

【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2年12月10日(2020.12.10)

【公表番号】特表2019-533714(P2019-533714A)

【公表日】令和1年11月21日(2019.11.21)

【年通号数】公開・登録公報2019-047

【出願番号】特願2019-524943(P2019-524943)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/403	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	31/501	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/4525	(2006.01)
A 6 1 K	31/453	(2006.01)
A 6 1 K	31/451	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
C 0 7 D	491/052	(2006.01)
C 0 7 D	401/10	(2006.01)
C 0 7 D	405/14	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)

C 0 7 D 211/38 (2006.01)
 C 0 7 D 413/10 (2006.01)
 C 0 7 D 211/34 (2006.01)
 C 0 7 D 211/32 (2006.01)
 C 0 7 D 413/14 (2006.01)
 C 0 7 D 413/12 (2006.01)
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)
 C 0 7 D 401/06 (2006.01)
 C 0 7 D 491/107 (2006.01)
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)
 C 0 7 D 491/044 (2006.01)
 C 0 7 D 513/04 (2006.01)
 C 0 7 D 491/048 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/403
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 19/08
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 1/02
 A 6 1 P 11/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/55
 A 6 1 K 31/501
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/4525
 A 6 1 K 31/453
 A 6 1 K 31/451
 A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/444
 C 0 7 D 491/052
 C 0 7 D 401/10
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 211/38
 C 0 7 D 413/10
 C 0 7 D 211/34
 C 0 7 D 211/32
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 D 471/04 1 0 7 A
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 491/107
 C 0 7 D 471/04 1 0 1
 C 0 7 D 471/04 1 0 7 K
 C 0 7 D 487/04 1 5 0
 C 0 7 D 491/044
 C 0 7 D 513/04 3 0 1
 C 0 7 D 491/048

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月27日(2020.10.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

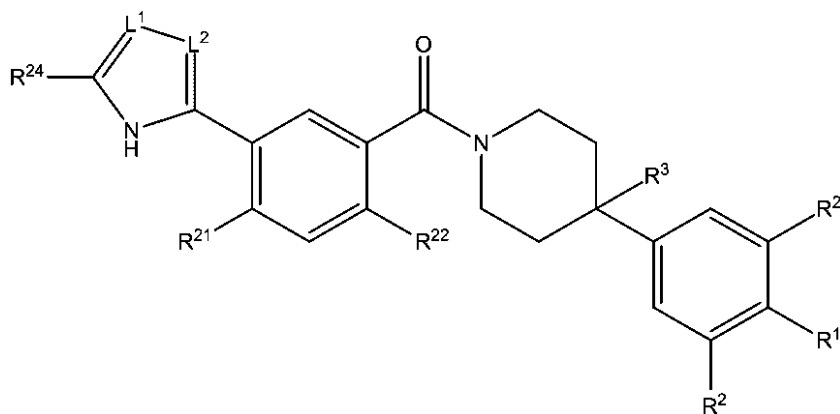
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

脂肪性肝疾患を処置することを、それを必要とする対象に行うための組成物であって、
 (a) 式(I X)

【化2065】



(I X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim$

C₅ シクロアルキル)、 - O - (C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、- OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、- (C₁ ~ C₄ アルキル)_t - OH、- (C₁ ~ C₄ アルキル)_t - O_t - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または - (C₁ ~ C₄ アルキル)_t - O - (C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R^{2 3} または N であり；

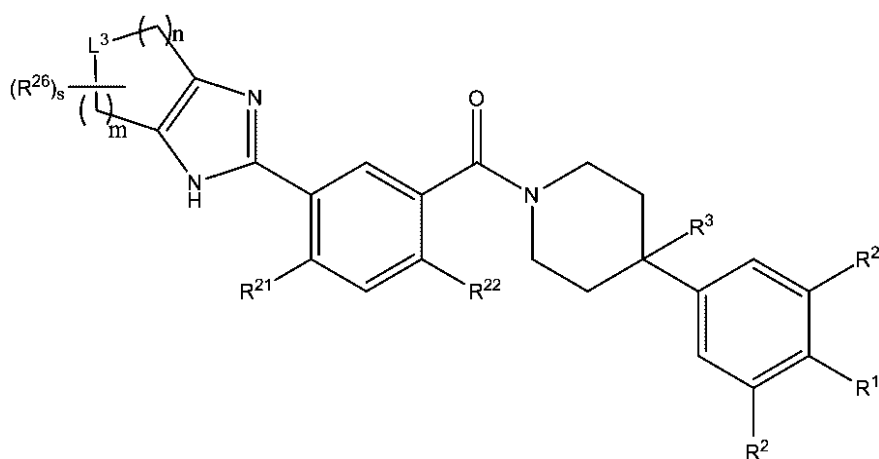
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R^{2 3} は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 0 6 6】



(X)

(式中、

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、- OH またはハロゲンであり；

L³ は、C (R^{6 0})₂、O または N R^{5 0} であり；

各 R^{6 0} は、独立して、H、- OH、- CN、- O_t - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、

- O - (C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または - C (O) - N (R^{6 0 1})₂ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{5 0} は、独立して、H、- C (O) - O_t - (C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、- C (O) - O_t - (C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する - C₃ ~ C₅ 環式アルキル、- C (O) - N (R^{5 0 1})₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各 R^{2 6} は、独立して、- OH、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、- (C₁ ~ C₄ アルキル)_t - O_t - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ~ C₄ アルキル)_t - O - (C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、- C (O) - O_t - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - N (R^{5 0 1})₂ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

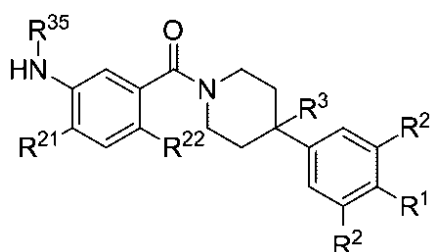
s は、0、1 または 2 であり；

各 R^{6 0 1} 及び R^{5 0 1} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、R^{2 6}、R^{6 0}、R^{5 0}、R^{5 0 1} 及び R^{6 0 1} のうちの 2 つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、R^{2 6}、R^{6 0}、R^{5 0}、R^{5 0 1} 及び R^{6 0 1} のうちの 2 つは、2 つの R^{2 6}、2 つの R^{6 0}、2 つの R^{5 0}、2 つの R^{5 0 1} または 2 つの R^{6 0 1} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2 0 6 7】



(VI - J)

(式中、

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、- OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン - 1 - イル、またはシクロプロピルであり；

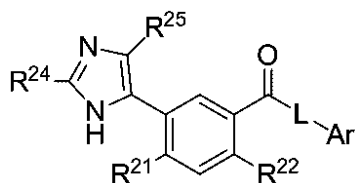
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)-R^{351}$ 、 $-C(O)-NHR^{351}$ 、 $-C(O)-O-R^{351}$ または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2068】

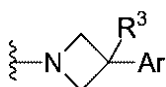


(XII)

(式中、

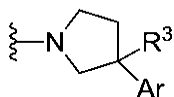
$L-Ar$ は、

【化2069】



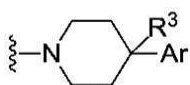
、

【化2070】



または

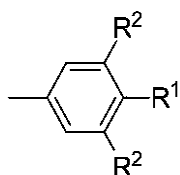
【化2071】



であり；

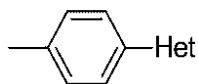
Ar は、

【化2072】



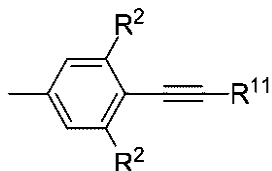
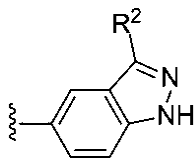
、

【化2073】



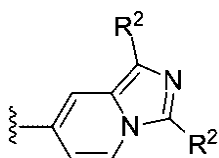
、

【化 2 0 7 4】

、
【化 2 0 7 5】

または

【化 2 0 7 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、- C N、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - C N、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - O H、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₆ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

u は、0 または 1 であり；

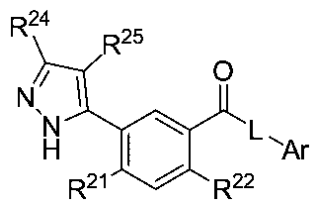
ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

各 R^{2 4 1} は、独立して、H または C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 5} は、ハロゲン、- C N、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - C N、C₁ ～ C₂ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (X I I I) ；

【化 2 0 7 7】

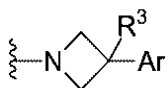


(X I I I)

(式中、

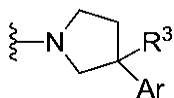
L - A r は、

【化 2 0 7 8】



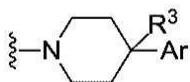
、

【化 2 0 7 9】



または

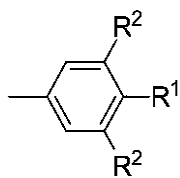
【化 2 0 8 0】



であり；

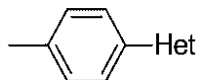
A r は、

【化 2 0 8 1】



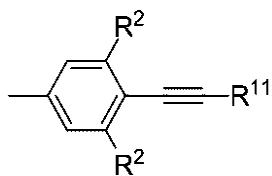
、

【化 2 0 8 2】

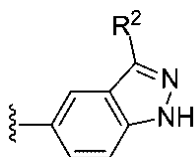


、

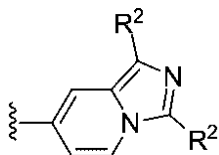
【化 2 0 8 3】



、
【化 2 0 8 4】



または
【化 2 0 8 5】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

各 R^{2 4} 及び R^{2 5} は、独立して、H、ハロゲン、- C N、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - C N、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - O H、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

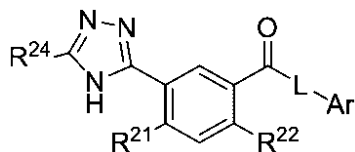
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{2 4 1} は、独立して、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (X I V) ；

【化 2 0 8 6】

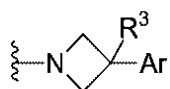
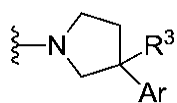


(X I V)

(式中、

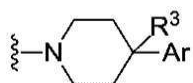
L - A r は、

【化 2 0 8 7】

、
【化 2 0 8 8】

または

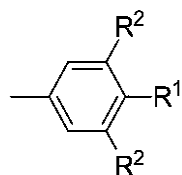
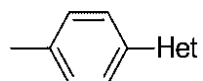
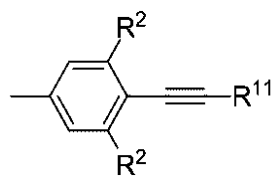
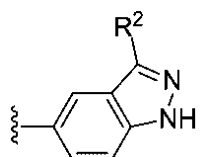
【化 2 0 8 9】



であり；

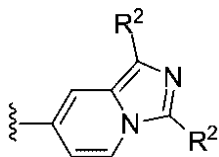
A r は、

【化 2 0 9 0】

、
【化 2 0 9 1】、
【化 2 0 9 2】、
【化 2 0 9 3】

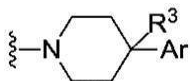
または

【化 2 0 9 4】



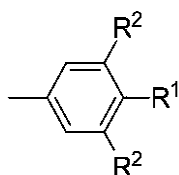
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 0 9 5】



であるとき、Ar は

【化 2 0 9 6】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

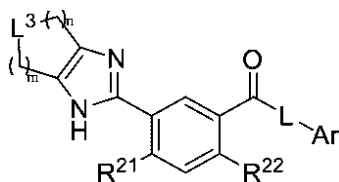
R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_t - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_t - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{2 4 1} は、独立して、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 0 9 7】



(XV)

(式中、

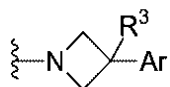
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

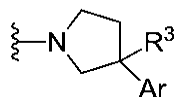
$L-Ar$ は、

【化 2098】



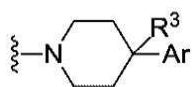
、

【化 2099】



または

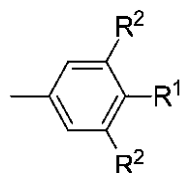
【化 2100】



であり；

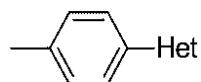
Ar は、

【化 2101】



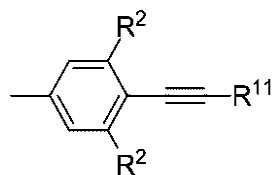
、

【化 2102】



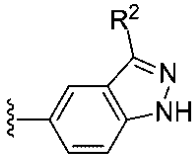
、

【化 2103】



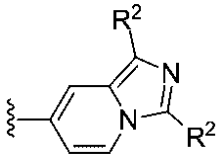
、

【化 2 1 0 4】



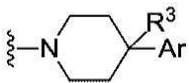
または

【化 2 1 0 5】



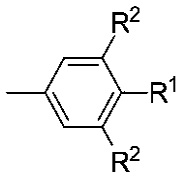
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 0 6】



であるとき、Ar は

【化 2 1 0 7】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

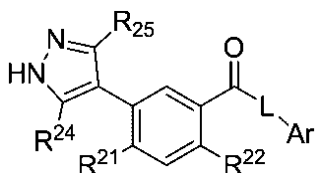
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 1 0 8】

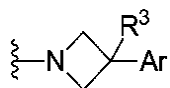


(XVI)

(式中、

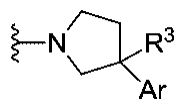
L-Arは、

【化2109】



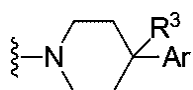
、

【化2110】



または

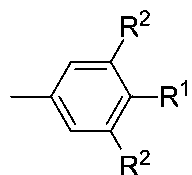
【化2111】



であり；

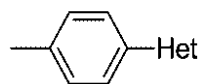
Arは、

【化2112】



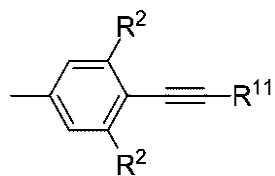
、

【化2113】



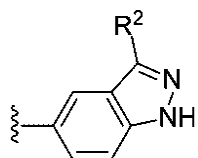
、

【化2114】



、

【化2115】



または

【化 2 1 1 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

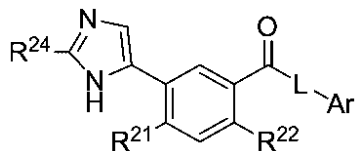
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I)：

【化 2 1 1 7】

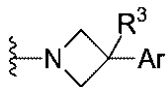


(X V I I)

(式中、

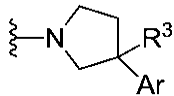
L - A r は、

【化 2 1 1 8】



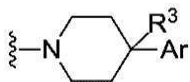
、

【化 2 1 1 9】



または

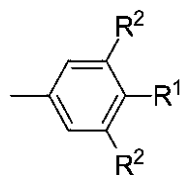
【化 2 1 2 0】



であり；

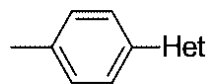
Ar は、

【化 2 1 2 1】



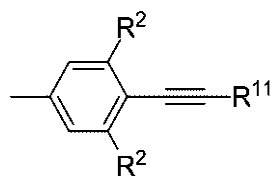
、

【化 2 1 2 2】



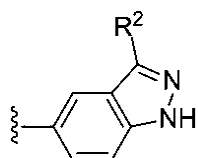
、

【化 2 1 2 3】



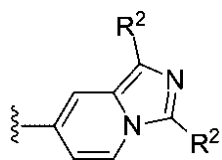
、

【化 2 1 2 4】



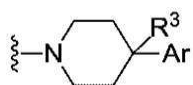
または

【化 2 1 2 5】



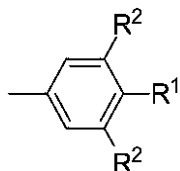
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 2 6】



であるとき、Ar は

【化 2 1 2 7】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

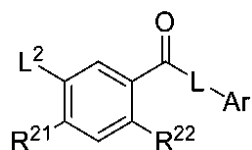
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I)：

【化 2 1 2 8】

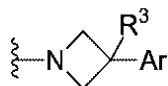


(X V I I I)

(式中、

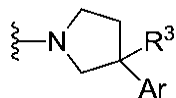
L - A r は、

【化 2 1 2 9】



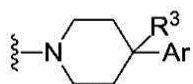
、

【化 2 1 3 0】



または

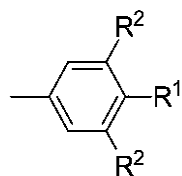
【化 2 1 3 1】



であり；

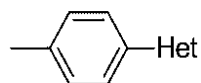
A r は、

【化 2 1 3 2】



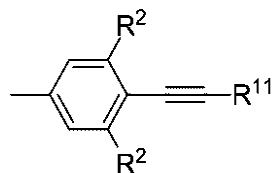
、

【化 2 1 3 3】



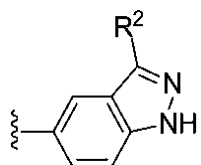
、

【化 2 1 3 4】



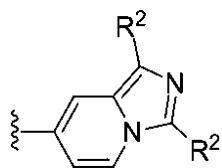
、

【化 2 1 3 5】



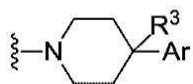
または

【化 2 1 3 6】



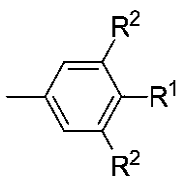
であり、ただし、L - A r が

【化 2 1 3 7】



であるとき、Arは

【化2138】



ではなく；

L^2 は、 $-NHR^{35}$ または $-C(O)NHR^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Hetは、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{員複素環})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ であり、この場合、 R^1 がHでも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

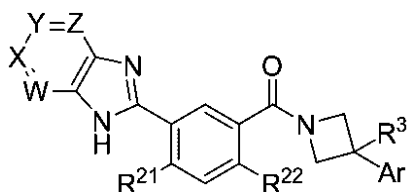
R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$ または $S(O)_2R^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k)式(XIX)：

【化2139】



(XIX)

(式中、

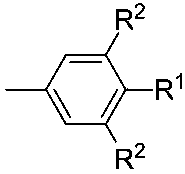
各W、X、Y及びZは、独立して、 $-N-$ または $-CR^{26}-$ であり、ただし、W、X、Y及びZのうち、 $-N-$ であるのは2つ以下であり；

各 R^{26} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-N(R^{27})_2$ 、 $-S(O)_2-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、または $-C(O)-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ であり；

各 R^{27} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、あるいは、 R^{27} は、両方とも $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、それらが結合しているNと一緒に互いに連結して、3～6員環を形成し、この場合、環は、環員の1つとして1つの酸素原子を必要に応じて含み、

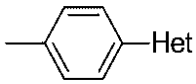
Arは、

【化 2 1 4 0】



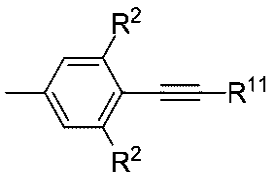
、

【化 2 1 4 1】



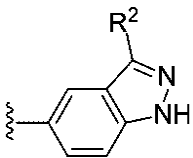
、

【化 2 1 4 2】



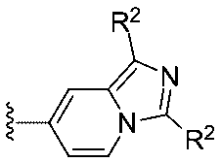
、

【化 2 1 4 3】



または

【化 2 1 4 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)、-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

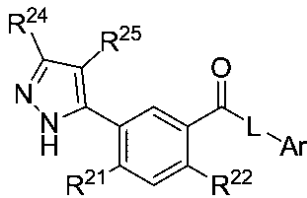
各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；R³は、HまたはFであり；R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) :

【化 2 1 4 5】

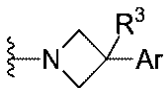


(X X)

(式中、

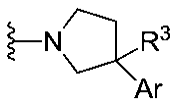
L - A r は、

【化 2 1 4 6】



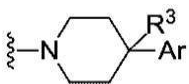
、

【化 2 1 4 7】



または

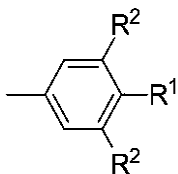
【化 2 1 4 8】



であり ;

A r は、

【化 2 1 4 9】



であり ;

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O- (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ~ 6 員複素環) または -O- (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており ;

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり ;

R³ は、H または F であり ;

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり ;

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり ;

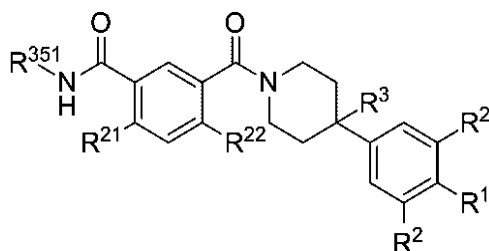
R²⁴ は、-O- (C₁ ~ C₄ アルキル)、-O- (C₁ ~ C₄ アルキル) - O- (C₁ ~ C₄ アルキル)、-O- (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -O- (4 ~ 6 員複素環) であり ;

環)であり、この場合、 $R^{2,4}$ は、1つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

$R^{2,5}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $R^{2,5}$ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m)式(XI)：

【化2150】



(XI)

式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

$R^{2,1}$ は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

$R^{2,2}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

$R^{3,5,1}$ は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_2-O-(C_1$ もしくは C_2 アルキル)である)もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組成物。

【請求項2】

前記脂肪性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)及び非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記脂肪性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)である、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項4】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式(IX)、(X)、(XII)、(XIV)、(XV)または(XX)を有する、請求項1～3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項5】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式(IX)を有する、請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式(X)を有する、請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式(XII)を有する、請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XIV) を有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XV) を有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

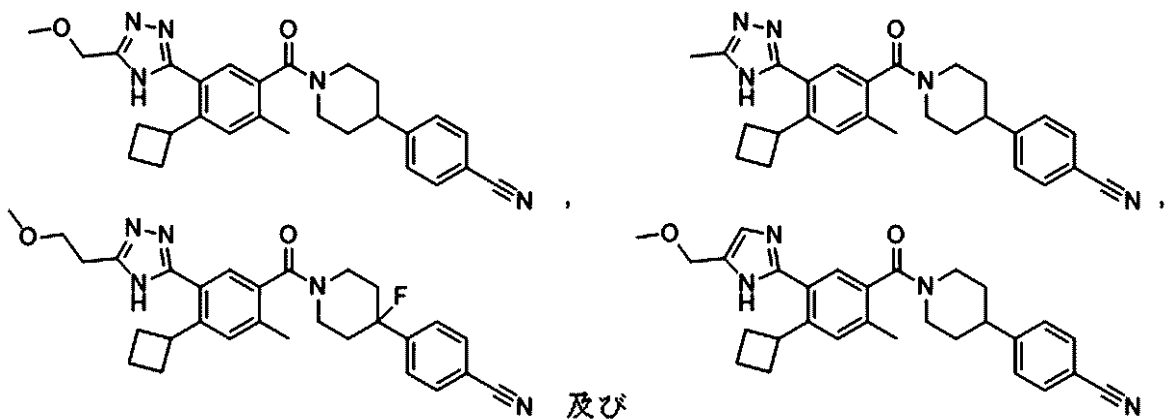
【請求項 10】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XX) を有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 11】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 2151】

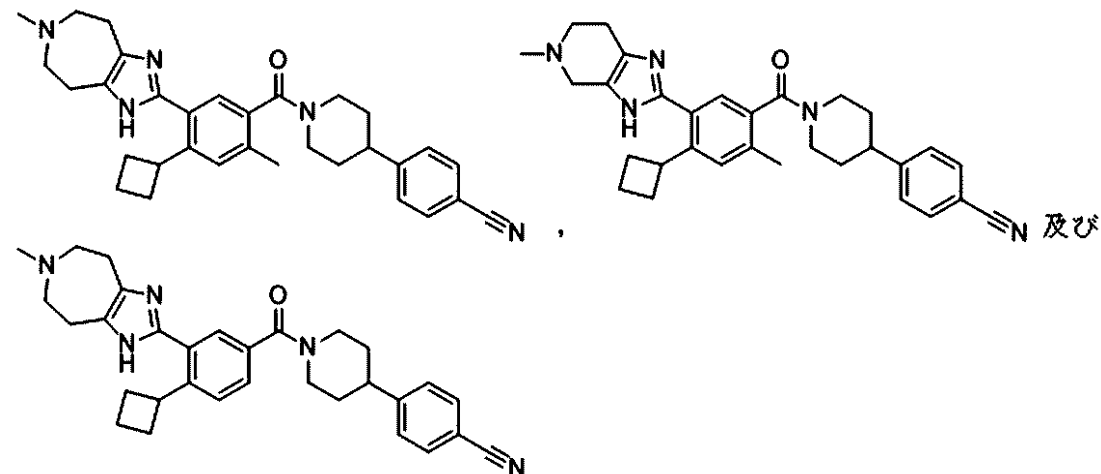


から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 12】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 2152】



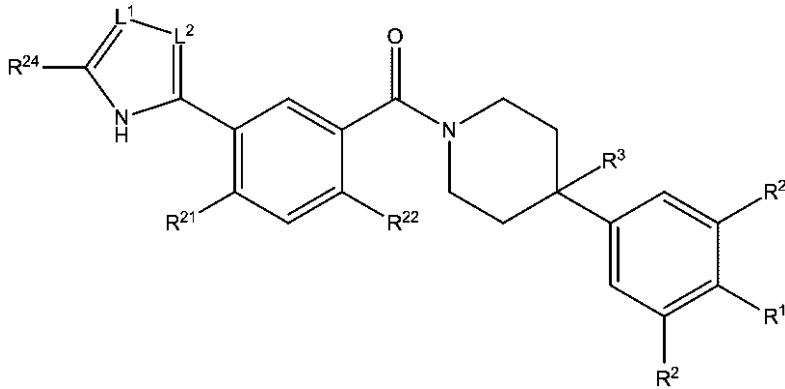
から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 13】

非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH) を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2 1 5 3】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

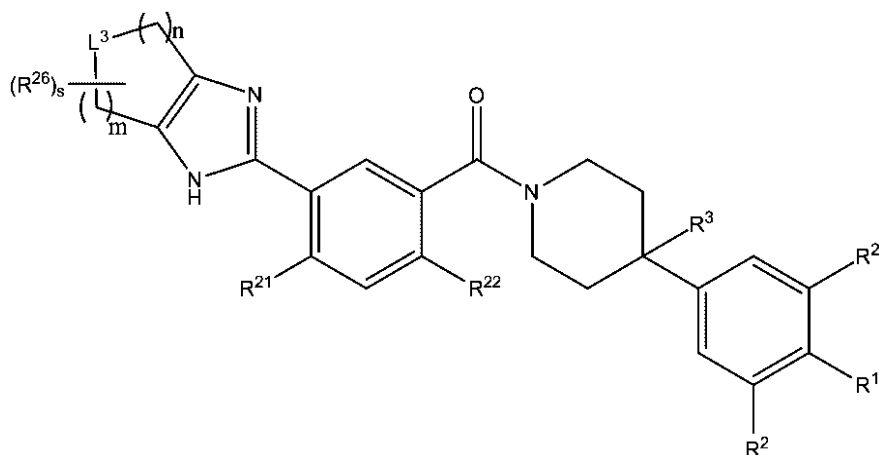
L² は、CH またはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式(X)：

【化 2 1 5 4】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

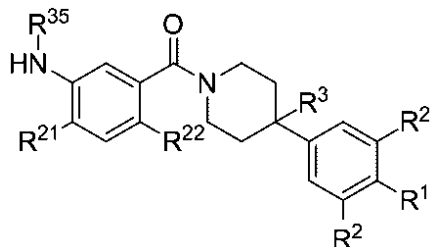
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2155】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

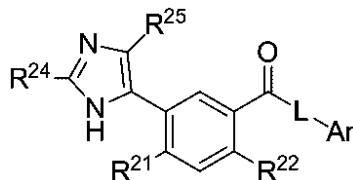
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2156】

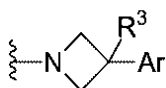


(XII)

