

【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2017-509678(P2017-509678A)

【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2016-560724(P2016-560724)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 31/155 (2006.01)

A 61 K 31/397 (2006.01)

A 61 K 31/40 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/7034 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/517 (2006.01)

A 61 K 31/4035 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/4196 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/4245 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/422 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 K 31/41 (2006.01)

A 61 K 31/433 (2006.01)

C 07 D 405/14 (2006.01)

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/4545 (2006.01)

C 07 D 403/04 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

C 07 D 403/14 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 401/14 C S P

A 61 P 3/10

A 61 P 3/06

A 61 P 3/04

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 K 45/00

A 61 K 31/155

A 61 K 31/397

A 61 K 31/40

A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/7034  
 A 6 1 K 31/444  
 A 6 1 K 31/517  
 A 6 1 K 31/4035  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/4196  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/4245  
 A 6 1 K 31/427  
 A 6 1 K 31/422  
 A 6 1 K 31/497  
 A 6 1 K 31/41  
 A 6 1 K 31/433  
 C 0 7 D 405/14  
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 H  
 A 6 1 K 31/4545  
 C 0 7 D 403/04  
 C 0 7 D 413/14  
 C 0 7 D 417/14  
 C 0 7 D 403/14

## 【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

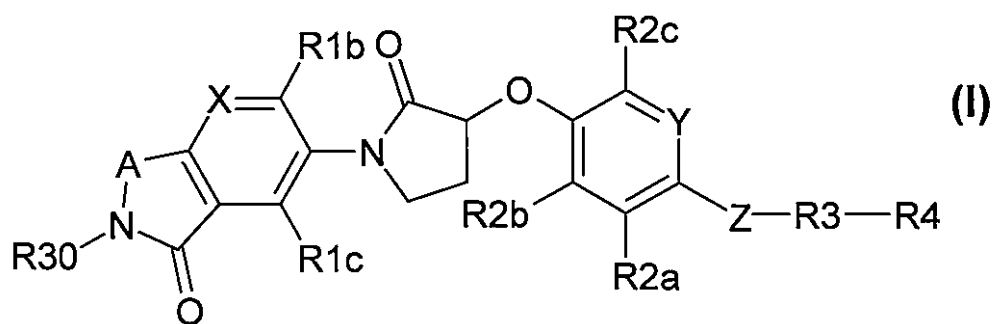
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



[ 式中、

X は、N または C - R 1 a であり；

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

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

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 O O R 1 3、C O N R 1 4 R 1 5、S (O)  
m R 1 6、O H、C N、(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  
アリアル環であり；

ここで、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル基、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル基、  
4 員、5 員または 6 員の複素環、フェニル、5 員または 6 員のヘテロアリアル環は、(C  
1 ~ 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  
1 ~ C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルオキシ、(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 および C l 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；

m は、0、1 または 2 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>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> ~ C  
6) - アルキル；O R 1 7、C O O R 1 9、および 4 員、5 員または 6 員の複素環のリス  
トから選択される 1 ~ 3 つの基で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - 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 - 原子と一緒にあって、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、C O O R 1 9 で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) - アルキル、または C N であり；

R 1 9 は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

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、F、C l、S F<sub>5</sub>、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルケニル  
、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 員のヘテロアリアル環で  
あり；

ここで、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル基、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル基、  
4 員、5 員または 6 員の複素環、フェニル、5 員または 6 員のヘテロアリアル環は、(C  
1 ~ 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  
1 ~ 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 および C l 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 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、前記式 I の化合物。

【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 に記載の式 I の化合物。

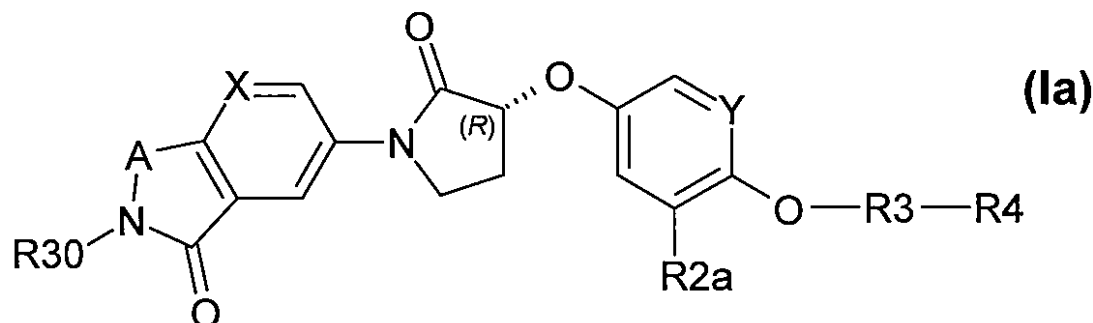
【請求項 3】

Z が、O である、請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物。

【請求項 4】

式 I a

【化 2】



[ 式中、

X は、N または C - R<sub>1a</sub> であり；

A は、C<sub>R31R33</sub>、NR<sub>31</sub>、C<sub>R31R33</sub> - NR<sub>31</sub> または C<sub>R31</sub> = N であり；

