

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和2年11月19日(2020.11.19)

【公表番号】特表2019-530720(P2019-530720A)

【公表日】令和1年10月24日(2019.10.24)

【年通号数】公開・登録公報2019-043

【出願番号】特願2019-520081(P2019-520081)

【国際特許分類】

C 07 D	471/04	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	37/08	(2006.01)
A 61 P	3/00	(2006.01)
A 61 P	11/06	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 K	31/475	(2006.01)

【F I】

C 07 D	471/04	1 0 2
C 07 D	471/04	C S P
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	37/02	
A 61 P	37/08	
A 61 P	3/00	
A 61 P	11/06	
A 61 P	35/00	
A 61 P	17/06	
A 61 P	19/02	
A 61 P	29/00	1 0 1
A 61 P	29/00	
A 61 P	37/06	
A 61 P	25/00	
A 61 P	1/04	
A 61 K	31/475	

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月7日(2020.10.7)

【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

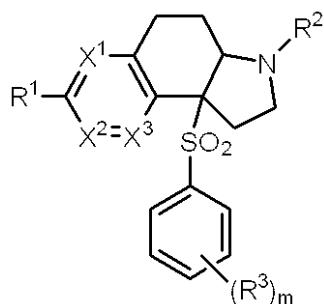
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：
【化1】



[式中、

X^1 、 X^2 および X^3 は、Nまたは CR^{1d} から独立して選択され；

R^1 は、ハロ、0～3個の R^{1a} で置換された C_{1-6} アルキル、0～3個の R^{1a} で置換された $O-C_{1-6}$ アルキル、0～3個の R^{1a} で置換された $-(CR^{1b}R^{1c})_r$ 、3～14員炭素環および0～3個の R^{1a} で置換された $-(CR^{1b}R^{1c})_r$ 、5～10員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、 $S(O)_p$ および $S(O)(NR^g)$ から選択された1～4個のヘテロ原子を含有している)から選択され；

R^{1a} は、各々独立して、水素、=O、ハロ、 CF_3 、 OCF_3 、CN、 NO_2 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r$ 、 $-OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-S(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-S(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-OC(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-S(O)_pNR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^bS(O)_pR^c$ 、0～3個の R^a で置換された C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～3個の R^a で置換された C_{2-6} アルケニル、0～3個の R^a で置換された C_{2-6} アルキニル、0～3個の R^a で置換された $-(CR^{1b}R^{1c})_r$ 、3～14員炭素環または0～3個の R^a で置換された $-(CR^{1b}R^{1c})_r$ 、5～7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、 $S(O)_p$ および $S(O)(NR^g)$ から選択された1～4個のヘテロ原子を含有している)であり；

R^{1b} および R^{1c} は、各々独立して、水素、ハロゲンまたは C_{1-6} アルキルであり；

R^{1d} は、各々独立して、水素、 CD_3 、ハロ、 CF_3 および C_{1-C_4} アルキルであり；

R^2 は、水素、CN、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、 $-C(O)R^{2d}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)OR^{2b}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-S(O)_2R^{2c}$ 、0～3個の R^{2a} で置換された C_{1-6} アルキル、0～3個の R^{2a} で置換された C_{2-6} アルケニル、0～4個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、3～10員炭素環ならびに0～4個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、4～7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、 $P(O)$ 、 $S(O)_p$ および $S(O)(NR^g)$ から選択された1～4個のヘテロ原子を含んでおり)から選択され；

R^{2a} は、各々独立して、水素、=O、ハロ、 OCF_3 、CN、 NO_2 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-OR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-S(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-S(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-OC(O)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-OC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-OC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-NR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-NR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-NR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-S(O)_pNR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^bS(O)_pR^c$ 、0～3個の R^a で置換された C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～3個の R^a で置換された C_{2-6} アルケニル、0～3個の R^a で置換された C_{2-6} アルキニル、0～3個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、3～14員炭素環または0～4個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、4～7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、 $S(O)_p$ および $S(O)(NR^g)$ から選択された1～4個のヘテロ原子を含有している)であり；

