

【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3年4月15日(2021.4.15)

【公表番号】特表2020-514334(P2020-514334A)

【公表日】令和2年5月21日(2020.5.21)

【年通号数】公開・登録公報2020-020

【出願番号】特願2019-547663(P2019-547663)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/65 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/12 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)
C 0 7 D 277/28 (2006.01)
C 0 7 D 231/12 (2006.01)
C 0 7 D 231/56 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 275/02 (2006.01)
C 0 7 D 277/34 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)
C 0 7 D 263/32 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 0 7 D 401/04 (2006.01)
C 0 7 D 403/12 (2006.01)
C 0 7 D 403/04 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 213/74 (2006.01)
C 0 7 D 239/42 (2006.01)
C 0 7 D 413/04 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/415 (2006.01)
A 6 1 K 31/416 (2006.01)
A 6 1 K 31/425 (2006.01)
A 6 1 K 31/421 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)
A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)
 A 6 1 K 9/08 (2006.01)
 A 6 1 K 9/107 (2006.01)
 A 6 1 K 9/10 (2006.01)
 A 6 1 K 9/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/65
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 1/12
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 K 45/00
 C 0 7 D 417/12 C S P
 C 0 7 D 277/28
 C 0 7 D 231/12 C
 C 0 7 D 231/56 D
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 275/02
 C 0 7 D 277/34
 C 0 7 D 417/04
 C 0 7 D 263/32
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 403/04
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 417/14
 C 0 7 D 213/74
 C 0 7 D 239/42 Z
 C 0 7 D 413/04
 C 0 7 D 405/12
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/415
 A 6 1 K 31/416

A 6 1 K 31/425
 A 6 1 K 31/421
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/4178
 A 6 1 K 31/4155
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/4245
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 9/107
 A 6 1 K 9/10
 A 6 1 K 9/06

【手続補正書】

【提出日】令和3年3月4日(2021.3.4)

【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

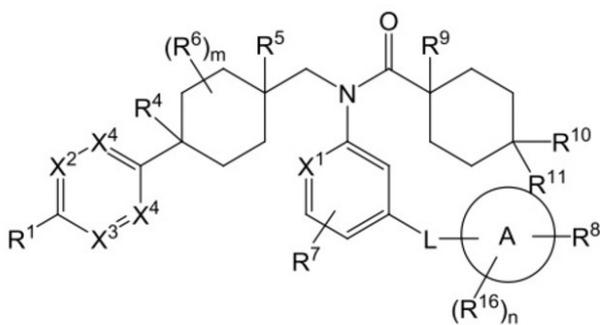
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の構造を有する化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物であって、

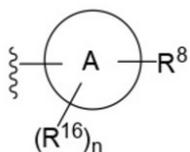
【化1】



式(I)

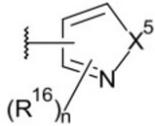
式中、

【化2】



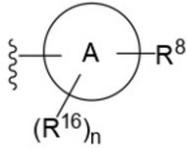
は、

【化 3】



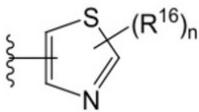
であり、
あるいは、

【化 4】



は、

【化 5】



であり、

あるいは、環 A は、オキサゾリル、フラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イソキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、あるいはチアジアゾリルである、5 員のヘテロアリールであり；

あるいは、環 A は、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、あるいはトリアジニルである、6 員のヘテロアリールであり；

あるいは、環 A はフェニルであり；

X^1 は CH または N であり；

R^1 は H、D、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}S(=O)_2$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-OC(=O)$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-C(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-NR^{15}C(=O)O$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-OC(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)N(R^{15})_2$ 、C₁-C₄ アルキル、C₂-C₄ アルケニル、C₂-C₄ アルキニル、C₁-C₄ アルコキシ、C₁-C₄ 重水素化アルキル、C₁-C₄ 重水素化アルコキシ、C₁-C₄ フルオロアルキル、C₁-C₄ フルオロアルコキシ、C₁-C₄ ヘテロアルキル、あるいは置換または非置換の単環式の C₂-C₅ ヘテロシクロアルキルであり；

X^2 は CR² または N であり；

R^2 は H、D、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}S(=O)_2$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-OC(=O)$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-C(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-NR^{15}C(=O)O$ (C₁-C₄ アルキル)、 $-OC(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)N(R^{15})_2$ 、C₁-C₄ アルキル、C₂-C₄ アルケニル、C₂-C₄ アルキニル、C₁-C₄ アルコキシ、C₁-C₄ 重水素化アルキル、C₁-C₄ 重水素化アルコキシ、C₁-C₄ フルオロアルキル、C₁-C₄ フルオロアルコキシ、C₁-C₄ ヘテロアルキルであり；

あるいは、 R^1 と R^2 は、介在する原子と一体となって、環に 0 - 3 の N 原子と 0 - 2 の O または S 原子を有する、置換または非置換の縮合 5 員環を形成し；

