

【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30年5月17日 (2018.5.17)

【公表番号】特表2017-509679(P2017-509679A)

【公表日】平成29年4月6日 (2017.4.6)

【年通号数】公開・登録公報2017-014

【出願番号】特願2016-560725(P2016-560725)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/7034 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 1

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

C 0 7 D 471/04 1 0 8 X

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/397

A 6 1 K 31/7034

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年3月27日 (2018.3.27)

【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

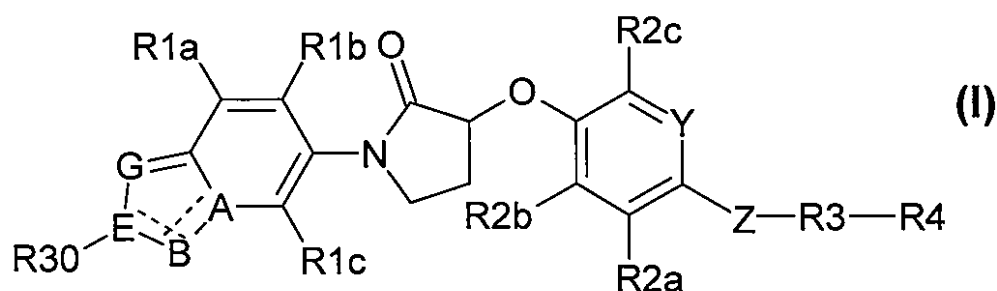
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

## 【化 1】



[ 式中、

A は、N または C であり；

B は、C O、N または C H であり；

E は、N または C であり；

G は、N または C R 3 0 であり；

ここで、A、B、E または G の基のうちの少なくとも 1 つは N であり；

R 3 0 は、H または ( C R 1 1 R 1 2 )<sub>n</sub> - R 3 2 であり；

R 1 1、R 1 2 は、互いに独立に、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

n は、0、1、2 または 3 であり；

R 3 2 は、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - シクロアルキル、C O O R 1 3、C O N R 1 4 R 1 5、S O<sub>2</sub> R 1 6 または O H であり；

R 1 3 は、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

R 1 4、R 1 5 は、互いに独立に、H、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル、O R 1 7 で置換されている ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル、または ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - シクロアルキル であり；  
 または R 1 4 および R 1 5 は、それらが結合している N - 原子と一緒に、O、S および N R 1 8 のリストから選択される追加のヘテロ原子を場合により含む、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環を形成し；

ここで、4 員、5 員または 6 員の複素環は、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルキル および O R 1 7 のリストから選択される 1 ~ 3 つの基で場合により置換されていてもよく；

R 1 6 は、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

R 1 7 は、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

R 1 8 は、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

R 1 a、R 1 b、R 1 c は、互いに独立に、H、F、C l、B r、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル または C N であり；

R 2 a、R 2 b、R 2 c は、互いに独立に、H、F、C l、B r、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル または C N であり；

Y は、N または C H であり；

Z は、結合、O、C R 5 R 5'、N R 6、C = O、S、S O または S O<sub>2</sub> であり；

R 5、R 5'、R 6 は、互いに独立に、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルキル であり；

R 3 は、結合または ( C R 7 R 7' )<sub>p</sub> であり；

p は、0、1、2、3 または 4 であり；

R 7、R 7' は、互いに独立に、H または ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル であり；

R 4 は、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) - アルキル、O R 8、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - シクロアルキル、( C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - ビシクロアルキル、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環、フェニル、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環 であり；

ここで、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - シクロアルキル、( C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - ビシクロアルキル、4 員、5 員または 6 員の複素環、フェニル、5 員または 6 員のヘテロアリール環は、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルキル、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルカノイル、ヒドロキシ、ヒドロキシ - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルキル、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) - アルキルオキシ - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ) - アルキル、オキ

ソ、FまたはC1から選択される1～3つの基で場合により置換されていてもよく；

R8は、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキル、ヒドロキシ-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)-アルキルまたは(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)-アルキルオキシ-(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)-アルキルであり；

ここで、各出現において、アルキル基の水素原子は、部分的にまたは完全に、フッ素原子によって置き換えられてもよい]

の化合物であって、その立体異性体のいずれか、または立体異性体の任意の比の混合物、または生理学的に許容されるその塩である、前記化合物。

【請求項2】

ピロリジノン環の3位が、(R)-配置を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Yが、Nである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

