) :

## 【化 9 - 1】



## 【化 9 - 2】



[ 式中、

$R^{1d}$  は、各々独立して、Cl または Me であり ;

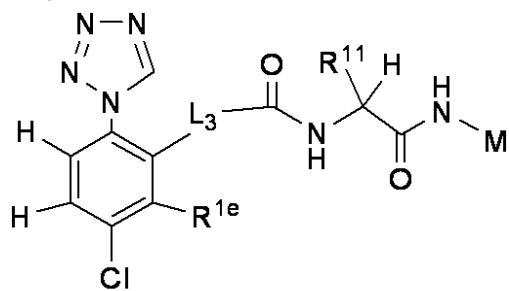
$R^{1e}$  は、各々独立して、H または F である ]

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】

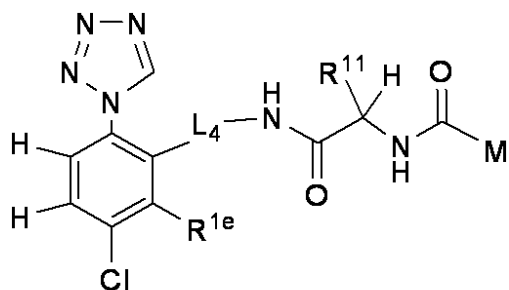
式 (I c) または (II c) :

【化 1 0 - 1】



(Ic)

【化 1 0 - 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。

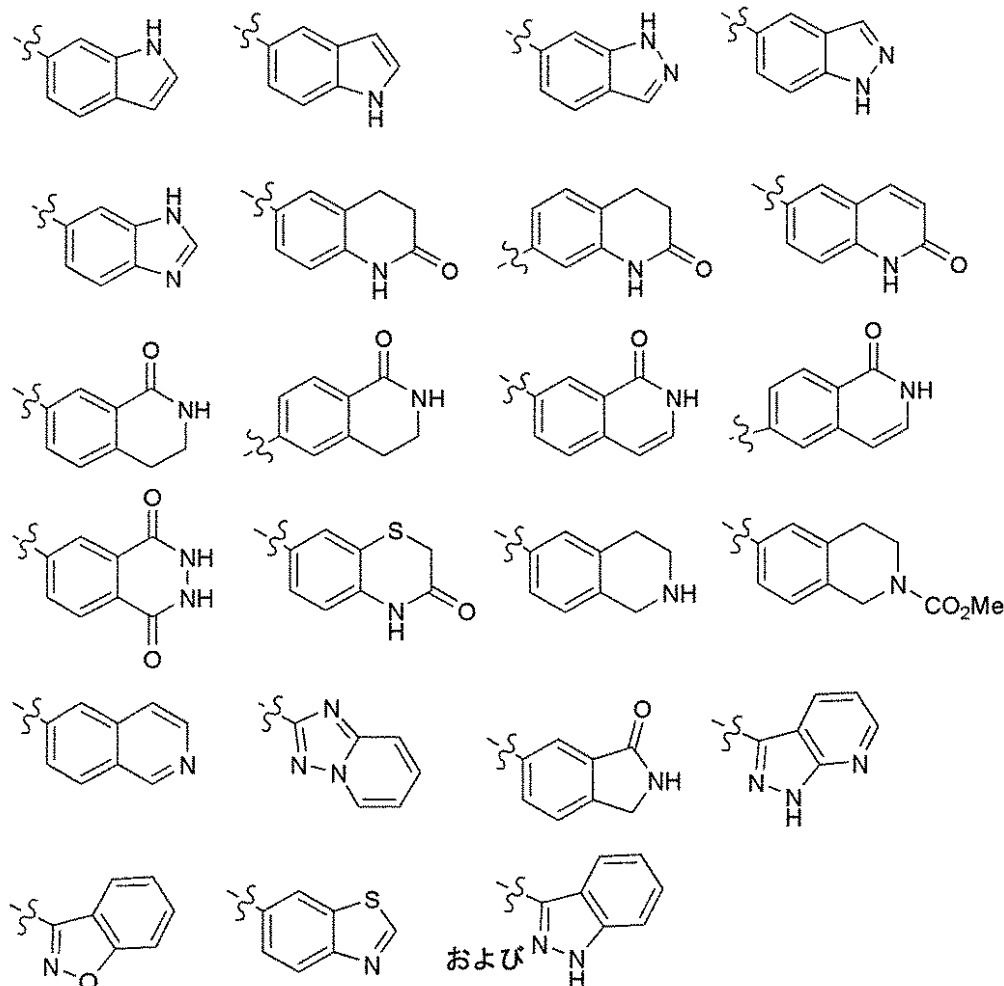
【請求項 9】

$L_3$  が、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C \equiv C-$  または  $-S(O)CH_2-$  であり；

