

【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 0 7 D 277/38 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 1 2 N 5/077 (2010.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/38

A 6 1 P 19/00

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 417/04 C S P

C 1 2 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

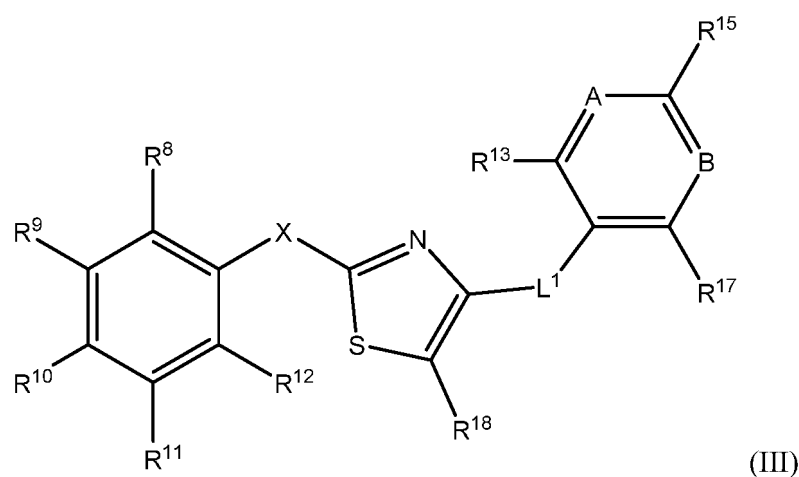
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式 (I I 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^{19} または S であり；

L^1 は、結合または置換されているか置換されていない $\text{C}_1 - \text{C}_3$ アルキレンであり；

n_1 は、0 から 4 の整数であり；

m_1 および v_1 は独立に、1 または 2 であり；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{8 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{8 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{8A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHN}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{ONR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{8D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{OR}^{8A}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{SO}_2\text{R}^{8A}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{8D}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{OCX}^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{8 \cdot 1}_2$

、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^9 は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{9 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{9 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{9A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHN}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{ONR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{9D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{OR}^{9A}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{SO}_2\text{R}^{9A}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{9D}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{OCX}^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{9 \cdot 1}_2$

、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^{10} は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{10 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{10 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{10A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHN}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{ONR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{OR}^{10A}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{SO}_2\text{R}^{10A}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{10D}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{OCX}^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{10 \cdot 1}_2$ 、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^{11} は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{11 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{11 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{11 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{11A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{NHN}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{ONR}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11B}\text{R}^{11C}$ 、 $-\text{OR}^{11A}$ 、 $-\text{NR}^{11B}\text{SO}_2\text{R}^{11A}$ 、 $-\text{NR}^{11B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11D}$ 、 $-\text{NR}^{11B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11D}$ 、 $-\text{NR}^{11B}\text{OR}^{11D}$ 、 $-\text{OCX}^{11 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{11 \cdot 1}_2$ 、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^{12} は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{12 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{12 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{12 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{12A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{12B}\text{R}^{12C}$ 、 $-\text{NHN}^{12B}\text{R}^{12C}$

