

【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31年4月25日(2019.4.25)

【公表番号】特表2018-508513(P2018-508513A)

【公表日】平成30年3月29日(2018.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2018-012

【出願番号】特願2017-545300(P2017-545300)

【国際特許分類】

C 07 D 277/38 (2006.01)

A 61 P 19/00 (2006.01)

A 61 K 31/426 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

C 07 D 417/04 (2006.01)

C 12 N 5/077 (2010.01)

【F I】

C 07 D 277/38

A 61 P 19/00

A 61 K 31/426

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/506

C 07 D 417/04 C S P

C 12 N 5/077 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成31年3月14日(2019.3.14)

【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

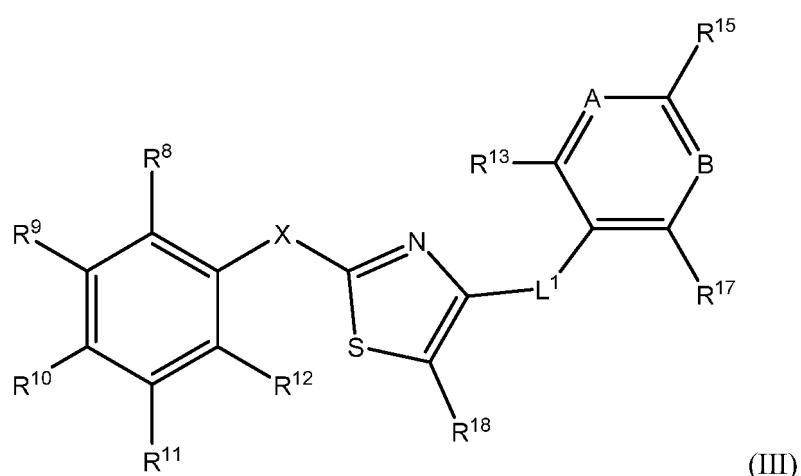
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式(I)の化合物またはその医薬として許容される塩。

【化1】



[式中、

A は、N であり；

B は、N であり；

X は、O、NR^{1~9} または S であり；

L¹ は、結合または置換されているか置換されていない C₁ - C₃ アルキレンであり；

n₁ は、0 から 4 の整数であり；

m₁ および v₁ は独立に、1 または 2 であり；

R⁸ は、水素、ハロゲン、-CX^{8~1}₃、-CHX^{8~1}₂、-CH₂X^{8~1}、-CN、-SO_n₁R^{8A}、-SO_v₁NR^{8B}R^{8C}、-NHNR^{8B}R^{8C}、-ONR^{8B}R^{8C}、-NHC(O)NHNR^{8B}R^{8C}、-NHC(O)NR^{8B}R^{8C}、-N(O)_m₁、-NR^{8B}R^{8C}、-C(O)R^{8D}、-C(O)OR^{8D}、-C(O)NR^{8B}R^{8C}、-OR^{8A}、-NR^{8B}SO₂R^{8A}、-NR^{8B}C(O)R^{8D}、-NR^{8B}C(O)OR^{8D}、-NR^{8B}OR^{8D}、-OCX^{8~1}₃、-OCHX^{8~1}₂

、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R⁹ は、水素、ハロゲン、-CX^{9~1}₃、-CHX^{9~1}₂、-CH₂X^{9~1}、-CN、-SO_n₁R^{9A}、-SO_v₁NR^{9B}R^{9C}、-NHNR^{9B}R^{9C}、-ONR^{9B}R^{9C}、-NHC(O)NHNR^{9B}R^{9C}、-NHC(O)NR^{9B}R^{9C}、-N(O)_m₁、-NR^{9B}R^{9C}、-C(O)R^{9D}、-C(O)OR^{9D}、-C(O)NR^{9B}R^{9C}、-OR^{9A}、-NR^{9B}SO₂R^{9A}、-NR^{9B}C(O)R^{9D}、-NR^{9B}C(O)OR^{9D}、-NR^{9B}OR^{9D}、-OCX^{9~1}₃、-OCHX^{9~1}₂

、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1~0} は、水素、ハロゲン、-CX^{1~0~1}₃、-CHX^{1~0~1}₂、-CH₂X^{1~0~0}₁、-CN、-SO_n₁R^{1~0~0A}、-SO_v₁NR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-NHNR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-ONR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-NHC(O)NHNR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-NHC(O)NR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-N(O)_m₁、-NR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-C(O)R^{1~0~0D}、-C(O)OR^{1~0~0D}、-C(O)NR^{1~0~0B}R^{1~0~0C}、-OR^{1~0~0A}、-NR^{1~0~0B}SO₂R^{1~0~0A}、-NR^{1~0~0B}C(O)R^{1~0~0D}、-NR^{1~0~0B}C(O)OR^{1~0~0D}、-NR^{1~0~0B}OR^{1~0~0D}、-OCX^{1~0~1}₃、-OCHX^{1~0~1}₂、置換されている

か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1~1} は、水素、ハロゲン、-CX^{1~1~1}₃、-CHX^{1~1~1}₂、-CH₂X^{1~1~1}₁、-CN、-SO_n₁R^{1~1~1A}、-SO_v₁NR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-NHNR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-ONR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-NHC(O)NHNR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-NHC(O)NR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-N(O)_m₁、-NR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-C(O)R^{1~1~1D}、-C(O)OR^{1~1~1D}、-C(O)NR^{1~1~1B}R^{1~1~1C}、-OR^{1~1~1A}、-NR^{1~1~1B}SO₂R^{1~1~1A}、-NR^{1~1~1B}C(O)R^{1~1~1D}、-NR^{1~1~1B}C(O)OR^{1~1~1D}、-NR^{1~1~1B}OR^{1~1~1D}、-OCX^{1~1~1}₃、-OCHX^{1~1~1}₂、置換されている