R^{2b} は、各々独立して、水素、 CF_3 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qOR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qS(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qS(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-C(O)R^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-OC(O)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-NR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-NR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-NR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-S(O)_2NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_q-NR^bS(O)_2R^c$ 、0～2個の R^a で置換された C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、0～3個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$ 、3～14員炭素環または0～4個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r$

f)_r - 5 ~ 7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{2c} は、各々独立して、水素、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{2 ~ 6}アルケニル、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{3 ~ 10}シクロアルキル、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{6 ~ 10}アリールまたは0 ~ 4個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r - 5 ~ 10員ヘテロ環(N、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{2d} は、各々独立して、水素、0 ~ 2個のR^dで置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、C_{1 ~ 6}ハロアルキル、C(O)NR¹¹R¹¹、0 ~ 3個のR^dで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r - C_{3 ~ 10}シクロアルキル(該シクロアルキル環は、縮合環、架橋環またはスピロ環であってもよい)、0 ~ 2個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r - フェニルまたは0 ~ 4個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r - 4 ~ 10員ヘテロ環(該ヘテロ環は、縮合環、架橋環またはスピロ環であってもよく、かつN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{2e} および R^{2f} は、各々独立して、水素、ハロゲンまたはC_{1 ~ 6}アルキルであり;

R^3 は、各々独立して、水素、ハロ、N₃、CN、-(CR^{1b}R^{1c})_r - OR^{3b}、-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR¹¹、0 ~ 3個のR^{3a}で置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、0 ~ 3個のR^{3a}で置換されたC_{3 ~ 10}シクロアルキル、0 ~ 3個のR^{3a}で置換されたフェニルまたは0 ~ 3個のR^{3a}で置換された4 ~ 10員ヘテロ環(N、OおよびS(O)_pから選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有する)から選択されるか、あるいは

隣接する炭素原子上に存在する2つのR³は、結合して、5 ~ 7員炭素環または5 ~ 7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)を形成しており、双方は0 ~ 3個のR^{3a}で所望により置換されていてもよく;

R^{3a} は、各々独立して、水素、=O、ハロ、OCF₃、OCHF₂、CF₃、CHF₂、CN、NO₂、-(CR^{1b}R^{1c})_r - OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)_pR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)(NR^g)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - OC(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)R^c、-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)OR^c、-NR^bC(O)N R¹¹R¹¹、-S(O)_pNR¹¹R¹¹、-NR^bS(O)_pR^c、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{2 ~ 6}アルケニル、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{2 ~ 6}アルキニル、C_{1 ~ 6}ハロアルキル、0 ~ 3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - 3 ~ 14員炭素環または0 ~ 3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - 5 ~ 10員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{3b} は、各々独立して、水素、CF₃、-(CR^{1b}R^{1c})_qOR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qS(O)_pR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qS(O)(NR^g)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_q-C(O)R^{3d}、-(CR^{1b}R^{1c})_q-C(O)OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qOC(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_q-C(O)NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR^bC(O)R^{3c}、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR^bC(O)OR^c、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR^bC(O)N R¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_qS(O)₂N R¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR^bS(O)₂R^c、0 ~ 3個のR^aで置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、C_{1 ~ 6}ハロアルキル、0 ~ 3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - 3 ~ 14員炭素環または0 ~ 3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - 5 ~ 7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{3c} および R^{3d} は、独立して、水素またはC_{1 ~ 6}アルキルであり;

R^{11} は、各々独立して、水素、0 ~ 3個のR^fで置換されたC_{1 ~ 6}アルキル、CF₃、0 ~ 3個のR^fで置換されたC_{3 ~ 10}シクロアルキル、0 ~ 3個のR^dで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - フェニルまたは0 ~ 4個のR^dで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r - 5 ~ 7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)であるか;あるいは

第1のR¹¹および第2のR¹¹は、双方同一窒素原子に結合しており、一緒になって、0 ~ 4個のR^dで置換されたヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1 ~ 4個のヘテロ原子を含有している)を形成しており;

R^a は、各々独立して、水素、=O、ハロ、OCF₃、CF₃、CHF₂、CN、NO₂、-(CR^{1b}R^{1c})_r - OR

^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)_pR^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)(NR^g)R^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)R^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)OR^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - OC(O)R^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - NR¹¹R¹¹、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)NR¹¹R¹¹、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)R^c、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)OR^c、 - NR^bC(O)NR¹¹R¹¹、 - S(O)_pNR¹¹R¹¹、 - NR^bS(O)_pR^c、 0~3個のR^fで置換されたC_{1~6}アルキル、 C_{1~6}ハロアルキル、 0~3個のR^eで置換されたC_{2~6}アルケニル、 0~3個のR^eで置換されたC_{2~6}アルキニル、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - 3~14員炭素環または0~4個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - 5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、 O、 S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり；