X^3 は CR³ または N であり；

R^3 は H、D、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}S(=O)_2$

($C_1 - C_4$ アルキル)、 $-OC(=O)(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-C(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)(C_1 - C_4$ アルキル)、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルコキシ、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルコキシ、あるいは $C_1 - C_4$ ヘテロアルキルであり；

X^4 はそれぞれ独立して CH または N であり；

X^5 は NR^8 または N であり；

R^4 は H 、 D 、 F 、または $-CH_3$ であり；

R^5 は H 、 D 、 F 、または $-CH_3$ であり；

あるいは、 R^4 と R^5 は一体となって、 $-CH_2-$ または $-CH_2CH_2-$ である架橋を形成し；

R^6 はそれぞれ独立して H 、 D 、 F 、 $-OH$ 、または $-CH_3$ であり；

m は 0 、 1 、または 2 であり；

R^7 は H 、 D 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルコキシ、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルコキシ、あるいは $C_1 - C_4$ ヘテロアルキルであり；

L は、存在しないか、 $-Y^2-L^1-$ 、 $-L^1-Y^2-$ 、シクロプロピレン、シクロブチレン、あるいはピシクロ[1.1.1]ペンチレンであり；

Y^2 は、存在しないか、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-S(=O)_2NR^{15}-$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C=C-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-C(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}C(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}C(=O)O-$ 、 $-NR^{15}C(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}S(=O)_2-$ 、あるいは $-NR^{15}-$ であり；

L^1 は存在しないか、置換または非置換の $C_1 - C_4$ アルキレンであり；

R^8 は H 、 D 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C(=O)(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-CO_2(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-C(=O)N(R^{15})_2$ 、 $-S(=O)_2(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-S(=O)_2N(R^{15})_2$ 、置換または非置換の $C_3 - C_6$ シクロアルキル、あるいは置換または非置換の単環式の $C_2 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、あるいは置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり；

R^9 は H 、 D 、あるいは $-CH_3$ であり；

R^{10} は $-CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)R^{14}$ 、 $-C(=O)OR^{14}$ 、 $-OC(=O)R^{14}$ 、 $-OC(=O)OR^{14}$ 、テトラゾリル、イミダゾール、 $-S(=O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}S(=O)_2R^{14}$ 、 $-C(=O)NR^{15}S(=O)_2R^{14}$ 、 $-S(=O)_2NR^{15}C(=O)R^{14}$ 、 $-CH_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)R^{14}$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)OR^{14}$ 、 $-OC(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-C(=NH)NH_2$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $-C(=O)NHC(=NH)NH_2$ 、 $-S(=O)_2OH$ 、あるいは $-OP(=O)(OR_{15})_2$ であり；

あるいは、 R^{10} は $-L^2-L^3-L^4-R^{13}$ であり；

L^2 は存在しないか、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキレン、あるいは置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキレンであり；

L^3 は存在しないか、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-NR^{15}-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}C(=O)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}C(=O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{15}C(=O)O-$ 、 $-OP(=O)(OR_{15})O-$ 、あるいは $-(OCH_2CH_2)_r-$ であり、 r は 1 または 2 であり；

L^4 は置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキレン、あるいは置換または非置換の $C_1 - C$

C_6 ヘテロアルキレンであり；

$R^{1\ 3}$ は H、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{1\ 2})_2$ 、 $-NR^{1\ 5}S(=O)_2R^{1\ 4}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{1\ 2})_2$ 、 $-SR^{1\ 2}$ 、 $-S(=O)R^{1\ 4}$ 、 $-S(=O)_2R^{1\ 4}$ 、 $-SO_3H$ 、 $-OP(=O)(OR^{1\ 5})_2$ 、 $-C(=O)R^{1\ 4}$ 、 $-OC(=O)R^{1\ 4}$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2R^{1\ 4}$ 、 $-OC(=O)OR^{1\ 4}$ 、 $-NR^{1\ 5}C(=O)R^{1\ 4}$ 、 $-C(=O)N(R^{1\ 2})_2$ 、 $-NR^{1\ 5}C(=O)OR^{1\ 4}$ 、 $-OC(=O)N(R^{1\ 2})_2$ 、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルコキシ、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、あるいは置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり；

$R^{1\ 1}$ は H、D、または $-CH_3$ であり；

あるいは、 R^9 と $R^{1\ 1}$ は一体となつて、 $-CH_2-$ または $-CH_2CH_2-$ である架橋を形成し；

$R^{1\ 2}$ はそれぞれ独立して、H、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、置換または非置換のベンジル、あるいは置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり；

$R^{1\ 4}$ は $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、置換または非置換のベンジル、あるいは、置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり；

$R^{1\ 5}$ は H あるいは置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキルであり；

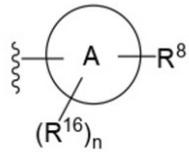
$R^{1\ 6}$ はそれぞれ独立して、H、D、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{1\ 5})_2$ 、 $-NR^{1\ 5}S(=O)_2(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-S(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)_2(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-OC(=O)(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-NR^{1\ 5}C(=O)(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)N(R^{1\ 5})_2$ 、 $-NR^{1\ 5}C(=O)O(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-OC(=O)N(R^{1\ 5})_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルコキシ、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換の単環式の $C_2 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、あるいは、置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり；および、 n は 0、1、または 2 であり、