Zが、Oである、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R3が、CH<sub>2</sub>である、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

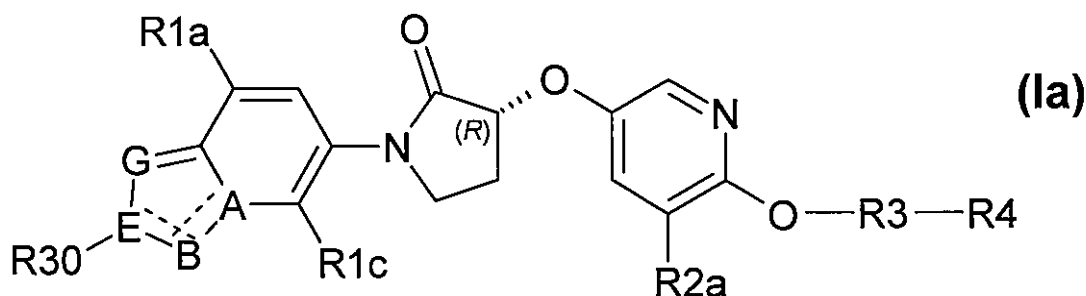
【請求項6】

R4が、(C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>)-シクロアルキルである、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

式Ia

【化2】



[ 式中、

Aは、NまたはCであり；

Bは、CO、NまたはCHであり；

Eは、NまたはCであり；

Gは、NまたはCR<sub>30</sub>であり；

ここで、A、B、EまたはGの基のうちの少なくとも1つはNであり；

R<sub>30</sub>は、Hまたは(CR<sub>11</sub>CR<sub>12</sub>)<sub>n</sub>-R<sub>32</sub>であり；

R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>は、互いに独立に、Hまたは(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

nは、0、1、2または3であり；

R<sub>32</sub>は、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>)-シクロアルキル、COOR<sub>13</sub>、CONR<sub>14</sub>R<sub>15</sub>、SO<sub>2</sub>R<sub>16</sub>またはOHであり；

R<sub>13</sub>は、Hまたは(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキルであり；

R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub>は、互いに独立に、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキル、OR<sub>17</sub>で置換されている(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-アルキル、または(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>)-シクロアルキルであり；  
またはR<sub>14</sub>およびR<sub>15</sub>は、それらが結合しているN-原子と一緒に、O、SおよびNR<sub>18</sub>のリストから選択される追加のヘテロ原子を場合により含む、4員、5員もしくは6員の複素環を形成し；

ここで、4員、5員または6員の複素環は、(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>)-アルキルおよびOR<sub>17</sub>のリストから選択される1～3つの基で場合により置換されていてもよく；

R 1 6 は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 7 は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 8 は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 a、R 1 c は、互いに独立に、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたはCNであり；

R 2 a は、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたはCNであり；

R 3 は、結合、または(CR<sub>7</sub>R<sub>7</sub>')<sub>p</sub>であり；

p は、0、1、2、3 または 4 であり；

R 7、R 7' は、互いに独立に、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 4 は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、OR 8、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環、フェニル、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり；

ここで、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル、4 員、5 員または 6 員の複素環、フェニル、5 員または 6 員のヘテロアリール環は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルカノイル、ヒドロキシ、ヒドロキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) - アルキルオキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキル、オキソ、F または Cl から選択される 1 ~ 3 つの基で場合により置換されていてもよく；

R 8 は、H、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、ヒドロキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキルまたは (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) - アルキルオキシ - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキルであり；

ここで、各出現において、アルキル基の水素原子は、部分的にまたは完全に、フッ素原子によって置き換えられてもよい]

の化合物であって、その立体異性体のいずれか、または立体異性体の任意の比の混合物、または生理学的に許容されるその塩である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 8】

式中、

A が、N または C であり；

B が、CO、N または CH であり；

E が、N または C であり；

G が、N または CR<sub>3</sub>O であり；

ここで、A、B、E または G の基のうちの少なくとも 1 つは N であり；

R 3 0 が、(CR<sub>11</sub>R<sub>12</sub>)<sub>n</sub> - R 3 2 であり；

R 1 1、R 1 2 が、互いに独立に、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

n が、0、1 または 2 であり；

R 3 2 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、COOR 1 3、CONR 1 4 R 1 5 または OH であり；