R^bは、各々独立して、水素、0~3個のR^dで置換されたC_{1~6}アルキル、 C_{1~6}ハロアルキル、 0~3個のR^dで置換されたC_{3~6}シクロアルキル、 0~4個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - 5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、 O、 S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)または0~3個のR^dで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - 6~10員炭素環であり；

R^cは、各々独立して、0~3個のR^fで置換されたC_{1~6}アルキル、 0~3個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - C_{3~6}シクロアルキルまたは0~3個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - フェニルであり；

R^dは、各々独立して、水素、=O、ハロ、OCF₃、CF₃、CN、NO₂、 - OR^e、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)R^c、 - NR^eR^e、 - NR^eC(O)OR^c、C(O)NR^eR^e、 - NR^eC(O)R^c、CO₂H、CO₂R^c、 - NR^eSO₂R^c、S O₂R^c、SO(NR^g)R^c、0~3個のR^fで置換されたC_{1~6}アルキル、 0~3個のR^fで置換されたC_{3~6}シクロアルキル、 0~3個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - フェニルまたは0~4個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - 5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、 O、 S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり；

R^eは、各々独立して、水素、C(O)NR^fR^f、C_{1~6}アルキル、 C_{3~6}シクロアルキル、 - 5~7員ヘテロ環または0~3個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - フェニルから選択され；

R^fは、各々独立して、水素、=O、ハロ、CN、NH₂、NH(C_{1~6}アルキル)、N(C_{1~6}アルキル)₂、SO₂(C_{1~6}アルキル)、SO(NR^g)(C_{1~6}アルキル)、CO₂H、CO₂(C_{1~6}アルキル)、OH、C_{3~6}シクロアルキル、CF₃、O(C_{1~6}アルキル)または所望により置換されていてもよい - (CR^{1b}R^{1c})_r - 5~10員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、 O、 S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)、フェニルまたはC_{3~6}シクロアルキルであり、各基は、ハロ、CN、CF₃、C_{1~6}アルキルまたはO(C_{1~6}アルキル)で所望により置換されていてもよく；

R^gは、各々独立して、水素、0~3個のR^fで置換されたC_{1~6}アルキル、 C_{1~6}ハロアルキル、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)R^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)OR^b、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)NR¹¹R¹¹、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - 3~14員炭素環または0~4個のR^fで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - 5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、 O、 P(O)およびS(O)pから選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり；

mは、0、1、2または3であり；

pおよびqは、各々独立して、0、1または2であり；および

rは、0、1、2、3または4である]

の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

X¹、X²およびX³が、独立してNまたはCHから選択され；

R¹が、ハロ、0~3個のR^{1a}で置換されたフェニル、0~3個のR^{1a}で置換されたC_{1~6}アルキルまたは0~3個のR^{1a}で置換されたO-C_{1~6}アルキルであり；

R^{1a}が、各々独立して、水素、CF₃、ハロ、0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキル、 - (CR^{1b}R^{1c})_r - OR^bまたは0~3個のR^aで置換された - (CR^{1b}R^{1c})_r - フェニルであり；

R^{1b}およびR^{1c}が、各々独立して、水素、ハロゲンまたはC_{1~6}アルキルであり；

R^{1d}が、各々独立して、水素、CD₃、ハロ、CF₃およびC_{1~4}アルキルであり；

R²が、水素、 - S(O)₂R^{2c}、0~3個のR^{2a}で置換されたC_{1~6}アルキル、 - C(O)OR^{2b}、 - C(O)R^{2d}、 - C(O)NR¹¹R¹¹または0~4個のR^aで置換された5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN

、O、P(O)、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{2a}が、各々独立して、水素または0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキルであり;

R^{2b}が、水素、0~2個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキル、0~3個のR^aで置換されたC_{3~6}シクロアルキル、0~4個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)または0~3個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~フェニルであり;

R^{2c}が、水素、0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキル、0~3個のR^aで置換されたC_{2~6}アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC_{3~10}シクロアルキル、0~3個のR^aで置換されたC_{6~10}アリールまたは0~4個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~5~10員ヘテロ環(N、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R^{2d}が、水素、0~2個のR^dで置換されたC_{1~6}アルキル、C_{1~6}ハロアルキル、C(O)NR¹¹R¹¹、0~2個のR^dで置換されたC_{3~10}シクロアルキル、0~2個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~フェニルまたは0~4個のR^aで置換された4~10員ヘテロ環(N、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり;

R³が、各々独立して、水素、ハロ、N₃、CN、OR^{3b}、-NH₂、-NH(C_{1~6}アルキル)、N(C_{1~6}アルキル)₂、0~3個のR^{3a}で置換されたC_{1~6}アルキルまたは0~3個のR^{3a}で置換されたC_{3~10}シクロアルキルであり;