R^{12C} 、 $-ONR^{12B}$ R^{12C} 、 $-NHC(O)NHN R^{12B}$ R^{12C} 、 $-NHC(O)NR^{12B}$ R^{12C} 、 $-N(O)_m$ R^{12C} 、 $-NR^{12B}$ R^{12C} 、 $-C(O)R^{12D}$ 、 $-C(O)OR^{12D}$ 、 $-C(O)NR^{12B}$ R^{12C} 、 $-OR^{12A}$ 、 $-NR^{12B}$ $SO_2 R^{12A}$ 、 $-NR^{12B}$ $C(O)R^{12D}$ 、 $-NR^{12B}$ $C(O)OR^{12D}$ 、 $-NR^{12B}$ OR^{12D} 、 $-OCX^{12 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{12 \cdot 1}_2$ 、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^{13} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{13 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{13 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{13 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_n$ R^{13A} 、 $-SO_v$ R^{13B} R^{13C} 、 $-NHN R^{13B}$ R^{13C} 、 $-ONR^{13B}$ R^{13C} 、 $-NHC(O)NHN R^{13B}$ R^{13C} 、 $-NHC(O)NR^{13B}$ R^{13C} 、 $-N(O)_m$ R^{13C} 、 $-NR^{13B}$ R^{13C} 、 $-C(O)R^{13D}$ 、 $-C(O)OR^{13D}$ 、 $-C(O)NR^{13B}$ R^{13C} 、 $-OR^{13A}$ 、 $-NR^{13B}$ $SO_2 R^{13A}$ 、 $-NR^{13B}$ $C(O)R^{13D}$ 、 $-NR^{13B}$ $C(O)OR^{13D}$ 、 $-NR^{13B}$ OR^{13D} 、 $-OCX^{13 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{13 \cdot 1}_2$ 、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^{15} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{15 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{15 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{15 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_n$ R^{15A} 、 $-SO_v$ R^{15B} R^{15C} 、 $-NHN R^{15B}$ R^{15C} 、 $-ONR^{15B}$ R^{15C} 、 $-NHC(O)NHN R^{15B}$ R^{15C} 、 $-NHC(O)NR^{15B}$ R^{15C} 、 $-N(O)_m$ R^{15C} 、 $-NR^{15B}$ R^{15C} 、 $-C(O)R^{15D}$ 、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}$ R^{15C} 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}$ $SO_2 R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}$ $C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}$ $C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}$ 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^{17} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{17 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{17 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{17 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_n$ R^{17A} 、 $-SO_v$ R^{17B} R^{17C} 、 $-NHN R^{17B}$ R^{17C} 、 $-ONR^{17B}$ R^{17C} 、 $-NHC(O)NHN R^{17B}$ R^{17C} 、 $-NHC(O)NR^{17B}$ R^{17C} 、 $-N(O)_m$ R^{17C} 、 $-NR^{17B}$ R^{17C} 、 $-C(O)R^{17D}$ 、 $-C(O)OR^{17D}$ 、 $-C(O)NR^{17B}$ R^{17C} 、 $-OR^{17A}$ 、 $-NR^{17B}$ $SO_2 R^{17A}$ 、 $-NR^{17B}$ $C(O)R^{17D}$ 、 $-NR^{17B}$ $C(O)OR^{17D}$ 、 $-NR^{17B}$ 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、 $-CX^{18 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{18 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{18 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_n$ R^{18A} 、 $-SO_v$ R^{18B} R^{18C} 、 $-NHN R^{18B}$ R^{18C} 、 $-ONR^{18B}$ R^{18C} 、 $-NHC(O)NHN R^{18B}$ R^{18C} 、 $-NHC(O)NR^{18B}$ R^{18C} 、 $-N(O)_m$ R^{18C} 、 $-NR^{18B}$ R^{18C} 、 $-C(O)R^{18D}$ 、 $-C(O)OR^{18D}$ 、 $-C(O)NR^{18B}$ R^{18C} 、 $-OR^{18A}$ 、 $-NR^{18B}$ $SO_2 R^{18A}$ 、 $-NR^{18B}$ $C(O)R^{18D}$ 、 $-NR^{18B}$ $C(O)OR^{18D}$ 、 $-NR^{18B}$ 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、 $-COR^{19D}$ 、 $-C(O)NHN R^{19B} R^{19C}$ 、 $-C(O)OR^{19D}$ 、 $-SO_2 R^{19A}$ 、 $C(O)N R^{19B} R^{19C}$ 、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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、 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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、 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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、 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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、 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、 $R^{19D F}$ - 置換されているか置換されていないアリール、または $R^{19D F}$ - 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；

$R^8 A$ 、 $R^8 B$ 、 $R^8 C$ 、 $R^8 D$ 、 $R^9 A$ 、 $R^9 B$ 、 $R^9 C$ 、 $R^9 D$ 、 $R^{10 A}$ 、 $R^{10 B}$ 、 $R^{10 C}$ 、 $R^{10 D}$ 、 $R^{11 A}$ 、 $R^{11 B}$ 、 $R^{11 C}$ 、 $R^{11 D}$ 、 $R^{12 A}$ 、 $R^{12 B}$ 、 $R^{12 C}$ 、 $R^{12 D}$ 、 $R^{13 A}$ 、 $R^{13 B}$ 、 $R^{13 C}$ 、 $R^{13 D}$ 、 $R^{15 A}$ 、 $R^{15 B}$ 、 $R^{15 C}$ 、 $R^{15 D}$ 、 $R^{17 A}$ 、 $R^{17 B}$ 、 $R^{17 C}$ 、 $R^{17 D}$ 、 $R^{18 A}$ 、 $R^{18 B}$ 、 $R^{18 C}$ および $R^{18 D}$ は独立に、水素、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)-OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、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 $R^8 B$ 、 $R^8 C$ 、 $R^9 B$ 、 $R^9 C$ 、 $R^{10 B}$ 、 $R^{10 C}$ 、 $R^{11 B}$ 、 $R^{11 C}$ 、 $R^{12 B}$ 、 $R^{12 C}$ 、 $R^{13 B}$ 、 $R^{13 C}$ 、 $R^{15 B}$ 、 $R^{15 C}$ 、 $R^{17 B}$ 、 $R^{17 C}$ 、 $R^{18 B}$ および $R^{18 C}$ 置換基は、任意に一緒になって、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；