ここで、「置換」との用語は、参照された基が、D、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NH(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)N(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)_2N(C_1 - C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ ヘテロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ フルオロアルコキシ、 $-SC_1 - C_4$ アルキル、 $-S(=O)C_1 - C_4$ アルキル、および $-S(=O)_2C_1 - C_4$ アルキルから独立して選択される 1 つ以上の置換基で置換されることを意味する、

化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

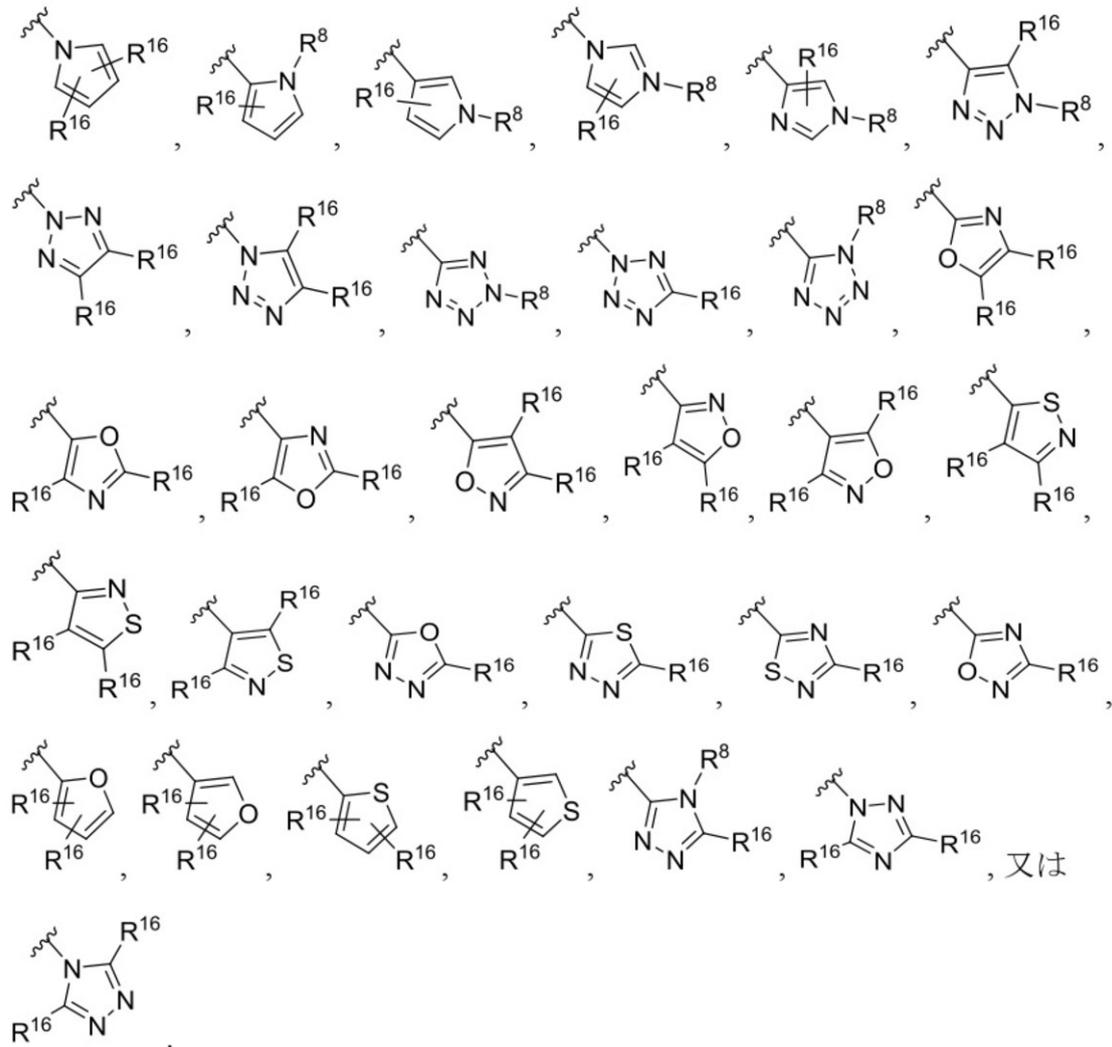
【請求項 2】

【化 6】



は、

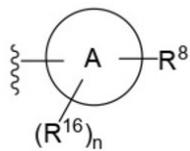
【化 7】



である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

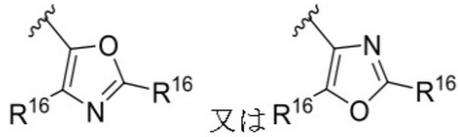
【請求項 3】

【化 8】



は、

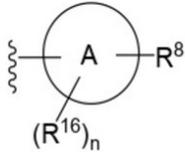
【化 9】



である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

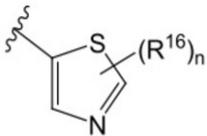
【請求項 4】

【化 10】



は、

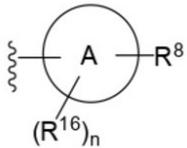
【化 11】



である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

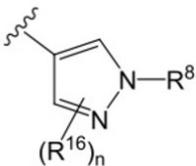
【請求項 5】

【化 12】



は、

【化 13】



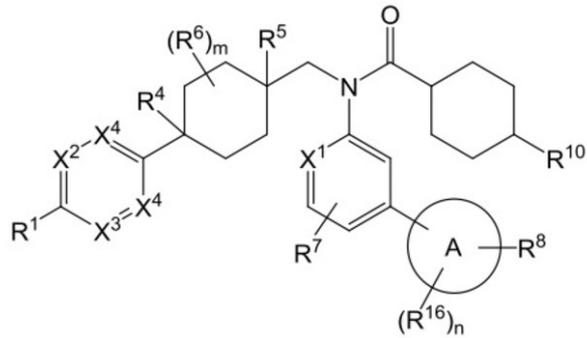
である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 6】

化合物が、式 (I I I) の構造、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物を有する、請求項 1 - 5 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物

°

【化 1 4】



式 (III).

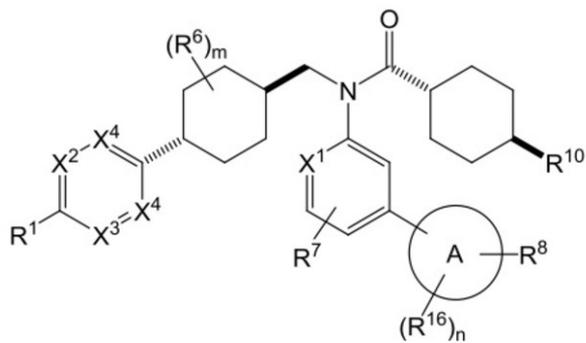
【請求項 7】

R⁴ は H であり、R⁵ は H であり、あるいは、R⁴ と R⁵ は一体となって、-CH₂CH₂- である架橋を形成する、請求項 1 - 6 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 8】