R^{3a}が、各々独立して、水素、=O、ハロ、OCF₃、OCHF₂、CF₃、CHF₂、CN、NO₂、-(CR^{1b}R^{1c})_r~OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~S(O)_pR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~S(O)(NR^g)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~C(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~C(O)OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~OC(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_r~NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_r~C(O)NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_r~NR^bC(O)R^c、-(CR^{1b}R^{1c})_r~NR^bC(O)OR^c、-NR^bC(O)N(R¹¹R¹¹、-S(O)_pNR¹¹R¹¹、-NR^bS(O)_pR^c、0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキル、0~3個のR^aで置換されたC_{2~6}アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC_{2~6}アルキニル、C_{1~6}ハロアルキル、0~3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r~3~14員炭素環または0~3個のR^aで置換された-(CR^{1b}R^{1c})_r~5~10員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり;および

R^{3b}が、各々独立して、水素、0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキルまたは0~3個のR^aで置換されたフェニルである、

請求項1記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項3】

X¹、X²およびX³の内の1つが、Nであり、X¹、X²およびX³の内の別の2つが、CHであり;

R¹が、0~3個のR^{1a}で置換されたC_{1~6}アルキルまたは0~3個のR^{1a}で置換されたO-C_{1~6}アルキルであり;

R^{1a}が、各々独立して、水素、CF₃、ハロまたは0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキルであり;

R²が、0~3個のR^{2a}で置換されたC_{1~6}アルキル、-C(O)OR^{2b}、-C(O)R^{2d}、-C(O)NR¹¹R¹¹であり;

R^{2a}が、各々独立して、水素または0~3個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキルであり;

R^{2b}が、水素、0~2個のR^aで置換されたC_{1~6}アルキル、0~3個のR^aで置換されたC_{3~6}シクロアルキル、0~4個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~5~7員ヘテロ環(炭素原子ならびにN、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)または0~3個のR^aで置換された-(CR^{2e}R^{2f})_r~フェニルであり;

R^{2d}が、0~2個のR^dで置換されたC_{3~10}シクロアルキルまたは0~4個のR^aで置換された4~10員ヘテロ環(N、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり;

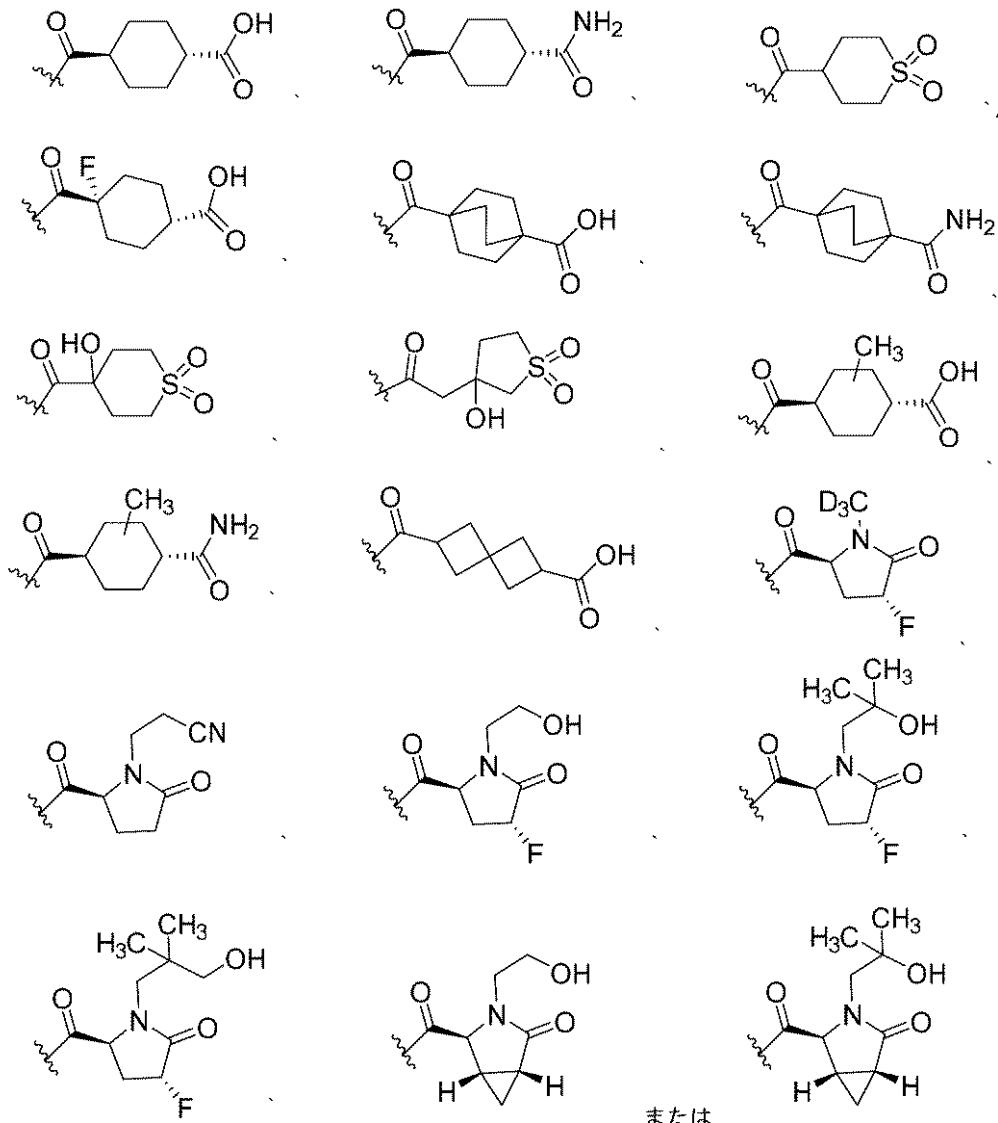
R³が、各々独立して、水素、ハロ、シクロプロピルまたはC_{1~6}アルキルである、