R<sub>30</sub> は、H または (C<sub>R11R12</sub>)<sub>n</sub> - R<sub>32</sub> であり；

R<sub>31</sub> は、H または (C<sub>R11R12</sub>)<sub>n</sub> - R<sub>32</sub> であり；

R<sub>33</sub> は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

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、COOR<sub>13</sub>、CONR<sub>14R15</sub>、S(O)<sub>m</sub>R<sub>16</sub>、OH、CN、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環、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>) - シクロアルキル基、4 員、5 員または 6 員の複素環、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>6</sub>) - アルキルオキシ、(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 および C<sub>1</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；

m は、0、1 または 2 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>3</sub> ~ C<sub>6</sub>) - シクロアルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル；OR<sub>17</sub>、COOR<sub>19</sub>、および 4 員、5 員または 6 員の複素環のリストから選択される 1 ~ 3 つの基で置換されている (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - 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<sub>16</sub> は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>17</sub> は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>18</sub> は、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R 1 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 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；

Y は、NまたはCH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、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルケニル、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>) - シクロアルキル基、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル基、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およびCl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 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 ~ 3のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

#### 【請求項5】

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い、  
請求項1 ~ 4のいずれか1項に記載の式Iの化合物。

#### 【請求項6】

X が、C - R 1 aであり；

A が、CR 3 1 R 3 3またはNR 3 1であり；

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

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

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

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、2または3であり；

R 3 2 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、COOR 1 3、CONR 1 4 R 1 5、S(O)<sub>m</sub> R 1 6、OH、CN、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、4員、5員もしくは6員の複素環、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>) - シクロアルキル基、4員、5員または6員の複素環、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>6</sub>) - アルキルオキシ、(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およびCl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；

m が、0、1または2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、または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 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 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 が、H または F 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；

Y が、N または CH であり；

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

p が、0、1、2、3 または 4 であり；

R 7、R 7' 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；

R 4 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルケニル、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 員のヘテロアリアル環であり；

ここで、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル基、(C<sub>5</sub> ~ C<sub>8</sub>) - ビシクロアルキル基、4 員、5 員または 6 員の複素環、フェニル、5 員または 6 員のヘテロアリアル環は、(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 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 8 が、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、

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 5 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 7】

式 I a の化合物であって、式中、

X が、C - R 1 a であり；

A が、CH<sub>2</sub>、CH (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルまたは ((C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルキル)<sub>2</sub> であり；

R 3 0 が、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 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、2 または 3 であり；

R 3 2 が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、COOR 1 3、CONR 1 4 R 1 5、S(O)<sub>m</sub> R 1 6、OH、CN、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル、4 員、5 員もしくは 6 員の複素環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリアル環であり；

ここで、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub>) - シクロアルキル基、4 員、5 員または 6 員の複素環、5 員または 6 員のヘテロアリアル環は、(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>6</sub>) - アルキルオキシ、(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 および Cl 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；

m が、0、1 または 2 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、または 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<sub>14</sub> および R<sub>15</sub> 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<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 員もしくは 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<sub>16</sub> が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>17</sub> が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>18</sub> が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>1a</sub> が、H または F であり；

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

Y が、N または CH であり；

R<sub>3</sub> が、CH<sub>2</sub> または CH<sub>2</sub> - 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；

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、

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 5 または 6 に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 8】

式 I a の化合物であって、式中、

X が、CH であり；

A が、CH<sub>2</sub> であり；

R<sub>30</sub> が、CH<sub>2</sub> - CONR<sub>14</sub>R<sub>15</sub> であり；

R<sub>14</sub> が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>15</sub> が、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキル、または 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；

R<sub>17</sub> が、H または (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) - アルキルであり；

R<sub>2a</sub> が、H または F であり；

Y が、N であり；

R<sub>3</sub> が、CH<sub>2</sub> または CH<sub>2</sub> - 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る、

化合物、または生理学的に許容されるその塩である、請求項 5 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

#### 【請求項 9】

Tert - ブチル 2 - [ 6 - [ (3R) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

2 - [ 6 - [ (3R) - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] プロパン酸、

2 - [ 5 - [ (3R) - 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 - 3 - オキソ - イソインドリン - 1 - イル ] 酢酸、