R 1 3 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 4、R 1 5 が、互いに独立に、H、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、OR 1 7 で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、または (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) - シクロアルキルであり；  
または R 1 4 および R 1 5 が、それらが結合している N - 原子と一緒にあって、O、S および NR 1 8 のリストから選択される追加のヘテロ原子を場合により含む、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環を形成し；

ここで、4 員、5 員または 6 員の複素環は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキルおよび OR 1 7 のリストから選択される 1 ~ 3 つの基で場合により置換されていてもよく；

R 1 6 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 7 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 8 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 a、R 1 c が、互いに独立に、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたはCNであり；

R 2 a が、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたはCNであり；

R<sub>3</sub> が、CH<sub>2</sub> であり；

R<sub>4</sub> が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキルおよび F から選択される 1 ~ 3 つの基で場合により置換されていてもよい (C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキルであり、

各出現において、アルキル基の水素原子は、部分的にまたは完全に、フッ素原子によって置き換えられてもよい、

その立体異性体のいずれか、または任意の比の立体異性体の混合物、または生理学的に許容されるその塩である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式中、

A が、N または C であり；

B が、CO、N または CH であり；

E が、N または C であり；

G が、N または CR<sub>3</sub>O であり；

ここで、A、B、E または G の基のうちの少なくとも 1 つは N であり；

R<sub>3</sub>O が、(CR<sub>1</sub>CR<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - R<sub>3</sub>2 であり；

R<sub>1</sub>1、R<sub>1</sub>2 が、互いに独立に、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

n が、0、1 または 2 であり；

R<sub>3</sub>2 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、COOR<sub>1</sub>3、CONR<sub>1</sub>4R<sub>1</sub>5 または OH であり；

R<sub>1</sub>3 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>1</sub>4、R<sub>1</sub>5 が、互いに独立に、H、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、OR<sub>1</sub>7 で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、または (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) - シクロアルキルであり；

または R<sub>1</sub>4 および R<sub>1</sub>5 が、それらが結合している N - 原子と一緒に、O、S および NR<sub>1</sub>8 のリストから選択される追加のヘテロ原子を場合により含む、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環を形成し；

ここで、4 員、5 員または 6 員の複素環は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>) - アルキルおよび OR<sub>1</sub>7 のリストから選択される 1 ~ 3 つの基で場合により置換されていてもよく；

R<sub>1</sub>6 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>1</sub>7 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>1</sub>8 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>1</sub>a、R<sub>1</sub>c が、互いに独立に、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたは CN であり；

R<sub>2</sub>a が、H、F、Cl、Br、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたは CN であり；

R<sub>3</sub> が、CH<sub>2</sub> であり；

R<sub>4</sub> が、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキルであり、

各出現において、アルキル基の水素原子は、部分的にまたは完全に、フッ素原子によって置き換えられてもよい、

その立体異性体のいずれか、または立体異性体の任意の比の混合物、または生理学的に許容されるその塩である、請求項 7 または 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

式中、

A が、N または C であり；

B が、CO、N または CH であり；

E が、N または C であり；

G が、N または CR<sub>3</sub>O であり；

ここで、A、B、E または G の基のうちの少なくとも 1 つは N であり；

R<sub>3</sub>O が、CH<sub>2</sub>CONR<sub>1</sub>4R<sub>1</sub>5 であり；

R<sub>1</sub>4、R<sub>1</sub>5 が、互いに独立に、H、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、OR<sub>1</sub>7 で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、または (C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) - シクロアルキルであり；

R<sub>1</sub>7 が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 a、R 1 c が、互いに独立に、H または F であり；

R 2 a が、H であり；

R 3 が、C H<sub>2</sub> であり；

R 4 が、( C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> ) - シクロアルキルである、

その立体異性体のいずれか、または立体異性体の任意の比の混合物、または生理学的に許容されるその塩である、請求項 7 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 1 - ( 2 - シクロプロピル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 6 - イル ) ピロリジン - 2 - オン、

( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 1 - ( [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 6 - イル ) ピロリジン - 2 - オン、

( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 1 - イミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 6 - イル - ピロリジン - 2 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - メチル - 3 - オキソ - イミダゾ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセテート、

( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 1 - ( [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 6 - イル ) ピロリジン - 2 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] 酢酸、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセテート、