か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1~2} は、水素、ハロゲン、-CX^{1~2~1}₃、-CHX^{1~2~1}₂、-CH₂X^{1~2~2}₁、-CN、-SO_n₁R^{1~2~2A}、-SO_v₁NR^{1~2~2B}R^{1~2~2C}、-NHNR^{1~2~2B}R^{1~2~2C}

$R^{1\sim 2}C$ 、 $-ONR^{1\sim 2}B$ $R^{1\sim 2}C$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1\sim 2}B$ $R^{1\sim 2}C$ 、 $-NHC(O)NR^{1\sim 2}B$ $R^{1\sim 2}C$ 、 $-N(O)_m$ I_1 、 $-NR^{1\sim 2}B$ $R^{1\sim 2}C$ 、 $-C(O)R^{1\sim 2}D$ 、 $-C(O)OR^{1\sim 2}D$ 、 $-C(O)NR^{1\sim 2}B$ $R^{1\sim 2}C$ 、 $-OR^{1\sim 2}A$ 、 $-NR^{1\sim 2}B$ $SO_2R^{1\sim 2}A$ 、 $-NR^{1\sim 2}B$ $C(O)R^{1\sim 2}D$ 、 $-NR^{1\sim 2}B$ $C(O)OR^{1\sim 2}D$ 、 $-NR^{1\sim 2}B$ $OR^{1\sim 2}D$ 、 $-OCX^{1\sim 2\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{1\sim 2\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

$R^{1\sim 3}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1\sim 3\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{1\sim 3\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{1\sim 3}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n\sim 1}R^{1\sim 3}A$ 、 $-SO_{v\sim 1}NR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-NHNR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-NHC(O)NR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-N(O)_m$ I_1 、 $-NR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-C(O)R^{1\sim 3}D$ 、 $-C(O)OR^{1\sim 3}D$ 、 $-C(O)NR^{1\sim 3}B$ $R^{1\sim 3}C$ 、 $-OR^{1\sim 3}A$ 、 $-NR^{1\sim 3}B$ $SO_2R^{1\sim 3}A$ 、 $-NR^{1\sim 3}B$ $C(O)R^{1\sim 3}D$ 、 $-NR^{1\sim 3}B$ $C(O)OR^{1\sim 3}D$ 、 $-NR^{1\sim 3}B$ $OR^{1\sim 3}D$ 、 $-OCX^{1\sim 3\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{1\sim 3\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

$R^{1\sim 5}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1\sim 5\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{1\sim 5\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{1\sim 5}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n\sim 1}R^{1\sim 5}A$ 、 $-SO_{v\sim 1}NR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-NHNR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-NHC(O)NR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-N(O)_m$ I_1 、 $-NR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-C(O)R^{1\sim 5}D$ 、 $-C(O)OR^{1\sim 5}D$ 、 $-C(O)NR^{1\sim 5}B$ $R^{1\sim 5}C$ 、 $-OR^{1\sim 5}A$ 、 $-NR^{1\sim 5}B$ $SO_2R^{1\sim 5}A$ 、 $-NR^{1\sim 5}B$ $C(O)R^{1\sim 5}D$ 、 $-NR^{1\sim 5}B$ $C(O)OR^{1\sim 5}D$ 、 $-NR^{1\sim 5}B$ $OR^{1\sim 5}D$ 、 $-OCX^{1\sim 5\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{1\sim 5\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

$R^{1\sim 7}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1\sim 7\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{1\sim 7\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{1\sim 7}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n\sim 1}R^{1\sim 7}A$ 、 $-SO_{v\sim 1}NR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-NHNR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-NHC(O)NR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-N(O)_m$ I_1 、 $-NR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-C(O)R^{1\sim 7}D$ 、 $-C(O)OR^{1\sim 7}D$ 、 $-C(O)NR^{1\sim 7}B$ $R^{1\sim 7}C$ 、 $-OR^{1\sim 7}A$ 、 $-NR^{1\sim 7}B$ $SO_2R^{1\sim 7}A$ 、 $-NR^{1\sim 7}B$ $C(O)R^{1\sim 7}D$ 、 $-NR^{1\sim 7}B$ $C(O)OR^{1\sim 7}D$ 、 $-NR^{1\sim 7}B$ $OR^{1\sim 7}D$ 、 $-OCX^{1\sim 7\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{1\sim 7\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

$R^{1\sim 8}$ は、水素、ハロゲン、 $-CX^{1\sim 8\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{1\sim 8\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{1\sim 8}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n\sim 1}R^{1\sim 8}A$ 、 $-SO_{v\sim 1}NR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-NHNR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-NHC(O)NHNR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-NHC(O)NR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-N(O)_m$ I_1 、 $-NR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-C(O)R^{1\sim 8}D$ 、 $-C(O)OR^{1\sim 8}D$ 、 $-C(O)NR^{1\sim 8}B$ $R^{1\sim 8}C$ 、 $-OR^{1\sim 8}A$ 、 $-NR^{1\sim 8}B$ $SO_2R^{1\sim 8}A$ 、 $-NR^{1\sim 8}B$ $C(O)R^{1\sim 8}D$ 、 $-NR^{1\sim 8}B$ $C(O)OR^{1\sim 8}D$ 、 $-NR^{1\sim 8}B$ $OR^{1\sim 8}D$ 、 $-OCX^{1\sim 8\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{1\sim 8\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換

されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19D} は、水素、-COR^{19D}、-C(O)NHR^{19B}R^{19C}、-C(O)OR^{19D}、-SO₂R^{19A}、C(O)NR^{19B}R^{19C}、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19A} は、独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19AF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19AF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19B} は、独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19BF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19BF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19C} は、独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19CF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19CF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19D} は、独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19DF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19DF}-置換されているか置換されていないヘテロアリール、