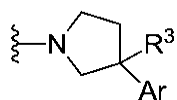
(式中、

L-Ar は、

【化2157】

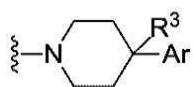


【化 2 1 5 8】



または

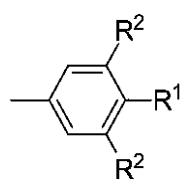
【化 2 1 5 9】



であり；

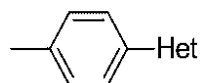
A r は、

【化 2 1 6 0】



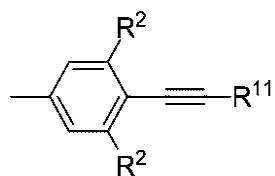
、

【化 2 1 6 1】



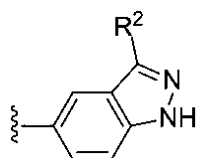
、

【化 2 1 6 2】



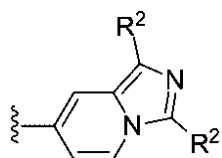
、

【化 2 1 6 3】



または

【化 2 1 6 4】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

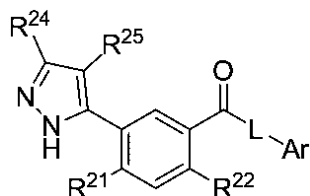
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化2165】

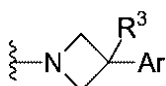


(XIII)

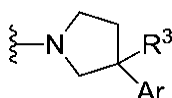
(式中、

L - Ar は、

【化2166】

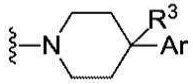


、
【化2167】



または

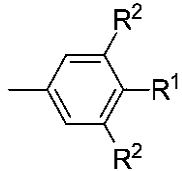
【化 2 1 6 8】



であり；

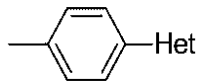
A r は、

【化 2 1 6 9】



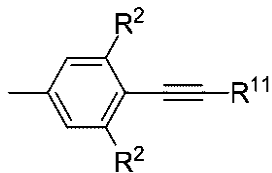
、

【化 2 1 7 0】



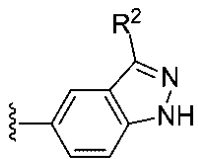
、

【化 2 1 7 1】



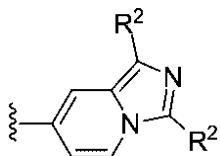
、

【化 2 1 7 2】



または

【化 2 1 7 3】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

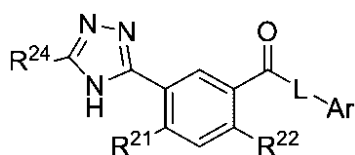
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 1 7 4】

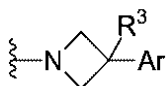


(XIV)

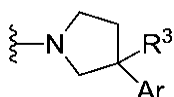
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 1 7 5】



、
【化 2 1 7 6】



または

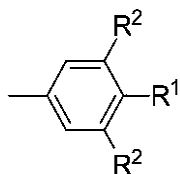
【化 2 1 7 7】



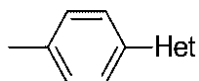
であり；

Ar は、

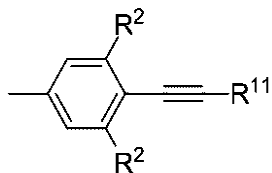
【化 2 1 7 8】



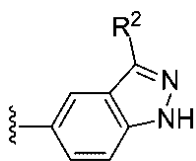
、
【化 2 1 7 9】



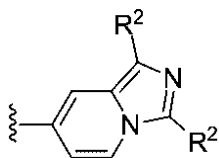
、
【化 2 1 8 0】



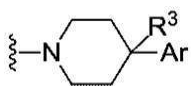
、
【化 2 1 8 1】



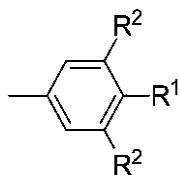
または
【化 2 1 8 2】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 1 8 3】



であるとき、Ar は
【化 2 1 8 4】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

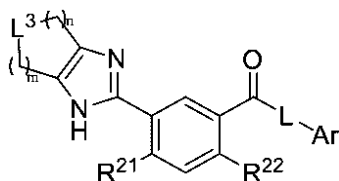
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g)式(XV)：

【化2185】



(XV)

(式中、

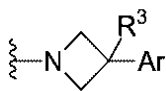
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

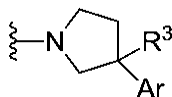
$L-Ar$ は、

【化2186】



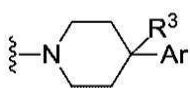
、

【化2187】



または

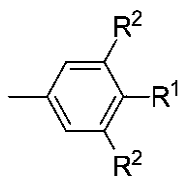
【化2188】



であり；

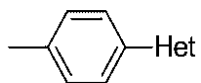
Ar は、

【化 2 1 8 9】



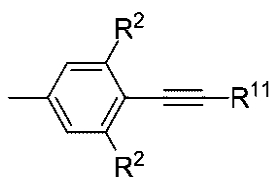
、

【化 2 1 9 0】



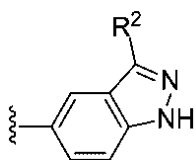
、

【化 2 1 9 1】



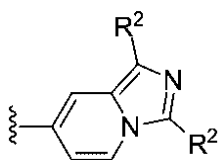
、

【化 2 1 9 2】



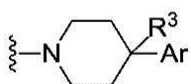
または

【化 2 1 9 3】



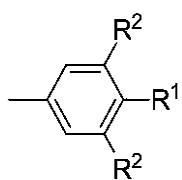
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 9 4】



であるとき、Ar は

【化 2 1 9 5】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

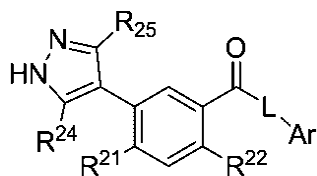
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 1 9 6】

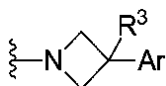


(XVI)

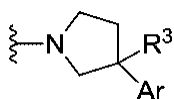
(式中、

L - Ar は、

【化 2 1 9 7】

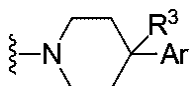


、
【化 2 1 9 8】



または

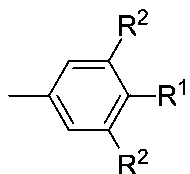
【化 2 1 9 9】



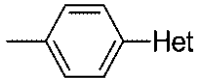
であり；

Ar は、

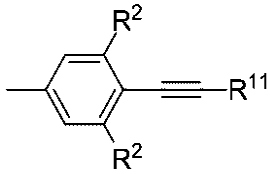
【化 2 2 0 0】



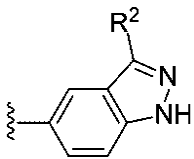
、
【化 2 2 0 1】



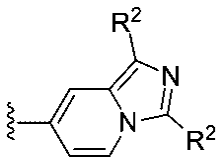
、
【化 2 2 0 2】



、
【化 2 2 0 3】



または
【化 2 2 0 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

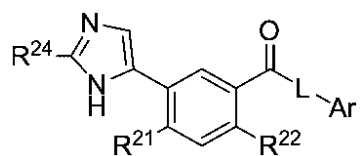
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 2 0 5】

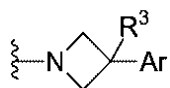


(XVII)

(式中、

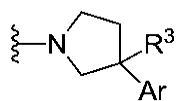
L - Ar は、

【化 2 2 0 6】



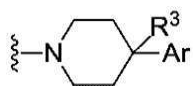
、

【化 2 2 0 7】



または

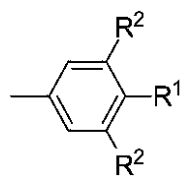
【化 2 2 0 8】



であり；

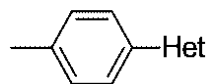
Ar は、

【化 2 2 0 9】



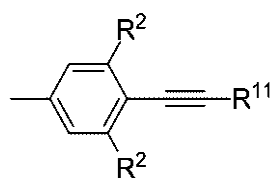
、

【化 2 2 1 0】



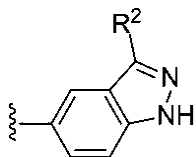
、

【化 2 2 1 1】



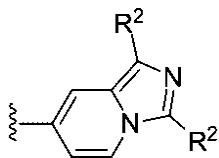
、

【化 2 2 1 2】



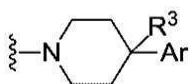
または

【化 2 2 1 3】



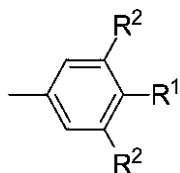
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 2 1 4】



であるとき、Ar は

【化 2 2 1 5】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

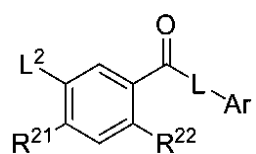
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹は、H または C₁～C₂アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 2 1 6】

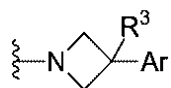


(X V I I I)

(式中、

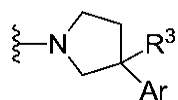
L - A r は、

【化 2 2 1 7】



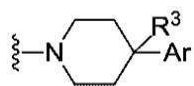
、

【化 2 2 1 8】



または

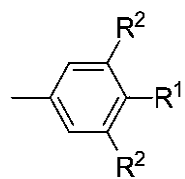
【化 2 2 1 9】



であり ;

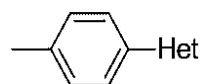
A r は、

【化 2 2 2 0】



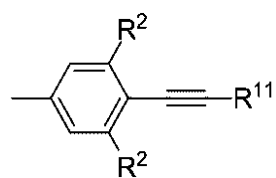
、

【化 2 2 2 1】

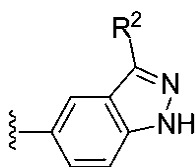


、

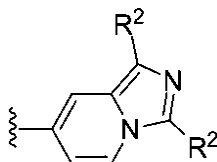
【化 2 2 2 2】



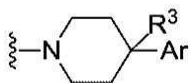
、
【化 2 2 2 3】



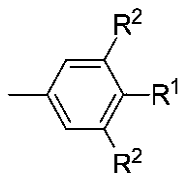
または
【化 2 2 2 4】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 2 2 5】



であるとき、Ar は
【化 2 2 2 6】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

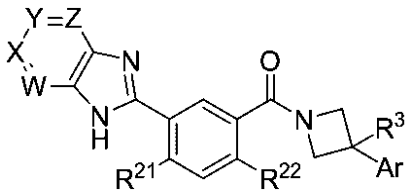
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 2 2 7】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

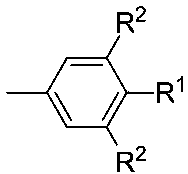
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

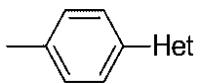
A r は、

【化 2 2 2 8】



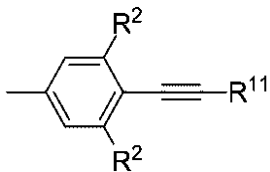
、

【化 2 2 2 9】



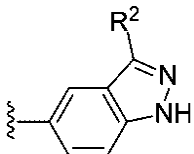
、

【化 2 2 3 0】



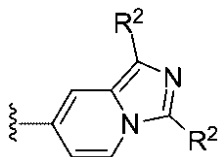
、

【化 2 2 3 1】



または

【化 2 2 3 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

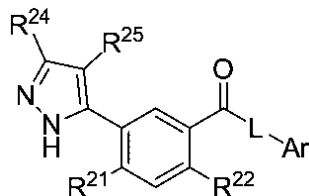
R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X)：

【化 2 2 3 3】

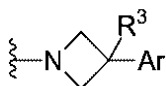


(X X)

(式中、

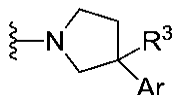
L - A r は、

【化 2 2 3 4】



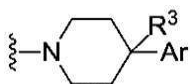
、

【化 2 2 3 5】



または

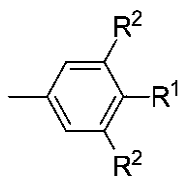
【化 2 2 3 6】



であり；

Ar は、

【化 2 2 3 7】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

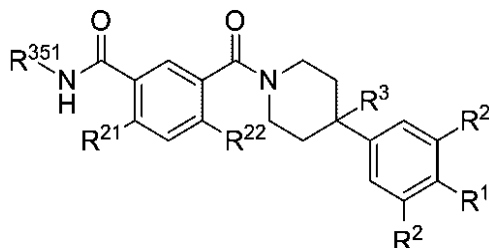
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 2 3 8】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

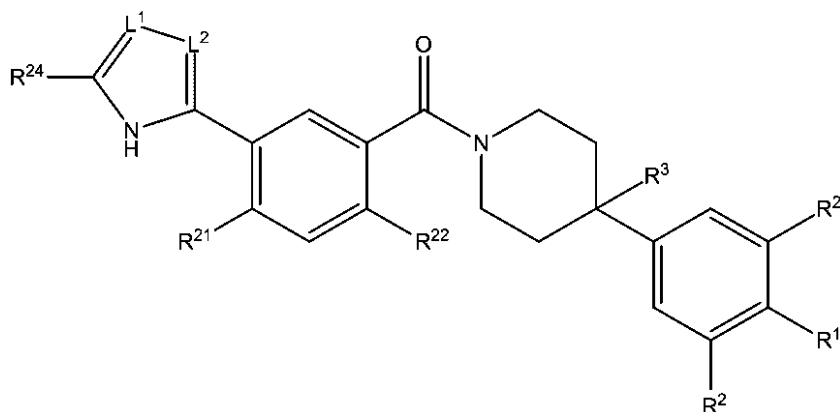
成物。

【請求項 14】

非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）を処置するための組成物であって、

（a）式（IX）

【化 2239】



（IX）

（式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル、-O-（C₃～C₅シクロアルキル）、-O-（C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル）であり、この場合、

C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル、C₃～C₅シクロアルキルであり、この場合、C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-（C₁～C₄アルキル）_t-OH、-（C₁～C₄アルキル）_t-O_t-（C₃～C₅シクロアルキル）、または-（C₁～C₄アルキル）_t-O-（C₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキル）であり、この場合、

t は、0または1であり；

C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³またはNであり；

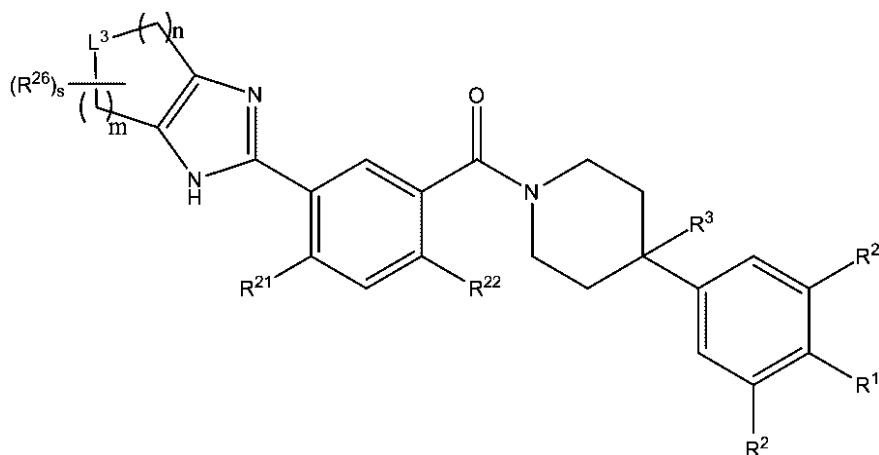
L² は、CHまたはNであり；

L¹ またはL² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

（b）式（X）：

【化 2 2 4 0】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

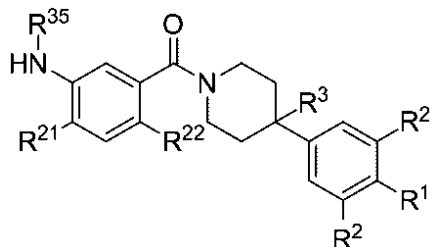
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2241】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

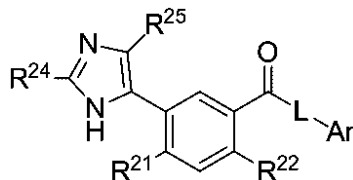
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} またはS(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2242】

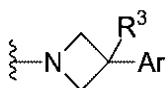


(XII)

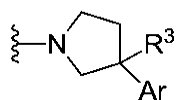
(式中、

L-Ar は、

【化2243】

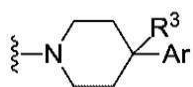


【化 2 2 4 4】



または

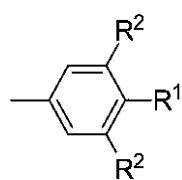
【化 2 2 4 5】



であり；

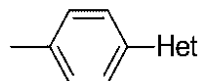
A r は、

【化 2 2 4 6】



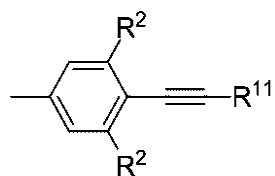
、

【化 2 2 4 7】



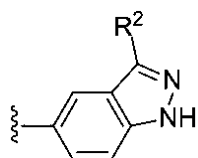
、

【化 2 2 4 8】



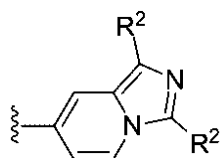
、

【化 2 2 4 9】



または

【化 2 2 5 0】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₆シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

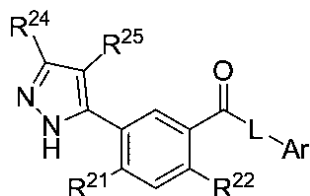
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e)式(XIII)：

【化2251】

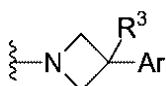


(XIII)

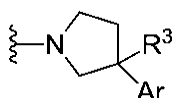
(式中、

L-Arは、

【化2252】

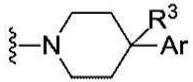


、
【化2253】



または

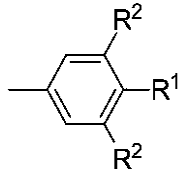
【化 2 2 5 4】



であり；

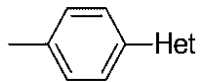
A r は、

【化 2 2 5 5】



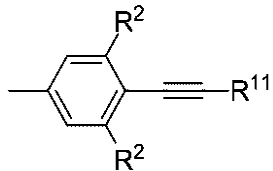
、

【化 2 2 5 6】



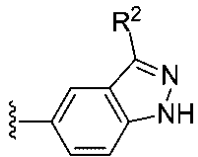
、

【化 2 2 5 7】



、

【化 2 2 5 8】



または

【化 2 2 5 9】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

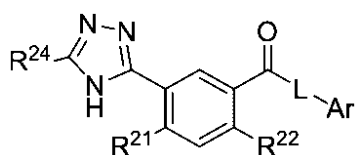
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 2 6 0】

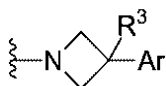


(XIV)

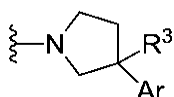
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 2 6 1】

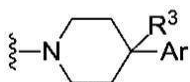


、
【化 2 2 6 2】



または

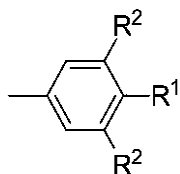
【化 2 2 6 3】



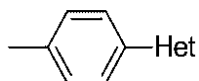
であり；

Ar は、

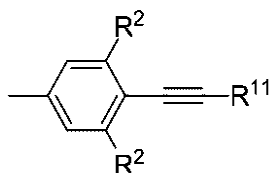
【化 2 2 6 4】



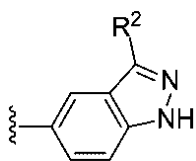
、
【化 2 2 6 5】



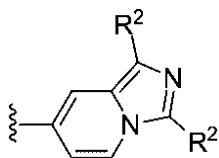
、
【化 2 2 6 6】



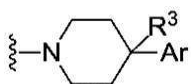
、
【化 2 2 6 7】



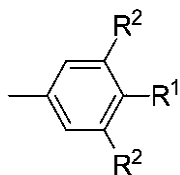
または
【化 2 2 6 8】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 2 6 9】



であるとき、Ar は
【化 2 2 7 0】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

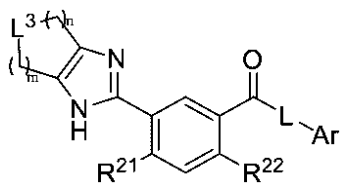
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2271】



(XV)

(式中、

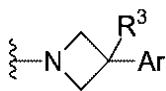
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

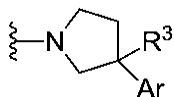
$L-Ar$ は、

【化2272】



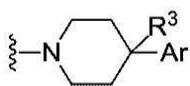
、

【化2273】



または

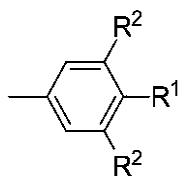
【化2274】



であり；

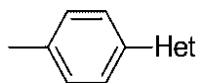
Ar は、

【化 2 2 7 5】



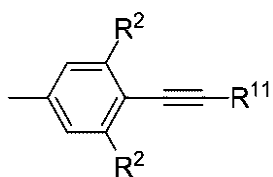
、

【化 2 2 7 6】



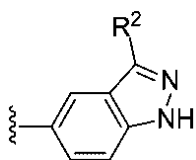
、

【化 2 2 7 7】



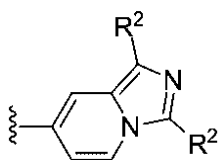
、

【化 2 2 7 8】



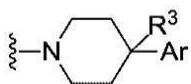
または

【化 2 2 7 9】



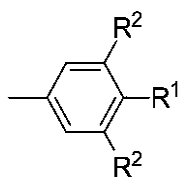
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 2 8 0】



であるとき、Ar は

【化 2 2 8 1】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

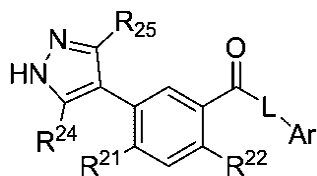
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化2282】

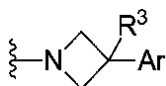


(XVI)

(式中、

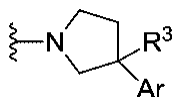
L - Ar は、

【化2283】



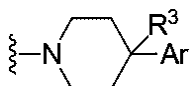
、

【化2284】



または

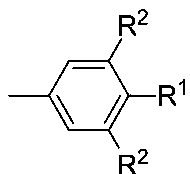
【化2285】



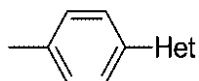
であり；

Ar は、

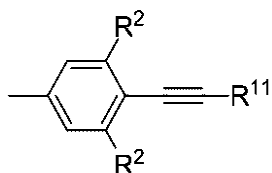
【化2286】



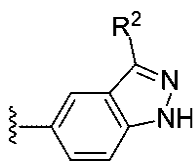
、
【化 2 2 8 7】



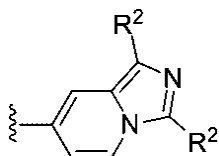
、
【化 2 2 8 8】



、
【化 2 2 8 9】



または
【化 2 2 9 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

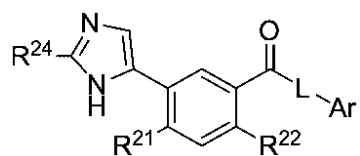
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 2 9 1】

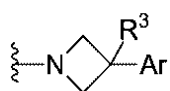


(XVII)

(式中、

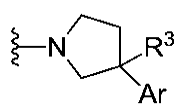
L - Ar は、

【化 2 2 9 2】



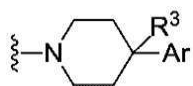
、

【化 2 2 9 3】



または

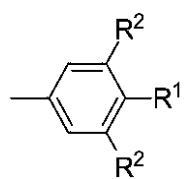
【化 2 2 9 4】



であり；

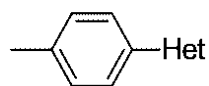
Ar は、

【化 2 2 9 5】



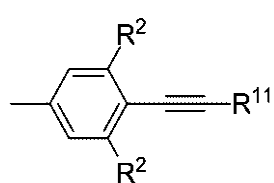
、

【化 2 2 9 6】



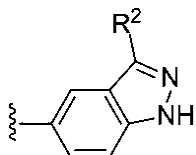
、

【化 2 2 9 7】



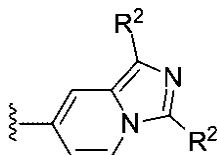
、

【化 2 2 9 8】



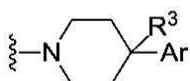
または

【化 2 2 9 9】



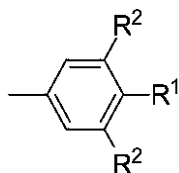
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 0 0】



であるとき、Ar は

【化 2 3 0 1】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

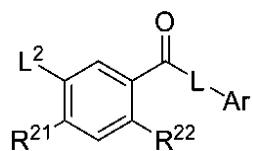
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 3 0 2】

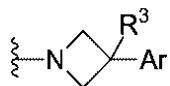


(X V I I I)

(式中、

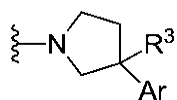
L - A r は、

【化 2 3 0 3】



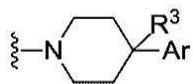
、

【化 2 3 0 4】



または

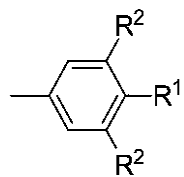
【化 2 3 0 5】



であり ;

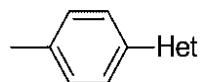
A r は、

【化 2 3 0 6】



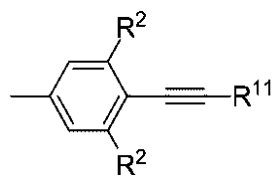
、

【化 2 3 0 7】

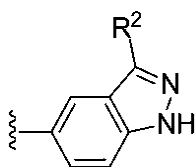


、

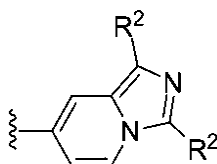
【化 2 3 0 8】



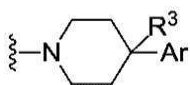
、
【化 2 3 0 9】



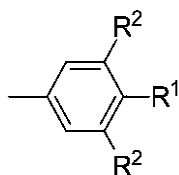
または
【化 2 3 1 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 3 1 1】



であるとき、Ar は
【化 2 3 1 2】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

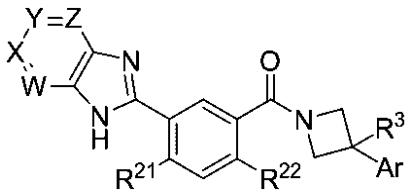
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 3 1 3】



(X I X)

(式中、

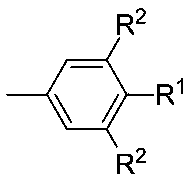
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

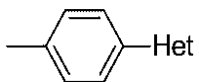
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じて含み、

A r は、

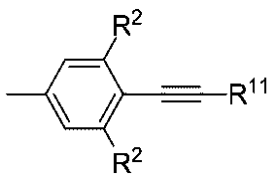
【化 2 3 1 4】



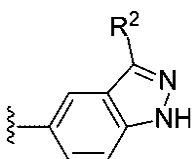
【化 2 3 1 5】



【化 2 3 1 6】

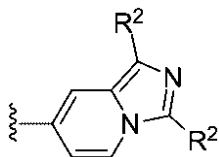


【化 2 3 1 7】



または

【化 2 3 1 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

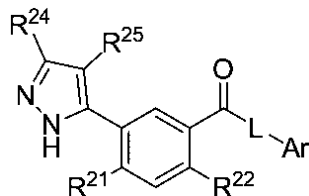
R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 3 1 9】

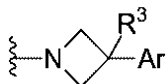


(X X)

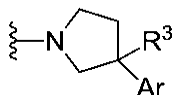
(式中、

L - A r は、

【化 2 3 2 0】

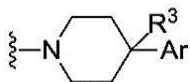


【化 2 3 2 1】



または

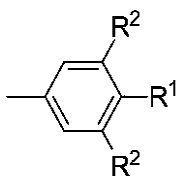
【化 2 3 2 2】



であり；

Ar は、

【化 2 3 2 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

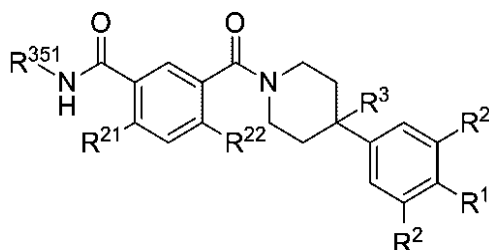
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 3 2 4】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