$R^{19 A F}$ 、 $R^{19 B F}$ 、 $R^{19 C F}$ および $R^{19 D F}$ は、独立に、オキソ、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(=O)NHNH_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(=O)H$ 、 $-NHC(O)-OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCHF_2$ 、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；

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

【請求項 2】

L^1 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】

R^{13} 、 R^{15} 、 R^{17} および R^{18} が独立に、水素である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^8 、 R^9 、 R^{11} および R^{12} が独立に、水素である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^{10} が水素、フッ素、塩素、ヨウ素、 $-CX^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{10 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{10 \cdot 1}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{10 A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-NHNHNR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-ONHNR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-NHC(O)NHNHNR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-NHC(O)NHNR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-C(O)R^{10 D}$ 、 $-C(O)OR^{10 D}$ 、 $-C(O)NR^{10 B}R^{10 C}$ 、 $-OR^{10 A}$ 、 $-NR^{10 B}SO_2R^{10 A}$ 、 $-NR^{10 B}C(O)R^{10 D}$ 、 $-NR^{10 B}C(O)OR^{10 D}$ 、 $-NR^{10 B}OR^{10 D}$ 、 $-OCX^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{10 \cdot 1}_2$ 、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る、請求項 1 に記載の化合物。

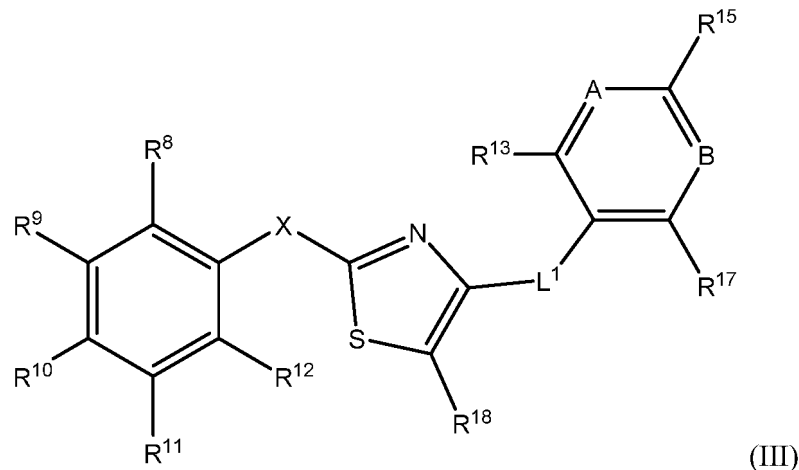
【請求項 6】

R^{10} 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、 CR^{14} または N であり；

B は、 CR^{16} または N であり；

X は、O、 NR^{19} または S であり；

L^1 は、結合または置換されているか置換されていない $C_1 - C_3$ アルキレンであり；

n_1 は、0 から 4 の整数であり；

m_1 および v_1 は独立に、1 または 2 であり；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-CX^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{8 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{8 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}R^{8A}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{8B}R^{8C}$ 、 $-NHN^{8B}R^{8C}$ 、 $-ONR^{8B}R^{8C}$ 、 $-NHC(O)NHN^{8B}R^{8C}$ 、 $-NHC(O)NR^{8B}R^{8C}$ 、 $-N(O)_{m_1}$ 、 $-NR^{8B}R^{8C}$ 、 $-C(O)R^{8D}$ 、 $-C(O)OR^{8D}$ 、 $-C(O)NR^{8B}R^{8C}$ 、 $-OR^{8A}$ 、 $-NR^{8B}SO_2R^{8A}$ 、 $-NR^{8B}C(O)R^{8D}$ 、 $-NR^{8B}C(O)OR^{8D}$ 、 $-NR^{8B}OR^{8D}$ 、 $-OCX^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{8 \cdot 1}_2$ 、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^9 は、水素、ハロゲン、 $-CX^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{9 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{9 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}R^{9A}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{9B}R^{9C}$ 、 $-NHN^{9B}R^{9C}$ 、 $-ONR^{9B}R^{9C}$ 、 $-NHC(O)NHN^{9B}R^{9C}$ 、 $-NHC(O)NR^{9B}R^{9C}$ 、 $-N(O)_{m_1}$ 、 $-NR^{9B}R^{9C}$ 、 $-C(O)R^{9D}$ 、 $-C(O)OR^{9D}$ 、 $-C(O)NR^{9B}R^{9C}$ 、 $-OR^{9A}$ 、 $-NR^{9B}SO_2R^{9A}$ 、 $-NR^{9B}C(O)R^{9D}$ 、 $-NR^{9B}C(O)OR^{9D}$ 、 $-NR^{9B}OR^{9D}$ 、 $-OCX^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{9 \cdot 1}_2$ 、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^{10} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{10 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{10 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}R^{10A}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{10B}R^{10C}$ 、 $-NHN^{10B}R^{10C}$ 、 $-ONR^{10B}R^{10C}$ 、 $-NHC(O)NHN^{10B}R^{10C}$ 、 $-NHC$