いるか置換されていない複素環アルキル、R^{1~9}D^F-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{1~9}D^F-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R⁸A、R⁸B、R⁸C、R⁸D、R⁹A、R⁹B、R⁹C、R⁹D、R¹⁰A、R¹
0B、R¹⁰C、R¹⁰D、R¹¹A、R¹¹B、R¹¹C、R¹¹D、R¹²A、R¹
2B、R¹²C、R¹²D、R¹³A、R¹³B、R¹³C、R¹³D、R¹⁵A、R¹
5B、R¹⁵C、R¹⁵D、R¹⁷A、R¹⁷B、R¹⁷C、R¹⁷D、R¹⁸A、R¹
8B、R¹⁸CおよびR¹⁸Dは独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-C
Br₃、-CI₃、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、
-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)
NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)
) - OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OC
HF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、置換されているか置換され
ていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換され
れているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換され
ていない複素環アルキル、置換されているか置換され
ていないアリール、または置換されているか置換され
ていないヘテロアリールであり；同一の窒素原子に結合しているR⁸B、R⁸C、R⁹B、R⁹C
、R¹⁰B、R¹⁰C、R¹¹B、R¹¹C、R¹²B、R¹²C、R¹³B、R¹³C
、R¹⁵B、R¹⁵C、R¹⁷B、R¹⁷C、R¹⁸BおよびR¹⁸C置換基は、任意に
一緒にになって、置換されているか置換され
ていない複素環アルキルまたは置換され
ているか置換され
ていないヘテロアリールを形成しても良く；

R¹⁹AF、R¹⁹BF、R¹⁹CFおよびR¹⁹DFは、独立に、オキソ、ハロゲン
、-CF₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH
、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC=(O)
NHNH₂、-NHC=(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC=(O)H、-N
HC(O)-OH、-NHOH、-OCF₃、-OCHF₂、置換され
ていないアルキル
、置換され
ていないヘテロアルキル、置換され
ていないシクロアルキル、置換され
ていない複素環アルキル、置換され
ていないアリール、または置換され
ていないヘテロアリール
であり；

X^{8~1}、X^{9~1}、X^{10~1}、X^{11~1}、X^{12~1}、X^{13~1}、X^{15~1}
、X^{17~1}およびX^{18~1}は独立に、-Cl、-Br、-Iまたは-Fである。]

【請求項2】

L¹が結合であり、XがNHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹³、R¹⁵、R¹⁷およびR¹⁸が独立に、水素である、請求項2に記載の化合物
。

【請求項4】

R⁸、R⁹、R¹¹およびR¹²が独立に、水素である、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R¹⁰が水素、フッ素、塩素、ヨウ素、-CX^{10~1}₃、-CHX^{10~1}₂、-C
H₂X^{10~1}、-CN、-SO_n₁R¹⁰A、-SO_v₁NR¹⁰B R¹⁰C、-NH
NR¹⁰B R¹⁰C、-ONR¹⁰B R¹⁰C、-NHC(O)NHN R¹⁰B R¹⁰C
、-NHC(O)NR¹⁰B R¹⁰C、-N(O)m₁、-NR¹⁰B R¹⁰C、-C(O)
R¹⁰D、-C(O)OR¹⁰D、-C(O)NR¹⁰B R¹⁰C、-OR¹⁰A、
-NR¹⁰B SO₂R¹⁰A、-NR¹⁰B C(O)R¹⁰D、-NR¹⁰B C(O)O
R¹⁰D、-NR¹⁰B OR¹⁰D、-OCX^{10~1}₃、-OCHX^{10~1}₂、置換
されているか置換され
ていないアルキル、置換
されているか置換
され
ていないシクロアルキル、置換
されているか置換
され
ていない複素環アルキル、置換
されているか置換
され
ていないアリール、または置換
されているか置換
され
ていないヘテロアリール
である、請求項1に記載の化合物。