化合物が式 (IV) の構造、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物を有し、

【化 1 5】

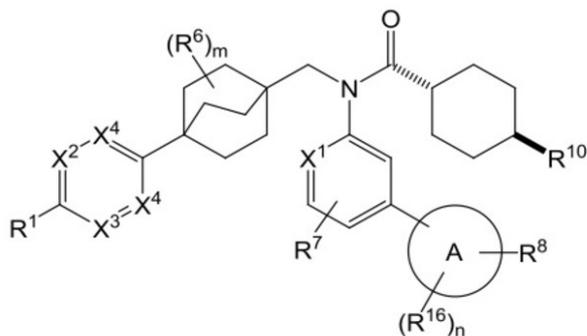


式 (IV);

または、

化合物が式 (V) の構造、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物を有する、請求項 7 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【化 1 6】



式 (V).

【請求項 9】

R¹⁰ は -CH₂OH、-CH₂CH₂OH、C₁-C₆ ヘテロアルキル、-CO₂H、-C(=O)R¹⁴、-C(=O)OR¹⁴、-OC(=O)R¹⁴、-OC(=O)OR¹⁴、-NR¹⁵S(=O)₂R¹⁴、-CH₂N(R¹²)₂、-NR¹⁵C(=O)R¹⁴、-C(=O)N(R¹²)₂、-NR¹⁵C(=O)OR¹⁴、-OC(=O)

) $N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-S(=O)_2OH$ 、あるいは $-OP(=O)(OR_{15})_2$ であり；

あるいは、 R^{10} は $-L^2-L^3-L^4-R^{13}$ であり；

L^2 は存在しないか、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、あるいは $-CH_2NHCH_2$ であり；

L^3 は存在しないか、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)-$ 、 $-C(=O)O-$ 、 $-OC(=O)-$ 、 $-OC(=O)O-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)O-$ 、 $-OP(=O)(OR_{15})O-$ 、あるいは $-(OCH_2CH_2)_r-$ であり、 r は1または2であり；

L^4 は $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2CH(OH)-$ 、 $-CH(CH_2OH)-$ 、 $-CH(CH_2OH)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH(OH)CH_2-$ 、 $-CH_2CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2NHCH_2-$ 、あるいは $-CH_2NHCH_2CH_2-$ である、請求項1-8のいずれか1つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項10】

R^{10} は、 $-CH_2OH$ 、 C_1-C_6 ヘテロアルキル、 $-CO_2H$ 、 $-NR^{15}C(=O)R^{14}$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{15}C(=O)OR^{14}$ 、または $-OC(=O)N(R^{12})_2$ であり；