メチル 2 - [ 6 - [ (3R) - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] プロパノエート、

メチル 2 - [ 5 - [ (3R) - 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 - 3 - オキソ - イソインドリン - 1 - 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 ] - 2 - ( 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル ) イソインドリン - 1 - オン、

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 ] - 2 - メチル - 3 - オキソ - イソインドリン - 1 - 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 - プロピル - イソインドリン - 1 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - イソプロピルスルファニル - 3 - ピリジル ) オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 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 - ( 2 - メチルテトラゾール - 5 - イル ) イソインドリン - 1 - オン、

2 - [ 3 - [ ( 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 ] - 5 - オキソ - 7 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 6 - 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 ] - 1 , 1 - ジメチル - 3 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - 1 - メチル - 3 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - 1 - メチル - 3 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - 1 - メチル - 3 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

2 - [ 3 - [ ( 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 ] - 5 - オキソ - 7 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 6 - 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 ] - 4 - フルオロ - 2 - ( メチルスルホニルメチル ) イソインドリン - 1 - オン、

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 - 2 - [ ( 2 - メチルテトラゾール - 5 - イル ) メチル ] イソインドリン - 1 - オン、

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 - 2 - ( メチルスルフィニルメチル ) イソインドリン - 1 - オン、

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 - 2 - ( メチルスルファニルメチル ) イソインドリン - 1 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロボキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロボキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - 4 - フルオロ - 2 - メチル - イソインドリン - 1 - オン、

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 ] - 1 , 2 - ジヒドロインダゾール - 3 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 S ) - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 5 - [ ( 3 S ) - 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 - インダゾール - 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 ] - 1 - メチル - 3 - オキソ - インダゾール - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 3 - [ ( 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 ] - 5 - オキソ - 7 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 6 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

エチル 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

2 - tert - ブチル - 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - エトキシ - 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 - イソインドリン - 1 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - エトキシ - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

2 - tert - ブチル - 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 ] - 4 - フルオロ - イソインドリン - 1 - オン、

メチル 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセテート、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) イソインドリン - 1 - オン、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロボキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

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 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - N , N , 1 - トリメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 -  
 ジヒドロキナゾリン - 2 - カルボキサミド (ステレオマー I )、  
 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 ] - N , N , 1 - トリメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 -  
 ジヒドロキナゾリン - 2 - カルボキサミド (ステレオマー II )、  
 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 ] - N , N , 3 - トリメチル - 4 - オキソ - キナゾリ  
 ン - 2 - カルボキサミド、  
 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 ] - N , N - ジメチル - 4 - オキソ - 3 H - キナゾリ  
 ン - 2 - カルボキサミド、  
 N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - N - メチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 -  
 オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ]  
 ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、  
 2 - [ 2 - ( 4 - ヒドロキシ - 1 - ピペリジル ) - 2 - オキソ - エチル ] - 6 - [ ( 3 R )  
 ) - 2 - オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジル ]  
 オキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 1 - オン、  
 2 - [ 2 - ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチル ] - 6 - [ ( 3 R )  
 ) - 2 - オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジ  
 ル ] オキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 1 - オン、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 4 - ジ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 ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 -  
 イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 N , N - ジメチル - 2 - [ 5 - オキソ - 3 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2  
 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] -  
 7 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 6 - イル ] アセトアミド、  
 N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( トリ  
 フルオロメトキシ ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] ア  
 セトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 3 - シクロプロピルプロピル ) - 3 - ピリジル ]  
 オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イ  
 ル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - [ ( 1 R , 3 S , 5 S ) - 3 - ビシクロ [ 3 . 1  
 . 0 ] ヘキサニル ] オキシ ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 -  
 イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエチル ) - 3 - ピリジル ] オ  
 キシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル  
 ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2  
 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イ  
 ソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 5 - フルオロ - 3 -  
 ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリ  
 ン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 5 - メチル - 3 - ピ  
 リジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン  
 - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメチルアミノ ) - 3 - ピリジル ]  
 オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イ  
 ル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジル ) オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - ( 4 - プロパノイルフェノキシ ) ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - ( 4 - ペンタノイルフェノキシ ) ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - ( 4 - ブタノイルフェノキシ ) - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

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 ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 4 - フルオロベンゾイル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - フルオロ - 3 - ピリジル ) オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - [ [ ( 1 R , 3 R , 5 S ) - 3 - ビシクロ [ 3 . 1 . 0 ] ヘキサニル ] オキシ ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロプロピルメチルスルファニル ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - シクロプロピルスルファニル - 3 - ピリジル ) オキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 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 ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( トリフルオロメチルスルファニル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( 2 - ピリジルオキシ ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - ( 4 - モルホリノフェノキシ ) - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 4 - アセチルピペラジン - 1 - イル ) フェノキシ ]

