

【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

A 61 P 29/00 1 0 1

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

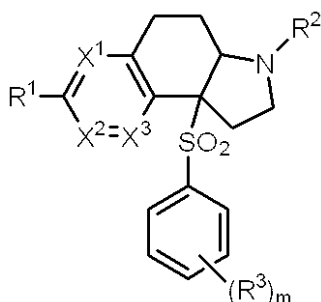
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



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、各々独立して、水素、=O、ハロ、 CF_3 、 OCF_3 、CN、 NO_2 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - S(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - OC(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r - NR^bS(O)_pR^c$ 、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^{1d}は、各々独立して、水素、CD₃、ハロ、CF₃およびC₁ - C₄アルキルであり；

R²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C₁₋₆アルキル、0～3個のR^{2a}で置換されたC₂₋₆アルケニル、0～4個のR^aで置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r-3\sim 10$ 員炭素環ならびに0～4個のR^aで置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r-4\sim 7$ 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^a 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 $-(CR^{2e}R^{2f})_r - 3 \sim 14$ 員炭素環または0~4個の R^a で置換された $-(CR^{2e}R^{2f})_r - 4 \sim 7$ 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 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qOR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qS(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qS(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)R^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qOC(O)R^b$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qNR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qNR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qNR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qNR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qS(O)_2NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{2e}R^{2f})_qNR^bS(O)_2R^c$ 、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 $-(CR^{2e}R^{2f})_r-3\sim 14$ 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C₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC₃~₁₀シクロアルキル、0~3個のR^aで置換されたC₆~₁₀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C₁~₆アルキル、C₁~₆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-C₃~₁₀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C₁~₆アルキルであり;

R³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-NR¹¹R¹¹、0~3個のR^{3a}で置換されたC₁~₆アルキル、0~3個のR^{3a}で置換されたC₃~₁₀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)NR¹¹R¹¹、-S(O)_pNR¹¹R¹¹、-NR^bS(O)_pR^c、0~3個のR^aで置換されたC₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルキニル、C₁~₆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})_r-C(O)R^{3d}、-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)OR^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qOC(O)R^b、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_r-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)NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_qS(O)₂NR¹¹R¹¹、-(CR^{1b}R^{1c})_qNR^bS(O)₂R^c、0~3個のR^aで置換されたC₁~₆アルキル、C₁~₆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C₁~₆アルキルであり;

R¹¹は、各々独立して、水素、0~3個のR^fで置換されたC₁~₆アルキル、CF₃、0~3個のR^fで置換されたC₃~₁₀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 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-S(O)_pR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-S(O)(NR^g)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-OC(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)R^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)OR^c$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bC(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-S(O)_pNR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-NR^bS(O)_pR^c$ 、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、 $-NR^eSO_2R^c$ 、SO₂R^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、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)R^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)OR^b$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、 $-(CR^{1b}R^{1c})_r-3-14$ 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】

X^1 、 X^2 および X^3 が、独立してNまたはCHから選択され；

R^1 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；

R^2 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、 $-C(O)OR^{2b}$ 、 $-C(O)R^{2d}$ 、 $-C(O)NR^{11}R^{11}$ 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C₁~₆アルキルであり；

R^{2b}が、水素、0~2個のR^aで置換されたC₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₃~₆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C₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC₃~₁₀シクロアルキル、0~3個のR^aで置換されたC₆~₁₀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C₁~₆アルキル、C₁~₆ハロアルキル、C(O)NR¹¹R¹¹、0~2個のR^dで置換されたC₃~₁₀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(C₁~₆アルキル)、N(C₁~₆アルキル)₂、0~3個のR^{3a}で置換されたC₁~₆アルキルまたは0~3個のR^{3a}で置換されたC₃~₁₀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)NR¹¹R¹¹、-S(O)_pNR¹¹R¹¹、-NR^bS(O)_pR^c、0~3個のR^aで置換されたC₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルケニル、0~3個のR^aで置換されたC₂~₆アルキニル、C₁~₆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C₁~₆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C₁~₆アルキルまたは0~3個のR^{1a}で置換されたO-C₁~₆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C₁~₆アルキルであり；

R²が、0~3個のR^{2a}で置換されたC₁~₆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C₁~₆アルキルであり；

R^{2b}が、水素、0~2個のR^aで置換されたC₁~₆アルキル、0~3個のR^aで置換されたC₃~₆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；