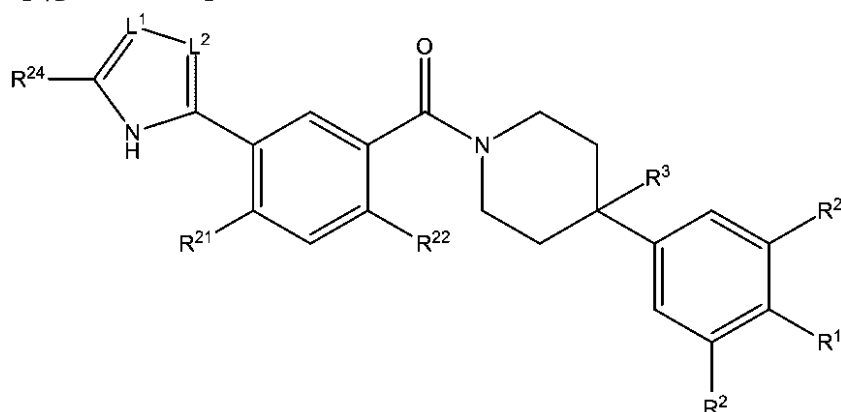
成物。

【請求項 15】

メタボリックシンドロームを処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2325】



(IX)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -O $_t$ -($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、CR 23 またはNであり；

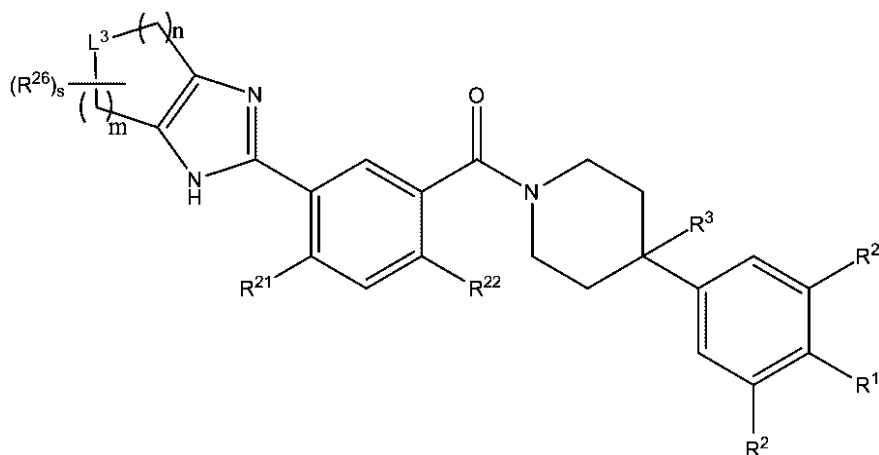
L^2 は、CHまたはNであり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R^{23} は、Hまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 3 2 6】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

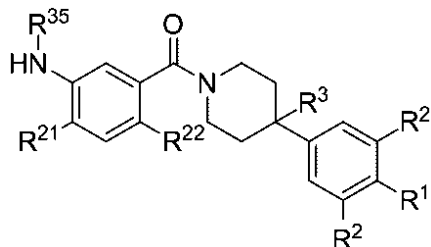
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2327】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

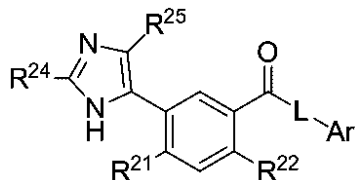
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2328】

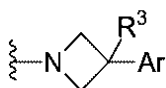


(XII)

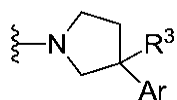
(式中、

L-Ar は、

【化2329】

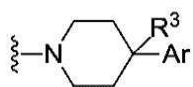


【化 2 3 3 0】



または

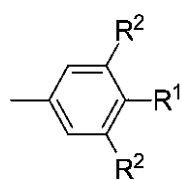
【化 2 3 3 1】



であり；

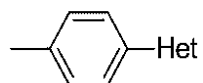
A r は、

【化 2 3 3 2】



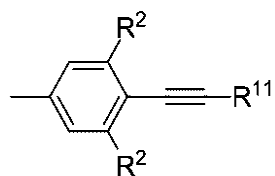
、

【化 2 3 3 3】



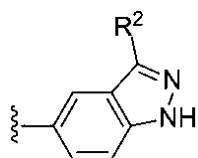
、

【化 2 3 3 4】



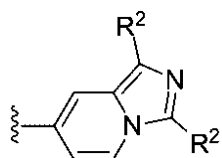
、

【化 2 3 3 5】



または

【化 2 3 3 6】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₆シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

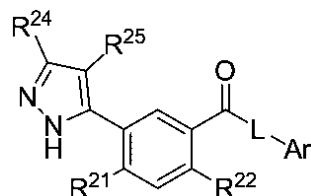
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e)式(XIII)：

【化2337】

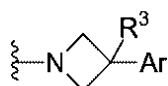


(XIII)

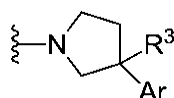
(式中、

L-Arは、

【化2338】

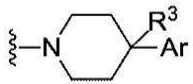


、
【化2339】



または

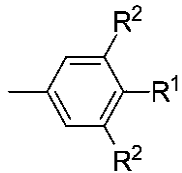
【化 2 3 4 0】



であり；

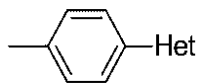
A r は、

【化 2 3 4 1】



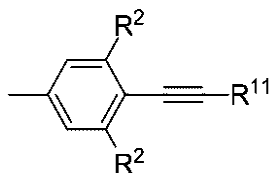
、

【化 2 3 4 2】



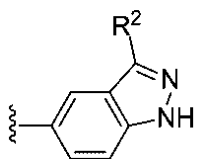
、

【化 2 3 4 3】



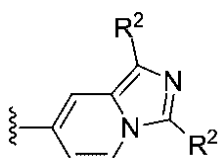
、

【化 2 3 4 4】



または

【化 2 3 4 5】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

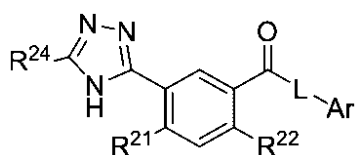
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2346】

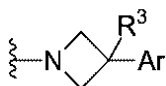


(XIV)

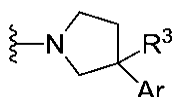
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2347】

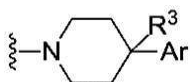


、
【化 2348】



または

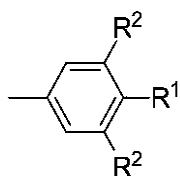
【化 2349】



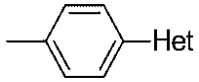
であり；

Ar は、

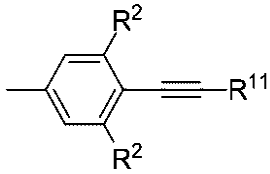
【化 2350】



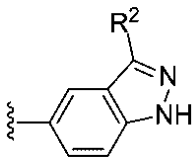
、
【化 2 3 5 1】



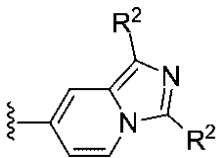
、
【化 2 3 5 2】



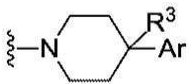
、
【化 2 3 5 3】



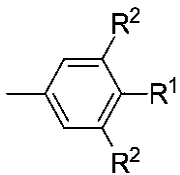
または
【化 2 3 5 4】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 3 5 5】



であるとき、Ar は
【化 2 3 5 6】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

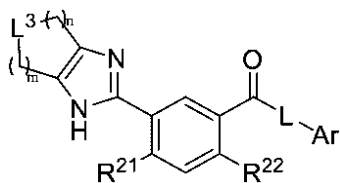
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2357】



(XV)

(式中、

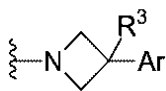
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

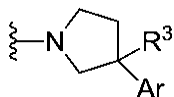
$L-Ar$ は、

【化2358】



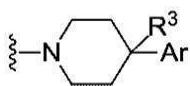
、

【化2359】



または

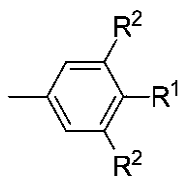
【化2360】



であり；

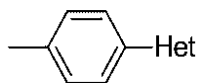
Ar は、

【化 2 3 6 1】



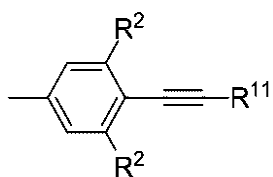
、

【化 2 3 6 2】



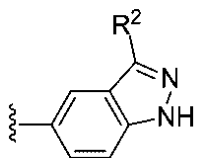
、

【化 2 3 6 3】



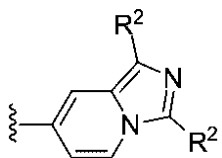
、

【化 2 3 6 4】



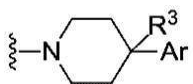
または

【化 2 3 6 5】



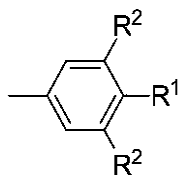
であり、ただし、L - A r が

【化 2 3 6 6】



であるとき、A r は

【化 2 3 6 7】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

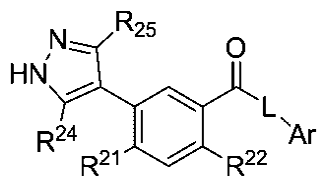
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2368】

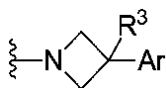


(XVI)

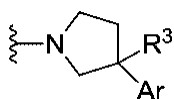
(式中、

L - Ar は、

【化 2369】

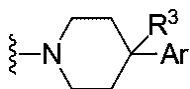


、
【化 2370】



または

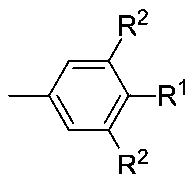
【化 2371】



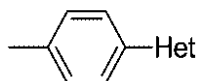
であり；

Ar は、

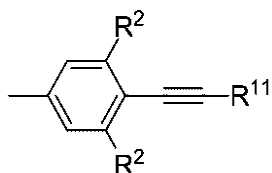
【化 2372】



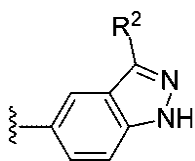
、
【化 2 3 7 3】



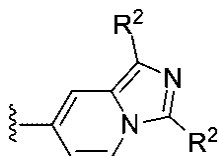
、
【化 2 3 7 4】



、
【化 2 3 7 5】



または
【化 2 3 7 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

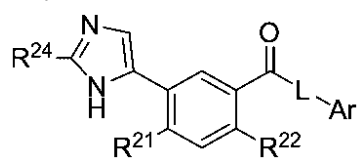
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 3 7 7】

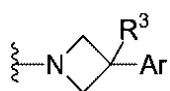


(XVII)

(式中、

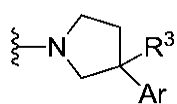
L - Ar は、

【化 2 3 7 8】



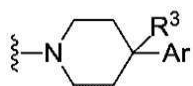
、

【化 2 3 7 9】



または

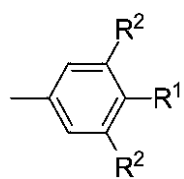
【化 2 3 8 0】



であり；

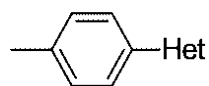
Ar は、

【化 2 3 8 1】



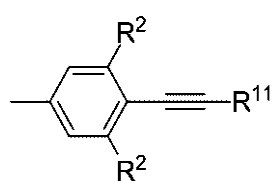
、

【化 2 3 8 2】



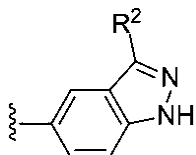
、

【化 2 3 8 3】



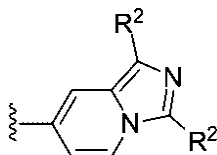
、

【化 2 3 8 4】



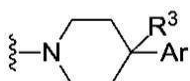
または

【化 2 3 8 5】



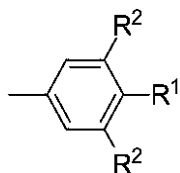
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 8 6】



であるとき、Ar は

【化 2 3 8 7】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

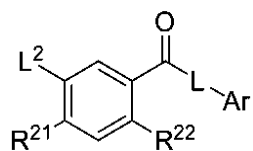
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 3 8 8】

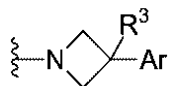


(X V I I I)

(式中、

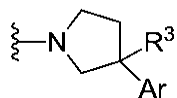
$L - Ar$ は、

【化 2 3 8 9】



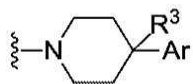
、

【化 2 3 9 0】



または

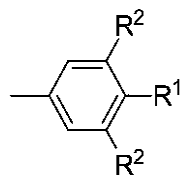
【化 2 3 9 1】



であり ;

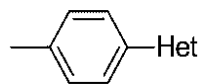
Ar は、

【化 2 3 9 2】



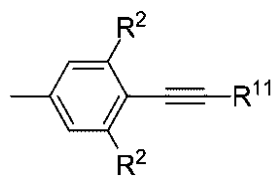
、

【化 2 3 9 3】

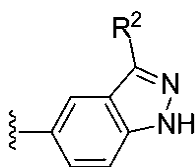


、

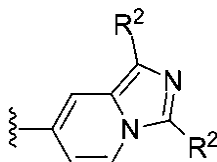
【化 2 3 9 4】



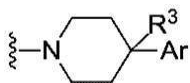
、
【化 2 3 9 5】



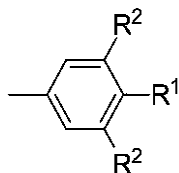
または
【化 2 3 9 6】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 3 9 7】



であるとき、Ar は
【化 2 3 9 8】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

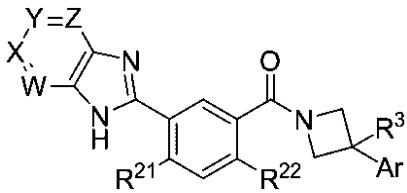
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 3 9 9】



(X I X)

(式中、

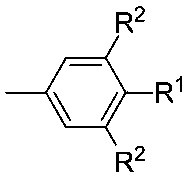
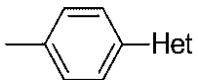
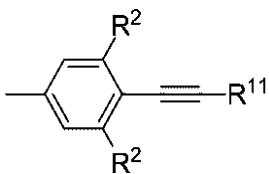
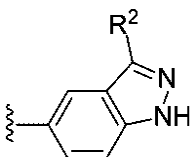
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じで含み、

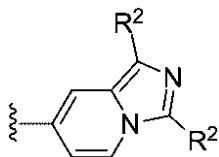
A r は、

【化 2 4 0 0】

、
【化 2 4 0 1】、
【化 2 4 0 2】、
【化 2 4 0 3】

または

【化 2 4 0 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

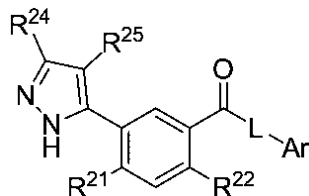
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X)：

【化 2 4 0 5】

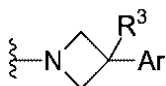


(X X)

(式中、

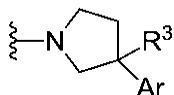
L - A r は、

【化 2 4 0 6】



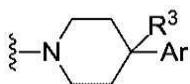
、

【化 2 4 0 7】



または

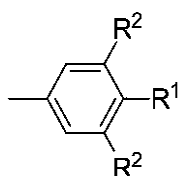
【化 2 4 0 8】



であり；

Ar は、

【化 2 4 0 9】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(4～6 員複素環) または -O-(C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

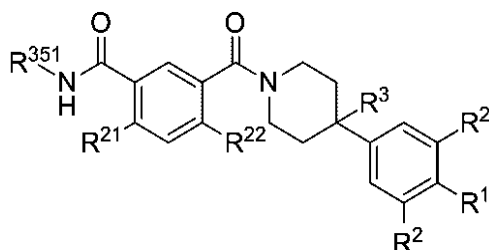
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₁～C₄ アルキル)-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O-(4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 4 1 0】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O-(C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

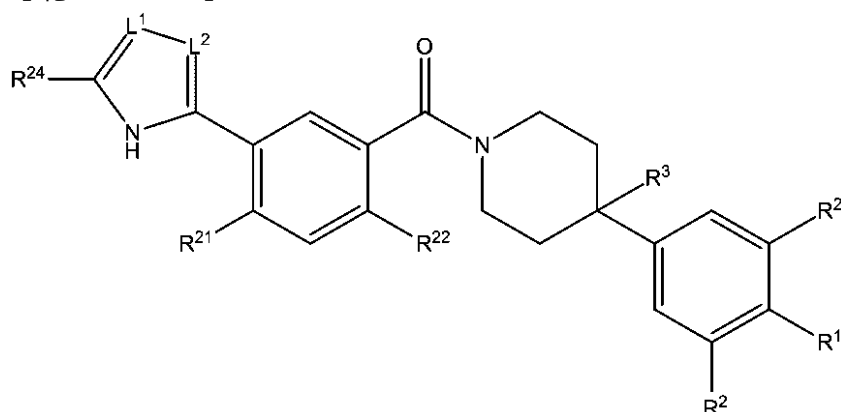
成物。

【請求項 16】

肝硬変を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2411】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

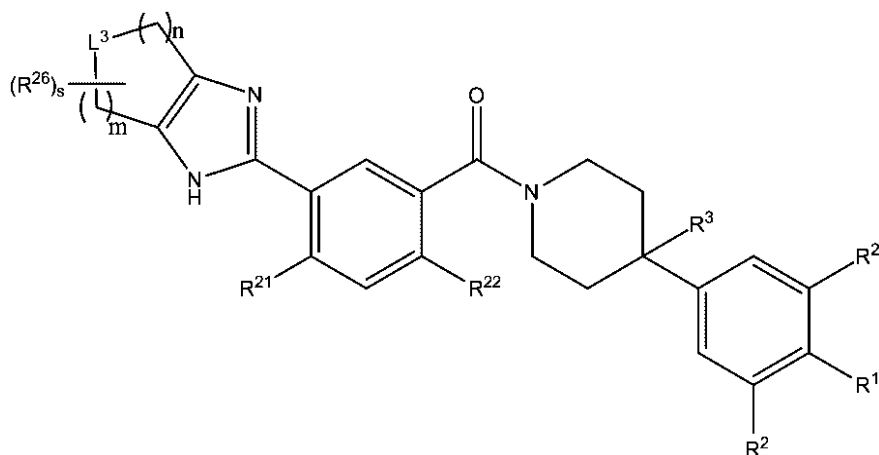
L² は、CHまたはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 4 1 2】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

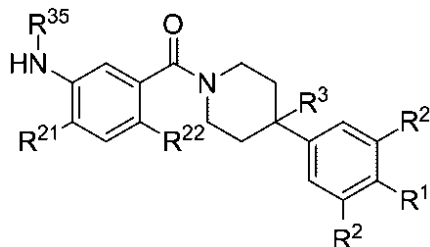
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2413】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

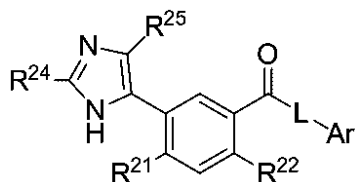
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} またはS(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2414】

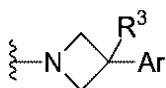


(XII)

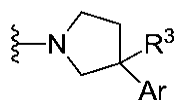
(式中、

L-Ar は、

【化2415】

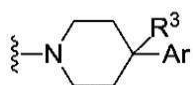


【化 2 4 1 6】



または

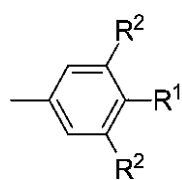
【化 2 4 1 7】



であり；

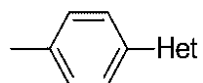
A r は、

【化 2 4 1 8】



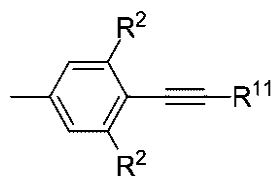
、

【化 2 4 1 9】



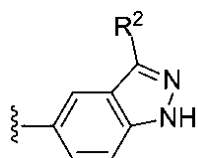
、

【化 2 4 2 0】



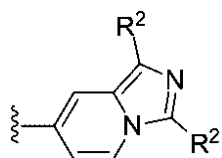
、

【化 2 4 2 1】



または

【化 2 4 2 2】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

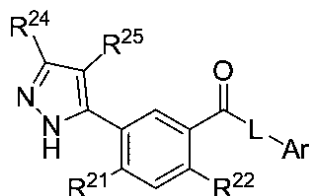
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化2423】

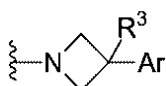


(XIII)

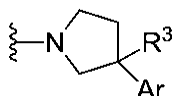
(式中、

L - Ar は、

【化2424】

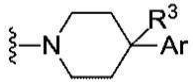


、
【化2425】



または

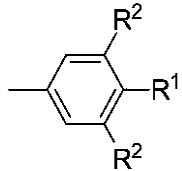
【化 2 4 2 6】



であり；

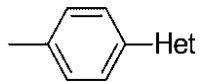
A r は、

【化 2 4 2 7】



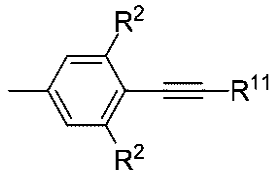
、

【化 2 4 2 8】



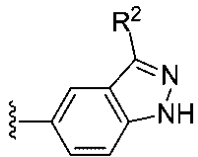
、

【化 2 4 2 9】



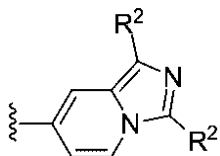
、

【化 2 4 3 0】



または

【化 2 4 3 1】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

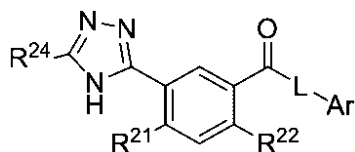
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 4 3 2】

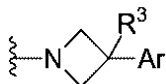


(XIV)

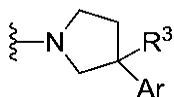
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 4 3 3】

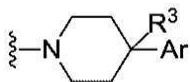


、
【化 2 4 3 4】



または

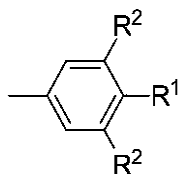
【化 2 4 3 5】



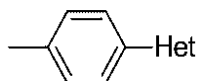
であり；

Ar は、

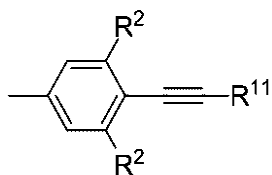
【化 2 4 3 6】



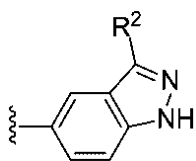
、
【化 2 4 3 7】



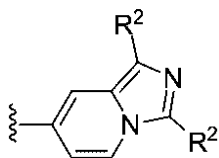
、
【化 2 4 3 8】



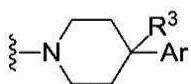
、
【化 2 4 3 9】



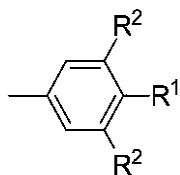
または
【化 2 4 4 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 4 4 1】



であるとき、Ar は
【化 2 4 4 2】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

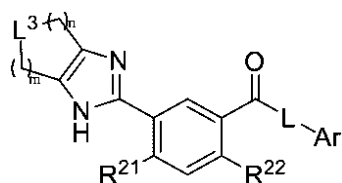
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 4 4 3】



(XV)

(式中、

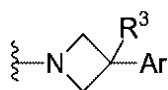
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \geq 3$ であり；

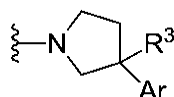
$L-Ar$ は、

【化 2 4 4 4】



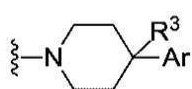
、

【化 2 4 4 5】



または

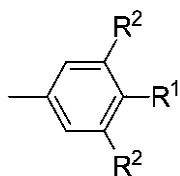
【化 2 4 4 6】



であり；

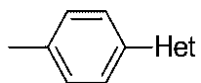
Ar は、

【化 2 4 4 7】



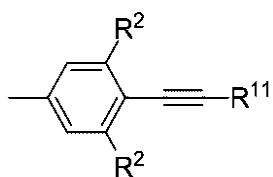
、

【化 2 4 4 8】



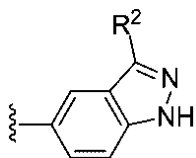
、

【化 2 4 4 9】



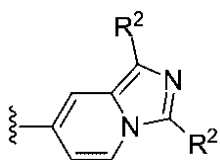
、

【化 2 4 5 0】



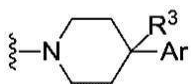
または

【化 2 4 5 1】



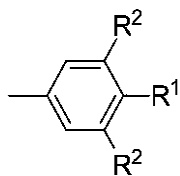
であり、ただし、L - A r が

【化 2 4 5 2】



であるとき、A r は

【化 2 4 5 3】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

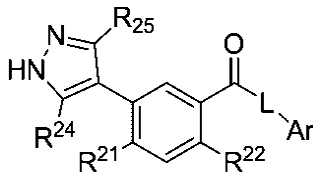
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 4 5 4】

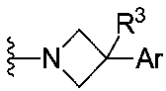


(XVI)

(式中、

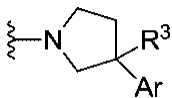
L - Ar は、

【化 2 4 5 5】



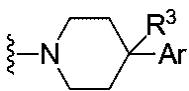
、

【化 2 4 5 6】



または

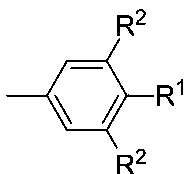
【化 2 4 5 7】



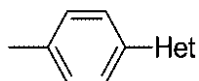
であり；

Ar は、

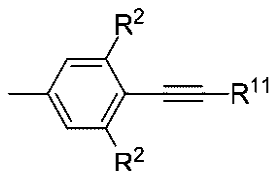
【化 2 4 5 8】



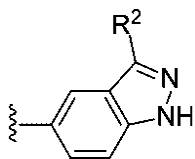
、
【化 2 4 5 9】



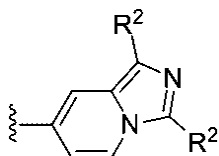
、
【化 2 4 6 0】



、
【化 2 4 6 1】



または
【化 2 4 6 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

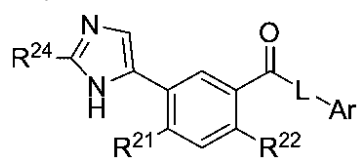
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 4 6 3】

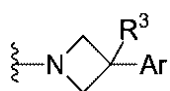


(X V I I)

(式中、

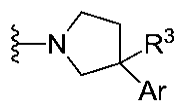
L - A r は、

【化 2 4 6 4】



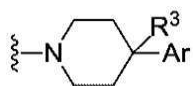
、

【化 2 4 6 5】



または

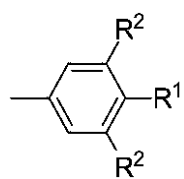
【化 2 4 6 6】



であり；

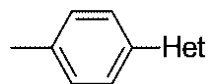
A r は、

【化 2 4 6 7】



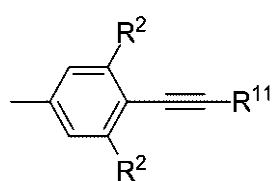
、

【化 2 4 6 8】



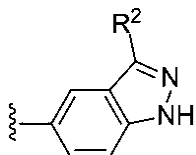
、

【化 2 4 6 9】



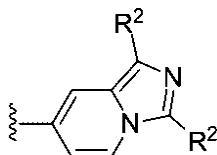
、

【化 2 4 7 0】



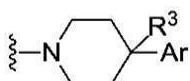
または

【化 2 4 7 1】



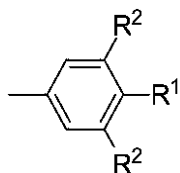
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 4 7 2】



であるとき、Ar は

【化 2 4 7 3】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R²⁴¹)₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)ₜ - Oᵤ - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)ₜ - Oᵤ - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

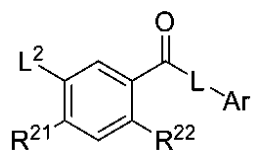
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹ は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 4 7 4】

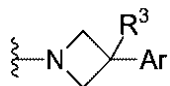


(X V I I I)

(式中、

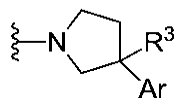
L - A r は、

【化 2 4 7 5】



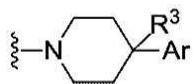
、

【化 2 4 7 6】



または

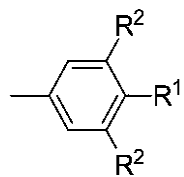
【化 2 4 7 7】



であり ;