あるいは、 R^{10} は $-L^2-L^3-L^4-R^{13}$ であり；

L^2 は存在しないか、または $-CH_2-$ であり；

L^3 は存在しないか、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-C(=O)NH-$ 、 $-NHC(=O)-$ 、 $-OC(=O)NH-$ 、または $-NHC(=O)O-$ であり；

L^4 は $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH(CH_2OH)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、あるいは $-CH_2CH(OH)CH_2-$ であり、および、

R^{13} は、 H 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-CH_2NHCH_3$ 、 $-CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)NHCH_3$ 、 $-OC(=O)NHCH_3$ 、 $NHC(=O)CH_3$ 、 $NHC(=O)OCH_3$ 、 $NHS(=O)_2CH_3$ 、 SO_2CH_3 、置換または非置換のシクロプロピル、置換または非置換のシクロブチル、置換または非置換のシクロペンチル、置換または非置換のシクロヘキシル、置換または非置換のフェニル、あるいは置換または非置換の単環式のヘテロアリールである、請求項1-8のいずれか1つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項11】

X^2 は CR^2 であり；

X^3 は CR^3 または N であり；

X^4 はそれぞれ CH であり；

あるいは、 X^4 はそれぞれ N であり；

あるいは、1つの X^4 は N であり、もう一方の X^4 は CH であり；

R^1 は H 、 D 、 F 、 Cl 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHS(=O)_2CH_3$ 、 $-OC(=O)CH_3$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-NHC(=O)CH_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-OCH(CH_3)_2$ 、 $-CD_3$ 、 $-OCD_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、

OCF₃、-OCH₂CF₃、-CH₂OH、-CH₂OCH₃、-CH₂OCH₂CH₃、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、または-CH₂N(CH₃)₂であり；
R²はH、D、F、Cl、-CN、-OH、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHS(=O)₂CH₃、-OC(=O)CH₃、-CO₂H、-CO₂CH₃、-NHC(=O)CH₃、-CH₃、-CH₂CH₃、-CH₂CH₂CH₃、-CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂CH₃、-CH₂CH(CH₃)₂、-C(CH₃)₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCH(CH₃)₂、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-OCH₂CF₃、-CH₂OH、-CH₂OCH₃、-CH₂OCH₂CH₃、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、または-CH₂N(CH₃)₂であり；

あるいは、R¹とR²は、介在する原子と一体となって、環に0-3のN原子と0-2のOまたはS原子を有する、置換または非置換の縮合5員環を形成し、すなわち、置換または非置換のジヒドロフラニル、置換または非置換のジオキサソリル、置換または非置換のフラニル、置換または非置換のチエニル、置換または非置換のピロリル、置換または非置換のオキサゾリル、置換または非置換のチアゾリル、置換または非置換のイミダゾリル、置換または非置換のピラゾリル、置換または非置換のトリアゾリル、置換または非置換のイソキサゾリル、あるいは置換または非置換のイソチアゾリルであり；

R³は、H、D、F、Cl、-CN、-OH、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-NHS(=O)₂CH₃、-OC(=O)(CH₃)、-CO₂H、-CO₂CH₃、-NHC(=O)CH₃、-CH₃、-CH₂CH₃、-CH₂CH₂CH₃、-CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂CH₃、-CH₂CH(CH₃)₂、-C(CH₃)₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCH(CH₃)₂、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-OCH₂CF₃、-CH₂OH、-CH₂OCH₃、-CH₂OCH₂CH₃、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、あるいは-CH₂N(CH₃)₂である、請求項1-10のいずれか1つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項12】

R¹はH、D、F、Cl、-CN、-OH、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-CH₃、-CH₂CH₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、あるいは-OCH₂CF₃であり；

R²はH、D、F、Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、あるいは-OCH₂CF₃であり；

R³はH、D、F、Cl、-CH₃、-OCH₃、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、あるいは-OCF₃である、請求項1-11のいずれか1つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項13】

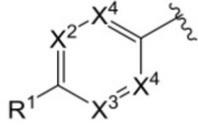
R¹は-OH、-NH₂、-NH(CH₃)、-N(CH₃)₂、-CH₃、-OCH₃、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、あるいは-OCH₂CF₃であり；