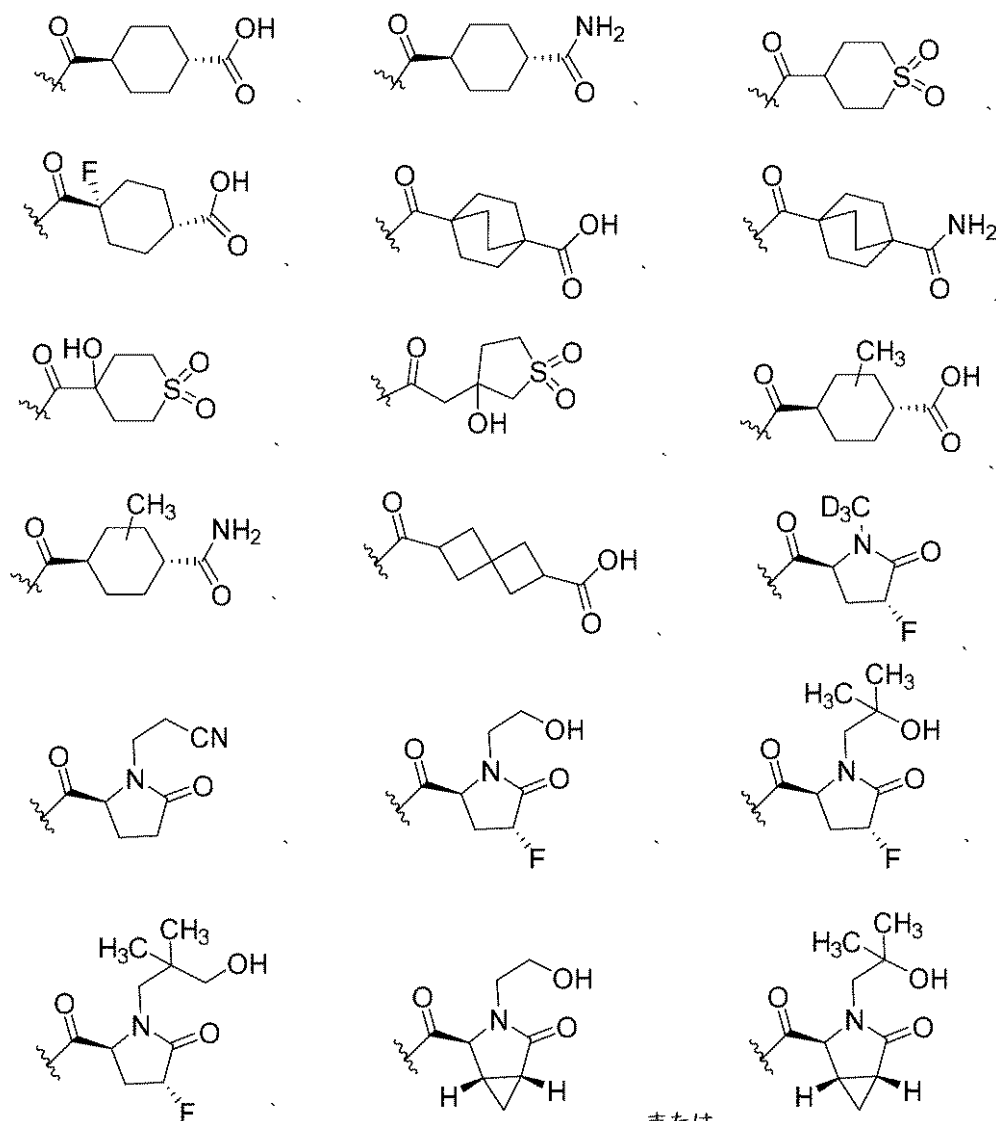
R^{2d}が、0~2個のR^dで置換されたC₃~₁₀シクロアルキルまたは0~4個のR^aで置換された4~10員ヘテロ環(N、O、S(O)_pおよびS(O)(NR^g)から選択された1~4個のヘテロ原子を含有している)であり；

R³が、各々独立して、水素、ハロ、シクロプロピルまたはC₁~₆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 - ピロロ[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 - ピロロ[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 - ピロロ[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(単一エナンチオマー)、

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)ビスクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボン酸 塩酸塩(単一エナンチオマー)、

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)ビスクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボキサミド(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)(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(単一エナンチオマー)、

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エン - 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エン - 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(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)(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(単一エナンチオマー)、

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(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)(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(単一エナンチオマー)、

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)ビスクロ[2.2.2]オクタン - 1 - カルボン酸(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(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 - ((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 - 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)、

(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(単一エナンチオマー)、

(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(単一エナンチオマー)、

(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(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)、

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(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 - カルボキサミド(単一エナンチオマー)、

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(単一エナンチオマー)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。