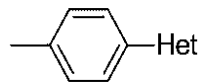
A r は、

【化 2 4 7 8】



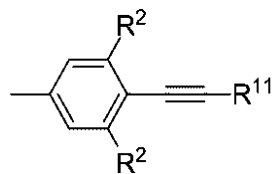
、

【化 2 4 7 9】

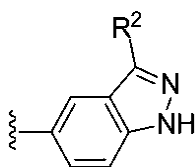


、

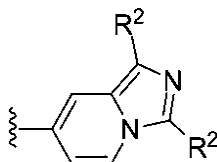
【化 2 4 8 0】



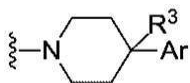
、
【化 2 4 8 1】



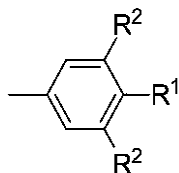
または
【化 2 4 8 2】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 4 8 3】



であるとき、Ar は
【化 2 4 8 4】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5 1} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じで置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

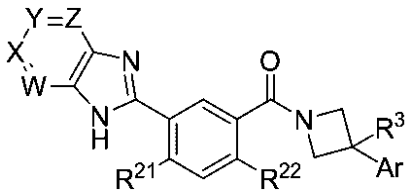
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 4 8 5】



(X I X)

(式中、

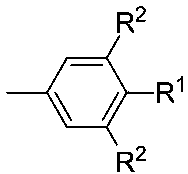
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R ^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R ^{2 6} は、独立して、H、C ₁ ~ C ₄ アルキル、- O - (C ₁ ~ C ₄ アルキル)、- N (R ^{2 7}) ₂、- S (O) ₂ - (C ₁ ~ C ₄ アルキル)、または - C (O) - (C ₁ ~ C ₄ アルキル) であり；

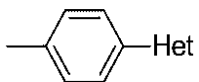
各 R ^{2 7} は、独立して、H または C ₁ ~ C ₄ アルキルであり、あるいは、R ^{2 7} は、両方とも C ₁ ~ C ₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じで含み、

A r は、

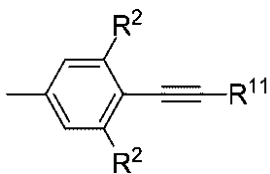
【化 2 4 8 6】



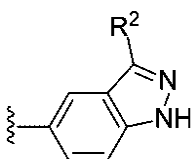
【化 2 4 8 7】



【化 2 4 8 8】

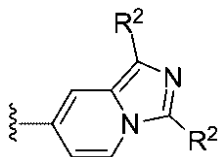


【化 2 4 8 9】



または

【化 2 4 9 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

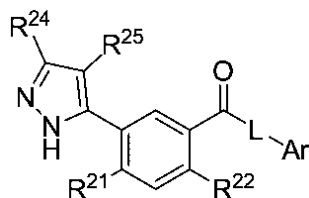
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 4 9 1】

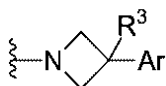


(X X)

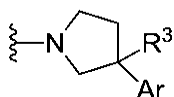
(式中、

L - A r は、

【化 2 4 9 2】

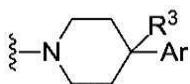


【化 2 4 9 3】



または

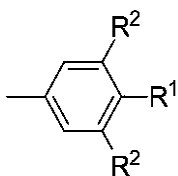
【化 2 4 9 4】



であり；

Ar は、

【化 2 4 9 5】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

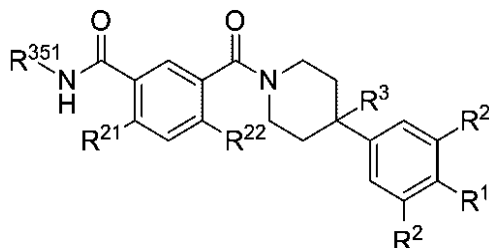
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 4 9 6】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

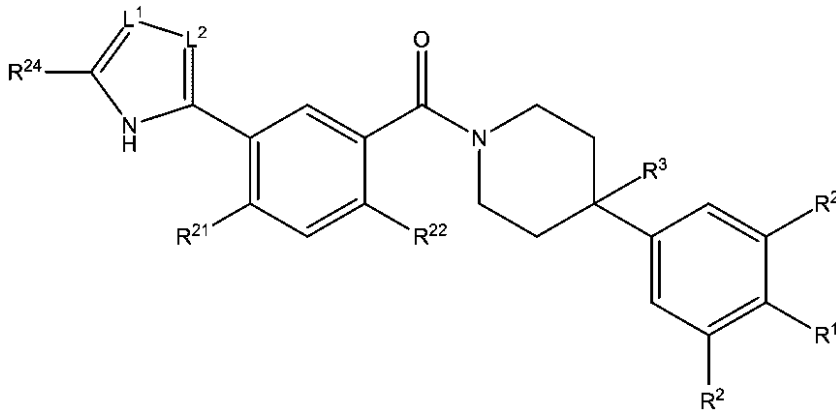
成物。

【請求項 17】

肝線維症を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2497】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

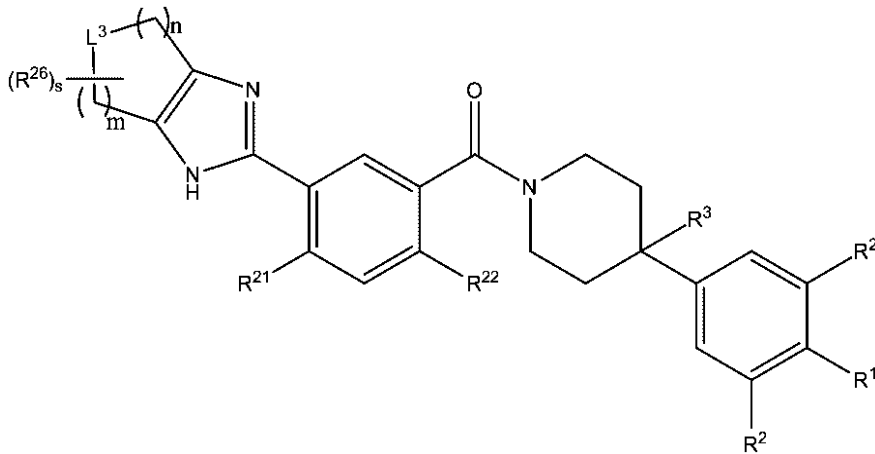
L² は、CH またはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 4 9 8】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

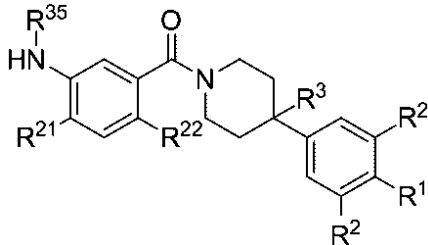
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2499】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

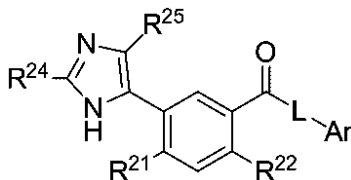
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2500】

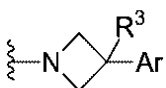


(XII)

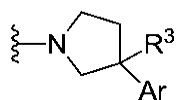
(式中、

L - Ar は、

【化2501】

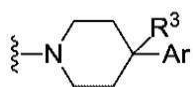


【化 2 5 0 2】



または

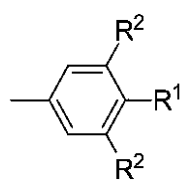
【化 2 5 0 3】



であり；

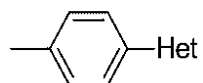
A r は、

【化 2 5 0 4】



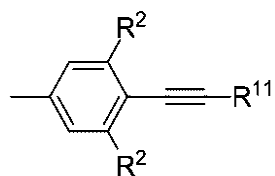
、

【化 2 5 0 5】



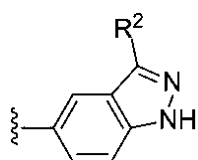
、

【化 2 5 0 6】



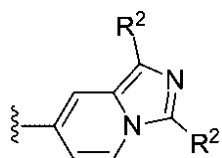
、

【化 2 5 0 7】



または

【化 2 5 0 8】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

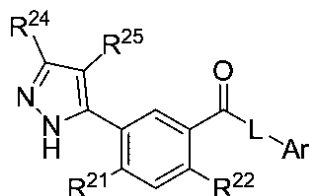
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化2509】

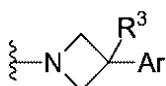


(XIII)

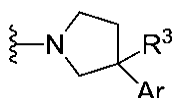
(式中、

L - Ar は、

【化2510】

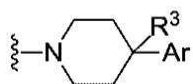


、
【化2511】



または

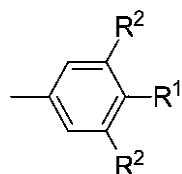
【化 2 5 1 2】



であり；

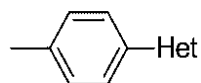
A r は、

【化 2 5 1 3】



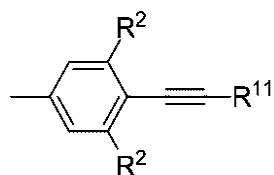
、

【化 2 5 1 4】



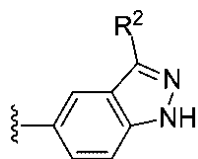
、

【化 2 5 1 5】



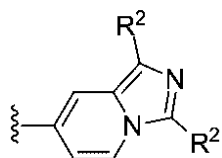
、

【化 2 5 1 6】



または

【化 2 5 1 7】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

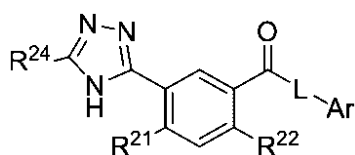
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2518】

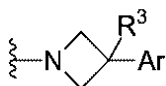


(XIV)

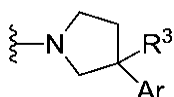
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2519】



、
【化 2520】



または

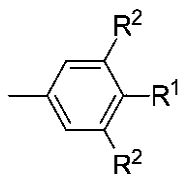
【化 2521】



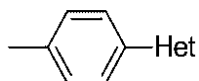
であり；

Ar は、

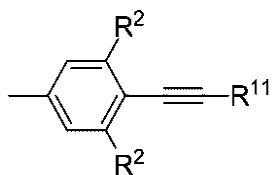
【化 2522】



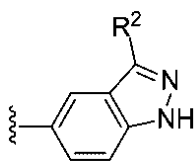
、
【化 2 5 2 3】



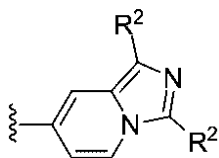
、
【化 2 5 2 4】



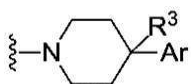
、
【化 2 5 2 5】



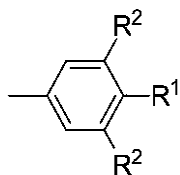
または
【化 2 5 2 6】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 5 2 7】



であるとき、Ar は
【化 2 5 2 8】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

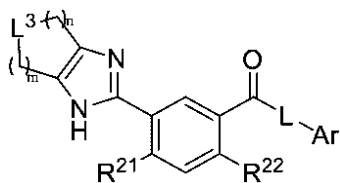
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 5 2 9】



(XV)

(式中、

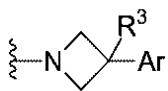
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

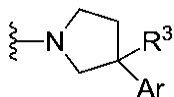
$L-Ar$ は、

【化 2 5 3 0】



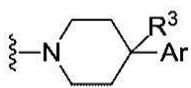
、

【化 2 5 3 1】



または

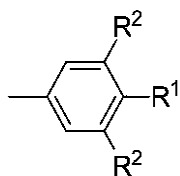
【化 2 5 3 2】



であり；

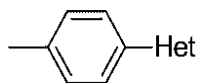
Ar は、

【化 2 5 3 3】



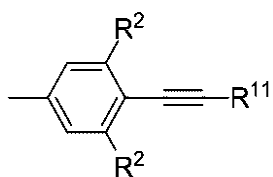
、

【化 2 5 3 4】



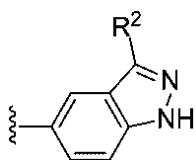
、

【化 2 5 3 5】



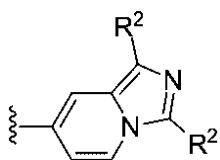
、

【化 2 5 3 6】



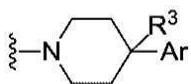
または

【化 2 5 3 7】



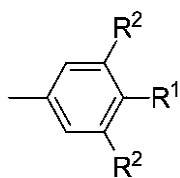
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 5 3 8】



であるとき、Ar は

【化 2 5 3 9】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

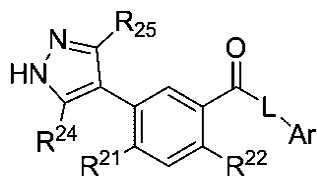
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 5 4 0】

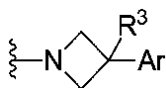


(XVI)

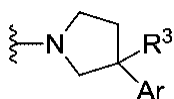
(式中、

L - Ar は、

【化 2 5 4 1】

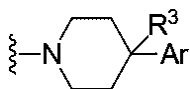


、
【化 2 5 4 2】



または

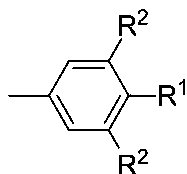
【化 2 5 4 3】



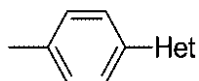
であり；

Ar は、

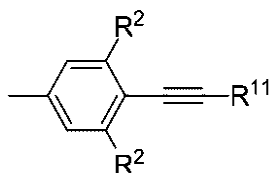
【化 2 5 4 4】



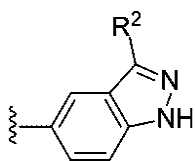
、
【化 2 5 4 5】



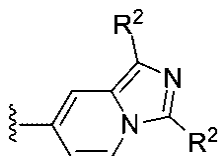
、
【化 2 5 4 6】



、
【化 2 5 4 7】



または
【化 2 5 4 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

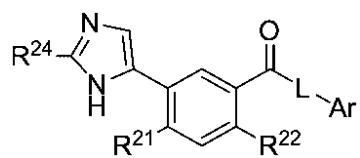
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 5 4 9】

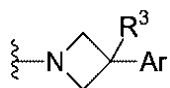


(XV I I)

(式中、

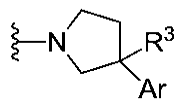
L - A r は、

【化 2 5 5 0】



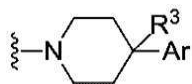
、

【化 2 5 5 1】



または

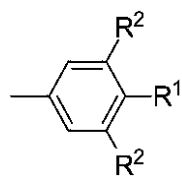
【化 2 5 5 2】



であり；

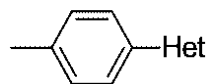
A r は、

【化 2 5 5 3】



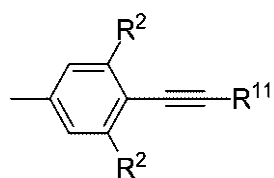
、

【化 2 5 5 4】



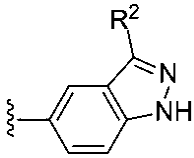
、

【化 2 5 5 5】



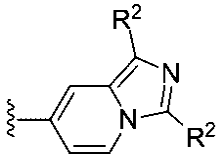
、

【化 2 5 5 6】



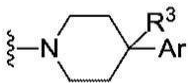
または

【化 2 5 5 7】



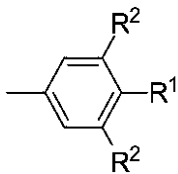
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 5 5 8】



であるとき、Ar は

【化 2 5 5 9】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

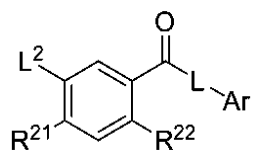
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹は、H または C₁～C₂アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 5 6 0】

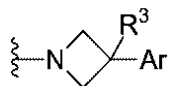


(X V I I I)

(式中、

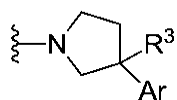
L - A r は、

【化 2 5 6 1】



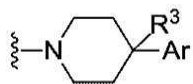
、

【化 2 5 6 2】



または

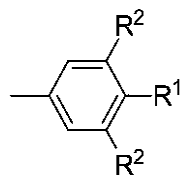
【化 2 5 6 3】



であり ;

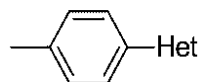
A r は、

【化 2 5 6 4】



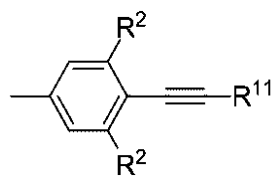
、

【化 2 5 6 5】

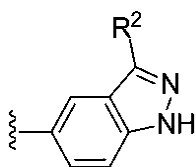


、

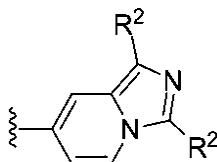
【化 2 5 6 6】



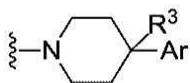
、
【化 2 5 6 7】



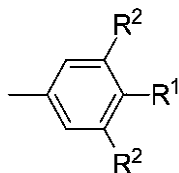
または
【化 2 5 6 8】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 5 6 9】



であるとき、Ar は
【化 2 5 7 0】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じで置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

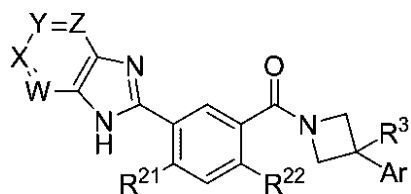
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 5 7 1】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

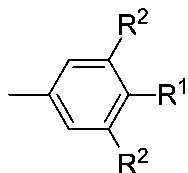
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

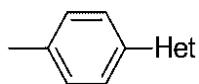
A r は、

【化 2 5 7 2】



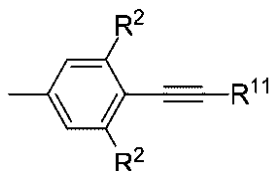
、

【化 2 5 7 3】



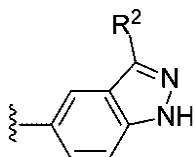
、

【化 2 5 7 4】



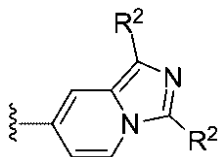
、

【化 2 5 7 5】



または

【化 2 5 7 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

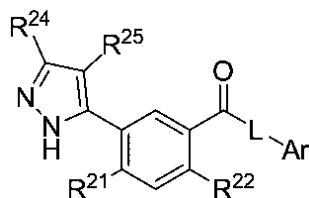
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (XX)：

【化 2 5 7 7】

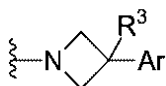


(XX)

(式中、

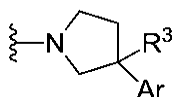
L - Ar は、

【化 2 5 7 8】



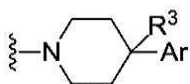
、

【化 2 5 7 9】



または

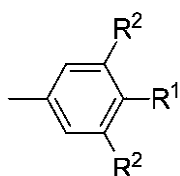
【化 2 5 8 0】



であり；

Ar は、

【化 2 5 8 1】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

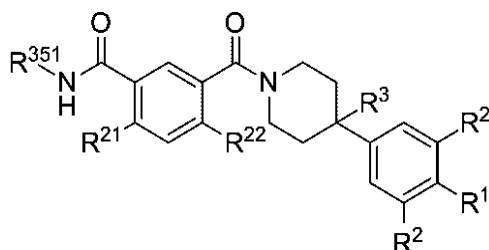
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 5 8 2】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

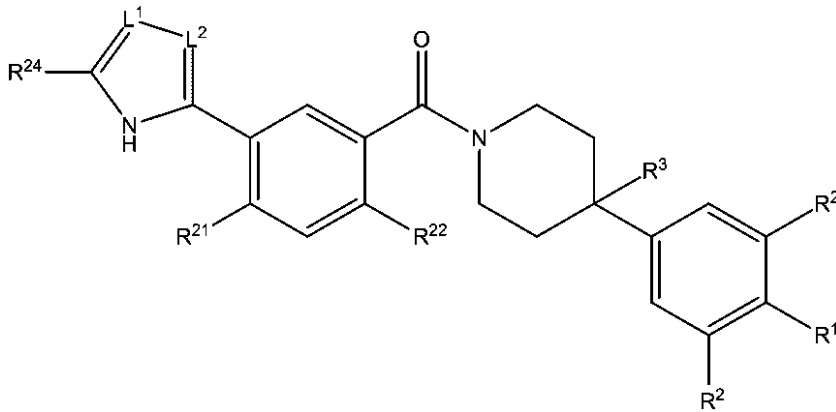
成物。

【請求項 18】

肝臓癌を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2583】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

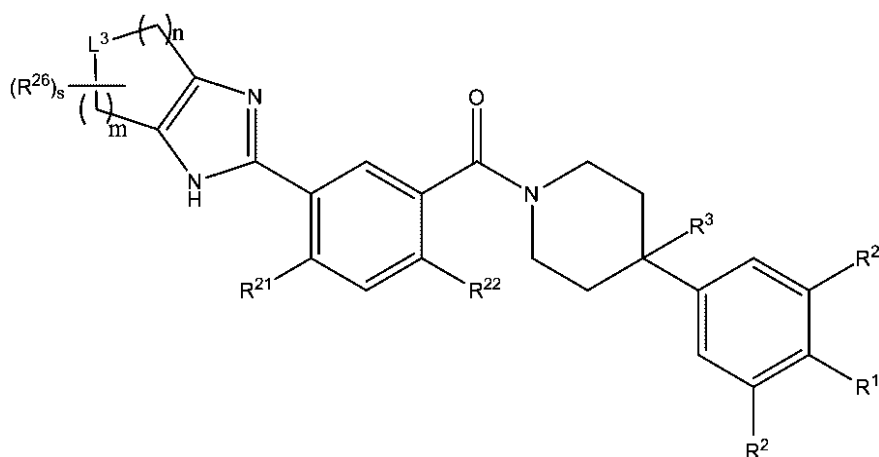
L² は、CHまたはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 5 8 4】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

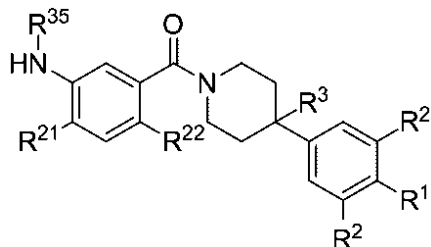
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2585】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

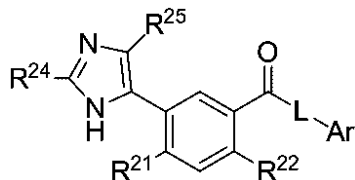
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2586】

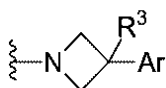


(XII)

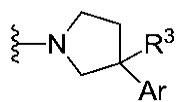
(式中、

L - Ar は、

【化2587】

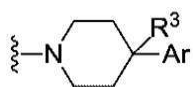


【化 2 5 8 8】



または

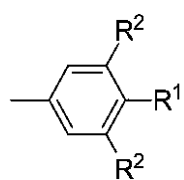
【化 2 5 8 9】



であり；

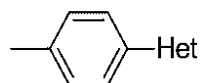
A r は、

【化 2 5 9 0】



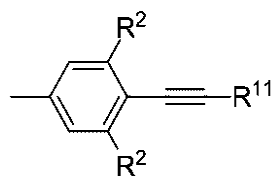
、

【化 2 5 9 1】



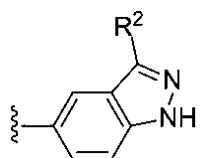
、

【化 2 5 9 2】



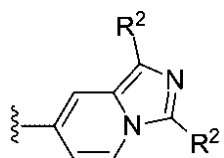
、

【化 2 5 9 3】



または

【化 2 5 9 4】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₆シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

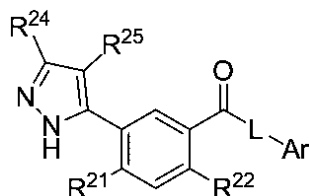
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e)式(XIII)：

【化2595】

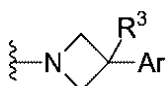


(XIII)

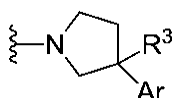
(式中、

L-Arは、

【化2596】

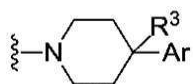


、
【化2597】



または

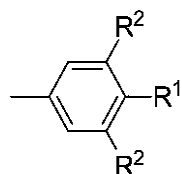
【化 2 5 9 8】



であり；

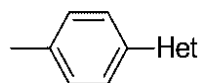
A r は、

【化 2 5 9 9】



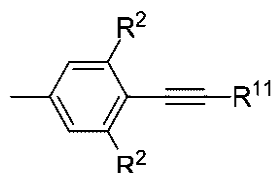
、

【化 2 6 0 0】



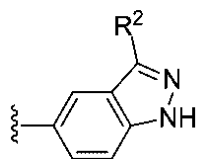
、

【化 2 6 0 1】



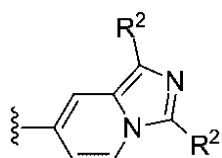
、

【化 2 6 0 2】



または

【化 2 6 0 3】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

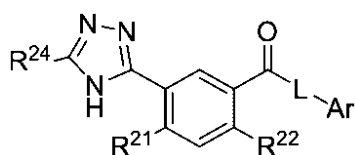
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2604】

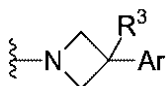


(XIV)

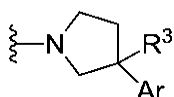
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2605】

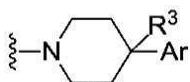


、
【化 2606】



または

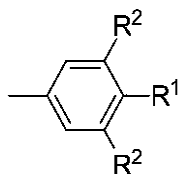
【化 2607】



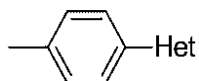
であり；

Ar は、

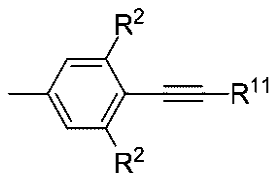
【化 2608】



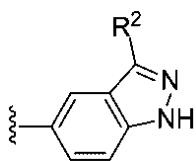
、
【化 2 6 0 9】



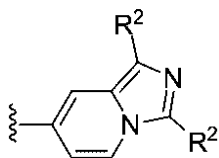
、
【化 2 6 1 0】



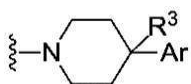
、
【化 2 6 1 1】



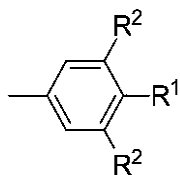
または
【化 2 6 1 2】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 6 1 3】



であるとき、Ar は
【化 2 6 1 4】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

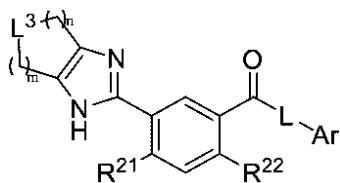
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2615】



(XV)

(式中、

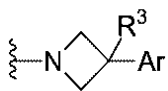
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

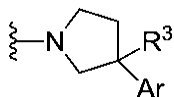
$L-Ar$ は、

【化2616】



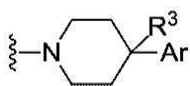
、

【化2617】



または

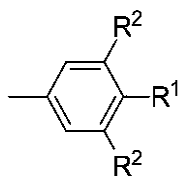
【化2618】



であり；

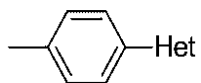
Ar は、

【化 2 6 1 9】



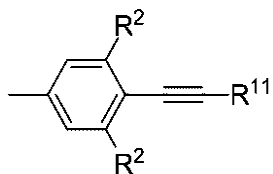
、

【化 2 6 2 0】



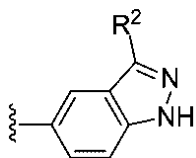
、

【化 2 6 2 1】



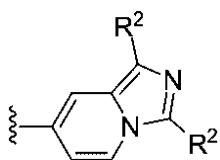
、

【化 2 6 2 2】



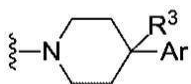
または

【化 2 6 2 3】



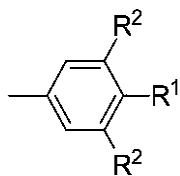
であり、ただし、L - A r が

【化 2 6 2 4】



であるとき、A r は

【化 2 6 2 5】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

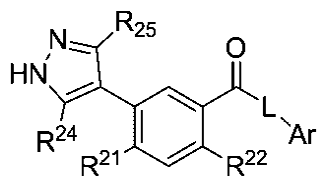
R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h)式(XVI)：