- 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( ペンタフルオロ - { 6 } - スルファニル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 4 - メチルチアゾール - 2 - イル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 5 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - [ ( 4 - オキソチアゾール - 2 - イル ) アミノ ] フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 3 - イソプロピル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( ピロリジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 4 - イル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - ( 4 - オキサゾール - 5 - イルフェノキシ ) - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - ( 4 - ピラジン - 2 - イルフェノキシ ) ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( 1 - エチルテトラゾール - 5 - イル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( チアジアゾール - 4 - イル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 3 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメトキシ ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、

N , N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - ( 4 - チアゾール - 2 - イルフェノキシ ) ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N, N - ジメチル - 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - [ ( 3 - メチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル ) メトキシ ] フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

N, N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ 4 - ( テトラゾール - 1 - イル ) フェノキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

エチル 3 - [ 2 - クロロ - 5 - [ ( 3 R ) - 1 - [ 2 - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) - 2 - オキソ - エチル ] - 3 - オキソ - イソインドリン - 5 - イル ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 3 - イル ] オキシ - フェニル ] プロパノエート、

N, N - ジメチル - 2 - [ 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - ( 4 - ピロリジン - 1 - イルフェノキシ ) ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 5 - ブロモ - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N, N - ジメチル - アセトアミド、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ 4 - ( シクロプロパンカルボニル ) フェノキシ ] - 2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N, N - ジメチル - アセトアミド、

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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - 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 ] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] 酢酸、

2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] 酢酸、

2 - [ [ 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] アセチル ] アミノ ] 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 ] - 2 - ( 2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチル ) イソインドリン - 1 - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N - ( 2 - メトキシエチル ) 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 - [ 2 - ( 4 - ヒドロキシ - 1 - ピペリジル ) - 2 - オキソ - エチル ] イソインドリン - 1 - オン、

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 - [ 2 - ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチル ] イソインドリン - 1 - 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド、

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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - N - メチル - アセトアミド、

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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ]

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] - 4 - フルオロ - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド、  
 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - ( 2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチル ) イソインドリン - 1 - オン、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - メチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド、  
 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - ( 1H - テトラゾール - 5 - イルメチル ) アセトアミド、  
 メチル 2 - [ [ 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] アセチル ] アミノ ] 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] - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - [ 2 - ヒドロキシ - 1 - ( ヒドロキシメチル ) エチル ] アセトアミド、  
 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N , N - ビス ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド、  
 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - [ ( 2 S ) - 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ] アセトアミド、  
 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 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] - N - [ ( 2 R ) - 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ] アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - エトキシ - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] アセトニトリル、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - エトキシ - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル] 酢酸、  
 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - [ ( 3 - メチルオキセタン - 3 - イル ) メチル ] イソインドリン - 1 - オン、  
 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - メチル - イソインドリン - 1 - オン、  
 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - イソプロピル - イソインドリン - 1 - オン、

6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 - シクロプロピルエトキシ ) - 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 - 2 - ( 3 - ヒドロキシプロピル ) イソインドリン - 1 - オン、  
 2 - [ 4 - フルオロ - 1 - オキソ - 6 - [ ( 3 R ) - 2 - オキソ - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 2 - トリフルオロエトキシ ) - 3 - ピリジル ] オキシ ] ピロリジン - 1 - イル ] イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( 2 , 2 - ジメチルプロポキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミド、  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ ( 6 - アリルオキシ - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - アセトアミドおよび  
 2 - [ 6 - [ ( 3 R ) - 3 - [ [ 6 - ( シクロブチルメトキシ ) - 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 - 1 - オキソ - イソインドリン - 2 - イル ] - N , N - ジメチル - 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 10】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 9 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 11】

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、ビッグアニド、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、ホスホエノールピ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、ピ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 - 還元酵素阻害薬、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疑似剤、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 またはプロヒピチン標的ペプチド - 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 受容体拮抗薬、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（EC 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 - ノベータ - 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 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

メトホルミンをさらに含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

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 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

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 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

少なくとも 1 種の G P R 40 作動薬をさらに含み、ここで G P R 40 作動薬が、T U G - 424、P - 1736、P - 11187、J T T - 851、G W 9508、C N X - 011 - 67、A M - 1638 および A M - 5262 のリストから選択される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

エゼチミブをさらに含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

少なくとも 1 種の H M G - C o A 還元酵素阻害薬をさらに含み、ここで H M G - C o A 還元酵素阻害薬が、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 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

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 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

アカルボースをさらに含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 21】

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 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。