メチル 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 2 - カルボキシレート、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

8 - フルオロ - 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 3 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 2 - シクロプロピルアセチル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 2 - シクロプロピルアセチル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 3 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] インダゾール - 2 - イル ] アセテート

ト、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] インダゾール - 2 - イル ] 酢酸、

2 - [ 5 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] 酢酸、

メチル 2 - [ 5 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] アセテート、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] イミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 2 - イル ] 酢酸、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] イミダゾ [ 1 , 2 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセテート、

( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 1 - ( 2 - メチルベンゾトリアゾール - 5 - イル ) ピロリジン - 2 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 4 - フルオロ - ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 2 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 3 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] 酢酸、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 3 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセテート、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 2 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 3 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセテート、

( R ) - 2 - ( 6 - ( 3 - ( ( 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) ピリジン - 3 - イル ) オキシ ) - 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) - 8 - フルオロ - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 ( 3 H ) - イル ) 酢酸、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド

、

N - シクロプロピル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 8 - フルオロ - 3 - オキソ - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾロ [ 4 , 3 - a ] ピリジン - 2 - イル ] アセトアミド

、

2 - [ 5 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] - N , N

- ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 5 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミドおよび

2 - [ 5 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] ベンゾトリアゾール - 2 - イル ] アセトアミド

のリストから選択される化合物または医薬として許容されるその塩。

【請求項 1 2】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種の化合物、またはそれらのいずれかの生理学的に許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

インスリンおよびインスリン誘導体、G L P - 1、G L P - 1 類似体および G L P - 1 受容体作動薬、ポリマー結合 G L P - 1 および G L P - 1 類似体、G L P - 1 / G I P 二重作動薬、G L P - 1 / グルカゴン受容体二重作動薬、P Y Y 3 - 3 6 またはその類似体、膵臓ポリペプチドまたはその類似体、グルカゴン受容体作動薬または拮抗薬、G I P 受容体作動薬または拮抗薬、グレリン拮抗薬または逆作動薬、キセニンおよびその類似体、D P P - I V 阻害薬、S G L T - 2 阻害薬、S G L T - 2 / S G L T - 1 二重阻害薬、ビグアニド、チアゾリジンジオン、P P A R 作動薬、P P A R モジュレーター、スルホニル尿素、メグリチニド、アルファ - グルコシダーゼ阻害薬、アミリンおよびアミリン類似体、G P R 1 1 9 作動薬、G P R 4 0 作動薬、G P R 1 2 0 作動薬、G P R 1 4 2 作動薬、T G R 5 作動薬、A M P K 刺激剤、A M P K アクチベーター、1 1 - ベータ - H S D の阻害薬、グルコキナーゼのアクチベーター、D G A T の阻害薬、タンパク質チロシンホスファターゼ 1 の阻害薬、グルコース - 6 - ホスファターゼの阻害薬、フルクトース - 1 , 6 - ビスホスファターゼの阻害薬、グリコーゲンホスホリラーゼの阻害薬、ホスホエノールビルビン酸カルボキシキナーゼの阻害薬、グリコーゲン合成キナーゼの阻害薬、ビルビン酸脱水素酵素キナーゼの阻害薬、C C R - 2 拮抗薬、グルコース輸送体 - 4 のモジュレーター、ソマトスタチン受容体 3 作動薬、H M G - C o A - 還元酵素阻害剤、フィブレート、ニコチン酸およびその誘導体、ニコチン酸受容体 1 作動薬、A C A T 阻害薬、コレステロール吸収阻害薬、胆汁酸結合性物質、I B A T 阻害薬、M T P 阻害薬、P C S K 9 のモジュレーター、L D L 受容体上昇調節剤 ( 肝臓選択的甲状腺ホルモン受容体ベータ作動薬 )、H D L 上昇化合物、脂質代謝モジュレーター、P L A 2 阻害薬、A p o A - I エンハンサー、コレステロール合成阻害薬、オメガ - 3 脂肪酸およびその誘導体、肥満の治療のための活性物質、C B 1 受容体拮抗薬、M C H - 1 拮抗薬、M C 4 受容体作動薬および部分的作動薬、N P Y 5 または N P Y 2 拮抗薬、N P Y 4 作動薬、ベータ - 3 アドレナリン受容体作動薬、レプチンまたはレプチン模倣物、5 H T 2 c 受容体作動薬、リパーゼ阻害薬、脈管形成阻害薬、H 3 拮抗薬、A g R P 阻害薬、三重モノアミン取り込み阻害薬、M e t A P 2 阻害薬、線維芽細胞成長因子受容体 4 またはプロヒビチン標的ペプチド - 1 の産生に対するアンチセンスオリゴヌクレオチド、高血圧、慢性心不全またはアテローム性動脈硬化症に影響を及ぼすための薬物、アンジオテンシン I I 受容体拮抗剤、アンジオテンシン受容体二重遮断薬 ( A R B )、アンジオテンシン転換酵素 ( A C E ) 阻害薬、アンジオテンシン転換酵素 2 ( A C E - 2 ) アクチベーター、レニン阻害薬、プロレニン阻害薬、エンドセリン転換酵素 ( E C E ) 阻害薬、エンドセリン受容体遮断薬、エンドセリン拮抗薬、利尿薬、アルドステロン拮抗薬、アルドステロン合成阻害薬、アルファ遮断薬、アルファ - 2 アドレナリン受容体の拮抗薬、ベータ遮断薬、アルファ - / ベータ - 混合遮断薬、カルシウム拮抗薬 / カルシウムチャネル遮断薬 ( C B B )、二重鉍質コルチコイド / C C B、中枢作用性抗高血圧薬、中性エンドペプチダーゼの阻害薬、アミノペプチダーゼ - A 阻害薬、バソペプチド阻害薬、バソペプチド二重阻害薬、ネプリリシン - A C E 阻害薬、ネプリリシン - E C E 阻害薬、二重作用性アンジオテンシン ( A T ) 受容体 - ネプリリシン阻害薬、A T 1 / エンドセリン - 1 ( E T A ) 二重拮抗薬、糖化最終産物破壊剤