(O)NR^{10B}R^{10C}、-N(O)_{m1}、-NR^{10B}R^{10C}、-C(O)R^{10D}、-C(O)OR^{10D}、-C(O)NR^{10B}R^{10C}、-OR^{10A}、-NR^{10B}SO₂R^{10A}、-NR^{10B}C(O)R^{10D}、-NR^{10B}C(O)OR^{10D}、-NR^{10B}OR^{10D}、-OCX¹⁰・¹₃、-OCHX¹⁰・¹₂、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；

R¹¹は、水素、ハロゲン、-CX¹¹・¹₃、-CHX¹¹・¹₂、-CH₂X¹¹・¹、-CN、-SO_{n1}R^{11A}、-SO_{v1}NR^{11B}R^{11C}、-NHNRR^{11B}R^{11C}、-ONRR^{11B}R^{11C}、-NHC(O)NHNRR^{11B}R^{11C}、-NHC(O)NR^{11B}R^{11C}、-N(O)_{m1}、-NR^{11B}R^{11C}、-C(O)R^{11D}、-C(O)OR^{11D}、-C(O)NR^{11B}R^{11C}、-OR^{11A}、-NR^{11B}SO₂R^{11A}、-NR^{11B}C(O)R^{11D}、-NR^{11B}C(O)OR^{11D}、-NR^{11B}OR^{11D}、-OCX¹¹・¹₃、-OCHX¹¹・¹₂、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；

R¹²は、水素、ハロゲン、-CX¹²・¹₃、-CHX¹²・¹₂、-CH₂X¹²・¹、-CN、-SO_{n1}R^{12A}、-SO_{v1}NR^{12B}R^{12C}、-NHNRR^{12B}R^{12C}、-ONRR^{12B}R^{12C}、-NHC(O)NHNRR^{12B}R^{12C}、-NHC(O)NR^{12B}R^{12C}、-N(O)_{m1}、-NR^{12B}R^{12C}、-C(O)R^{12D}、-C(O)OR^{12D}、-C(O)NR^{12B}R^{12C}、-OR^{12A}、-NR^{12B}SO₂R^{12A}、-NR^{12B}C(O)R^{12D}、-NR^{12B}C(O)OR^{12D}、-NR^{12B}OR^{12D}、-OCX¹²・¹₃、-OCHX¹²・¹₂、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；

R¹³は、水素、ハロゲン、-CX¹³・¹₃、-CHX¹³・¹₂、-CH₂X¹³・¹、-CN、-SO_{n1}R^{13A}、-SO_{v1}NR^{13B}R^{13C}、-NHNRR^{13B}R^{13C}、-ONRR^{13B}R^{13C}、-NHC(O)NHNRR^{13B}R^{13C}、-NHC(O)NR^{13B}R^{13C}、-N(O)_{m1}、-NR^{13B}R^{13C}、-C(O)R^{13D}、-C(O)OR^{13D}、-C(O)NR^{13B}R^{13C}、-OR^{13A}、-NR^{13B}SO₂R^{13A}、-NR^{13B}C(O)R^{13D}、-NR^{13B}C(O)OR^{13D}、-NR^{13B}OR^{13D}、-OCX¹³・¹₃、-OCHX¹³・¹₂、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；