R²はH、D、F、Cl、-CH₃、-CD₃、-CH₂F、-CHF₂、あるいは-CF₃であり；

R³はHである、請求項1-11のいずれか1つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

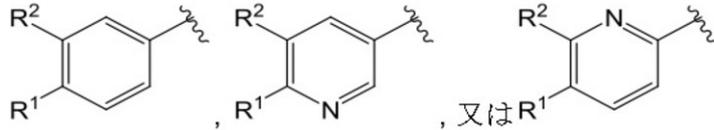
【請求項14】

【化 17】



は、

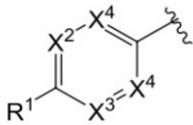
【化 18】



である、請求項 1 - 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

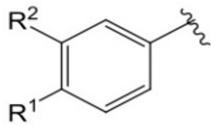
【請求項 15】

【化 19】



は、

【化 20】



である、請求項 1 - 13 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 16】

R^8 は H、D、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-CD_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CHFCH_3$ 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2CH_2OCH_3$ 、 $-CH_2CH_2NH_2$ 、 $-CH_2CH_2NHCH_3$ 、 $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)CH_3$ 、 $-C(=O)CH_2CH_3$ 、 $-C(=O)CH(CH_3)_2$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-CO_2CH_2CH_3$ 、 $-CO_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(=O)NHCH_3$ 、 $-S(=O)_2CH_3$ 、 $-S(=O)_2NHCH_3$ 、置換または非置換のシクロプロピル、置換または非置換のシクロブチル、置換または非置換のシクロペンチル、置換または非置換のシクロヘキシル、置換または非置換のオキセタニル、置換または非置換のテトラヒドロフラン、置換または非置換のテトラヒドロピラニル、あるいは置換または非置換のテトラヒドロチオピラニルであり；および、

R^{16} はそれぞれ独立して、H、D、F、Cl、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(CH_3)$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NHS(=O)_2CH_3$ 、 $-S(=O)_2CH_3$ 、 $-C(=O)CH_3$ 、 $-OC(=O)CH_3$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-NHC(=O)CH_3$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-CH=CH_2$ 、 $-CH=CHCH_3$ 、 $-C_6H_5$ 、 $-C_6H_4CH_3$ 、 $-OC$

H₃、-OCH₂CH₃、-OCH(CH₃)₂、-CD₃、-OCD₃、-CH₂F、
-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、
OCH₂CF₃、-CH₂OH、-CH₂CH₂OH、-CH₂OCH₃、-CH₂OC
H₂CH₃、-CH₂NH₂、-CH₂NHCH₃、または-CH₂N(CH₃)₂、置
換または非置換のシクロプロピル、置換または非置換のシクロブチル、置換または非置換
のシクロペンチル、置換または非置換のシクロヘキシル、置換または非置換のアジリジニ
ル、置換または非置換のアゼチジニル、置換または非置換のピロリジニル、置換または非
置換のピペリジニル、置換または非置換のテトラヒドロフラニル、置換または非置換のテ
トラヒドロピラニル、置換または非置換のテトラヒドロチオピラニル、置換または非置換
のモルホリニル、置換または非置換のチオモルホリニル、あるいは置換または非置換のピ
ペラジニルである、請求項 1 - 15 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的
に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 17】

R⁸ は -CH₃、-CH₂CH₃、-CH₂CH₂CH₃、-CH(CH₃)₂、-CH
₂CH₂CH₂CH₃、-CH(CH₃)CH₂CH₃、-CH₂CH(CH₃)₂、-
C(CH₃)₃、-CD₃、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-CH₂CF₃、-C
HFCH₃、-CH₂CH₂F、-CH₂CH₂OH、-CH₂CH₂OCH₃、-CH
₂CH₂NH₂、-CH₂CH₂NHCH₃、-CH₂CH₂N(CH₃)₂、置換また
は非置換のシクロプロピル、置換または非置換のシクロブチル、置換または非置換のシク
ロペンチル、置換または非置換のシクロヘキシル、置換または非置換のオキセタニル、置
換または非置換のテトラヒドロフラニル、あるいは置換または非置換のテトラヒドロピラ
ニルであり；および、

R¹⁶ はそれぞれ独立して、H、D、F、Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-CD₃、
-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、または-CH₂CF₃である、請求項 1 - 15 のい
ずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 18】

トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((ト
ランス - 4 - (6 - (ジメチルアミノ) ピリジン - 3 - イル) シクロヘキシル) メチル)
カルバモイル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((ト
ランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモ
イル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((ト
ランス - 4 - (3 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - インダゾール - 5 - イル) シクロヘキ
シル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル
) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル)
カルバモイル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル
) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル)
カルバモイル) シクロヘキシル カルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル
) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル)
カルバモイル) シクロヘキシル メチルカーボネート；

トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル
) ((トランス - 4 - (3 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - インダゾール - 5 - イル) シ
クロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

トランス - 4 - ((3 - (3 - シクロプロピルイソチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((ト
ランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カル
バモイル) シクロヘキシル メチルカルバメート；