、組み換えレナラーゼ、血圧ワクチン、抗 R A A S ワクチン、A T 1 - または A T 2 - ワクチン、抗高血圧反応を伴う遺伝子多型性のモジュレーター、ならびに血小板凝集阻害薬のリストから選択される 1 種またはそれ以上の有効成分をさらに含む、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

メトホルミンをさらに含む、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

少なくとも 1 種の D P P - I V 阻害薬をさらに含み、ここで D P P - I V 阻害薬が、アログリブチン、リナグリブチン、サキサグリブチン、シタグリブチン、アナグリブチン、テネリグリブチン、トレラグリブチン、ビルダグリブチン、ゲミグリブチン、オマリグリブチン、エボグリブチンおよびデュトグリブチンのリストから選択される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

少なくとも 1 種の S G L T - 2 阻害薬をさらに含み、ここで S G L T - 2 阻害薬が、カナグリフロジン、ダパグリフロジン、レモグリフロジン、レモグリフロジンエタボネート、セルグリフロジン、エンパグリフロジン、イブラグリフロジン、トホグリフロジン、ルセオグリフロジンおよびエルツグリフロジンのリストから選択される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

少なくとも 1 種の G P R 4 0 作動薬をさらに含み、ここで G P R 4 0 作動薬が、T U G - 4 2 4、P - 1 7 3 6、P - 1 1 1 8 7、J T T - 8 5 1、G W 9 5 0 8、C N X - 0 1 1 - 6 7、A M - 1 6 3 8 および A M - 5 2 6 2 のリストから選択される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

エゼチミブをさらに含む、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

少なくとも 1 種の H M G - C o A 還元酵素阻害剤をさらに含み、ここで H M G - C o A 還元酵素阻害剤が、シムバスタチン、アトルバスタチン、ロスバスタチン、プラバスタチン、フルバスタチン、ピタバスタチン、ロバスタチン、メバスタチン、リバスタチンおよびセリバスタチンのリストから選択される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

少なくとも 1 種の P P A R 作動薬または P P A R モジュレーターをさらに含み、ここで P P A R 作動薬または P P A R モジュレーターが、サログリタザール、ピオグリタゾン、ロシグリタゾンおよびロベグリタゾンのリストから選択される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

アカルボースをさらに含む、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 3】

糖尿病、肥満、脂質異常症および関連障害の予防および / または治療のための、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 4】

G P R 1 1 9 に関連した疾患の予防および / または治療のための、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。