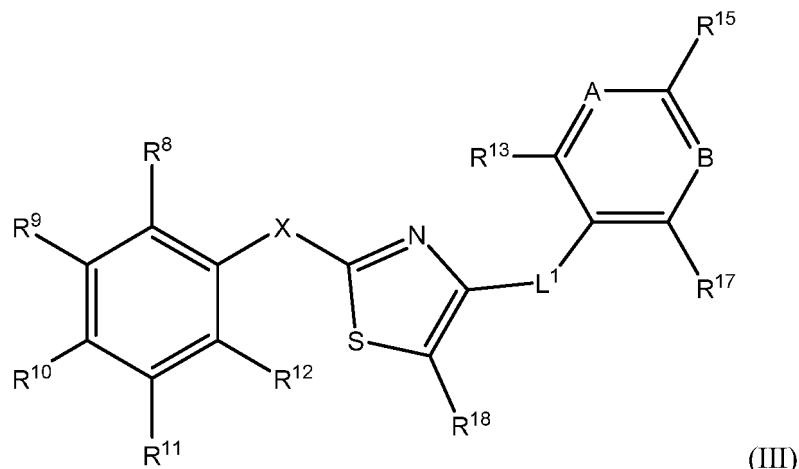
【請求項 6】

R¹⁰ がフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

処置を必要とする対象での疾患治療のための医薬組成物であって、式(III)の化合物またはその医薬として許容される塩：

【化 2】



[式中、

A は、C R¹~⁴ または N であり；

B は、C R¹~⁶ または N であり；

X は、O、N R¹~⁹ または S であり；

L¹ は、結合または置換されているか置換されていない C₁~C₃ アルキレンであり；

n₁ は、0 から 4 の整数であり；

m₁ および v₁ は独立に、1 または 2 であり；

R⁸ は、水素、ハロゲン、-CX⁸₁³、-CHX⁸₁²、-CH₂X⁸₁¹、-CN、-SO_n₁R⁸^A、-SO_v₁NR⁸^BR⁸^C、-NHNR⁸^BR⁸^C、-ONR⁸^BR⁸^C、-NHC(O)NHNR⁸^BR⁸^C、-NHC(O)NR⁸^BR⁸^C、-N(O)_m₁、-NR⁸^BR⁸^C、-C(O)R⁸^D、-C(O)OR⁸^D、-C(O)NR⁸^BR⁸^C、-OR⁸^A、-NR⁸^BSO₂R⁸^A、-NR⁸^BC(O)R⁸^D、-NR⁸^BC(O)OR⁸^D、-NR⁸^BOR⁸^D、-OCX⁸₁³、-OCHX⁸₁²、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R⁹ は、水素、ハロゲン、-CX⁹₁³、-CHX⁹₁²、-CH₂X⁹₁¹、-CN、-SO_n₁R⁹^A、-SO_v₁NR⁹^BR⁹^C、-NHNR⁹^BR⁹^C、-ONR⁹^BR⁹^C、-NHC(O)NHNR⁹^BR⁹^C、-NHC(O)NR⁹^BR⁹^C、-N(O)_m₁、-NR⁹^BR⁹^C、-C(O)R⁹^D、-C(O)OR⁹^D、-C(O)NR⁹^BR⁹^C、-OR⁹^A、-NR⁹^BSO₂R⁹^A、-NR⁹^BC(O)R⁹^D、-NR⁹^BC(O)OR⁹^D、-NR⁹^BOR⁹^D、-OCX⁹₁³、-OCHX⁹₁²、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R¹⁰ は、水素、ハロゲン、-CX¹⁰₁³、-CHX¹⁰₁²、-CH₂X¹⁰₁¹、-CN、-SO_n₁R¹⁰^A、-SO_v₁NR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHNR¹⁰^BR¹⁰^C、-ONR¹⁰^C、-ONR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHC(O)NHNR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHC(O)NR¹⁰^BR¹⁰^C、-N(O)_m₁、-NR¹⁰^BR¹⁰^C、-C(O)R¹⁰^D、-C(O)OR¹⁰^D、-C(O)NR¹⁰^BR¹⁰^C、-OR¹⁰^A、-NR¹⁰^BSO₂R¹⁰^A、-NR¹⁰^BC(O)R¹⁰^D、-NR¹⁰^BC(O)OR¹⁰^D、-NR¹⁰^BOR¹⁰^D、-OCX¹⁰₁³、-OCHX¹⁰₁²、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

(O)NR^{1 0}B R^{1 0}C、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 0}B R^{1 0}C、-C(O)R^{1 0}D、-C(O)OR^{1 0}D、-C(O)NR^{1 0}B R^{1 0}C、-OR^{1 0}A、-NR^{1 0}B SO₂R^{1 0}A、-NR^{1 0}B C(O)R^{1 0}D、-NR^{1 0}B C(O)OR^{1 0}D、-NR^{1 0}B OR^{1 0}D、-OCX^{1 0 . 1}₃、-OCHX^{1 0 . 1}₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1 1}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 1 . 1}₃、-CHX^{1 1 . 1}₂、-CH₂X^{1 1 . 1}₁、-CN、-SO_{n 1}R^{1 1 A}、-SO_{v 1}NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHNR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-ONR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHC(O)NHNR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHC(O)NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-C(O)R^{1 1 D}、-C(O)OR^{1 1 D}、-C(O)NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-OR^{1 1 A}、-NR^{1 1 B}SO₂R^{1 1 A}、-NR^{1 1 B}C(O)R^{1 1 D}、-NR^{1 1 B}C(O)OR^{1 1 D}、-NR^{1 1 B}OR^{1 1 D}、-OCX^{1 1 . 1}₃、-OCHX^{1 1 . 1}₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1 2}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 2 . 1}₃、-CHX^{1 2 . 1}₂、-CH₂X^{1 2 . 1}₁、-CN、-SO_{n 1}R^{1 2 A}、-SO_{v 1}NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHNR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-ONR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHC(O)NHNR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHC(O)NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-C(O)R^{1 2 D}、-C(O)OR^{1 2 D}、-C(O)NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-OR^{1 2 A}、-NR^{1 2 B}SO₂R^{1 2 A}、-NR^{1 2 B}C(O)R^{1 2 D}、-NR^{1 2 B}C(O)OR^{1 2 D}、-NR^{1 2 B}OR^{1 2 D}、-OCX^{1 2 . 1}₃、-OCHX^{1 2 . 1}₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1 3}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 3 . 1}₃、-CHX^{1 3 . 1}₂、-CH₂X^{1 3 . 1}₁、-CN、-SO_{n 1}R^{1 3 A}、-SO_{v 1}NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHNR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-ONR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHC(O)NHNR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHC(O)NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-C(O)R^{1 3 D}、-C(O)OR^{1 3 D}、-C(O)NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-OR^{1 3 A}、-NR^{1 3 B}SO₂R^{1 3 A}、-NR^{1 3 B}C(O)R^{1 3 D}、-NR^{1 3 B}C(O)OR^{1 3 D}、-NR^{1 3 B}OR^{1 3 D}、-OCX^{1 3 . 1}₃、-OCHX^{1 3 . 1}₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1 4}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 4 . 1}₃、-CHX^{1 4 . 1}₂、-CH₂X^{1 4 . 1}₁、-CN、-SO_{n 1}R^{1 4 A}、-SO_{v 1}NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHNR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-ONR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHC(O)NHNR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHC(O)NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-C(O)R^{1 4 D}、-C(O)OR^{1 4 D}、-C(O)NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-OR^{1 4 A}、-NR^{1 4 B}SO₂R^{1 4 A}、-NR^{1 4 B}C(O)R^{1 4 D}、-NR^{1 4 B}C(O)OR^{1 4 D}、-NR^{1 4 B}OR^{1 4 D}、-OCX^{1 4 . 1}₃、-OCHX^{1 4 . 1}₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{15} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{15\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{15\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{15\cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{15A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHNR^{15B}$ R^{15C} 、 $-ONR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-C(O)R^{15D}$ 、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}SO_2R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}OR^{15D}$ 、 $-OCX^{15\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{15\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{16} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{16\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{16\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{16\cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{16A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHNR^{16B}$ R^{16C} 、 $-ONR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-C(O)R^{16D}$ 、 $-C(O)OR^{16D}$ 、 $-C(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-OR^{16A}$ 、 $-NR^{16B}SO_2R^{16A}$ 、 $-NR^{16B}C(O)R^{16D}$ 、 $-NR^{16B}C(O)OR^{16D}$ 、 $-NR^{16B}OR^{16D}$ 、 $-OCX^{16\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{16\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{17} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{17\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{17\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{17\cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{17A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHNR^{17B}$ R^{17C} 、 $-ONR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-C(O)R^{17D}$ 、 $-C(O)OR^{17D}$ 、 $-C(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-OR^{17A}$ 、 $-NR^{17B}SO_2R^{17A}$ 、 $-NR^{17B}C(O)R^{17D}$ 、 $-NR^{17B}C(O)OR^{17D}$ 、 $-NR^{17B}OR^{17D}$ 、 $-OCX^{17\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{17\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{18} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{18\cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{18\cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{18\cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{18A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHNR^{18B}$ R^{18C} 、 $-ONR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-C(O)R^{18D}$ 、 $-C(O)OR^{18D}$ 、 $-C(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-OR^{18A}$ 、 $-NR^{18B}SO_2R^{18A}$ 、 $-NR^{18B}C(O)R^{18D}$ 、 $-NR^{18B}C(O)OR^{18D}$ 、 $-NR^{18B}OR^{18D}$ 、 $-OCX^{18\cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{18\cdot 1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19} は、水素、 $-COR^{19D}$ 、 $-C(O)NHNR^{19B}R^{19C}$ 、 $-C(O)O$ R^{19D} 、 $-SO_2R^{19A}$ 、 $C(O)NR^{19B}R^{19C}$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル

、置換されているか置換されていないアリール、置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19A} は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-HNHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、 R^{19AF} -置換されているか置換されていないアルキル、 R^{19AF} -置換されているか置換されていないヘテロアルキル、 R^{19AF} -置換されているか置換されていないシクロアルキル、 R^{19AF} -置換されているか置換されていないアリール、または R^{19AF} -置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19B} は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-HNHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、 R^{19BF} -置換されているか置換されていないアルキル、 R^{19BF} -置換されているか置換されていないヘテロアルキル、 R^{19BF} -置換されているか置換されていないシクロアルキル、 R^{19BF} -置換されているか置換されていないアリール、または R^{19BF} -置換されているか置換されていないヘテロアリール；

R^{19C} は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-HNHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、 R^{19CF} -置換されているか置換されていないアルキル、 R^{19CF} -置換されているか置換されていないヘテロアルキル、 R^{19CF} -置換されているか置換されていないシクロアルキル、 R^{19CF} -置換されているか置換されていないアリール、または R^{19CF} -置換されているか置換されていないヘテロアリール；

R^{19D} は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-HNHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、 R^{19DF} -置換されているか置換されていないアルキル、 R^{19DF} -置換されているか置換されていないヘテロアルキル、 R^{19DF} -置換されているか置換されていないシクロアルキル、 R^{19DF} -置換されているか置換されていないアリール、または R^{19DF} -置換されているか置換されていないヘテロアリール；

R^8A 、 R^8B 、 R^8C 、 R^8D 、 R^9A 、 R^9B 、 R^9C 、 R^9D 、 R^{10A} 、 R^{10B} 、 R^{10C} 、 R^{10D} 、 R^{11A} 、 R^{11B} 、 R^{11C} 、 R^{11D} 、 R^{12A} 、 R^{12B} 、 R^{12C} 、 R^{12D} 、 R^{13A} 、 R^{13B} 、 R^{13C} 、 R^{13D} 、 R^{14A} 、 R^{14B} 、 R^{14C} 、 R^{14D} 、 R^{15A} 、 R^{15B} 、 R^{15C} 、 R^{15D} 、 R^{16A} 、 R^{16B}

R_6^B 、 $R^{1-6}C$ 、 $R^{1-6}D$ 、 $R^{1-7}A$ 、 $R^{1-7}B$ 、 $R^{1-7}C$ 、 $R^{1-7}D$ 、 $R^{1-8}A$ 、 $R^{1-8}B$ 、 $R^{1-8}C$ および $R^{1-8}D$ は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)-OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCH₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；同一の窒素原子に結合している R^{8B} 、 R^{8C} 、 R^{9B} 、 R^{9C} 、 R^{10B} 、 R^{10C} 、 R^{11B} 、 R^{11C} 、 R^{12B} 、 R^{12C} 、 R^{13B} 、 R^{13C} 、 R^{14B} 、 R^{14C} 、 R^{15B} 、 R^{15C} 、 R^{16B} 、 R^{16C} 、 R^{17B} 、 R^{17C} 、 R^{18B} および R^{18C} 置換基は、任意に一緒にあって、置換されているか置換されていない複素環アルキルまたは置換されているか置換されていないヘテロアリールを形成しても良く；

R^{19AF} 、 R^{19BF} 、 R^{19CF} および R^{19DF} は、独立に、オキソ、ハロゲン、-CF₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)-OH、-NHOH、-OCF₃、-OCHF₂、置換されていないアルキル、置換されていないヘテロアルキル、置換されていないシクロアルキル、置換されていない複素環アルキル、置換されていないアリール、または置換されていないヘテロアリールであり；

X^{8-1} 、 X^{9-1} 、 X^{10-1} 、 X^{11-1} 、 X^{12-1} 、 X^{13-1} 、 X^{14-1} 、 X^{15-1} 、 X^{16-1} 、 X^{17-1} および X^{18-1} は独立に、-Cl、-Br、-Iまたは-Fである。]