R¹⁴は、水素、ハロゲン、-CX¹⁴・¹₃、-CHX¹⁴・¹₂、-CH₂X¹⁴・¹、-CN、-SO_{n1}R^{14A}、-SO_{v1}NR^{14B}R^{14C}、-NHNRR^{14B}R^{14C}、-ONRR^{14B}R^{14C}、-NHC(O)NHNRR^{14B}R^{14C}、-NHC(O)NR^{14B}R^{14C}、-N(O)_{m1}、-NR^{14B}R^{14C}、-C(O)R^{14D}、-C(O)OR^{14D}、-C(O)NR^{14B}R^{14C}、-OR^{14A}、-NR^{14B}SO₂R^{14A}、-NR^{14B}C(O)R^{14D}、-NR^{14B}C(O)OR^{14D}、-NR^{14B}OR^{14D}、-OCX¹⁴・¹₃、-OCHX¹⁴・¹₂、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^{15} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{15 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{15 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{15}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{15A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHN R^{15B}R^{15C}$ 、 $-ONR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-C(O)R^{15D}$ 、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}SO_2R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}OR^{15D}$ 、 $-OCX^{15 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{15 \cdot 1}_2$ 、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、 $-CX^{16 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{16 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{16}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{16A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHN R^{16B}R^{16C}$ 、 $-ONR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-C(O)R^{16D}$ 、 $-C(O)OR^{16D}$ 、 $-C(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-OR^{16A}$ 、 $-NR^{16B}SO_2R^{16A}$ 、 $-NR^{16B}C(O)R^{16D}$ 、 $-NR^{16B}C(O)OR^{16D}$ 、 $-NR^{16B}OR^{16D}$ 、 $-OCX^{16 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{16 \cdot 1}_2$ 、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、 $-CX^{17 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{17 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{17}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{17A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHN R^{17B}R^{17C}$ 、 $-ONR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-C(O)R^{17D}$ 、 $-C(O)OR^{17D}$ 、 $-C(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-OR^{17A}$ 、 $-NR^{17B}SO_2R^{17A}$ 、 $-NR^{17B}C(O)R^{17D}$ 、 $-NR^{17B}C(O)OR^{17D}$ 、 $-NR^{17B}OR^{17D}$ 、 $-OCX^{17 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{17 \cdot 1}_2$ 、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、 $-CX^{18 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{18 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{18}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{18A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHN R^{18B}R^{18C}$ 、 $-ONR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-C(O)R^{18D}$ 、 $-C(O)OR^{18D}$ 、 $-C(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-OR^{18A}$ 、 $-NR^{18B}SO_2R^{18A}$ 、 $-NR^{18B}C(O)R^{18D}$ 、 $-NR^{18B}C(O)OR^{18D}$ 、 $-NR^{18B}OR^{18D}$ 、 $-OCX^{18 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{18 \cdot 1}_2$ 、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、 $-COR^{19D}$ 、 $-C(O)NHN R^{19B}R^{19C}$ 、 $-C(O)OR^{19D}$ 、 $-SO_2R^{19A}$ 、 $C(O)NR^{19B}R^{19C}$ 、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

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、-NHNH₂、-ONH₂、-NHC(O)NHNH₂、-NHC(O)NH₂、-NH₂SO₂H、-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、-NH₂SO₂H、-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、-NH₂SO₂H、-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、-NH₂SO₂H、-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；

$$\begin{array}{cccccccccccc} R^8 A & , & R^8 B & , & R^8 C & , & R^8 D & , & R^9 A & , & R^9 B & , & R^9 C & , & R^9 D & , & R^{10} A & , & R^{10} B \\ R^{10} C & , & R^{10} D & , & R^{11} A & , & R^{11} B & , & R^{11} C & , & R^{11} D & , & R^{12} A & , & R^{12} B & , & R^{12} C & , & R^{12} D \\ R^{13} A & , & R^{13} B & , & R^{13} C & , & R^{13} D & , & R^{14} A & , & R^{14} B & , & R^{14} C & , & R^{14} D & , & R^{15} A & , & R^{15} B \\ R^{15} C & , & R^{15} D & , & R^{16} A & , & R^{16} B & , & R^{16} C & , & R^{16} D \end{array}$$

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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)-OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCCl_3$ 、 $-OCBr_3$ 、 $-OCI_3$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCHCl_2$ 、 $-OCHBr_2$ 、 $-OCHI_2$ 、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 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；

R^{19AF} 、 R^{19BF} 、 R^{19CF} および R^{19DF} は、独立に、オキソ、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(=O)NHNH_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(=O)H$ 、 $-NHC(O)-OH$ 、 $-NHOH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCHF_2$ 、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；

$X^{8 \cdot 1}$ 、 $X^{9 \cdot 1}$ 、 $X^{10 \cdot 1}$ 、 $X^{11 \cdot 1}$ 、 $X^{12 \cdot 1}$ 、 $X^{13 \cdot 1}$ 、 $X^{14 \cdot 1}$ 、 $X^{15 \cdot 1}$ 、 $X^{16 \cdot 1}$ 、 $X^{17 \cdot 1}$ および $X^{18 \cdot 1}$ 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。

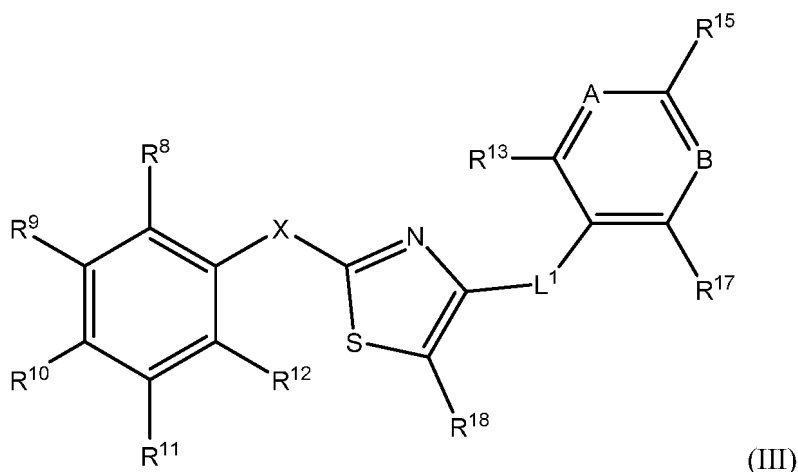
【請求項 12】

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 (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】