$L_4$  が、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、または  $-COCH_2-$  であり；

M が、0 ~ 2 個の  $R^3$  で置換されており、フェニル、ピリジル、チエニル、

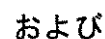
## 【化 1 1】



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、 $NH_2$ 、 $CO_2H$ 、 $CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2Et$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CON(Me)_2$ 、 $-NHCOMe$ 、 $-NHCO_2Me$ 、 $-(C=NH)NHOH$ 、 $-CONHC_2H_4CO_2H$ 、 $-CON(Me)CH_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_2CO_2Et$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2Et$ 、 $-CO_2(CH_2)_2N(Et)_2$ 、 $-CO_2(CH_2)_3N(Bu)_2$ 、 $-CH_2NHCO_2Me$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-CH_2NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2Et$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(Me)_2$ 、 $-CH_2NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHCONH(CH_2)_3CO_2Me$ 、 $-CONHSO_2Me$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $P(O)(OH)_2$ 、 $P(O)(OEt)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OH)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OEt)_2$ 、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 1 2】

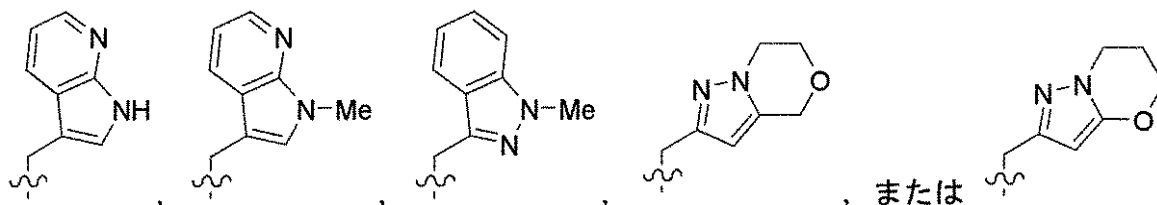


であり；

R<sup>11</sup>が、ネオペンチル、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe、-CH<sub>2</sub>S(t-Bu)、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)Me、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)<sub>2</sub>Me、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>C(O)N(Me)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(Me)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NHC(NH<sub>2</sub>)=N(NO<sub>2</sub>)、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 - 1 H - 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 ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) メチル、( 1 - メチル - 5 - ( メチルスルホニル ) - 1 H - 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、1 H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イルメチル、1 - メチル - 1 H - 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 - C O<sub>2</sub> M e - 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 - C O<sub>2</sub> M e - 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 - C O<sub>2</sub> M e - ピペリジン - 3 - イル ) メチル、( 1 - C O<sub>2</sub> M e - ピペリジン - 4 - イル ) メチル、テトラヒドロ - 2 H - 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 - 1<sup>6</sup> - チオモルホリン - 4 - イル ) メチル、( 1 , 1 - ジオキソ - 1<sup>6</sup> - 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、1 H - インドール - 3 - イル、キノキサリン - 2 - イルメチル、