請求項2記載の化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項4】

R²が、

【化2】



または

である、請求項3記載の化合物あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項5】

以下の化合物：

3 - ((2S) - 2 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロ口[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロ口[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル) - 1 - (メチル - d₃)ピロリジン - 2 - オントリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロ口[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル) - 1 - (メチル - d₃)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロ口[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン -

2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボキサミド(單一エナンチオマー)、

4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル)ビシクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボン酸 塩酸塩(單一エナンチオマー)、

4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル)ビシクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボキサミド(單一エナンチオマー)、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 5,6,6a,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 7H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - イル)メタノン(單一エナンチオマー)、

6 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル)スピロ[3.3]ヘプタン - 2 - カルボン酸(2つのジアステレオマーの混合物)、

1 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル) - 2 - (3 - ヒドロキシ - 1,1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル)エタン - 1 - オン(2つのジアステレオマーの混合物)、

2 - (3 - ヒドロキシ - 1,1 - ジオキシドテトラヒドロチオフェン - 3 - イル) - 1 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル)エタン - 1 - オントリフルオロアセテート(2つのジアステレオマーの混合物)、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル)メタノン(單一エナンチオマー)、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 5,6,6a,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 7H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - イル)メタノン トリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

3 - ((2S) - 2 - (9a - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル トリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(9a - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 5,6,6a,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 7H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - イル)メタノン トリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

4 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)ビシクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボン酸(單一エナンチオマー)、

2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 1 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル)プロパン - 1 - オン トリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

3 - ヒドロキシ - 3 - メチル - 1 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル)ブタン - 1 - オントリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

3 - ((5S) - 2 - オキソ - 5 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)ピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル トリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - イル)メタノン トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

3 - ((2S) - 2 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(1,1 - ジオキシドテトラヒドロ - 2H - チオピラン - 4 - イル)(9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 1,2,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 3H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)メタノン トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル) - 3 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボン酸 トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 4 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 3 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9a - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 4 - (9a - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 3 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 3 - メチル - 4 - (7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 9b - (フェニルスルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 3 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R) - 4 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 3 - メチルシクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

(1R,4S,5S) - 4 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 3 - アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン - 2 - オン トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]キノリン - 7 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 1 - (3 - ヒドロキシ - 2,2 - ジメチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

3 - ((2S) - 2 - (7 - ((2,6 - ジクロロベンジル)オキシ) - 9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル(単一エナンチオマー)、

(1r,4r) - 4 - (7 - ((2,6 - ジクロロベンジル)オキシ) - 9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル)シクロヘキサン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

3 - ((2S) - 2 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル(単一エナンチオマー)、

3 - ((2S) - 2 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 5 - オキソピロリジン - 1 - イル)プロパンニトリル(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5R) - 3 - フルオロ - 5 - (9b - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5R) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5R) - 3 - フルオロ - 5 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((4 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノリン - 7 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル)ピロリジン - 2 - オン(単一エナンチオマー)、