【化2626】

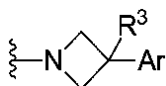


(XVI)

(式中、

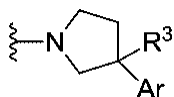
L-Arは、

【化2627】



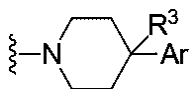
、

【化2628】



または

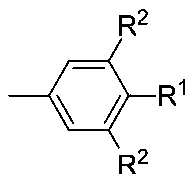
【化2629】



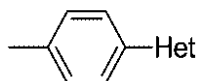
であり；

Arは、

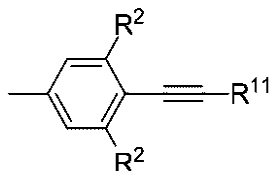
【化2630】



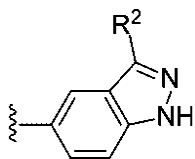
、
【化 2 6 3 1】



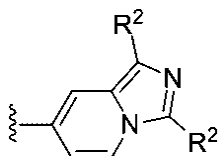
、
【化 2 6 3 2】



、
【化 2 6 3 3】



または
【化 2 6 3 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

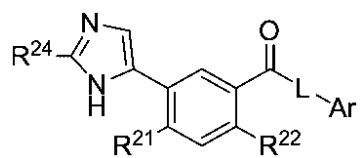
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 6 3 5】

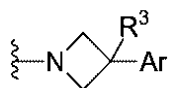


(XVII)

(式中、

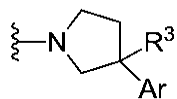
L - Ar は、

【化 2 6 3 6】



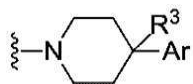
、

【化 2 6 3 7】



または

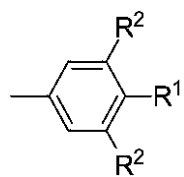
【化 2 6 3 8】



であり；

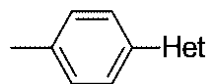
Ar は、

【化 2 6 3 9】



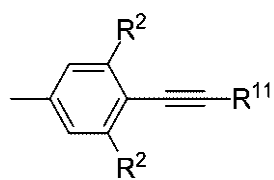
、

【化 2 6 4 0】



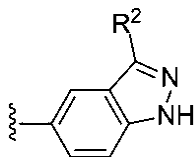
、

【化 2 6 4 1】



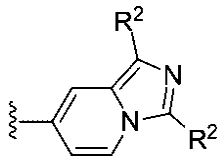
、

【化 2 6 4 2】



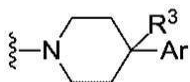
または

【化 2 6 4 3】



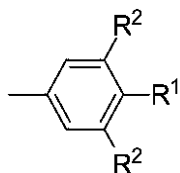
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 6 4 4】



であるとき、Ar は

【化 2 6 4 5】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

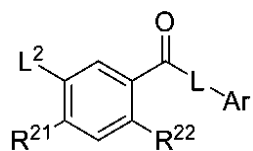
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 6 4 6】

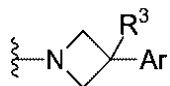


(X V I I I)

(式中、

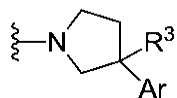
L - A r は、

【化 2 6 4 7】



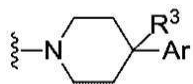
、

【化 2 6 4 8】



または

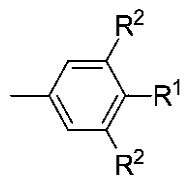
【化 2 6 4 9】



であり ;

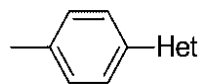
A r は、

【化 2 6 5 0】



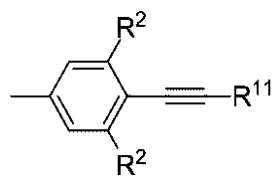
、

【化 2 6 5 1】

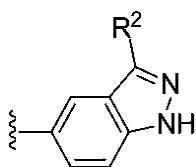


、

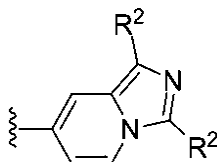
【化 2 6 5 2】



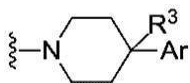
、
【化 2 6 5 3】



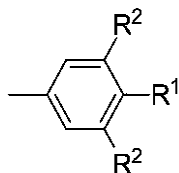
または
【化 2 6 5 4】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 6 5 5】



であるとき、Ar は
【化 2 6 5 6】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

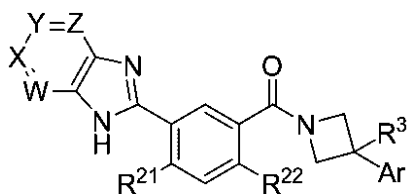
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 6 5 7】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

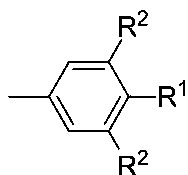
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

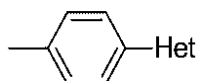
て含み、

Ar は、

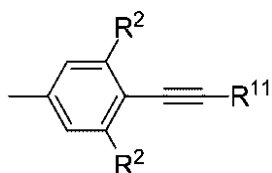
【化 2 6 5 8】



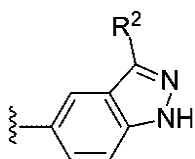
【化 2 6 5 9】



【化 2 6 6 0】

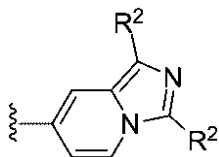


【化 2 6 6 1】



または

【化 2 6 6 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

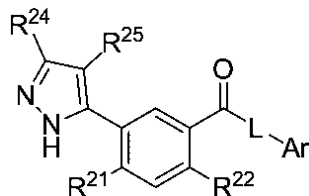
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 6 6 3】

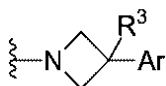


(X X)

(式中、

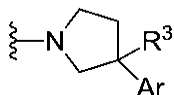
L - A r は、

【化 2 6 6 4】



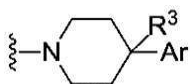
、

【化 2 6 6 5】



または

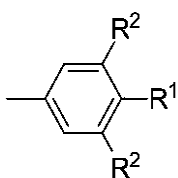
【化 2 6 6 6】



であり；

Ar は、

【化 2 6 6 7】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

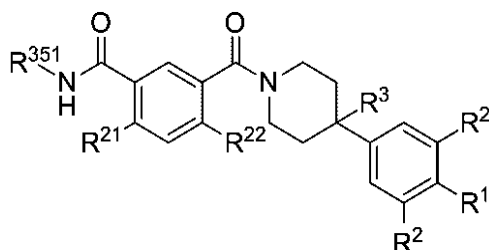
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 6 6 8】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

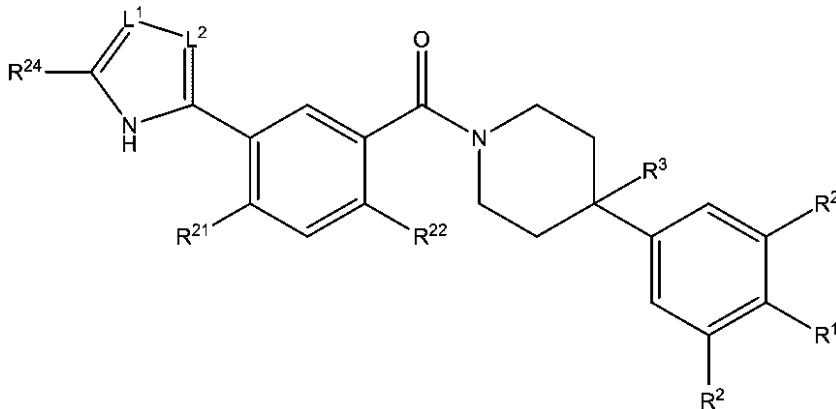
成物。

【請求項 19】

インターロイキン 1 ベータ (I L 1) レベルが上昇している疾患または状態を処置するための組成物であって、

(a) 式 (I X)

【化 2669】



(I X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

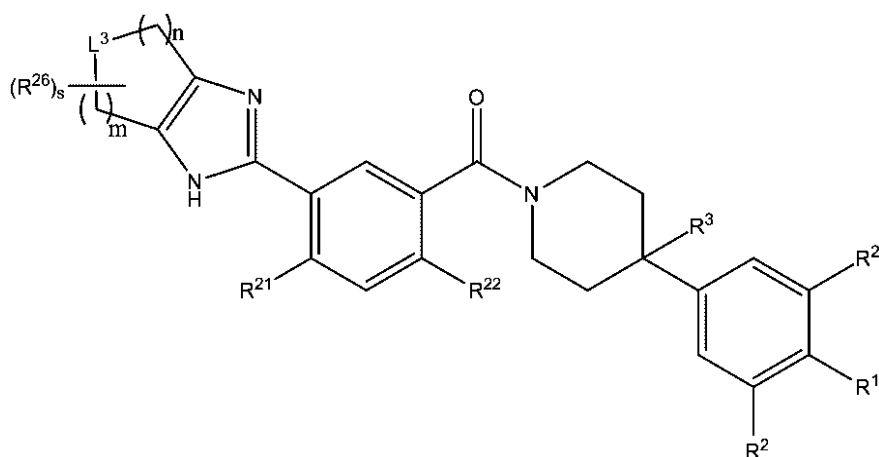
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 6 7 0】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

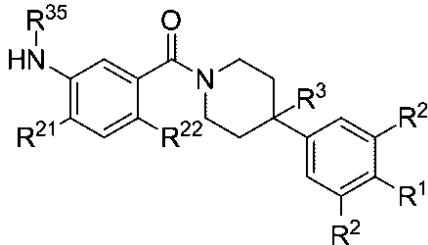
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2671】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

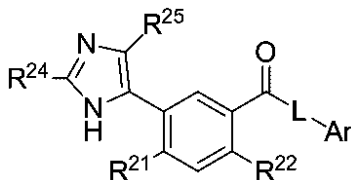
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2672】

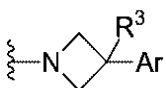


(XII)

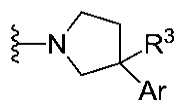
(式中、

L - Ar は、

【化2673】

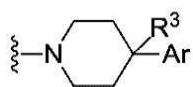


【化 2 6 7 4】



または

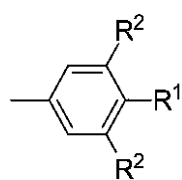
【化 2 6 7 5】



であり；

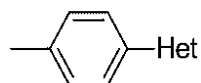
A r は、

【化 2 6 7 6】



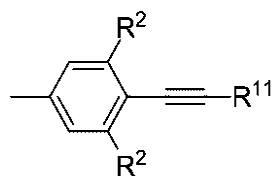
、

【化 2 6 7 7】



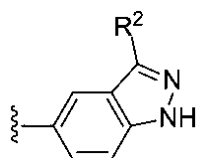
、

【化 2 6 7 8】



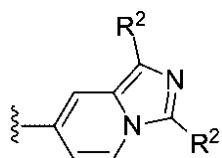
、

【化 2 6 7 9】



または

【化 2 6 8 0】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₆シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

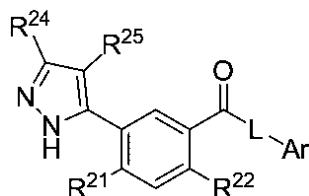
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e)式(XIII)：

【化2681】

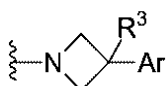


(XIII)

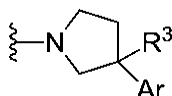
(式中、

L-Arは、

【化2682】

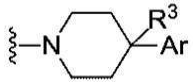


、
【化2683】



または

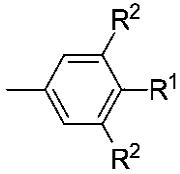
【化 2 6 8 4】



であり；

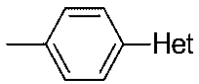
A r は、

【化 2 6 8 5】



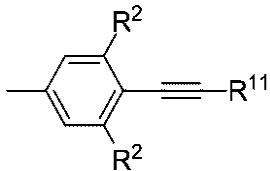
、

【化 2 6 8 6】



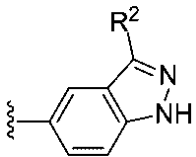
、

【化 2 6 8 7】



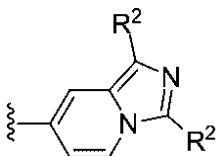
、

【化 2 6 8 8】



または

【化 2 6 8 9】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

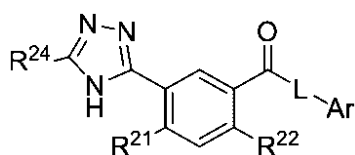
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2690】

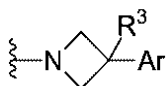


(XIV)

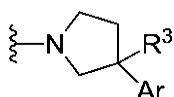
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2691】

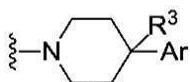


、
【化 2692】



または

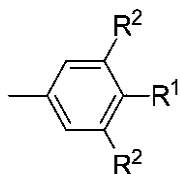
【化 2693】



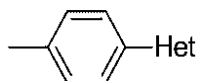
であり；

Ar は、

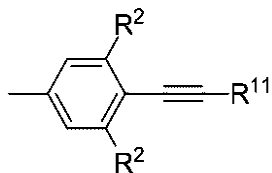
【化 2694】



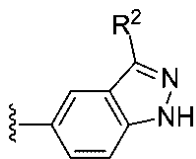
、
【化 2 6 9 5】



、
【化 2 6 9 6】



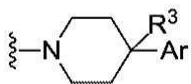
、
【化 2 6 9 7】



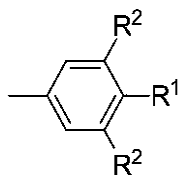
または
【化 2 6 9 8】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 6 9 9】



であるとき、Ar は
【化 2 7 0 0】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

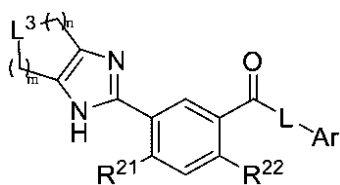
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g)式(XV)：

【化2701】



(XV)

(式中、

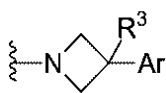
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

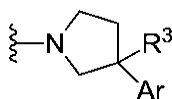
$L-Ar$ は、

【化2702】



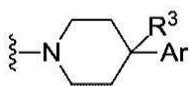
、

【化2703】



または

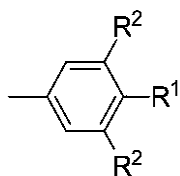
【化2704】



であり；

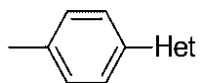
Ar は、

【化 2 7 0 5】



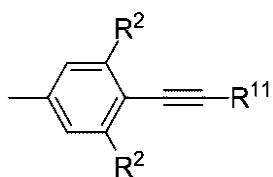
、

【化 2 7 0 6】



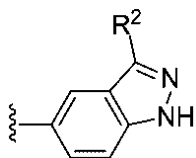
、

【化 2 7 0 7】



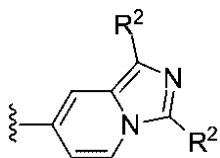
、

【化 2 7 0 8】



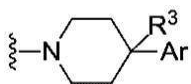
または

【化 2 7 0 9】



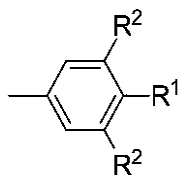
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 7 1 0】



であるとき、Ar は

【化 2 7 1 1】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

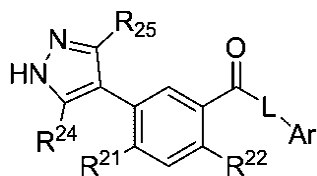
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 7 1 2】

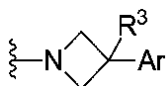


(XVI)

(式中、

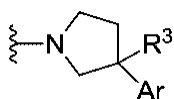
L - Ar は、

【化 2 7 1 3】



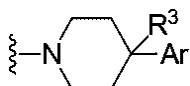
、

【化 2 7 1 4】



または

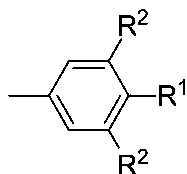
【化 2 7 1 5】



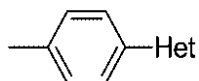
であり；

Ar は、

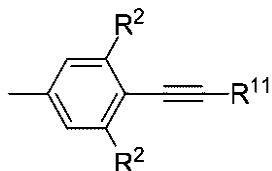
【化 2 7 1 6】



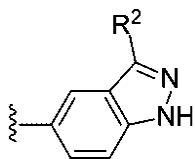
、
【化 2 7 1 7】



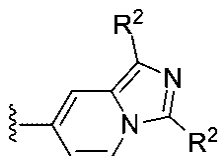
、
【化 2 7 1 8】



、
【化 2 7 1 9】



または
【化 2 7 2 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

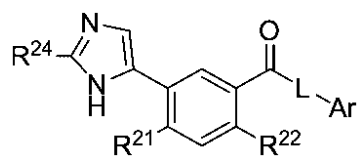
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 7 2 1】

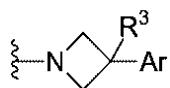


(XVII)

(式中、

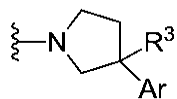
L - Ar は、

【化 2 7 2 2】



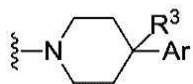
、

【化 2 7 2 3】



または

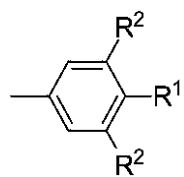
【化 2 7 2 4】



であり；

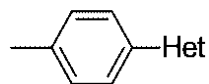
Ar は、

【化 2 7 2 5】



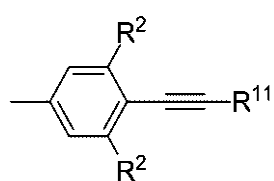
、

【化 2 7 2 6】



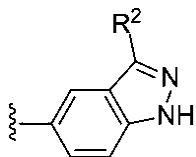
、

【化 2 7 2 7】



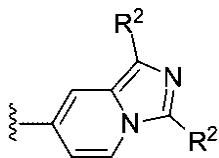
、

【化 2 7 2 8】



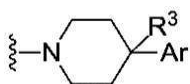
または

【化 2 7 2 9】



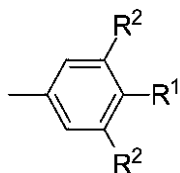
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 7 3 0】



であるとき、Ar は

【化 2 7 3 1】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

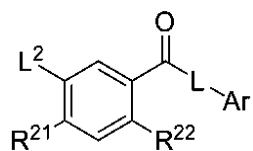
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 7 3 2】

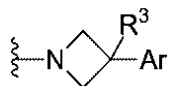


(X V I I I)

(式中、

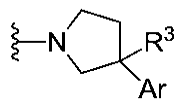
L - A r は、

【化 2 7 3 3】



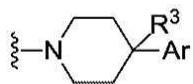
、

【化 2 7 3 4】



または

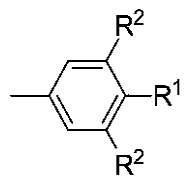
【化 2 7 3 5】



であり ;

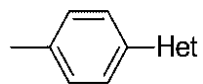
A r は、

【化 2 7 3 6】



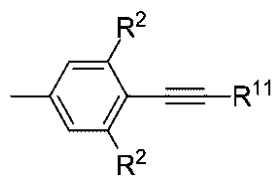
、

【化 2 7 3 7】

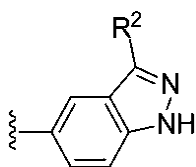


、

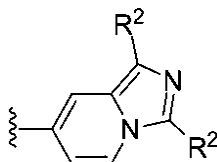
【化 2 7 3 8】



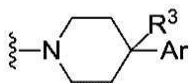
、
【化 2 7 3 9】



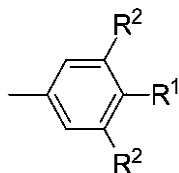
または
【化 2 7 4 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 7 4 1】



であるとき、Ar は
【化 2 7 4 2】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5 1} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

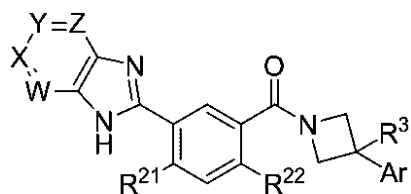
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 7 4 3】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R ^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

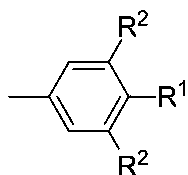
各 R ^{2 6} は、独立して、H、C ₁ ~ C ₄ アルキル、- O - (C ₁ ~ C ₄ アルキル)、- N (R ^{2 7}) ₂、- S (O) ₂ - (C ₁ ~ C ₄ アルキル)、または - C (O) - (C ₁ ~ C ₄ アルキル) であり；

各 R ^{2 7} は、独立して、H または C ₁ ~ C ₄ アルキルであり、あるいは、R ^{2 7} は、両方とも C ₁ ~ C ₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

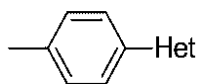
て含み、

A r は、

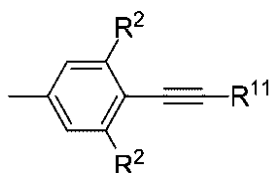
【化 2 7 4 4】



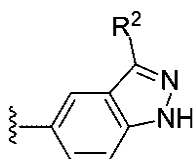
【化 2 7 4 5】



【化 2 7 4 6】

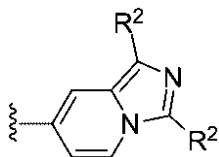


【化 2 7 4 7】



または

【化 2 7 4 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

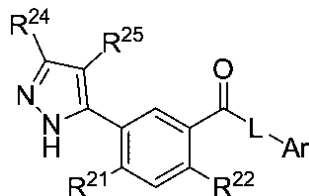
R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 7 4 9】

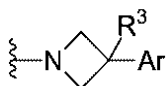


(X X)

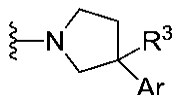
(式中、

L - A r は、

【化 2 7 5 0】

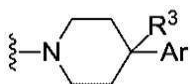


【化 2 7 5 1】



または

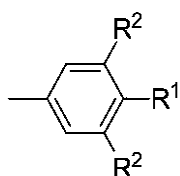
【化 2 7 5 2】



であり；

Ar は、

【化 2 7 5 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(4～6 員複素環)または-O-(C₁～C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは4～6 員複素環であり；

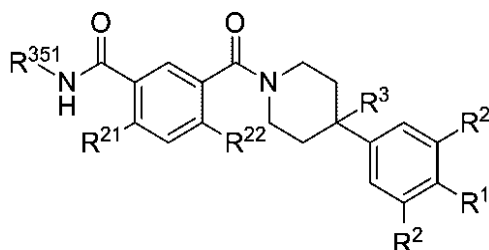
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₁～C₄ アルキル)-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、または-O-(4～6 員複素環)であり、この場合、R^{2 4} は、1つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたはC₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 7 5 4】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、H、ハロゲンまたはC₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたはC₂-O-(C₁もしくはC₂ アルキル)である)もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

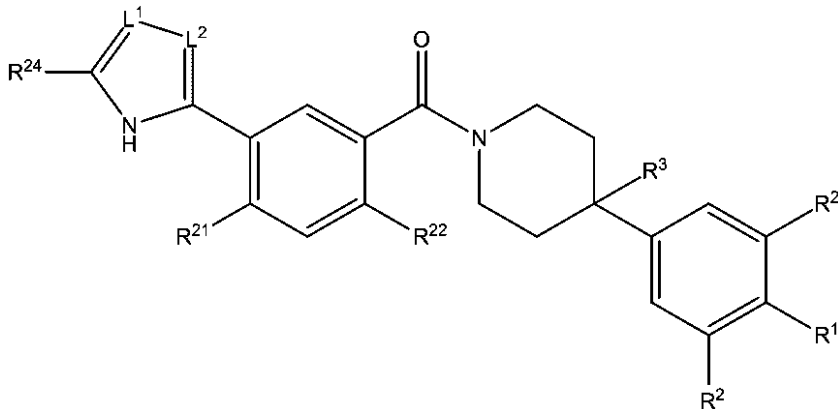
成物。

【請求項 20】

ヘルパー T 細胞 (T_h) レベルが上昇している疾患または状態を処置するための組成物であって、

(a) 式 (I X)

【化 2755】



(I X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、CR²³またはNであり；

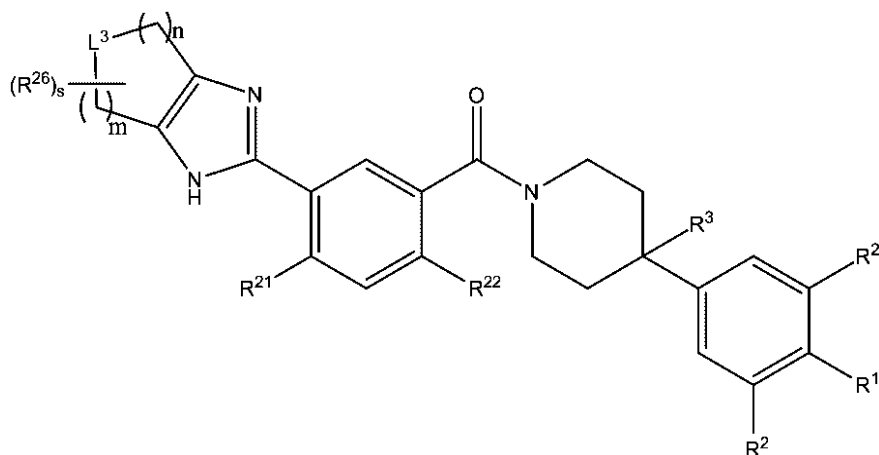
L^2 は、CHまたはNであり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R^{23} は、Hまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 7 5 6】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

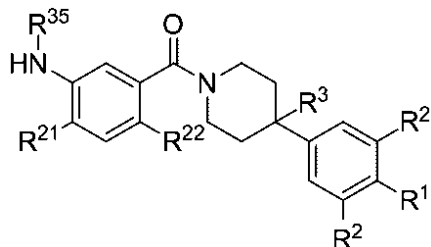
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2757】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

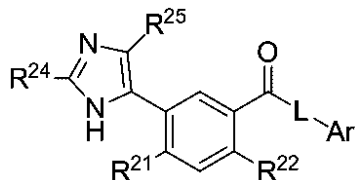
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2758】

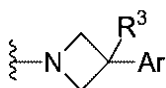


(XII)

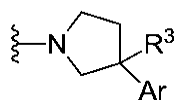
(式中、

L-Ar は、

【化2759】

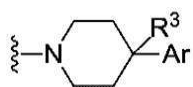


【化 2 7 6 0】



または

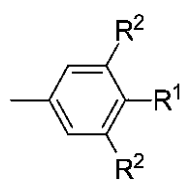
【化 2 7 6 1】



であり；

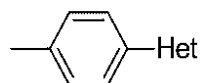
A r は、

【化 2 7 6 2】



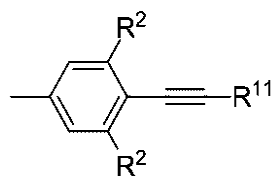
、

【化 2 7 6 3】



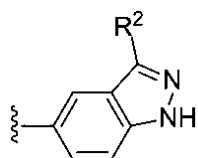
、

【化 2 7 6 4】



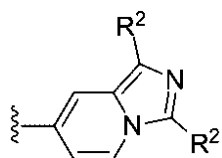
、

【化 2 7 6 5】



または

【化 2 7 6 6】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₆シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

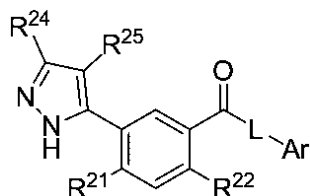
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁵は、ハロゲン、-CN、-(C₁～C₄アルキル)-CN、C₁～C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e)式(XIII)：

【化2767】

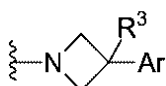


(XIII)