(III)

[式中、

A は、 C R^{14} または N であり；

B は、 C R^{16} または N であり；

X は、O、 NR^{19} または S であり；

L^1 は、結合または置換されているか置換されていない $\text{C}_1 - \text{C}_3$ アルキレンであり；

n_1 は、0 から 4 の整数であり；

m_1 および v_1 は独立に、1 または 2 であり；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{8 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{8 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{8A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHN R}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{ONR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN R}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{8D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{8B}\text{R}^{8C}$ 、 $-\text{OR}^{8A}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{SO}_2\text{R}^{8A}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{8D}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{NR}^{8B}\text{OR}^{8D}$ 、 $-\text{OCX}^{8 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{8 \cdot 1}_2$ 、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^9 は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{9 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{9 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{9A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHN R}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{ONR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN R}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{9D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{9B}\text{R}^{9C}$ 、 $-\text{OR}^{9A}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{SO}_2\text{R}^{9A}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{9D}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{NR}^{9B}\text{OR}^{9D}$ 、 $-\text{OCX}^{9 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{9 \cdot 1}_2$ 、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^{10} は、水素、ハロゲン、 $-\text{CX}^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{CHX}^{10 \cdot 1}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}^{10 \cdot 1}_1$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{SO}_{n_1}\text{R}^{10A}$ 、 $-\text{SO}_{v_1}\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHN R}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{ONR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHN R}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{N}(\text{O})_{m_1}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{10D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10B}\text{R}^{10C}$ 、 $-\text{OR}^{10A}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{SO}_2\text{R}^{10A}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{C}(\text{O})\text{R}^{10D}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{NR}^{10B}\text{OR}^{10D}$ 、 $-\text{OCX}^{10 \cdot 1}_3$ 、 $-\text{OCHX}^{10 \cdot 1}_2$ 、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^{11} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{11 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{11 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{11 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{11A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{11B}R^{11C}$ 、 $-NHN R^{11B}R^{11C}$ 、 $-ONR^{11B}R^{11C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{11B}R^{11C}$ 、 $-NHC(O)NR^{11B}R^{11C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{11B}R^{11C}$ 、 $-C(O)R^{11D}$ 、 $-C(O)OR^{11D}$ 、 $-C(O)NR^{11B}R^{11C}$ 、 $-OR^{11A}$ 、 $-NR^{11B}SO_2R^{11A}$ 、 $-NR^{11B}C(O)R^{11D}$ 、 $-NR^{11B}C(O)OR^{11D}$ 、 $-NR^{11B}OR^{11D}$ 、 $-OCX^{11 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{11 \cdot 1}_2$ 、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^{12} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{12 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{12 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{12 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{12A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{12B}R^{12C}$ 、 $-NHN R^{12B}R^{12C}$ 、 $-ONR^{12B}R^{12C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{12B}R^{12C}$ 、 $-NHC(O)NR^{12B}R^{12C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{12B}R^{12C}$ 、 $-C(O)R^{12D}$ 、 $-C(O)OR^{12D}$ 、 $-C(O)NR^{12B}R^{12C}$ 、 $-OR^{12A}$ 、 $-NR^{12B}SO_2R^{12A}$ 、 $-NR^{12B}C(O)R^{12D}$ 、 $-NR^{12B}C(O)OR^{12D}$ 、 $-NR^{12B}OR^{12D}$ 、 $-OCX^{12 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{12 \cdot 1}_2$ 、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^{13} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{13 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{13 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{13 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{13A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{13B}R^{13C}$ 、 $-NHN R^{13B}R^{13C}$ 、 $-ONR^{13B}R^{13C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{13B}R^{13C}$ 、 $-NHC(O)NR^{13B}R^{13C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{13B}R^{13C}$ 、 $-C(O)R^{13D}$ 、 $-C(O)OR^{13D}$ 、 $-C(O)NR^{13B}R^{13C}$ 、 $-OR^{13A}$ 、 $-NR^{13B}SO_2R^{13A}$ 、 $-NR^{13B}C(O)R^{13D}$ 、 $-NR^{13B}C(O)OR^{13D}$ 、 $-NR^{13B}OR^{13D}$ 、 $-OCX^{13 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{13 \cdot 1}_2$ 、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^{14} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{14 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{14 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{14 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{14A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{14B}R^{14C}$ 、 $-NHN R^{14B}R^{14C}$ 、 $-ONR^{14B}R^{14C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{14B}R^{14C}$ 、 $-NHC(O)NR^{14B}R^{14C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{14B}R^{14C}$ 、 $-C(O)R^{14D}$ 、 $-C(O)OR^{14D}$ 、 $-C(O)NR^{14B}R^{14C}$ 、 $-OR^{14A}$ 、 $-NR^{14B}SO_2R^{14A}$ 、 $-NR^{14B}C(O)R^{14D}$ 、 $-NR^{14B}C(O)OR^{14D}$ 、 $-NR^{14B}OR^{14D}$ 、 $-OCX^{14 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{14 \cdot 1}_2$ 、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^{15} は、水素、ハロゲン、 $-CX^{15 \cdot 1}_3$ 、 $-CHX^{15 \cdot 1}_2$ 、 $-CH_2X^{15 \cdot 1}_1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{15A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHN R^{15B}R^{15C}$ 、 $-ONR^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{15B}R^{15C}$ 、 $-NHC(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-C(O)R^{15D}$ 、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}SO_2R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}OR^{15D}$ 、 $-OCX^{15 \cdot 1}_3$ 、 $-OCHX^{15 \cdot 1}_2$ 、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；