(1R,4S,5S) - 4 - (9b - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 7 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 2,3,3a,4,5,9b - ヘキサヒドロ - 1H - ピロロ[3,2 - f]キノリン - 3 - カルボニル) - 3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 3 - アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン - 2 - オン トリフルオロアセテート(単一エナンチオマー)、

(3R,5S) - 3 - フルオロ - 5 - (9a - ((3 - フルオロフェニル)スルホニル) - 3 - (パーフルオロプロパン - 2 - イル) - 6,6a,7,8,9,9a - ヘキサヒドロ - 5H - ピロロ[2,3 - h]イソキノ

リン-7-カルボニル)-1-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)ピロリジン-2-オントリフルオロアセテート(單一エナンチオマー)、

(1R,4S,5S)-4-(9a-((3-フルオロフェニル)スルホニル)-3-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6,6a,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-5H-ピロロ[2,3-h]イソキノリン-7-カルボニル)-3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン-2-オン(單一エナンチオマー)、

(3R,5S)-3-フルオロ-1-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-5-(7-(パーフルオロプロパン-2-イル)-9b-(フェニルスルホニル)-2,3,3a,4,5,9b-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[3,2-f]キノリン-3-カルボニル)ピロリジン-2-オン(單一エナンチオマー)、

1-(9b-((4-フルオロフェニル)スルホニル)-7-(パーフルオロプロパン-2-イル)-2,3,3a,4,5,9b-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[3,2-f]キノリン-3-カルボニル)-2-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)ピラゾリジン-3-オン(單一エナンチオマー)、

1-(9a-((4-フルオロフェニル)スルホニル)-3-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6,6a,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-5H-ピロロ[2,3-h]イソキノリン-7-カルボニル)-2-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)ピラゾリジン-3-オン(單一エナンチオマー)、

1-(9b-((3-フルオロフェニル)スルホニル)-7-(パーフルオロプロパン-2-イル)-2,3,3a,4,5,9b-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[3,2-f]キノリン-3-カルボニル)-2-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)ピラゾリジン-3-オン(單一エナンチオマー)、

1-(9a-((3-フルオロフェニル)スルホニル)-3-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6,6a,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-5H-ピロロ[2,3-h]イソキノリン-7-カルボニル)-2-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)ピラゾリジン-3-オン(單一エナンチオマー)、

2-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-1-(7-(パーフルオロプロパン-2-イル)-9b-(フェニルスルホニル)-2,3,3a,4,5,9b-ヘキサヒドロ-1H-ピロロ[3,2-f]キノリン-3-カルボニル)ピラゾリジン-3-オン(單一エナンチオマー)、

(1R,3S,4R)-4-(9a-((4-フルオロフェニル)スルホニル)-3-(パーフルオロプロパン-2-イル)-6,6a,7,8,9,9a-ヘキサヒドロ-5H-ピロロ[2,3-h]キノリン-7-カルボニル)-3-メチルシクロヘキサン-1-カルボキサミド(單一エナンチオマー)、

2,2,2-トリフルオロ-1-(9a-((3-フルオロフェニル)スルホニル)-3-(パーフルオロプロパン-2-イル)-5,6,6a,8,9,9a-ヘキサヒドロ-7H-ピロロ[2,3-h]イソキノリン-7-イル)エタン-1-オン(單一エナンチオマー)および

1-(7-((2,6-ジクロロベンジル)オキシ)-9b-(フェニルスルホニル)-1,2,3a,4,5,9b-ヘキサヒドロ-3H-ピロロ[3,2-f]キノリン-3-イル)-2,2,2-トリフルオロエタン-1-オン、

から選択される化合物、あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項6】

請求項1～5いずれかに記載の1以上の化合物あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩、ならびに医薬的に許容し得る担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項7】

治療上有効量の請求項1～5いずれかに記載の化合物あるいはその立体異性体または医薬的に許容される塩を含む、自己免疫疾患または障害、喘息、アレルギー性疾患または障害、代謝性疾患または障害および癌から選択される疾患または障害を、診断、予防または治療するための、医薬組成物。

【請求項8】

自己免疫疾患または障害が、乾癬、関節リウマチ、関節炎、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、急性移植片対宿主病、乾癬性関節炎、強直性脊椎炎および多発性硬化症から選択される、請求項7記載の医薬組成物。