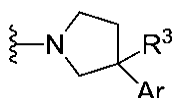
(式中、

L-Arは、

【化2768】

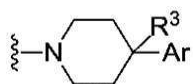


、
【化2769】



または

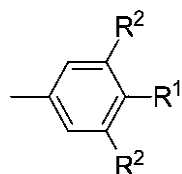
【化 2 7 7 0】



であり；

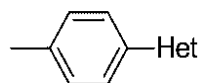
A r は、

【化 2 7 7 1】



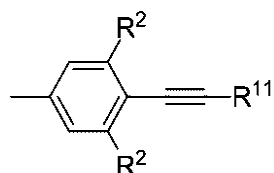
、

【化 2 7 7 2】



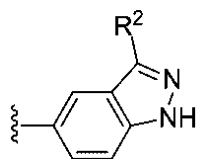
、

【化 2 7 7 3】



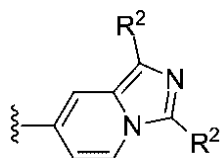
、

【化 2 7 7 4】



または

【化 2 7 7 5】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

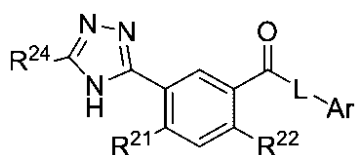
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2776】

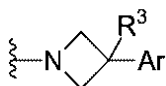


(XIV)

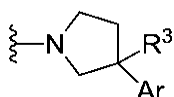
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2777】

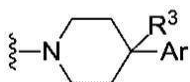


、
【化 2778】



または

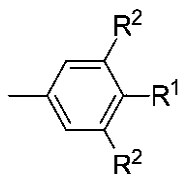
【化 2779】



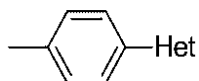
であり；

Ar は、

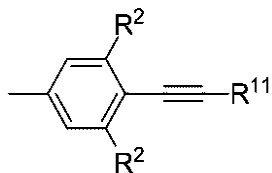
【化 2780】



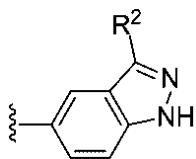
、
【化 2 7 8 1】



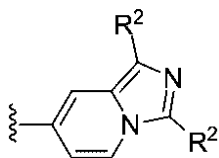
、
【化 2 7 8 2】



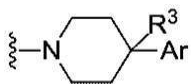
、
【化 2 7 8 3】



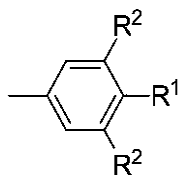
または
【化 2 7 8 4】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 7 8 5】



であるとき、Ar は
【化 2 7 8 6】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

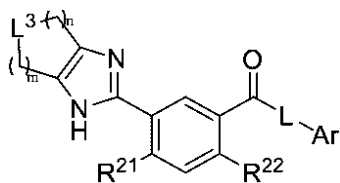
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2787】



(XV)

(式中、

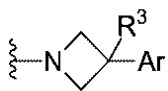
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

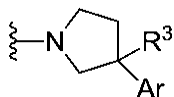
$L-Ar$ は、

【化2788】



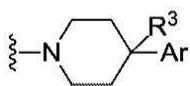
、

【化2789】



または

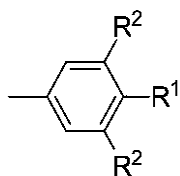
【化2790】



であり；

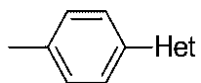
Ar は、

【化 2 7 9 1】



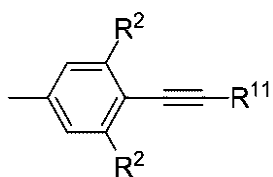
、

【化 2 7 9 2】



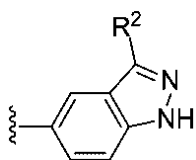
、

【化 2 7 9 3】



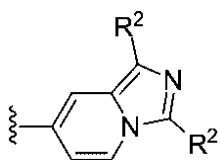
、

【化 2 7 9 4】



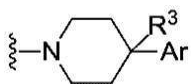
または

【化 2 7 9 5】



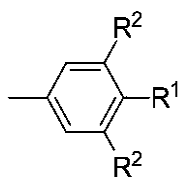
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 7 9 6】



であるとき、Ar は

【化 2 7 9 7】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

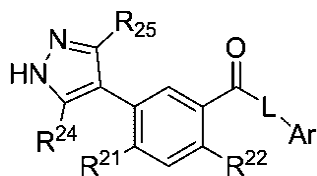
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2798】

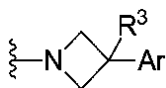


(XVI)

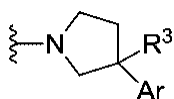
(式中、

L - Ar は、

【化 2799】

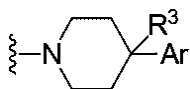


、
【化 2800】



または

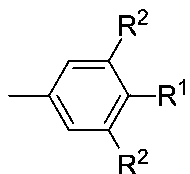
【化 2801】



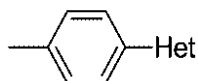
であり；

Ar は、

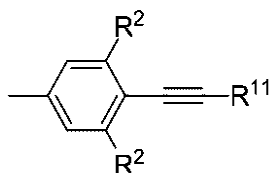
【化 2802】



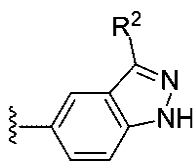
、
【化 2 8 0 3】



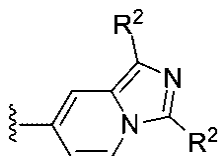
、
【化 2 8 0 4】



、
【化 2 8 0 5】



または
【化 2 8 0 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

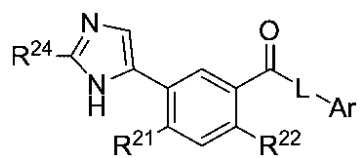
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 8 0 7】

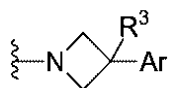


(X V I I)

(式中、

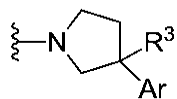
L - A r は、

【化 2 8 0 8】



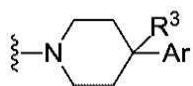
、

【化 2 8 0 9】



または

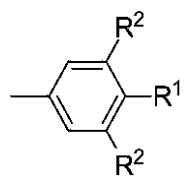
【化 2 8 1 0】



であり；

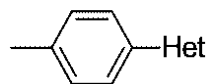
A r は、

【化 2 8 1 1】



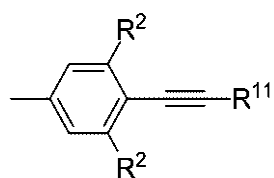
、

【化 2 8 1 2】



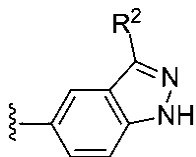
、

【化 2 8 1 3】



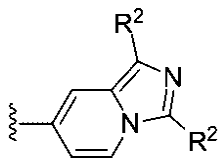
、

【化 2 8 1 4】



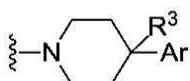
または

【化 2 8 1 5】



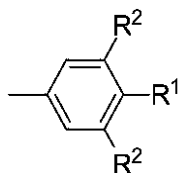
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 8 1 6】



であるとき、Ar は

【化 2 8 1 7】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

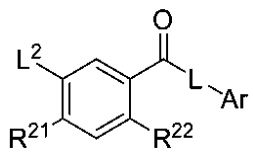
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 8 1 8】

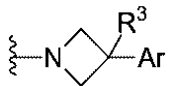


(X V I I I)

(式中、

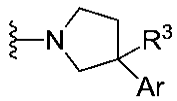
L - A r は、

【化 2 8 1 9】



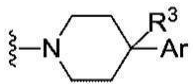
、

【化 2 8 2 0】



または

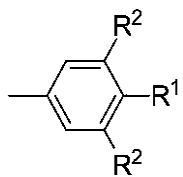
【化 2 8 2 1】



であり ;

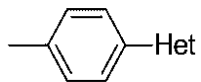
A r は、

【化 2 8 2 2】



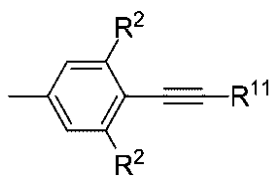
、

【化 2 8 2 3】

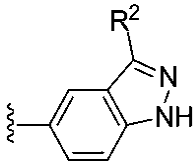


、

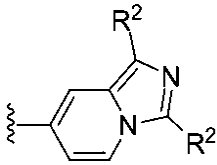
【化 2 8 2 4】



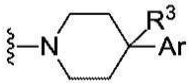
、
【化 2 8 2 5】



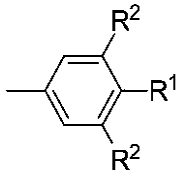
または
【化 2 8 2 6】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 8 2 7】



であるとき、Ar は
【化 2 8 2 8】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

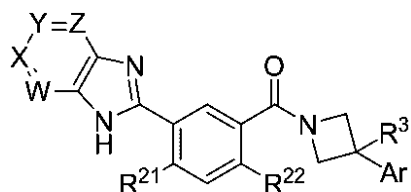
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 8 2 9】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

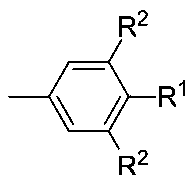
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

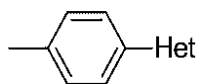
Ar は、

【化 2 8 3 0】



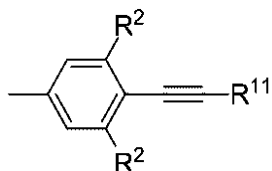
、

【化 2 8 3 1】



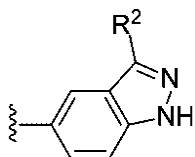
、

【化 2 8 3 2】



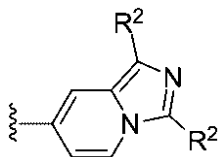
、

【化 2 8 3 3】



または

【化 2 8 3 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環)、-O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

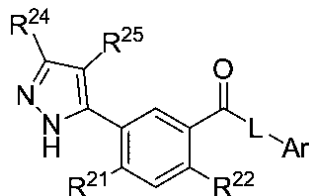
R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X)：

【化 2 8 3 5】

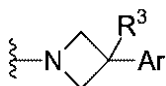


(X X)

式中、

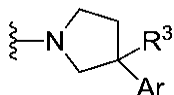
L - A r は、

【化 2 8 3 6】



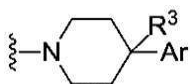
、

【化 2 8 3 7】



または

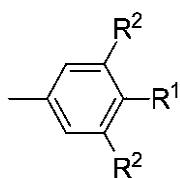
【化 2 8 3 8】



であり；

Ar は、

【化 2 8 3 9】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

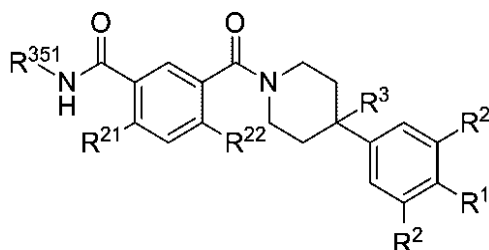
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル)-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 8 4 0】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

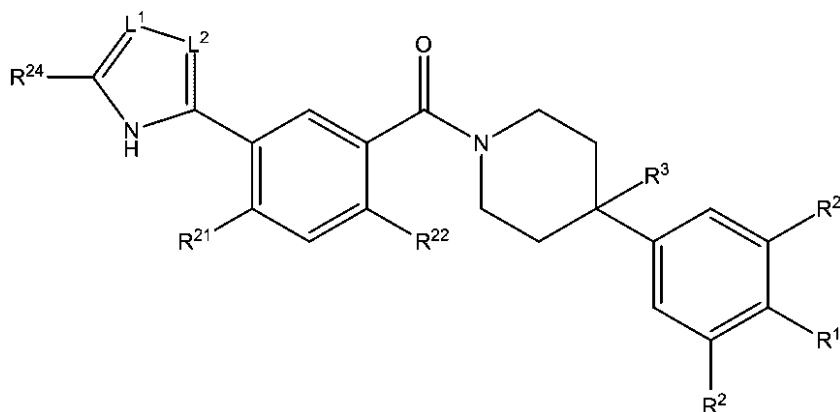
成物。

【請求項 21】

制御性 T 細胞 (T_{reg}) が減少または抑制されている疾患または状態を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 2841】



(IX)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、C R^{23} または N であり；

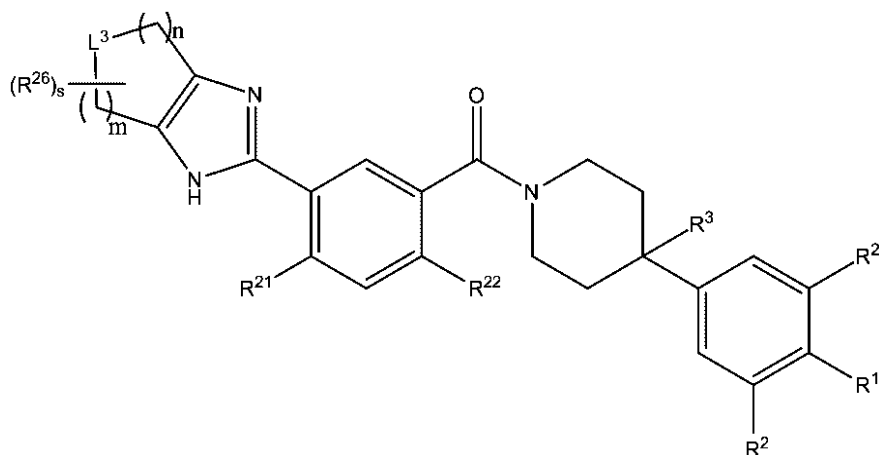
L^2 は、CH または N であり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、N であり；

R^{23} は、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 8 4 2】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

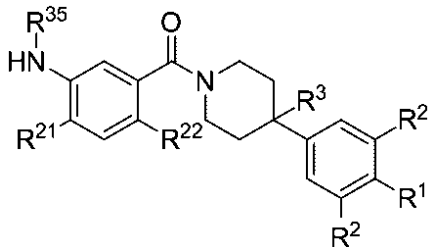
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2843】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

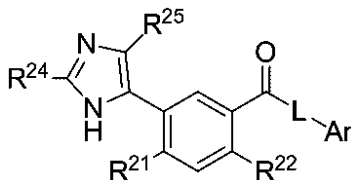
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2844】

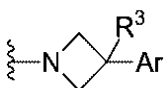


(XII)

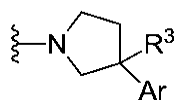
(式中、

L-Ar は、

【化2845】

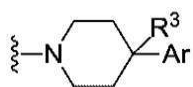


【化 2 8 4 6】



または

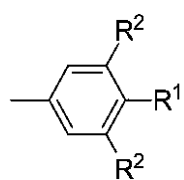
【化 2 8 4 7】



であり；

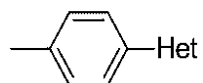
A r は、

【化 2 8 4 8】



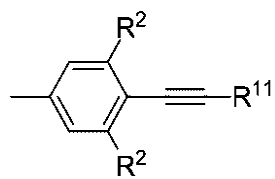
、

【化 2 8 4 9】



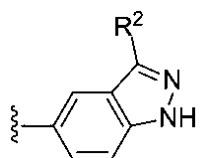
、

【化 2 8 5 0】



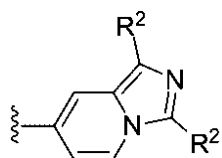
、

【化 2 8 5 1】



または

【化 2 8 5 2】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

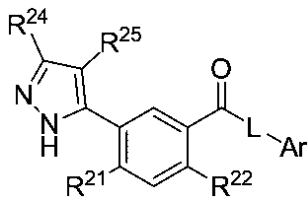
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化2853】

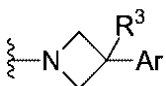


(XIII)

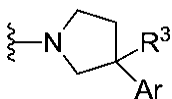
(式中、

L-Ar は、

【化2854】

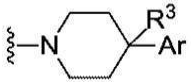


、
【化2855】



または

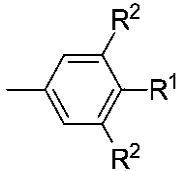
【化 2 8 5 6】



であり；

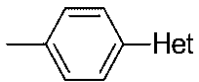
A r は、

【化 2 8 5 7】



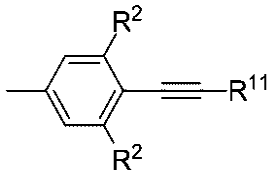
、

【化 2 8 5 8】



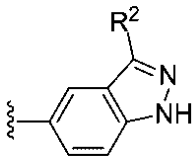
、

【化 2 8 5 9】



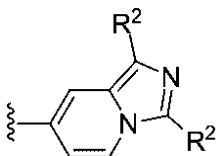
、

【化 2 8 6 0】



または

【化 2 8 6 1】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

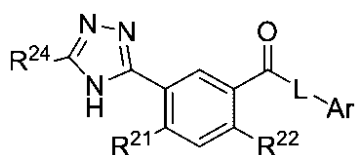
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2862】

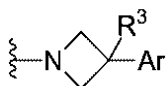


(XIV)

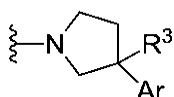
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2863】

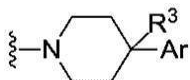


、
【化 2864】



または

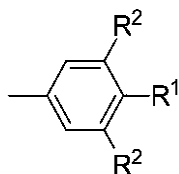
【化 2865】



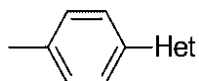
であり；

Ar は、

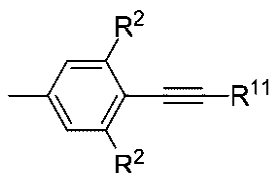
【化 2866】



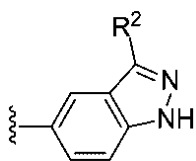
、
【化 2 8 6 7】



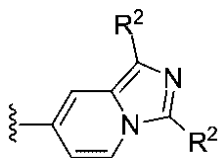
、
【化 2 8 6 8】



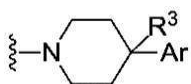
、
【化 2 8 6 9】



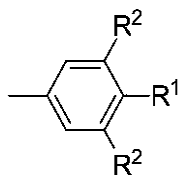
または
【化 2 8 7 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 8 7 1】



であるとき、Ar は
【化 2 8 7 2】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

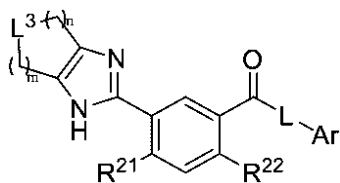
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2873】



(XV)

(式中、

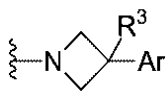
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

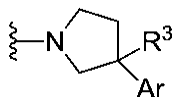
$L-Ar$ は、

【化2874】



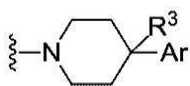
、

【化2875】



または

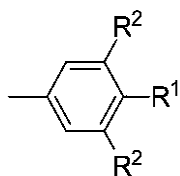
【化2876】



であり；

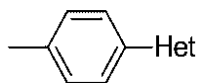
Ar は、

【化 2 8 7 7】



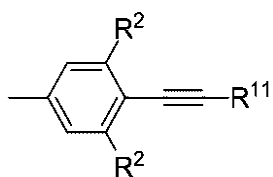
、

【化 2 8 7 8】



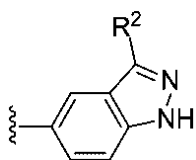
、

【化 2 8 7 9】



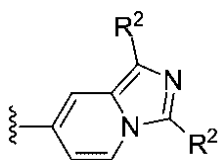
、

【化 2 8 8 0】



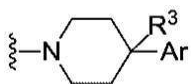
または

【化 2 8 8 1】



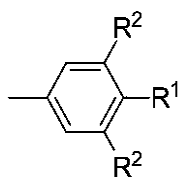
であり、ただし、L - A r が

【化 2 8 8 2】



であるとき、A r は

【化 2 8 8 3】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

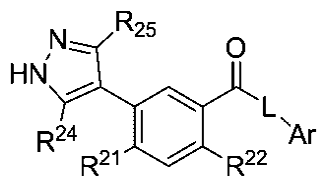
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化2884】

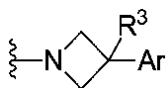


(XVI)

(式中、

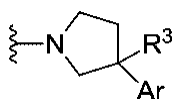
L - Ar は、

【化2885】



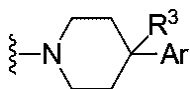
、

【化2886】



または

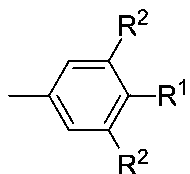
【化2887】



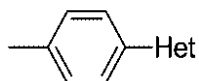
であり；

Ar は、

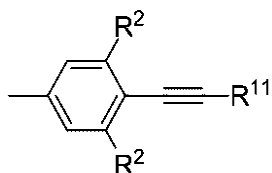
【化2888】



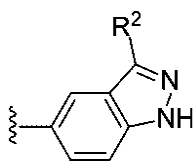
、
【化 2 8 8 9】



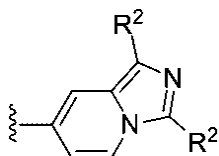
、
【化 2 8 9 0】



、
【化 2 8 9 1】



または
【化 2 8 9 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

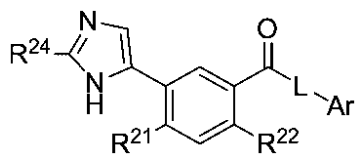
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 8 9 3】

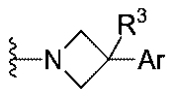


(XVII)

(式中、

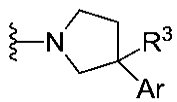
L - Ar は、

【化 2 8 9 4】



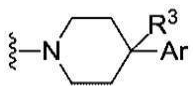
、

【化 2 8 9 5】



または

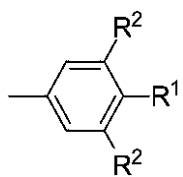
【化 2 8 9 6】



であり；

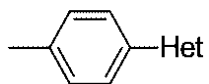
Ar は、

【化 2 8 9 7】



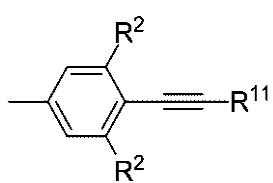
、

【化 2 8 9 8】



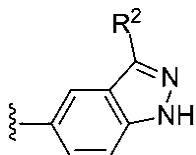
、

【化 2 8 9 9】



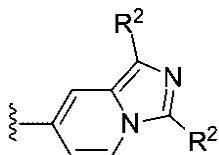
、

【化 2 9 0 0】



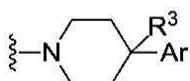
または

【化 2 9 0 1】



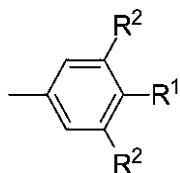
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 0 2】



であるとき、Ar は

【化 2 9 0 3】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R²⁴¹)₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

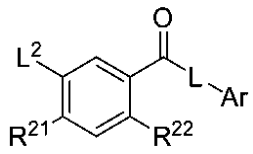
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹ は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 9 0 4】

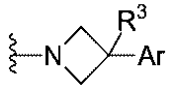
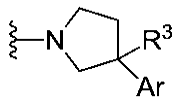


(X V I I I)

(式中、

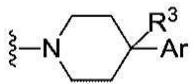
 $L-Ar$ は、

【化 2 9 0 5】

、
【化 2 9 0 6】

または

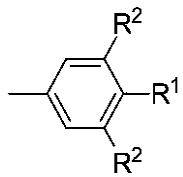
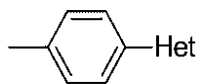
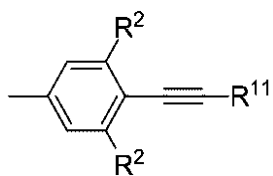
【化 2 9 0 7】



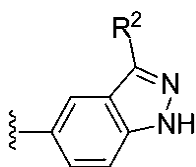
であり ;

 Ar は、

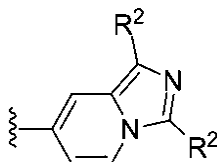
【化 2 9 0 8】

、
【化 2 9 0 9】、
【化 2 9 1 0】

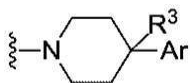
、
【化 2 9 1 1】



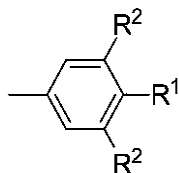
または
【化 2 9 1 2】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 9 1 3】



であるとき、Ar は
【化 2 9 1 4】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5 1} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

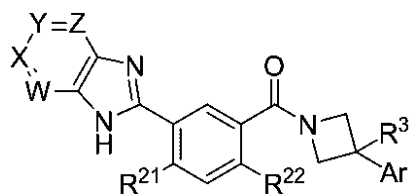
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 9 1 5】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

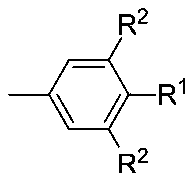
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

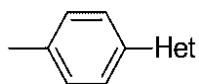
A r は、

【化 2 9 1 6】



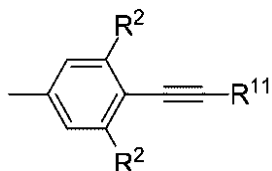
、

【化 2 9 1 7】



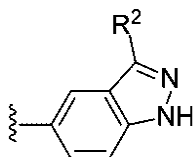
、

【化 2 9 1 8】



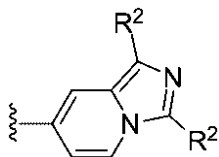
、

【化 2 9 1 9】



または

【化 2 9 2 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

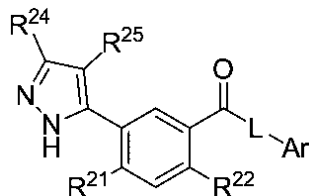
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 9 2 1】

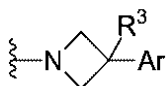


(X X)

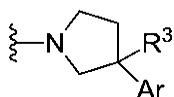
(式中、

L - A r は、

【化 2 9 2 2】

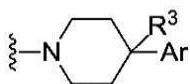


【化 2 9 2 3】



または

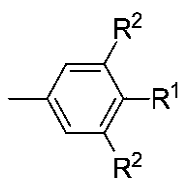
【化 2 9 2 4】



であり；

Ar は、

【化 2 9 2 5】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(4～6 員複素環) または -O-(C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

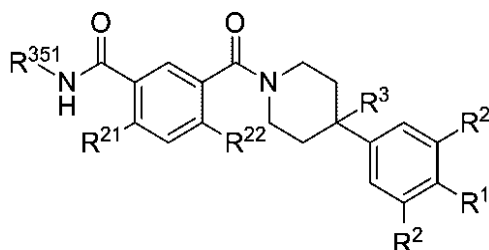
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₁～C₄ アルキル)-O-(C₁～C₄ アルキル)、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O-(4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 9 2 6】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃～C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O-(C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

成物。

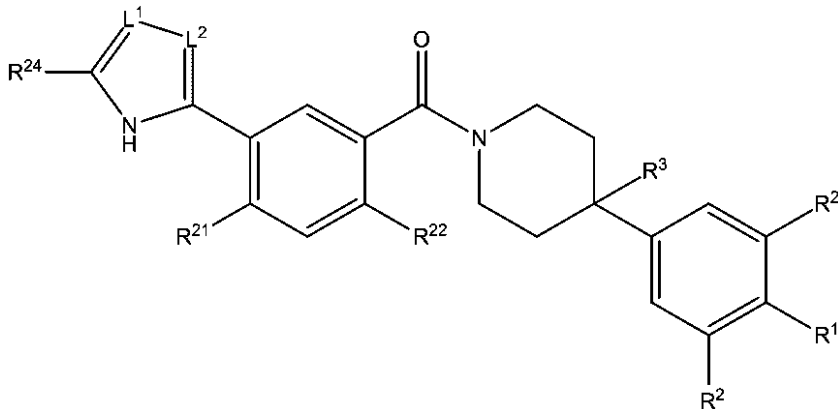
【請求項 22】

確立された非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）を逆転させるための組成物であって

—

(a) 式 (IX)

【化 2927】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル、C₃～C₅シクロアルキルであり、この場合、C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁～C₄アルキル)_t-OH、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_t-(C₃～C₅シクロアルキル)、または-(C₁～C₄アルキル)_t-O-(C₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³またはNであり；