を含む医薬組成物。

【請求項8】

細胞でのgp130受容体の活性を調節する、細胞でのMYC発現を増加させる、または細胞でのpSTAT3発現を増加させるための医薬組成物であって、結合部位1gp130受容体作動薬を含む医薬組成物。

【請求項9】

前記gp130受容体の活性が増加する請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記gp130受容体の活性が低下または阻害される請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記活性がホモ二量体化である請求項9に記載の医薬組成物。

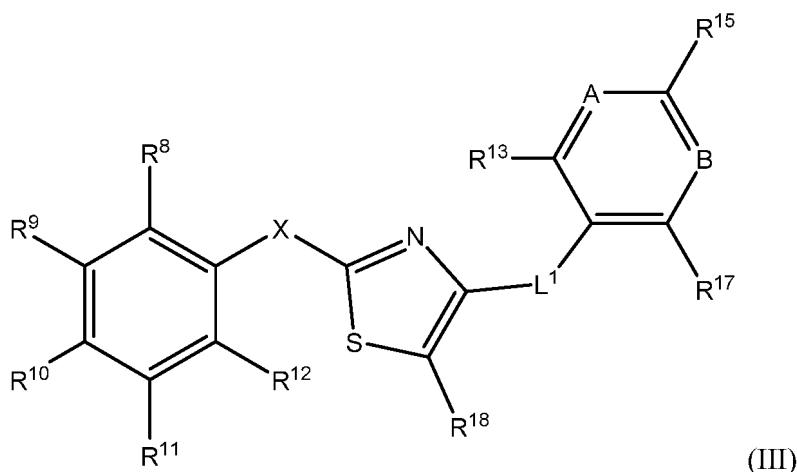
【請求項12】

前記細胞が軟骨細胞である請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項13】

前記結合部位1gp130受容体作動薬が式(I)(II)(III)の化合物またはその医薬として許容される塩である請求項8に記載の医薬組成物。

【化3】



[式中、

Aは、C₁～C₄またはNであり；Bは、C₁～C₆またはNであり；Xは、O、NR₁～NR₉またはSであり；L₁は、結合または置換されているか置換されていないC₁～C₃アルキレンであり；n₁は、0から4の整数であり；m₁およびv₁は独立に、1または2であり；

R⁸は、水素、ハロゲン、-CX⁸₁₃、-CHX⁸₁₂、-CH₂X⁸₁、-CN、-SO_n₁R⁸^A、-SO_v₁NR⁸^BR⁸^C、-NHNR⁸^BR⁸^C、-ONR⁸^BR⁸^C、-NHC(O)NHNR⁸^BR⁸^C、-NHC(O)NR⁸^BR⁸^C、-N(O)_m₁、-NR⁸^BR⁸^C、-C(O)R⁸^D、-C(O)OR⁸^D、-C(O)NR⁸^BR⁸^C、-OR⁸^A、-NR⁸^BSO₂R⁸^A、-NR⁸^BC(O)R⁸^D、-NR⁸^BC(O)OR⁸^D、-NR⁸^BOR⁸^D、-OCX⁸₁₃、-OCHX⁸₁₂

、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R⁹は、水素、ハロゲン、-CX⁹₁₃、-CHX⁹₁₂、-CH₂X⁹₁、-CN、-SO_n₁R⁹^A、-SO_v₁NR⁹^BR⁹^C、-NHNR⁹^BR⁹^C、-ONR⁹^BR⁹^C、-NHC(O)NHNR⁹^BR⁹^C、-NHC(O)NR⁹^BR⁹^C、-N(O)_m₁、-NR⁹^BR⁹^C、-C(O)R⁹^D、-C(O)OR⁹^D、-C(O)NR⁹^BR⁹^C、-OR⁹^A、-NR⁹^BSO₂R⁹^A、-NR⁹^BC(O)R⁹^D、-NR⁹^BC(O)OR⁹^D、-NR⁹^BOR⁹^D、-OCX⁹₁₃、-OCHX⁹₁₂

、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R¹⁰は、水素、ハロゲン、-CX¹⁰₁₃、-CHX¹⁰₁₂、-CH₂X¹⁰₁、-CN、-SO_n₁R¹⁰^A、-SO_v₁NR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHNR¹⁰^BR¹⁰^C、-ONR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHC(O)NHNR¹⁰^BR¹⁰^C、-NHC(O)NR¹⁰^BR¹⁰^C、-N(O)_m₁、-NR¹⁰^BR¹⁰^C、-C(O)R¹⁰^D、-C(O)OR¹⁰^D、-C(O)NR¹⁰^BR¹⁰^C、-OR¹⁰^A、-NR¹⁰^BSO₂R¹⁰^A、-NR¹⁰^BC(O)R¹⁰^D、-NR¹⁰^BC(O)OR¹⁰^D、-NR¹⁰^BOR¹⁰^D、-OCX¹⁰₁₃、-OCHX¹⁰₁₂、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素

環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{1 1}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 1 . 1}₃、-CHX^{1 1 . 1}₂、-CH₂X^{1 1}₁
 ·¹、-CN、-SO_{n 1}R^{1 1 A}、-SO_{v 1}NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHNR^{1 1 B}
 R^{1 1 C}、-ONR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHC(O)NHNR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-NHC
 (O)NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-C(O)R^{1 1}
 D、-C(O)OR^{1 1 D}、-C(O)NR^{1 1 B}R^{1 1 C}、-OR^{1 1 A}、-NR^{1 1}
 B SO₂R^{1 1 A}、-NR^{1 1 B}C(O)R^{1 1 D}、-NR^{1 1 B}C(O)OR^{1 1 D}、
 -NR^{1 1 B}OR^{1 1 D}、-OCX^{1 1 . 1}₃、-OCHX^{1 1 . 1}₂、置換されている
 か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換
 されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素
 環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換
 被していないヘテロアリールであり；