メチル)カルバモイル)シクロヘキシル (2-ヒドロキシエチル)カルバメート;
トランス-4-(3-(1-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)フェニル)
(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)
カルバモイル)シクロヘキシル (1-メチルアゼチジン-3-イル)カルバメート;
トランス-4-(3-(1-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)フェニル)
(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)
カルバモイル)シクロヘキシル オキセタン-3-イルカルバメート;
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルオキサゾール-4-イル)フェニル)(
トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)カルバ
モイル)シクロヘキシル (2-ヒドロキシエチル)カルバメート;
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルオキサゾール-4-イル)フェニル)(
トランス-4-(5-メトキシ-6-メチルピリジン-2-イル)シクロヘキシル)メチ
ル)カルバモイル)シクロヘキシル (2-ヒドロキシエチル)カルバメート;
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルチアゾール-5-イル)フェニル)(
トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)カルバ
モイル)シクロヘキシル 3-ヒドロキシアゼチジン-1-カルボン酸塩;
2-(3-(3-(トランス-4-(3-(1-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)
フェニル)(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシ
ル)メチル)カルバモイル)シクロヘキシル)オキシ)カルボニル)アミノ)酢酸;
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルオキサゾール-4-イル)フェニル)(
トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)カルバ
モイル)シクロヘキシル 3-ヒドロキシアゼチジン-1-カルボン酸塩;
トランス-4-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキ
シル)メチル)(3-(2-メトキシチアゾール-5-イル)フェニル)カルバモイル)
シクロヘキシル ジメチルカルバメート;
トランス-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシ
ル)メチル)-4-(2-メトキシエトキシ)-N-(3-(2-メトキシチアゾール-
5-イル)フェニル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)シクロヘキシ
ル)メチル)-4-(3-メトキシプロポキシ)-N-(3-(2-メトキシチアゾール-
5-イル)フェニル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-4-(2-ヒドロキシエトキシ)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-
3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)-N-(3-(2-メトキシチアゾール-
5-イル)フェニル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-4-(3-ヒドロキシプロポキシ)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ
-3-メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)-N-(3-(2-メトキシチアゾール-
5-イル)フェニル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-N-(3-(2-シクロプロピルチアゾール-5-イル)フェニル)-4-(
2-(ジメチルアミノ)エトキシ)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチ
ルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-N-(3-(1-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)フェニル)
-4-(ヒドロキシメチル)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェ
ニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-4-(ヒドロキシメチル)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メ
チルフェニル)シクロヘキシル)メチル)-N-(3-(2-メトキシチアゾール-5-
イル)フェニル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-N-(3-(2-シクロプロピルチアゾール-5-イル)フェニル)-4-(
ヒドロキシメチル)-N-(3-(3-(トランス-4-(4-メトキシ-3-メチルフェニル)
シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルチアゾール-5-イル)フェニル)(
トランス-4-(3-(2-シクロプロピルチアゾール-5-イル)フェニル)(

トランス - メチル 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (6 - (ジメチルアミノ) ピリジン - 3 - イル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキサカルボン酸塩 ;

メチル 4 - (((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) カルバモイル) ピシクロ [2 . 2 . 2] オクタン - 1 - カルボン酸塩 ;

トランス - 4 - (ベンジルオキシ) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサカルボキサミド ;

トランス - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - 4 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - N - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサカルボキサミド ;

トランス - メチル 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキサカルボン酸塩 ;

トランス - メチル 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (6 - (ジメチルアミノ) ピリジン - 3 - イル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキサカルボン酸塩 ;

トランス - N¹ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N¹ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N⁴ - メチルシクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N - 1 - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N¹ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N¹ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N¹ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N⁴ , N⁴ - ジメチルシクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N¹ - (2 - ヒドロキシエチル) - N⁴ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N⁴ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N¹ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N⁴ - (2 - メトキシエチル) - N¹ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N¹ - (2 - (ジメチルアミノ) エチル) - N⁴ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N⁴ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) シクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

トランス - N¹ - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N¹ - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N⁴ - (メチルスルホニル) シクロヘキサ - 1 , 4 - ジカルボキサミド ;

メチル (トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) カルバメート ;

tert - ブチル (トランス - 4 - (((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) カルバモイル) シクロヘキシル) カルバメート ;

tert - ブチル ((トランス - 4 - (((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル) フェニル) カルバモイル) シクロヘキシル) メチル) カルバメート ;

トランス - 4 - (アミノメチル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - N - (3 - (2 - メトキシチアゾール - 5 - イル

- N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) - 4 - (メチルスルホンアミド) シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - N - (3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシアセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
2 - ((トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) アミノ) - 2 - オキソエチル メチルカルバメート ;
トランス - N - (3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシアセトアミド) - N - ((4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) ピシクロ [2 . 2 . 2] オクタン - 1 - イル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルオキサゾール - 4 - イル) フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシアセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル (2 - アセトアミドエチル) カルバメート ;
トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル (2 - (メチルスルホンアミド) エチル) カルバメート ;
;
トランス - 4 - ((3 - (1 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル - メチルエタン - 1 , 2 - ジイルジカルバメート ;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロパンアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) - 4 - (2 - ヒドロキシプロパンアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
N - (トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) オキセタン - 3 - カルボキサミド ;
トランス - 4 - (2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) アセトアミド) - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - 4 - (2 - (1 H - イミダゾール - 2 - イル) アセトアミド) - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) シクロヘキサカルボキサミド ;
N - (トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) - 1 - メチルアゼチジン - 3 - カルボキサミド ;
N - (トランス - 4 - ((3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル) シクロヘキシル) メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) アゼチジン - 3 - カルボキサミド ;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル) フェニル) - N - (