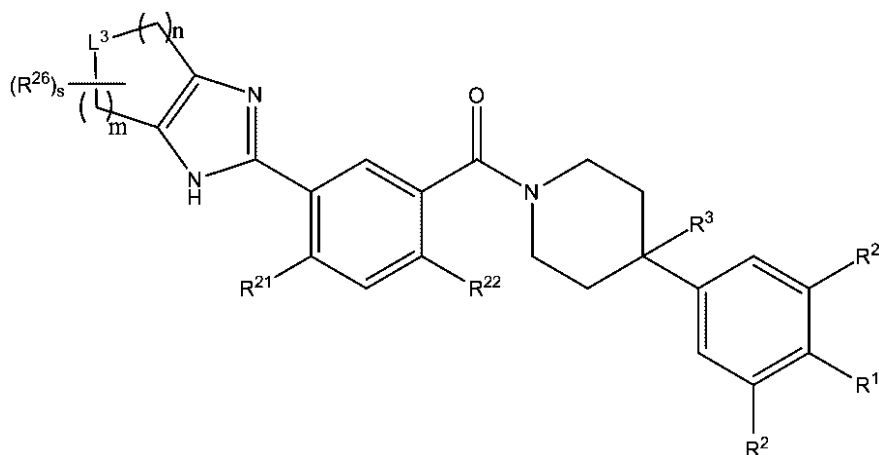
L² は、CHまたはNであり；

L¹またはL²のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 9 2 8】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

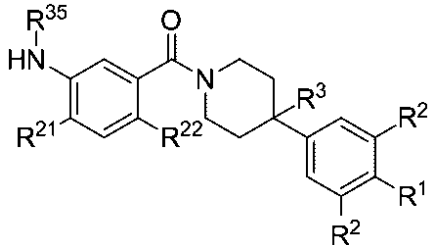
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2929】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

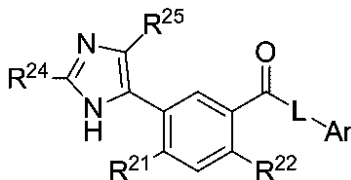
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} またはS(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2930】

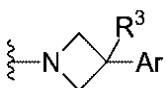


(XII)

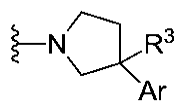
(式中、

L-Ar は、

【化2931】

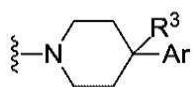


【化 2 9 3 2】



または

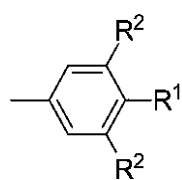
【化 2 9 3 3】



であり；

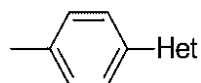
A r は、

【化 2 9 3 4】



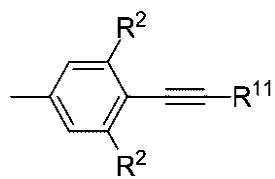
、

【化 2 9 3 5】



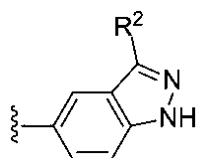
、

【化 2 9 3 6】



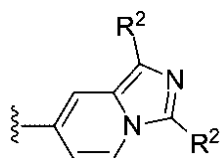
、

【化 2 9 3 7】



または

【化 2 9 3 8】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

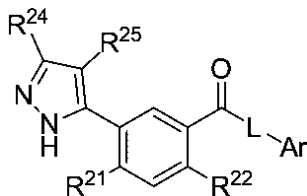
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化2939】

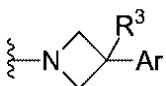


(XIII)

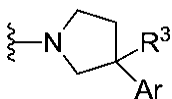
(式中、

L-Ar は、

【化2940】

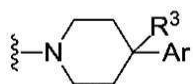


、
【化2941】



または

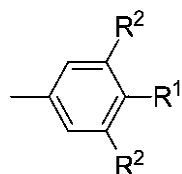
【化 2 9 4 2】



であり；

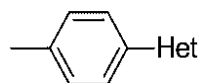
A r は、

【化 2 9 4 3】



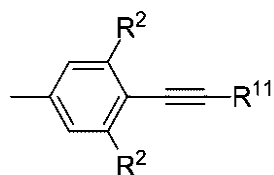
、

【化 2 9 4 4】



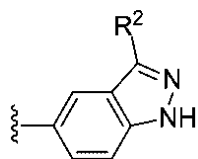
、

【化 2 9 4 5】



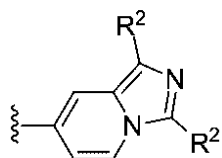
、

【化 2 9 4 6】



または

【化 2 9 4 7】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

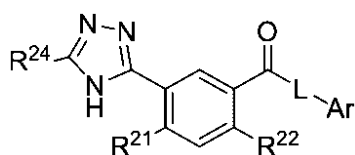
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2948】

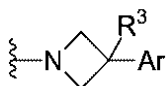


(XIV)

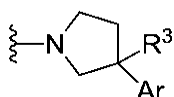
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2949】

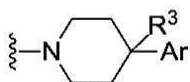


、
【化 2950】



または

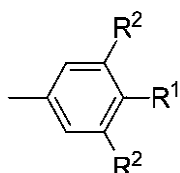
【化 2951】



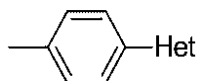
であり；

Ar は、

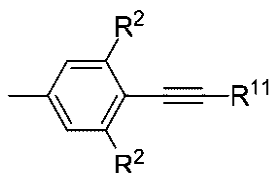
【化 2952】



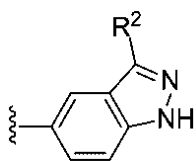
、
【化 2 9 5 3】



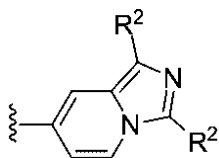
、
【化 2 9 5 4】



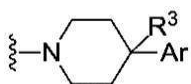
、
【化 2 9 5 5】



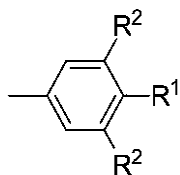
または
【化 2 9 5 6】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 9 5 7】



であるとき、Ar は
【化 2 9 5 8】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

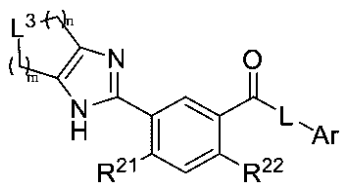
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2959】



(XV)

(式中、

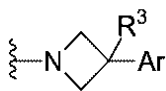
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

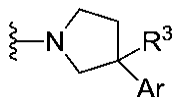
$L-Ar$ は、

【化2960】



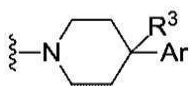
、

【化2961】



または

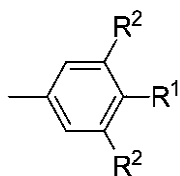
【化2962】



であり；

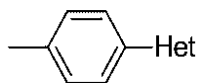
Ar は、

【化 2 9 6 3】



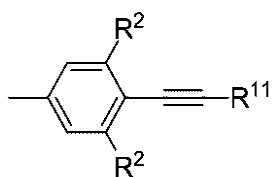
、

【化 2 9 6 4】



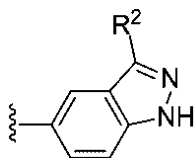
、

【化 2 9 6 5】



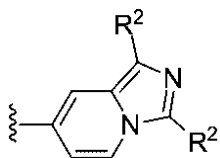
、

【化 2 9 6 6】



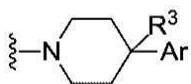
または

【化 2 9 6 7】



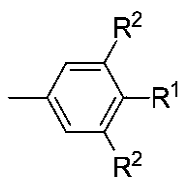
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 6 8】



であるとき、Ar は

【化 2 9 6 9】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

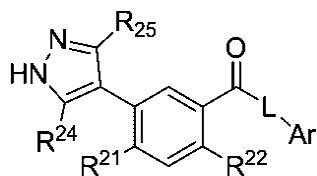
R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h)式(XVI)；

【化2970】

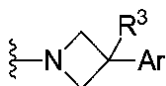


(XVI)

(式中、

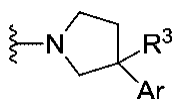
L-Arは、

【化2971】



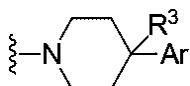
、

【化2972】



または

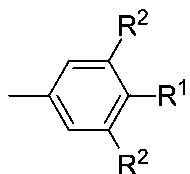
【化2973】



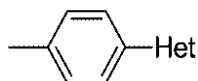
であり；

Arは、

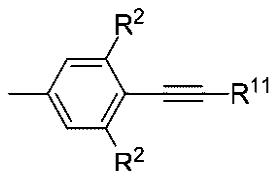
【化2974】



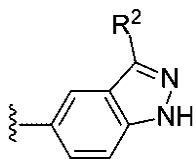
、
【化 2 9 7 5】



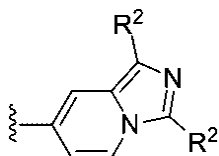
、
【化 2 9 7 6】



、
【化 2 9 7 7】



または
【化 2 9 7 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

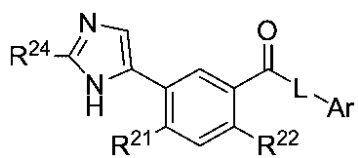
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 9 7 9】

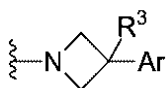


(XVII)

(式中、

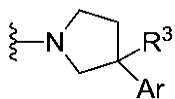
L - Ar は、

【化 2 9 8 0】



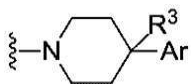
、

【化 2 9 8 1】



または

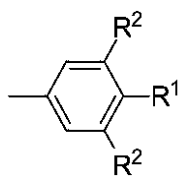
【化 2 9 8 2】



であり；

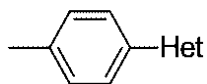
Ar は、

【化 2 9 8 3】



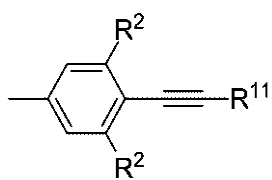
、

【化 2 9 8 4】



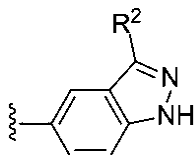
、

【化 2 9 8 5】



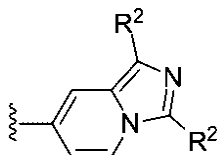
、

【化 2 9 8 6】



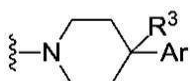
または

【化 2 9 8 7】



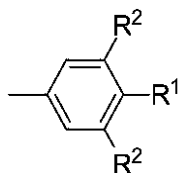
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 8 8】



であるとき、Ar は

【化 2 9 8 9】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R²⁴¹)₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

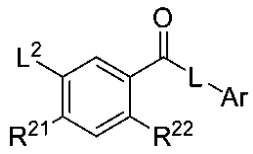
t は、0 または 1 であり；

u は、0 または 1 であり；

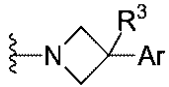
ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹ は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

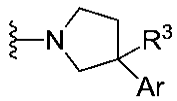
(j) 式 (X V I I I) :
【化 2 9 9 0】



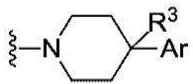
(X V I I I)
(式中、
L - A r は、
【化 2 9 9 1】



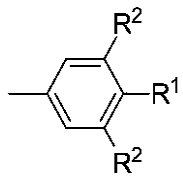
、
【化 2 9 9 2】



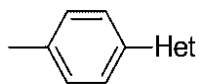
または
【化 2 9 9 3】



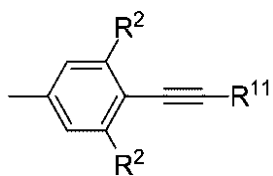
であり ;
A r は、
【化 2 9 9 4】



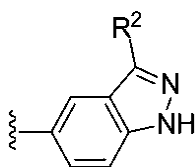
、
【化 2 9 9 5】



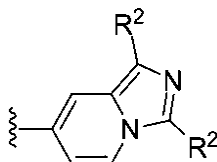
、
【化 2 9 9 6】



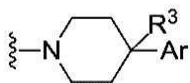
、
【化 2 9 9 7】



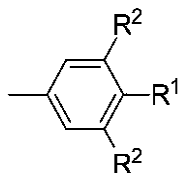
または
【化 2 9 9 8】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 9 9 9】



であるとき、Ar は
【化 3 0 0 0】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5 1} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリーールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

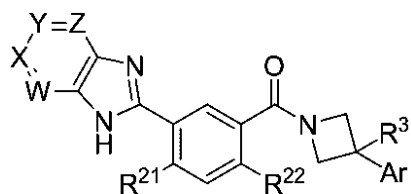
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリーールまたはヘテロアリーールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 0 0 1】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

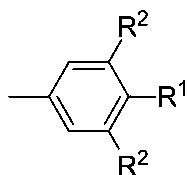
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

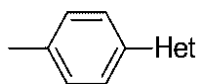
A r は、

【化 3 0 0 2】



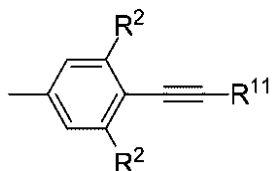
、

【化 3 0 0 3】



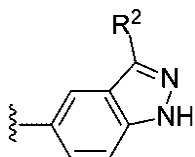
、

【化 3 0 0 4】



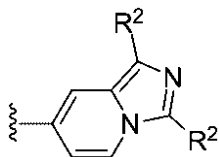
、

【化 3 0 0 5】



または

【化 3 0 0 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

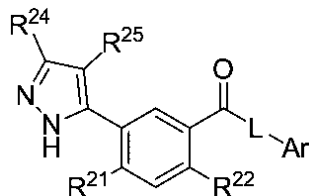
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 0 0 7】

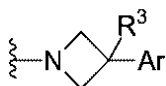


(X X)

(式中、

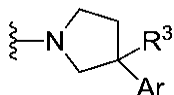
L - A r は、

【化 3 0 0 8】



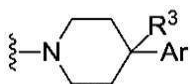
、

【化 3 0 0 9】



または

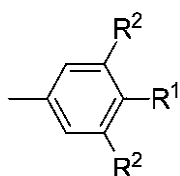
【化 3 0 1 0】



であり；

Ar は、

【化 3 0 1 1】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

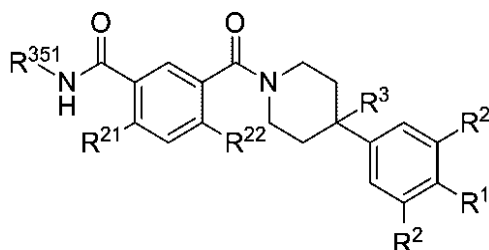
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 3 0 1 2】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

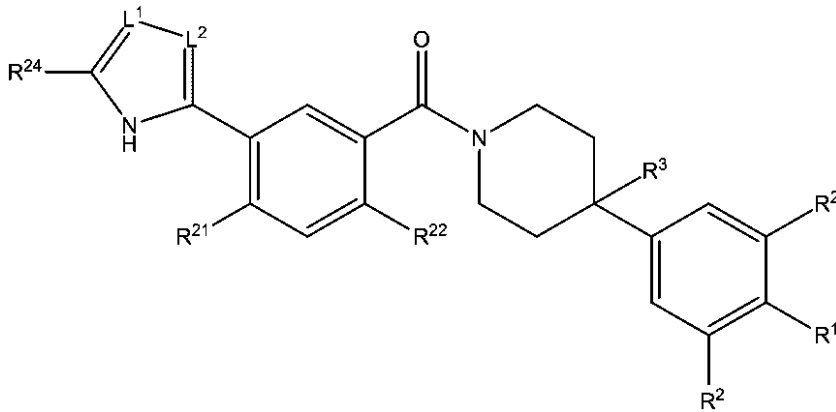
成物。

【請求項 23】

線維症遺伝子発現を低下させるための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 3013】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

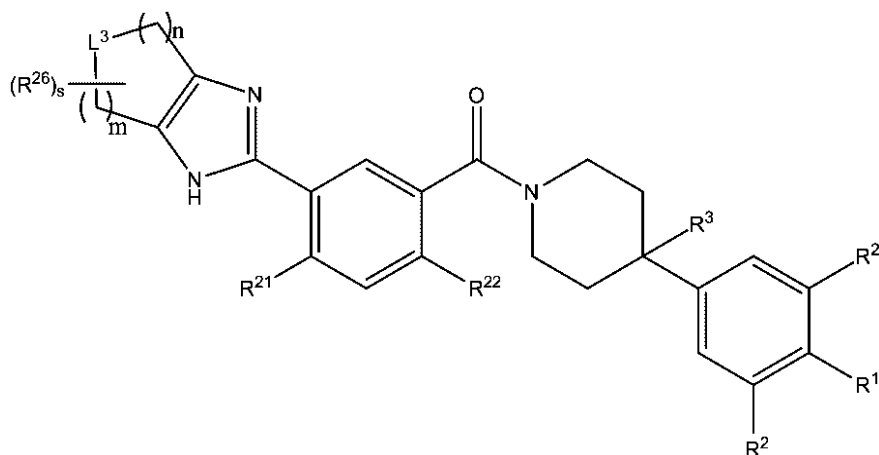
L² は、CHまたはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 3 0 1 4】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

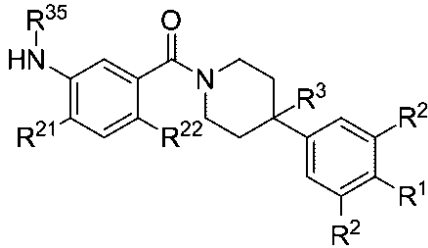
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化3015】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

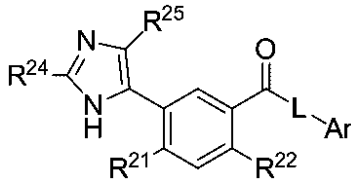
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化3016】

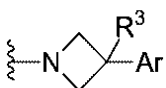


(XII)

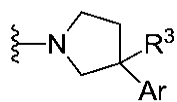
(式中、

L-Ar は、

【化3017】

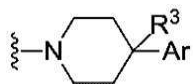


【化 3 0 1 8】



または

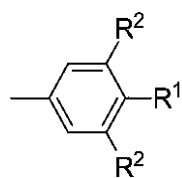
【化 3 0 1 9】



であり；

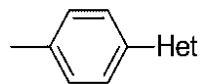
A r は、

【化 3 0 2 0】



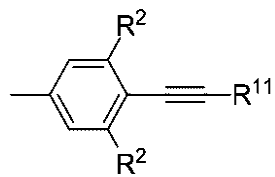
、

【化 3 0 2 1】



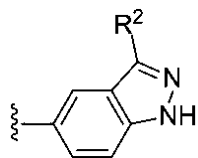
、

【化 3 0 2 2】



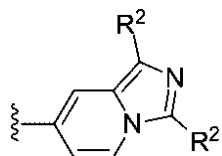
、

【化 3 0 2 3】



または

【化 3 0 2 4】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

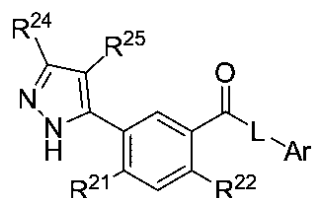
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化3025】

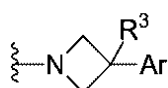


(XIII)

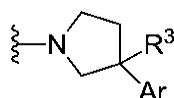
(式中、

L - Ar は、

【化3026】

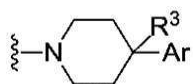


、
【化3027】



または

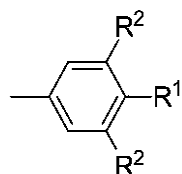
【化 3 0 2 8】



であり；

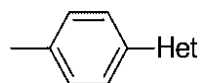
A r は、

【化 3 0 2 9】



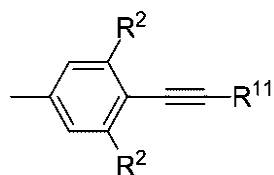
、

【化 3 0 3 0】



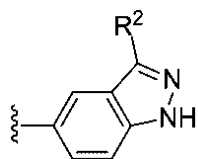
、

【化 3 0 3 1】



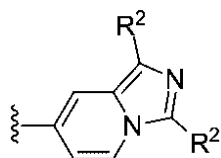
、

【化 3 0 3 2】



または

【化 3 0 3 3】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

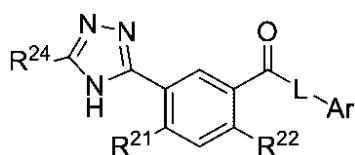
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 3034】

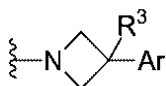


(XIV)

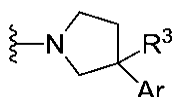
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 3035】

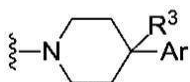


、
【化 3036】



または

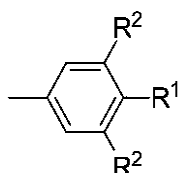
【化 3037】



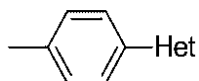
であり；

Ar は、

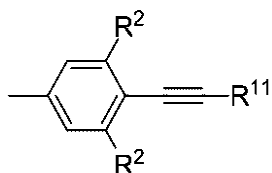
【化 3038】



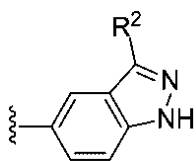
、
【化 3 0 3 9】



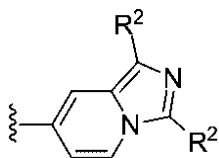
、
【化 3 0 4 0】



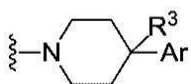
、
【化 3 0 4 1】



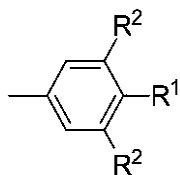
または
【化 3 0 4 2】



であり、ただし、L - Ar が
【化 3 0 4 3】



であるとき、Ar は
【化 3 0 4 4】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

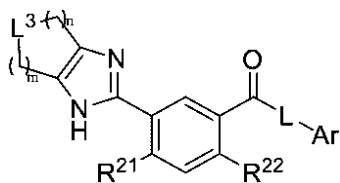
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化3045】



(XV)

(式中、

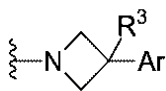
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

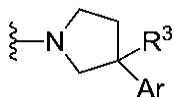
$L-Ar$ は、

【化3046】



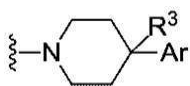
、

【化3047】



または

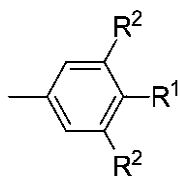
【化3048】



であり；

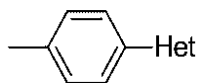
Ar は、

【化 3 0 4 9】



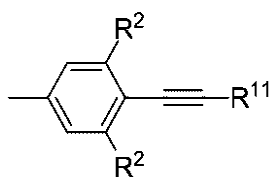
、

【化 3 0 5 0】



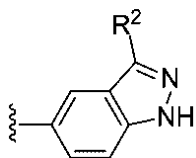
、

【化 3 0 5 1】



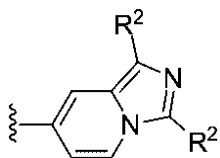
、

【化 3 0 5 2】



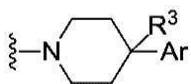
または

【化 3 0 5 3】



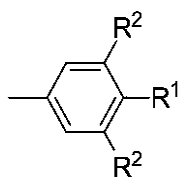
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 0 5 4】



であるとき、Ar は

【化 3 0 5 5】



ではなく；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

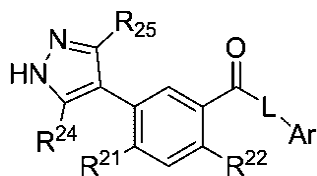
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化3056】

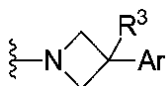


(XVI)

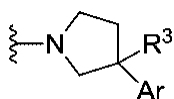
(式中、

L - Ar は、

【化3057】

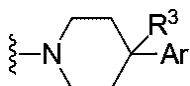


、
【化3058】



または

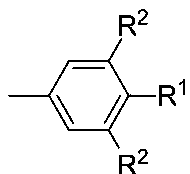
【化3059】



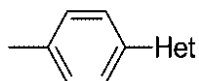
であり；

Ar は、

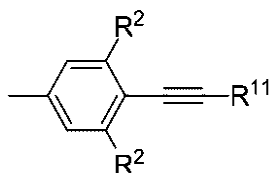
【化3060】



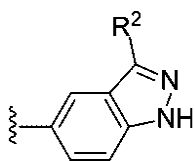
、
【化 3 0 6 1】



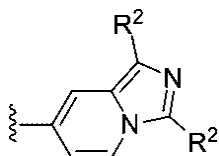
、
【化 3 0 6 2】



、
【化 3 0 6 3】



または
【化 3 0 6 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

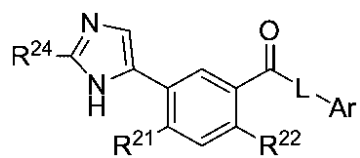
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 3 0 6 5】

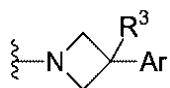


(XVII)

(式中、

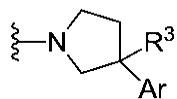
L - Ar は、

【化 3 0 6 6】



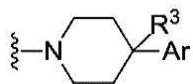
、

【化 3 0 6 7】



または

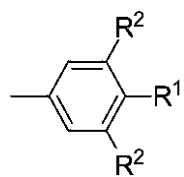
【化 3 0 6 8】



であり；

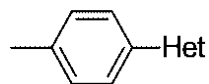
Ar は、

【化 3 0 6 9】



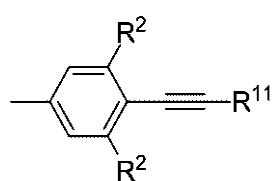
、

【化 3 0 7 0】



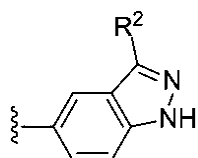
、

【化 3 0 7 1】



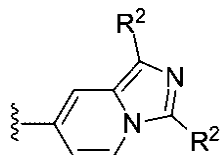
、

【化 3 0 7 2】



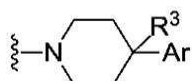
または

【化 3 0 7 3】



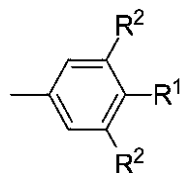
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 0 7 4】



であるとき、Ar は

【化 3 0 7 5】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

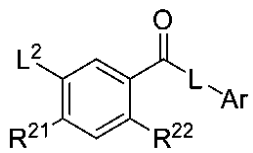
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 3 0 7 6】

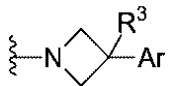


(X V I I I)

(式中、

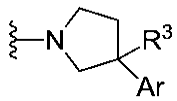
L - A r は、

【化 3 0 7 7】



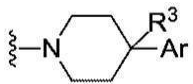
、

【化 3 0 7 8】



または

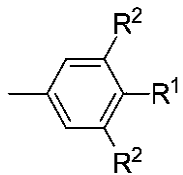
【化 3 0 7 9】



であり；

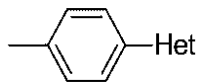
A r は、

【化 3 0 8 0】



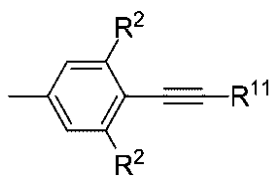
、

【化 3 0 8 1】

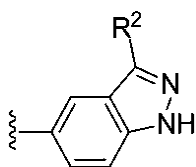


、

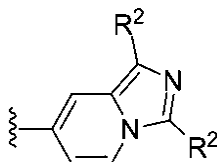
【化 3 0 8 2】



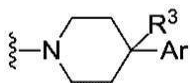
、
【化 3 0 8 3】



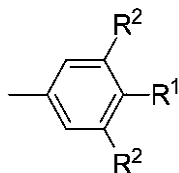
または
【化 3 0 8 4】



であり、ただし、L - Ar が
【化 3 0 8 5】



であるとき、Ar は
【化 3 0 8 6】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

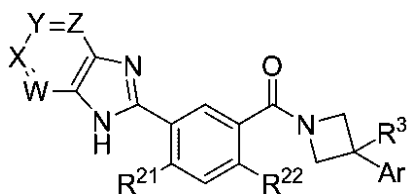
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 0 8 7】



(X I X)

(式中、

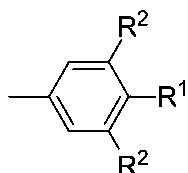
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