【化 1 3】

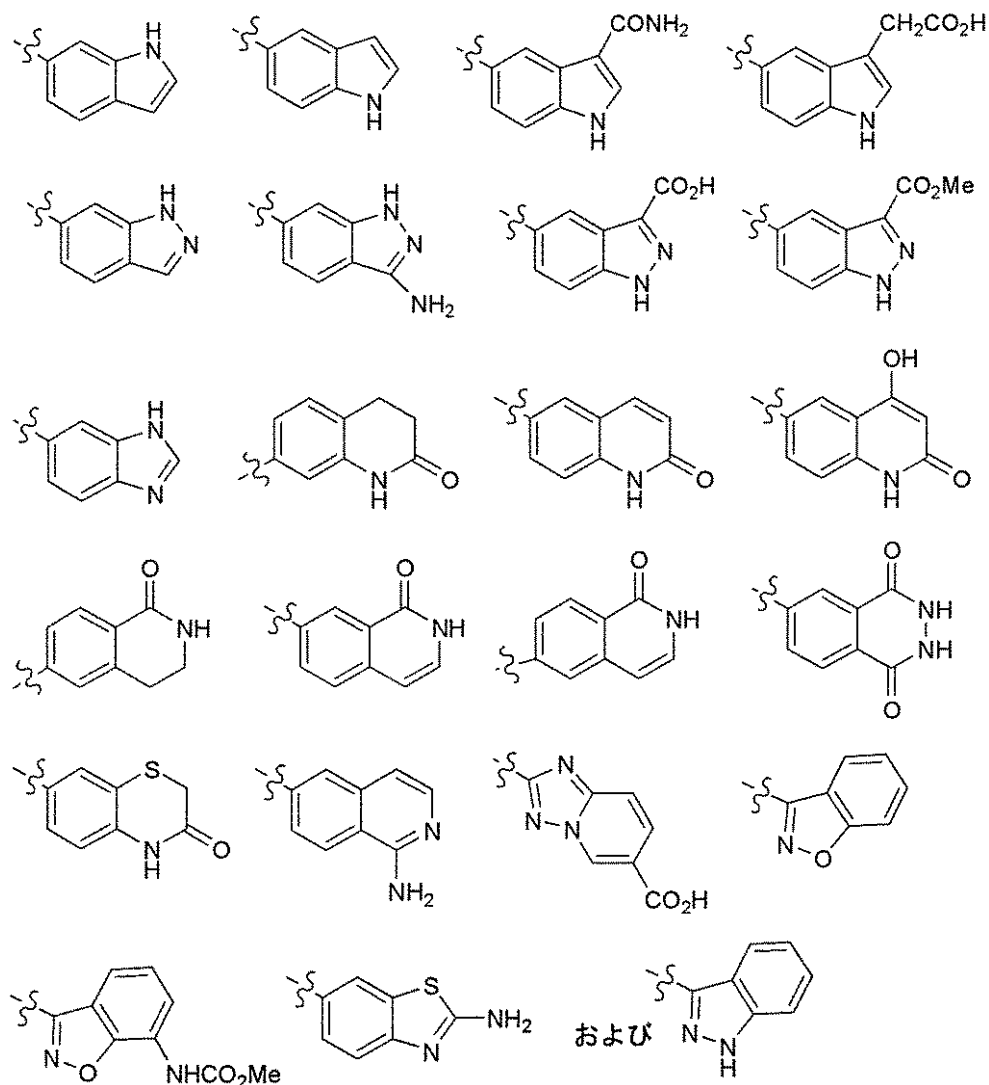


である、請求項 7 または請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

M が、0 ~ 2 個の R<sup>3</sup> で置換されており、フェニル、ピリジル、チエニル、

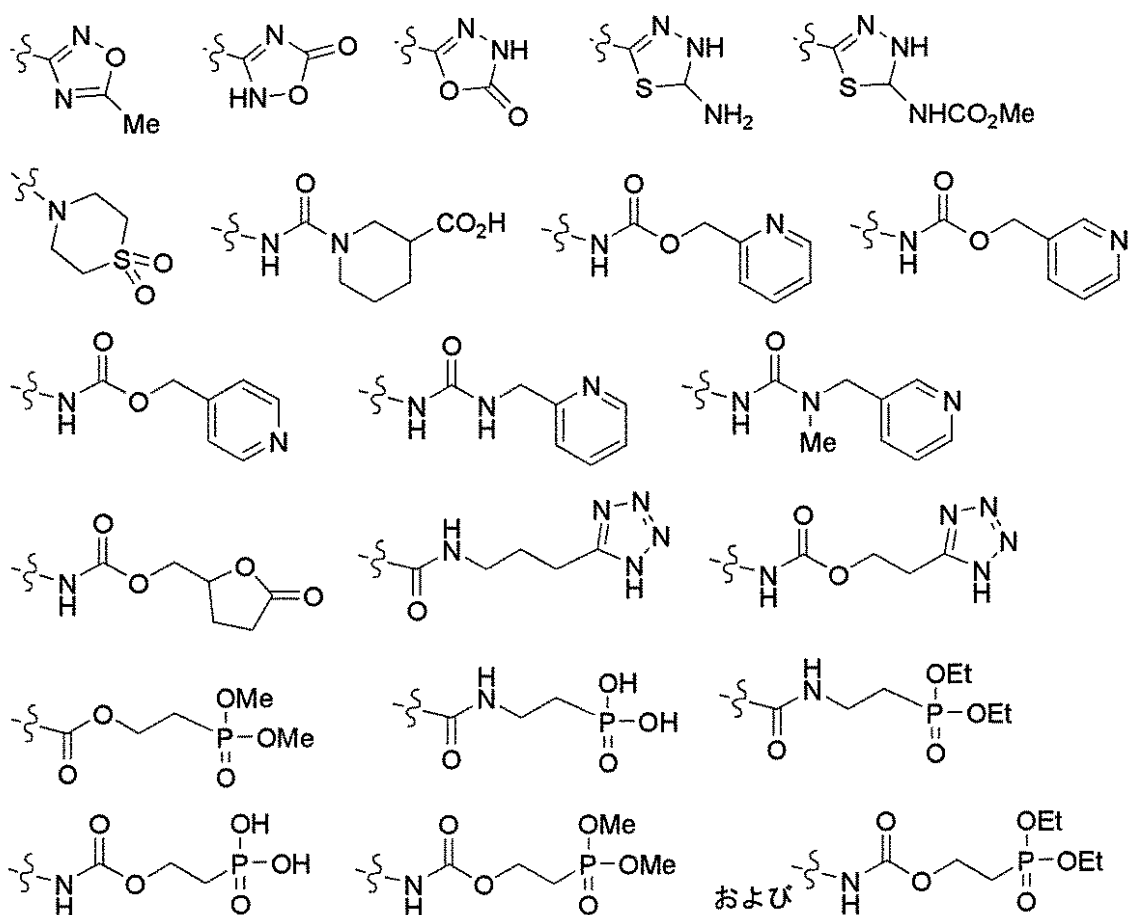
## 【化 1 4】



からなる群から選択され；

$R^3$ が、各々独立して、F、Cl、CN、 $CO_2H$ 、 $CO_2Me$ 、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NHCO_2Me$ 、 $-(C=NH)NHOH$ 、 $-CONHCH_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2H$ 、 $-CONH(CH_2)_3CO_2Et$ 、 $-CH_2NHCO_2Me$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-CH_2NHCO_2(CH_2)_2OMe$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHC(O)_2(CH_2)_2CO_2Et$ 、 $-CH_2NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2H$ 、 $-NHCONH(CH_2)_2CO_2Me$ 、 $-NHCONH(CH_2)_3CO_2Me$ 、 $-CONHSO_2Me$ 、 $P(O)(OH)_2$ 、 $P(O)(OEt)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OH)_2$ 、 $-CH_2P(O)(OEt)_2$ 、ピリジン-4-イル、テトラヒドロフラン-2-イル、メトキシ-、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】

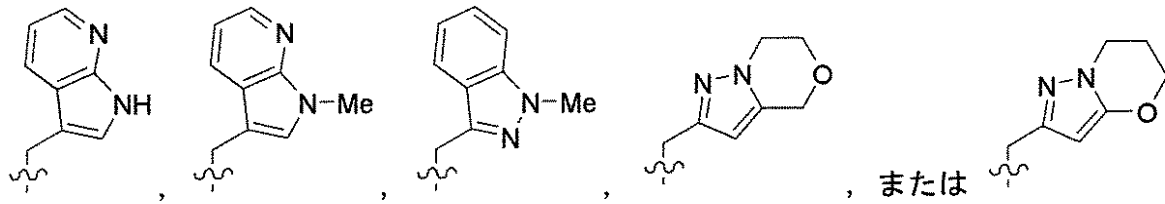


であり；

$R^{11}$ が、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$ 、 $-(\text{CH}_2)_4\text{N}(\text{Me})_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_3\text{NHC}(\text{NH}_2)=\text{N}(\text{NO}_2)$ 、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-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- $\text{CO}_2\text{Me}$ -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- $\text{CO}_2\text{Me}$ -ピペリジン-3-イル)メチル、(1- $\text{CO}_2\text{Me}$ -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-1<sup>6</sup>-チオモルホリン-4-イル)メチル、(1,1-ジオキソ-1<sup>6</sup>-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 1 6】



である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

医薬上許容される担体および請求項 1 から 1 0 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 1 2】

請求項 1 から 1 0 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 1 3】

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 1 2 に記載の薬剤。

【請求項 1 4】

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 1 2 に記載の薬剤。

【請求項 1 5】

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 1 0 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。