R^{1 2}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 2 . 1}₃、-CHX^{1 2 . 1}₂、-CH₂X^{1 2}
 ·¹、-CN、-SO_{n 1}R^{1 2 A}、-SO_{v 1}NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHNR^{1 2 B}
 R^{1 2 C}、-ONR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHC(O)NHNR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-NHC
 (O)NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-C(O)R^{1 2}
 D、-C(O)OR^{1 2 D}、-C(O)NR^{1 2 B}R^{1 2 C}、-OR^{1 2 A}、-NR^{1 2}
 B SO₂R^{1 2 A}、-NR^{1 2 B}C(O)R^{1 2 D}、-NR^{1 2 B}C(O)OR^{1 2 D}、
 -NR^{1 2 B}OR^{1 2 D}、-OCX^{1 2 . 1}₃、-OCHX^{1 2 . 1}₂、置換されている
 か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換
 されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素
 環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換
 被していないヘテロアリールであり；

R^{1 3}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 3 . 1}₃、-CHX^{1 3 . 1}₂、-CH₂X^{1 3}
 ·¹、-CN、-SO_{n 1}R^{1 3 A}、-SO_{v 1}NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHNR^{1 3 B}
 R^{1 3 C}、-ONR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHC(O)NHNR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-NHC
 (O)NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-C(O)R^{1 3}
 D、-C(O)OR^{1 3 D}、-C(O)NR^{1 3 B}R^{1 3 C}、-OR^{1 3 A}、-NR^{1 3}
 B SO₂R^{1 3 A}、-NR^{1 3 B}C(O)R^{1 3 D}、-NR^{1 3 B}C(O)OR^{1 3 D}、
 -NR^{1 3 B}OR^{1 3 D}、-OCX^{1 3 . 1}₃、-OCHX^{1 3 . 1}₂、置換されている
 か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換
 されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素
 環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換
 被していないヘテロアリールであり；

R^{1 4}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 4 . 1}₃、-CHX^{1 4 . 1}₂、-CH₂X^{1 4}
 ·¹、-CN、-SO_{n 1}R^{1 4 A}、-SO_{v 1}NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHNR^{1 4 B}
 R^{1 4 C}、-ONR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHC(O)NHNR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-NHC
 (O)NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-C(O)R^{1 4}
 D、-C(O)OR^{1 4 D}、-C(O)NR^{1 4 B}R^{1 4 C}、-OR^{1 4 A}、-NR^{1 4}
 B SO₂R^{1 4 A}、-NR^{1 4 B}C(O)R^{1 4 D}、-NR^{1 4 B}C(O)OR^{1 4 D}、
 -NR^{1 4 B}OR^{1 4 D}、-OCX^{1 4 . 1}₃、-OCHX^{1 4 . 1}₂、置換されている
 か置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換
 されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素
 環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換
 被していないヘテロアリールであり；

R^{1 5}は、水素、ハロゲン、-CX^{1 5 . 1}₃、-CHX^{1 5 . 1}₂、-CH₂X^{1 5}
 ·¹、-CN、-SO_{n 1}R^{1 5 A}、-SO_{v 1}NR^{1 5 B}R^{1 5 C}、-NHNR^{1 5 B}
 R^{1 5 C}、-ONR^{1 5 B}R^{1 5 C}、-NHC(O)NHNR^{1 5 B}R^{1 5 C}、-NHC
 (O)NR^{1 5 B}R^{1 5 C}、-N(O)_{m 1}、-NR^{1 5 B}R^{1 5 C}、-C(O)R^{1 5}

R^{15} は、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}SO_2R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}OR^{15D}$ 、 $-OCX^{15.1}_3$ 、 $-OCHX^{15.1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{16} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{16.1}_3$ 、 $-CHX^{16.1}_2$ 、 $-CH_2X^{16.1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{16A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHNR^{16B}$ 、 R^{16C} 、 $-ONR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-C(O)R^{16D}$ 、 $-C(O)OR^{16D}$ 、 $-C(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-OR^{16A}$ 、 $-NR^{16B}SO_2R^{16A}$ 、 $-NR^{16B}C(O)R^{16D}$ 、 $-NR^{16B}C(O)OR^{16D}$ 、 $-NR^{16B}OR^{16D}$ 、 $-OCX^{16.1}_3$ 、 $-OCHX^{16.1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{17} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{17.1}_3$ 、 $-CHX^{17.1}_2$ 、 $-CH_2X^{17.1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{17A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHNR^{17B}$ 、 R^{17C} 、 $-ONR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-C(O)R^{17D}$ 、 $-C(O)OR^{17D}$ 、 $-C(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-OR^{17A}$ 、 $-NR^{17B}SO_2R^{17A}$ 、 $-NR^{17B}C(O)R^{17D}$ 、 $-NR^{17B}C(O)OR^{17D}$ 、 $-NR^{17B}OR^{17D}$ 、 $-OCX^{17.1}_3$ 、 $-OCHX^{17.1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{18} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{18.1}_3$ 、 $-CHX^{18.1}_2$ 、 $-CH_2X^{18.1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{18A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHNR^{18B}$ 、 R^{18C} 、 $-ONR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-C(O)R^{18D}$ 、 $-C(O)OR^{18D}$ 、 $-C(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-OR^{18A}$ 、 $-NR^{18B}SO_2R^{18A}$ 、 $-NR^{18B}C(O)R^{18D}$ 、 $-NR^{18B}C(O)OR^{18D}$ 、 $-NR^{18B}OR^{18D}$ 、 $-OCX^{18.1}_3$ 、 $-OCHX^{18.1}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19} は、水素、 $-COR^{19D}$ 、 $-C(O)NHNR^{19B}R^{19C}$ 、 $-C(O)OR^{19D}$ 、 $-SO_2R^{19A}$ 、 $C(O)NR^{19B}R^{19C}$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19A} は独立に、水素、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHSO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-$

NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19AF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19AF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19AF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19B}は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19BF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19BF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19BF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19C}は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19CF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19CF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19CF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{19D}は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-CN、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19DF}-置換されているか置換されていないアルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19DF}-置換されているか置換されていないアリール、またはR^{19DF}-置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；

R^{8A}、R^{8B}、R^{8C}、R^{8D}、R^{9A}、R^{9B}、R^{9C}、R^{9D}、R^{10A}、R^{10B}、R^{10C}、R^{10D}、R^{11A}、R^{11B}、R^{11C}、R^{11D}、R^{12A}、R^{12B}、R^{12C}、R^{12D}、R^{13A}、R^{13B}、R^{13C}、R^{13D}、R^{14A}、R^{14B}、R^{14C}、R^{14D}、R^{15A}、R^{15B}、R^{15C}、R^{15D}、R^{16A}、R^{16B}、R^{16C}、R^{16D}、R^{17A}、R^{17B}、R^{17C}、R^{17D}、R^{18A}、R^{18B}、R^{18C}およびR^{18D}は独立に、水素、ハロゲン、-CF₃、-CCl₃、-CBr₃、-CI₃、-OH、-NH₂、-COOH、-CONH₂、-NO₂、-SH、-SO₃H、-SO₄H、-SO₂NH₂、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NHSO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)-OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、

HF_2 、 $-\text{OCHCl}_2$ 、 $-\text{OCHBr}_2$ 、 $-\text{OCHI}_2$ 、置換されているか置換されていないアルキル、置換されているか置換されていないヘテロアルキル、置換されているか置換されていないシクロアルキル、置換されているか置換されていない複素環アルキル、置換されているか置換されていないアリール、または置換されているか置換されていないヘテロアリールであり；同一の窒素原子に結合している $\text{R}^{8\text{B}}$ 、 $\text{R}^{8\text{C}}$ 、 $\text{R}^{9\text{B}}$ 、 $\text{R}^{9\text{C}}$ 、 $\text{R}^{10\text{B}}$ 、 $\text{R}^{10\text{C}}$ 、 $\text{R}^{11\text{B}}$ 、 $\text{R}^{11\text{C}}$ 、 $\text{R}^{12\text{B}}$ 、 $\text{R}^{12\text{C}}$ 、 $\text{R}^{13\text{B}}$ 、 $\text{R}^{13\text{C}}$ 、 $\text{R}^{14\text{B}}$ 、 $\text{R}^{14\text{C}}$ 、 $\text{R}^{15\text{B}}$ 、 $\text{R}^{15\text{C}}$ 、 $\text{R}^{16\text{B}}$ 、 $\text{R}^{16\text{C}}$ 、 $\text{R}^{17\text{B}}$ 、 $\text{R}^{17\text{C}}$ 、 $\text{R}^{18\text{B}}$ および $\text{R}^{18\text{C}}$ 置換基は、任意に一緒にあって、置換されているか置換されていない複素環アルキルまたは置換されているか置換されていないヘテロアリールを形成しても良く；

$\text{R}^{19\text{A}}\text{F}$ 、 $\text{R}^{19\text{B}}\text{F}$ 、 $\text{R}^{19\text{C}}\text{F}$ および $\text{R}^{19\text{D}}\text{F}$ は、独立に、オキソ、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SO}_3\text{H}$ 、 $-\text{SO}_4\text{H}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHNH}_2$ 、 $-\text{ONH}_2$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{H}$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{NHOH}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、置換されていないアルキル、置換されていないヘテロアルキル、置換されていないシクロアルキル、置換されていない複素環アルキル、置換されていないアリール、または置換されていないヘテロアリールであり；

$\text{X}^{8\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{9\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{10\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{11\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{12\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{13\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{14\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{15\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{16\text{.1}}$ 、 $\text{X}^{17\text{.1}}$ および $\text{X}^{18\text{.1}}$ は独立に、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{I}$ または $-\text{F}$ である。】

【請求項 14】

L^1 が結合であり、 X が NH である請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

A が $\text{CR}^{1\text{.4}}$ であり； B が $\text{CR}^{1\text{.6}}$ である請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

A が N であり； B が $\text{CR}^{1\text{.6}}$ であり； $\text{R}^{1\text{.6}}$ が水素である請求項 13 に記載の医薬組成物。

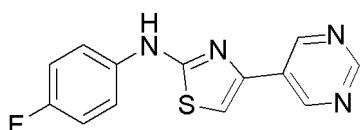
【請求項 17】

A および B が独立に N であり； $\text{R}^{1\text{.0}}$ がフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

構造が、

【化 4】



である、請求項 1 に記載の化合物。

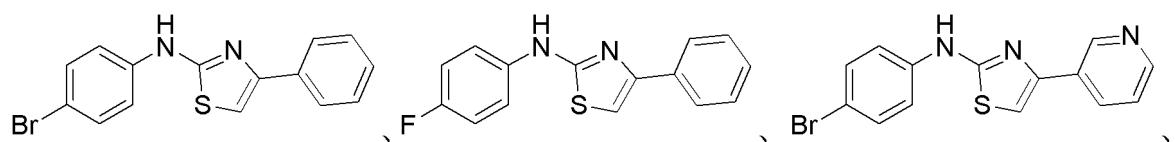
【請求項 19】

疾患が、軟骨変性疾患、関節表面損傷又は関節炎である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

化合物が、

【化 5】



である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

局所接触用に製剤化された、請求項 7～17、19 及び 20 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

経皮的送達用である、請求項7～17、19及び20のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

アブリケータスティック、液剤、懸濁液、乳濁液、ゲル、クリーム、軟膏、ペースト、ゼリー剤、塗布剤、粉剤又はエアロゾルとして製剤化された、請求項22に記載の医薬組成物。