(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (2 - (メチルスルホンアミド)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (1 - シクロプロピル - 1H - ピラゾール - 4 - イル)フェニル)
- N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)
- 4 - (2 - (メチルスルホニル)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (1 - シクロプロピル - 1H - ピラゾール - 4 - イル)フェニル)
- N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)
- 4 - (2 - (メチルスルホンアミド)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミ
ド;
メチル (2 - ((トランス - 4 - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)
)フェニル)((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)
)メチル)カルバモイル)シクロヘキシル)アミノ) - 2 - オキソエチル)カルバメート
;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - 4 - (
2 - (ジメチルアミノ)アセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 -
メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - 4 - (2 - アミノアセトアミド) - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール -
5 - イル)フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)
シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (2 - (メチルアミノ)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - 4 - (2 - アセトアミドアセトアミド) - N - (3 - (2 - シクロプロピルチ
アゾール - 5 - イル)フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチル
フェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (2 - (メチルチオ)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (2 - (メチルスルフィニル)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (3 - (メチルスルフィニル)プロパンアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (3 - (メチルスルホニル)プロパンアミド)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - 4 - (2 - (1H - イミダゾール - 4 - イル)アセトアミド) - N - (3 - (
2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 -
メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミ
ド;
トランス - N - (3 - (1 - シクロプロピル - 1H - ピラゾール - 4 - イル)フェニル)
- 4 - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)アセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4
- メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサ
ミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - 4 - (
2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)アセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキ
シ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - 4 - (
2 - (3 - ヒドロキシプロポキシ)アセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4 - メト

キシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド ;
トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - 4 - (
2 - (2 - (ジメチルアミノ)エトキシ)アセトアミド) - N - ((トランス - 4 - (4
- メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサ
ミド ;

トランス - 4 - (2 - (2 - アミノエトキシ)アセトアミド) - N - (3 - (2 - シクロ
プロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - ((トランス - 4 - (4 - メトキシ -
3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル)シクロヘキサカルボキサミド ;

トランス - N - (3 - (2 - シクロプロピルチアゾール - 5 - イル)フェニル) - N - (
(トランス - 4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル)シクロヘキシル)メチル) - 4
- (2 - (2 - (メチルアミノ)エトキシ)アセトアミド)シクロヘキサカルボキサミ
ド ;

である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

【請求項 19】

請求項 1 - 18 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物、および少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 20】

哺乳動物における肝臓の疾患または疾病、

哺乳動物における肝線維症、

哺乳動物における肝臓炎、あるいは、

哺乳動物における胃腸の疾患または疾病

を処置または予防するための製剤の製造における、請求項 1 - 18 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物の使用。

【請求項 21】

肝臓の疾患または疾病が、原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、胆汁うっ滞、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH)、または非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD)、脂肪肝 (脂肪症)、肝硬変、アルコール性肝炎、肝内胆汁うっ滞、または肝外胆汁うっ滞であり、

肝線維症は、C 型肝炎ウイルス (HCV)、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH)、原発性硬化性胆管炎 (PSC)、肝硬変、ウイルソン病、B 型肝炎ウイルス (HBV)、HIV 関連の脂肪性肝炎と肝硬変、慢性ウイルス性肝炎、非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD)、アルコール性脂肪性肝炎 (ASH)、原発性胆汁性肝硬変 (PBC)、あるいは胆汁性肝硬変と診断された哺乳動物におけるものであり、

肝臓炎は、C 型肝炎ウイルス (HCV)、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH)、原発性硬化性胆管炎 (PSC)、肝硬変、ウイルソン病、B 型肝炎ウイルス (HBV)、HIV 関連の脂肪性肝炎と肝硬変、慢性ウイルス性肝炎、非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD)、アルコール性脂肪性肝炎 (ASH)、原発性胆汁性肝硬変 (PBC)、あるいは胆汁性肝硬変と診断された哺乳動物におけるものであり、

肝臓炎は炎症性腸疾患と診断された哺乳動物におけるものであり、

肝臓炎は胃腸管の炎症に関連付けられ、

胃腸の疾患または疾病は、壊死性腸炎、胃炎、潰瘍性大腸炎、クローン病、炎症性腸疾患、過敏性腸症候群、胃腸炎、放射線により誘発された小腸炎、偽膜性大腸炎、化学療法により誘発された小腸炎、胃食道逆流症 (GERD)、消化性潰瘍、非潰瘍性消化不良 (NUD)、セリアック病、腸のセリアック病、術後の炎症、胃発癌、移植片対宿主病、あるいはこれらの任意の組み合わせであり、もしくは、

胃腸の疾患または疾病は、下痢を伴う過敏性腸症候群 (IBS-D)、便秘を伴う過敏性腸症候群 (IBS-C)、混合型 IBS (IBS-M)、分類不能型 IBS (IBS-U)、あるいは胆汁酸性下痢 (BAD) である、請求項 20 に記載の使用。