D 、 $-C(O)OR^{15D}$ 、 $-C(O)NR^{15B}R^{15C}$ 、 $-OR^{15A}$ 、 $-NR^{15B}SO_2R^{15A}$ 、 $-NR^{15B}C(O)R^{15D}$ 、 $-NR^{15B}C(O)OR^{15D}$ 、 $-NR^{15B}OR^{15D}$ 、 $-OCX^{15 \cdot 1_3}$ 、 $-OCHX^{15 \cdot 1_2}$ 、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、 $-CX^{16 \cdot 1_3}$ 、 $-CHX^{16 \cdot 1_2}$ 、 $-CH_2X^{16 \cdot 1_1}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{16A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHN R^{16B}R^{16C}$ 、 $-ONR^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{16B}R^{16C}$ 、 $-NHC(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-C(O)R^{16D}$ 、 $-C(O)OR^{16D}$ 、 $-C(O)NR^{16B}R^{16C}$ 、 $-OR^{16A}$ 、 $-NR^{16B}SO_2R^{16A}$ 、 $-NR^{16B}C(O)R^{16D}$ 、 $-NR^{16B}C(O)OR^{16D}$ 、 $-NR^{16B}OR^{16D}$ 、 $-OCX^{16 \cdot 1_3}$ 、 $-OCHX^{16 \cdot 1_2}$ 、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、 $-CX^{17 \cdot 1_3}$ 、 $-CHX^{17 \cdot 1_2}$ 、 $-CH_2X^{17 \cdot 1_1}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{17A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHN R^{17B}R^{17C}$ 、 $-ONR^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{17B}R^{17C}$ 、 $-NHC(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-C(O)R^{17D}$ 、 $-C(O)OR^{17D}$ 、 $-C(O)NR^{17B}R^{17C}$ 、 $-OR^{17A}$ 、 $-NR^{17B}SO_2R^{17A}$ 、 $-NR^{17B}C(O)R^{17D}$ 、 $-NR^{17B}C(O)OR^{17D}$ 、 $-NR^{17B}OR^{17D}$ 、 $-OCX^{17 \cdot 1_3}$ 、 $-OCHX^{17 \cdot 1_2}$ 、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、 $-CX^{18 \cdot 1_3}$ 、 $-CHX^{18 \cdot 1_2}$ 、 $-CH_2X^{18 \cdot 1_1}$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n1}R^{18A}$ 、 $-SO_{v1}NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHN R^{18B}R^{18C}$ 、 $-ONR^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NHN R^{18B}R^{18C}$ 、 $-NHC(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-N(O)_m1$ 、 $-NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-C(O)R^{18D}$ 、 $-C(O)OR^{18D}$ 、 $-C(O)NR^{18B}R^{18C}$ 、 $-OR^{18A}$ 、 $-NR^{18B}SO_2R^{18A}$ 、 $-NR^{18B}C(O)R^{18D}$ 、 $-NR^{18B}C(O)OR^{18D}$ 、 $-NR^{18B}OR^{18D}$ 、 $-OCX^{18 \cdot 1_3}$ 、 $-OCHX^{18 \cdot 1_2}$ 、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、 $-COR^{19D}$ 、 $-C(O)NHN R^{19B}R^{19C}$ 、 $-C(O)OR^{19D}$ 、 $-SO_2R^{19A}$ 、 $C(O)NR^{19B}R^{19C}$ 、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、 $-CF_3$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CBr_3$ 、 $-CI_3$ 、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-SH$ 、 $-SO_3H$ 、 $-SO_4H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-NHNH_2$ 、 $-ONH_2$ 、 $-NHC(O)NHNH_2$ 、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NH SO_2H$ 、 $-NHC(O)H$ 、 $-NHC(O)OH$ 、 $-$

NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19A}F - 置換されているか置換されていないアルキル、R^{19A}F - 置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19A}F - 置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19A}F - 置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19A}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^{19A}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

;

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、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19B}F - 置換されているか置換されていないアルキル、R^{19B}F - 置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19B}F - 置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19B}F - 置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19B}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^{19B}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

;

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、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19C}F - 置換されているか置換されていないアルキル、R^{19C}F - 置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19C}F - 置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19C}F - 置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19C}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^{19C}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

;

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、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OCHF₂、-OCHCl₂、-OCHBr₂、-OCHI₂、R^{19D}F - 置換されているか置換されていないアルキル、R^{19D}F - 置換されているか置換されていないヘテロアルキル、R^{19D}F - 置換されているか置換されていないシクロアルキル、R^{19D}F - 置換されているか置換されていない複素環アルキル、R^{19D}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^{19D}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

;

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、-NH₂SO₂H、-NHC(O)H、-NHC(O)OH、-NHOH、-OCF₃、-OCCl₃、-OCBr₃、-OCI₃、-OC

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 R^8B 、 R^8C 、 R^9B 、 R^9C 、 R^{10}B 、 R^{10}C 、 R^{11}B 、 R^{11}C 、 R^{12}B 、 R^{12}C 、 R^{13}B 、 R^{13}C 、 R^{14}B 、 R^{14}C 、 R^{15}B 、 R^{15}C 、 R^{16}B 、 R^{16}C 、 R^{17}B 、 R^{17}C 、 R^{18}B および R^{18}C 置換基は、任意に一緒になって、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；

R^{19}AF 、 R^{19}BF 、 R^{19}CF および R^{19}DF は、独立に、オキソ、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{SH}$ 、 $-\text{SO}_3\text{H}$ 、 $-\text{SO}_4\text{H}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHNH}_2$ 、 $-\text{ONH}_2$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{NHNH}_2$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{H}$ 、 $-\text{NHC}=(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})-\text{OH}$ 、 $-\text{NHOH}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、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；

$\text{X}^{8 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{9 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{10 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{11 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{12 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{13 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{14 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{15 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{16 \cdot 1}$ 、 $\text{X}^{17 \cdot 1}$ および $\text{X}^{18 \cdot 1}$ 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 CR^{14} であり； B が CR^{16} 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 CR^{16} であり； R^{16} が水素である請求項 13 に記載の医薬組成物。

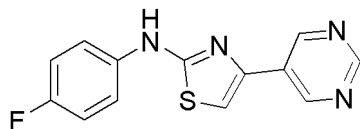
【請求項 17】

A および B が独立に N であり； R^{10} 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。

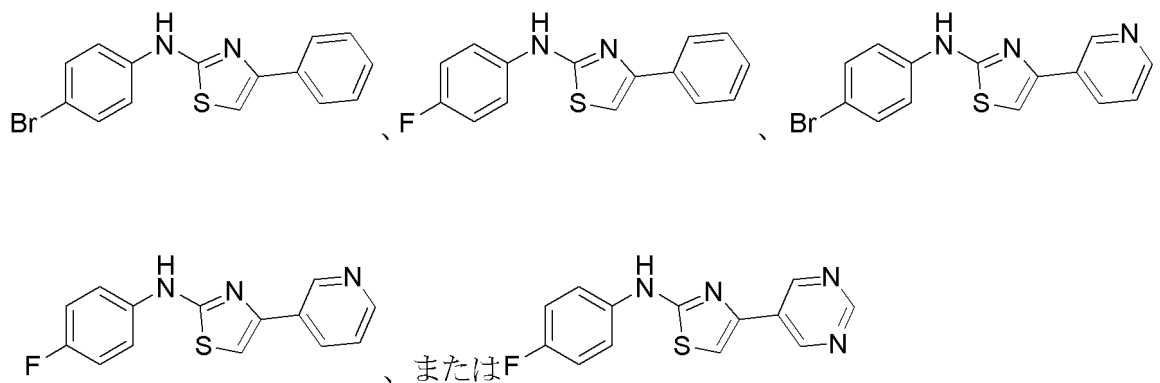
【請求項 19】

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 2 1】

局所接触用に製剤化された、請求項 7 ~ 1 7、1 9 及び 2 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

経皮的送達用である、請求項 7 ~ 1 7、1 9 及び 2 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

アプリータスティック、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 2 2 に記載の医薬組成物。