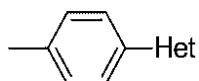
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じて含み、

A r は、

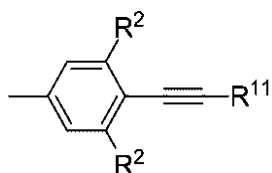
【化 3 0 8 8】



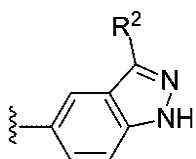
【化 3 0 8 9】



【化 3 0 9 0】

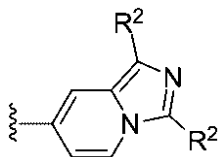


【化 3 0 9 1】



または

【化 3 0 9 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

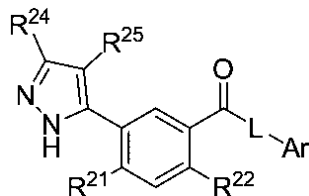
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 0 9 3】

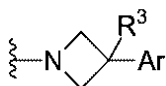


(X X)

(式中、

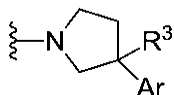
L - A r は、

【化 3 0 9 4】



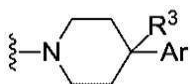
、

【化 3 0 9 5】



または

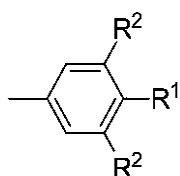
【化 3 0 9 6】



であり；

Ar は、

【化 3 0 9 7】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

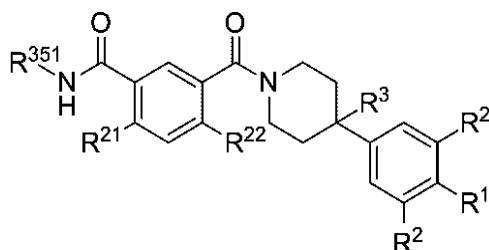
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 3 0 9 8】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

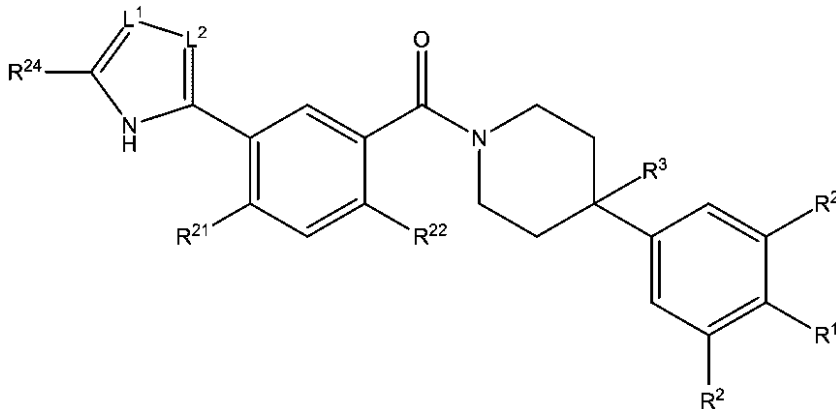
成物。

【請求項 24】

皮膚線維症を処置するための組成物であって、

(a) 式 (IX)

【化 3099】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でも ハロゲン でも ない とき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH または ハロゲン であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ または N であり；

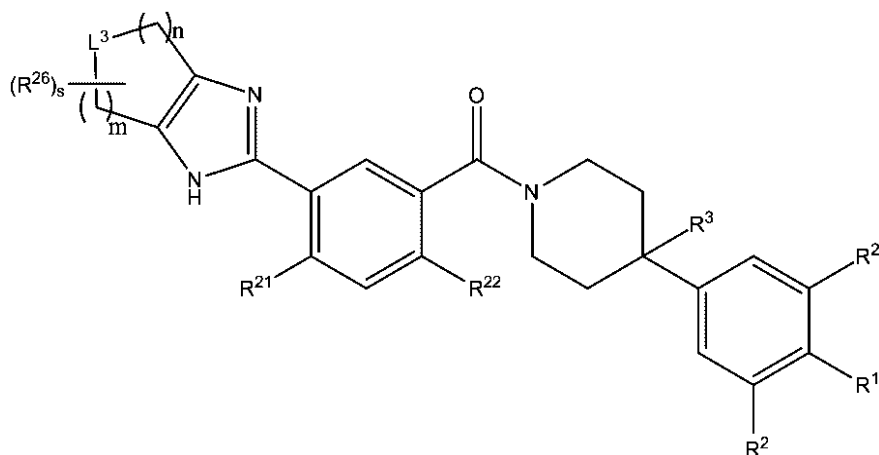
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 3 1 0 0】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

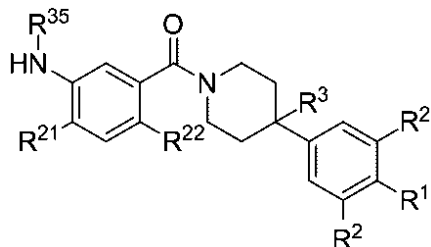
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化3101】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

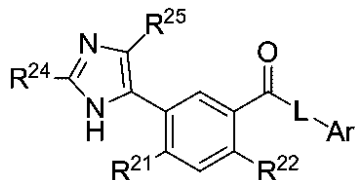
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または $S(O)_2 R^{351}$ であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化3102】

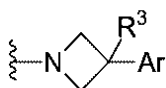


(XII)

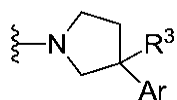
(式中、

L-Ar は、

【化3103】

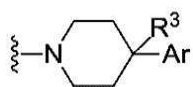


【化 3 1 0 4】



または

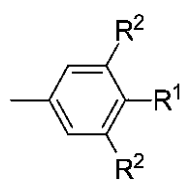
【化 3 1 0 5】



であり；

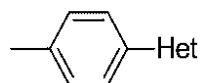
A r は、

【化 3 1 0 6】



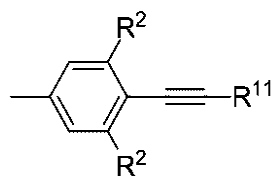
、

【化 3 1 0 7】



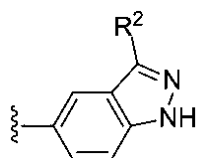
、

【化 3 1 0 8】



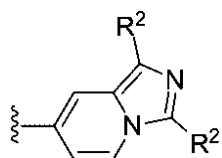
、

【化 3 1 0 9】



または

【化 3 1 1 0】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

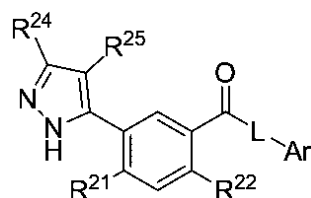
ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化3111】

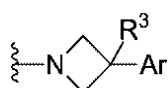


(XIII)

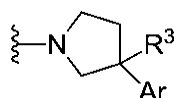
(式中、

L - Ar は、

【化3112】

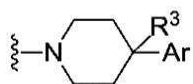


、
【化3113】



または

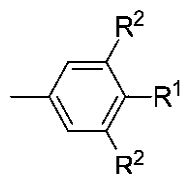
【化 3 1 1 4】



であり；

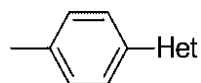
A r は、

【化 3 1 1 5】



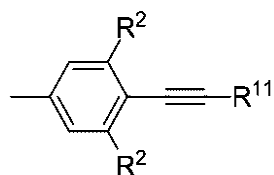
、

【化 3 1 1 6】



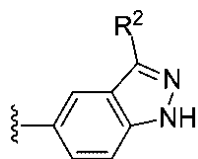
、

【化 3 1 1 7】



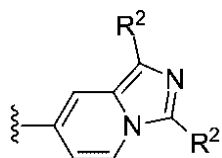
、

【化 3 1 1 8】



または

【化 3 1 1 9】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

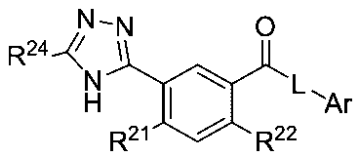
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 3 1 2 0】

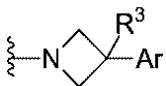


(XIV)

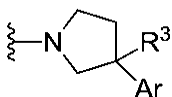
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 3 1 2 1】

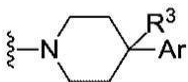


、
【化 3 1 2 2】



または

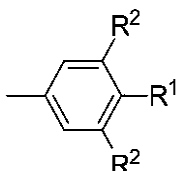
【化 3 1 2 3】



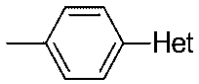
であり；

Ar は、

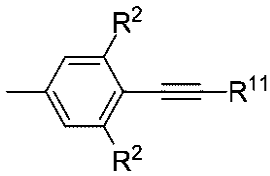
【化 3 1 2 4】



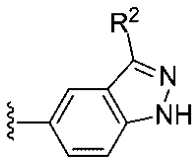
、
【化 3 1 2 5】



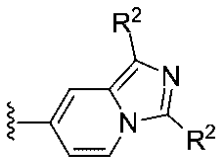
、
【化 3 1 2 6】



、
【化 3 1 2 7】



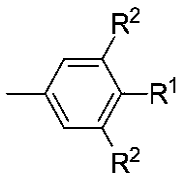
または
【化 3 1 2 8】



であり、ただし、L - Ar が
【化 3 1 2 9】



であるとき、Ar は
【化 3 1 3 0】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

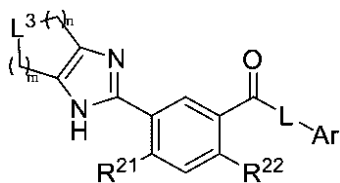
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 3 1 3 1】



(XV)

(式中、

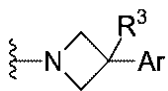
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \geq 3$ であり；

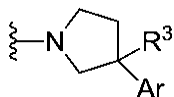
$L-Ar$ は、

【化 3 1 3 2】



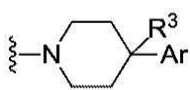
、

【化 3 1 3 3】



または

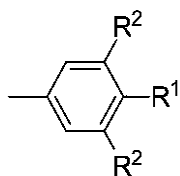
【化 3 1 3 4】



であり；

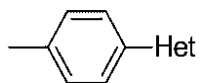
Ar は、

【化 3 1 3 5】



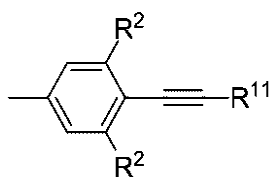
、

【化 3 1 3 6】



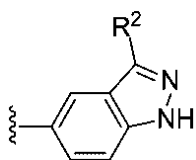
、

【化 3 1 3 7】



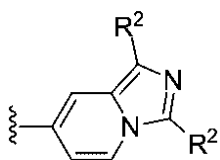
、

【化 3 1 3 8】



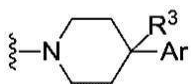
または

【化 3 1 3 9】



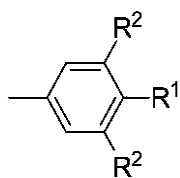
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 1 4 0】



であるとき、Ar は

【化 3 1 4 1】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

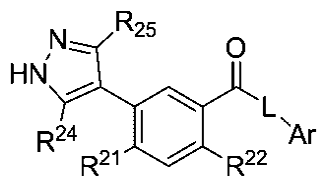
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 3 1 4 2】

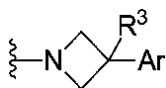


(XVI)

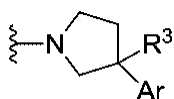
(式中、

L - Ar は、

【化 3 1 4 3】

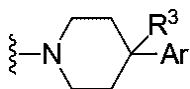


、
【化 3 1 4 4】



または

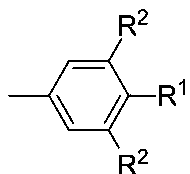
【化 3 1 4 5】



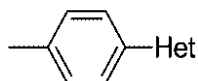
であり；

Ar は、

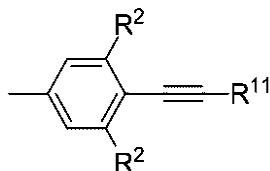
【化 3 1 4 6】



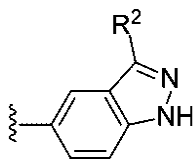
、
【化 3 1 4 7】



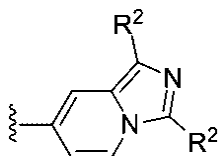
、
【化 3 1 4 8】



、
【化 3 1 4 9】



または
【化 3 1 5 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - C H₃ であり；

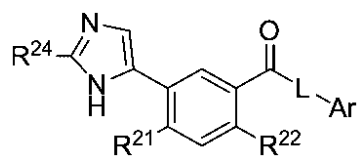
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ 及び R²⁵ のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 3 1 5 1】

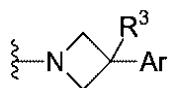


(XVII)

(式中、

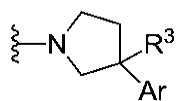
L - Ar は、

【化 3 1 5 2】



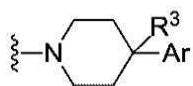
、

【化 3 1 5 3】



または

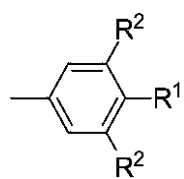
【化 3 1 5 4】



であり；

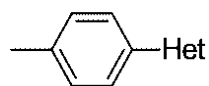
Ar は、

【化 3 1 5 5】



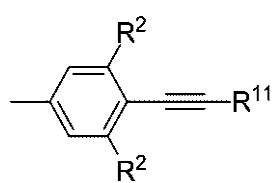
、

【化 3 1 5 6】



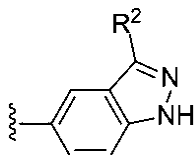
、

【化 3 1 5 7】



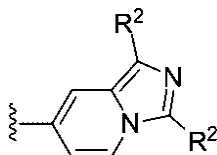
、

【化 3 1 5 8】



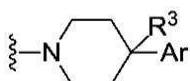
または

【化 3 1 5 9】



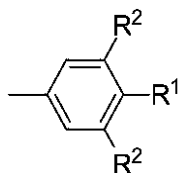
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 1 6 0】



であるとき、Ar は

【化 3 1 6 1】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

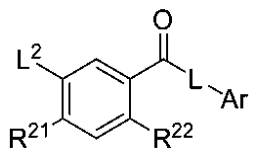
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 3 1 6 2】

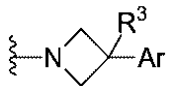


(X V I I I)

(式中、

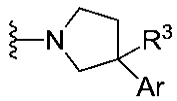
L - A r は、

【化 3 1 6 3】



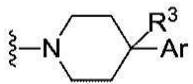
、

【化 3 1 6 4】



または

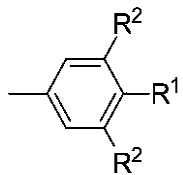
【化 3 1 6 5】



であり ;

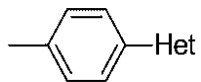
A r は、

【化 3 1 6 6】



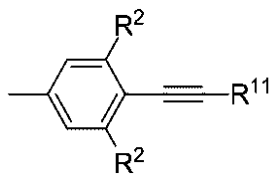
、

【化 3 1 6 7】

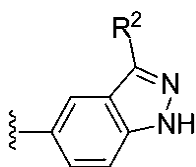


、

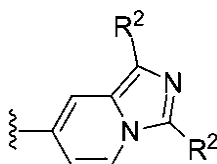
【化 3 1 6 8】



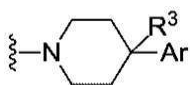
、
【化 3 1 6 9】



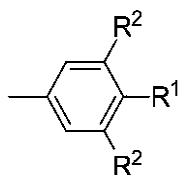
または
【化 3 1 7 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 3 1 7 1】



であるとき、Ar は
【化 3 1 7 2】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

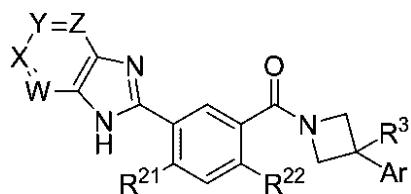
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 1 7 3】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

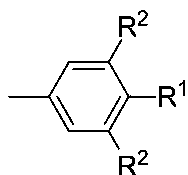
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

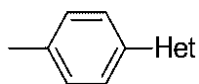
A r は、

【化 3 1 7 4】



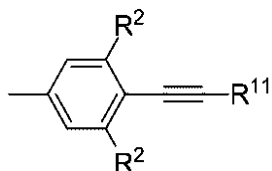
、

【化 3 1 7 5】



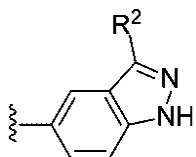
、

【化 3 1 7 6】



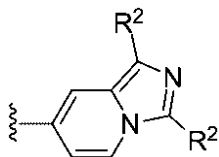
、

【化 3 1 7 7】



または

【化 3 1 7 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

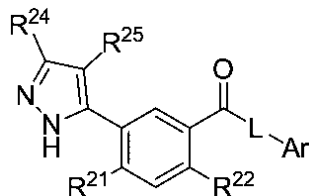
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 1 7 9】

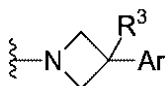


(X X)

(式中、

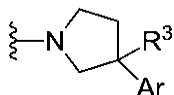
L - A r は、

【化 3 1 8 0】



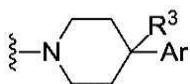
、

【化 3 1 8 1】



または

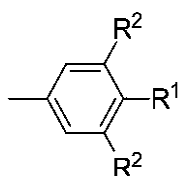
【化 3 1 8 2】



であり；

Ar は、

【化 3 1 8 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R^{2 1}は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

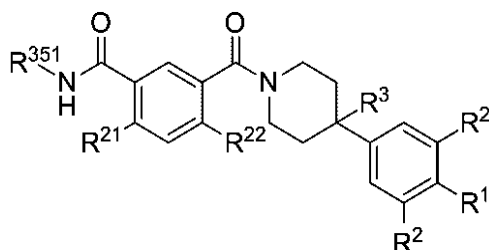
R^{2 2}は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R^{2 4}は、-O-(C₁～C₄アルキル)、-O-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、または-O-(4～6員複素環)であり、この場合、R^{2 4}は、1つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5}は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₅シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5}は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m)式(XI)：

【化 3 1 8 4】



(XI)

(式中、

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(C₁～C₄直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃～C₅シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、H、ハロゲンまたはC₁～C₄直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{2 1}は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2}は、H、ハロゲン、C₁～C₂アルキルであり；

R^{3 5 1}は、C₁～C₂アルキルまたはC₂-O-(C₁もしくはC₂アルキル)である)もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を含む、組

成物。

【請求項 25】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (IX)、(X)、(XII)、(XIV)、(XV) または (XX) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 26】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (IX) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 27】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 28】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XII) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 29】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XIV) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 30】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XV) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

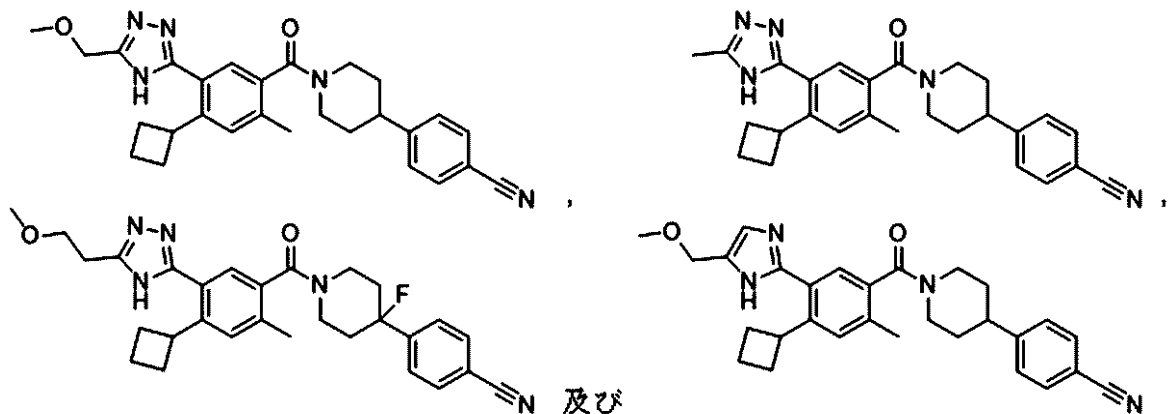
【請求項 31】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XX) を有する、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 32】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 3185】

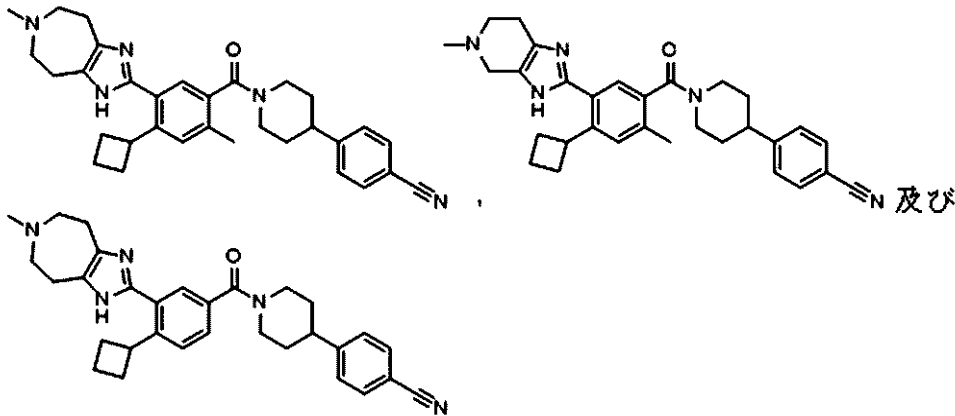


から選択される、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 33】

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 3 1 8 6】



から選択される、請求項 13 ~ 24 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 34】

前記疾患または状態が、家族性地中海熱（F M F）、化膿性関節炎、壊疽性膿皮症、ざ瘡（P A P A）、クリオピリン関連周期熱症候群（C A P S）、高 I g D 症候群（H I D S）、成人及び若年スチル病、シュニッツラー症候群、T N F 受容体関連周期性症候群（T R A P S）、ブラウ症候群、スウィート症候群、I L - 1 受容体拮抗分子欠損症（D I R A）、再発性特発性心膜炎、マクロファージ活性化症候群（M A S）、蕁麻疹様血管炎、抗合成酵素症候群、再発性軟骨炎、ベーチェット病、エルドハイム・チェスター症候群（組織球症）、滑膜炎、ざ瘡、膿疱症、骨化症、骨炎（S A P H O）、関節リウマチ、周期熱、アフタ性口内炎、咽頭炎、リンパ節炎症候群（P F A P A）、尿酸結晶性関節炎（痛風）、2 型糖尿病、くすぶり型多発性骨髄腫、心筋梗塞後心不全、骨関節炎、輸血関連急性肺障害、人工呼吸器誘発肺損傷、特発性を含む肺線維症、慢性閉塞性肺疾患、ならびに喘息から選択される、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記疾患または状態が、乾癬、関節リウマチ、多発性硬化症、強直性脊椎炎、炎症性腸疾患、喘息、腫瘍形成及び移植拒絶反応から選択される、請求項 20 または 21 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記上昇したヘルパー T 細胞が、 $T_h 1$ 、 $T_h 2$ 、 $T_h 9$ または $T_h 17$ である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 37】

前記上昇したヘルパー T 細胞が、 T_{17} である、請求項 36 に記載の組成物。

【請求項 38】

T_{reg} 細胞が抑制されている、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 39】

前記非アルコール性脂肪性肝炎を処置することが、確立された非アルコール性脂肪性肝炎の少なくとも 1 つの症状を逆転させることを含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 40】

前記非アルコール性脂肪性肝炎を処置することが、非アルコール性脂肪性肝炎の少なくとも 1 つの症状の進行を防ぐことを含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 41】

前記症状が、A S T レベルの上昇、A L T レベルの上昇、肝臓トリグリセリドレベルの上昇、コレステロールレベルの上昇、肝脂肪化、肝炎症、肝臓風船化、肝線維化及び N A F L D 活動性スコアから選択される、請求項 39 または 40 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 1 2 8

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 1 2 8 】

様々な態様において、構造 (I)、(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)、(X)、(XI) を有する化合物または表 1 に記載するような化合物を、皮膚線維症を処置するための医薬品の製造に使用することができる。更なる態様において、構造 (I)、(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)、(X)、(XI) を有する化合物または表 1 に記載するような化合物を、皮膚線維症を処置するために使用することができる。

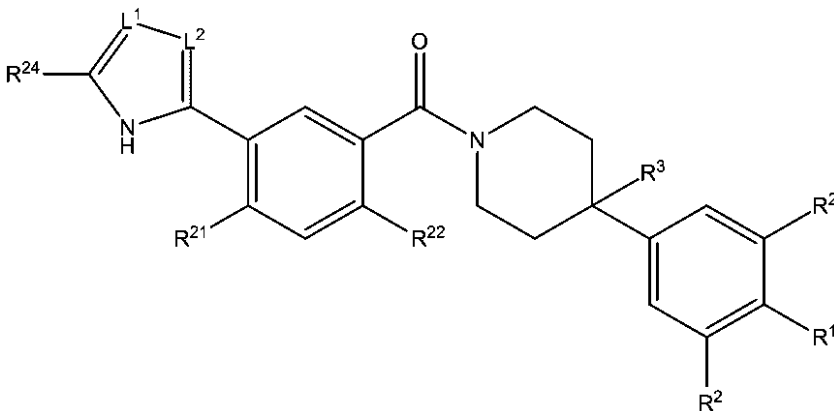
特定の実施形態では、例えば、以下が提供される：

(項目 1)

脂肪性肝疾患を処置することを、それを必要とする対象に行う方法であって、前記対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2 0 6 5】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

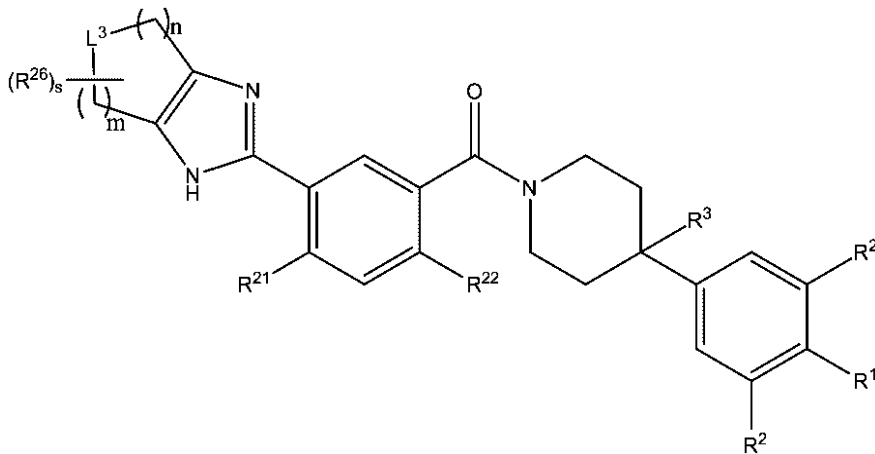
L² は、CH または N であり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

$R^{2,3}$ は、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2066】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{6,0})_2$ 、O または $NR^{5,0}$ であり；

各 $R^{6,0}$ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または -C(O)-N($R^{6,0,1}$)₂ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 $R^{5,0}$ は、独立して、H、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_3 \sim C_5$ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する - $C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、-C(O)-N($R^{5,0,1}$)₂、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり；

$R^{2,1}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

$R^{2,2}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 $R^{2,6}$ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t

- (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C(O) - N(R^{5 0 1})₂ であり、この場合、
t は、0 または 1 であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

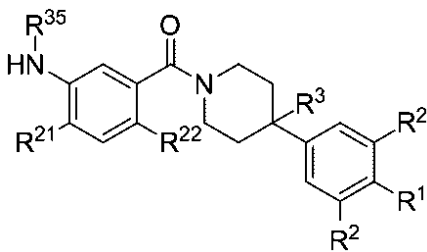
s は、0、1 または 2 であり；

各 R^{6 0 1} 及び R^{5 0 1} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル
であり；

ここで、R^{2 6}、R^{6 0}、R^{5 0}、R^{5 0 1} 及び R^{6 0 1} のうちの 2 つは、必要に応じて
連結して環を形成しており、この場合、R^{2 6}、R^{6 0}、R^{5 0}、R^{5 0 1} 及び R^{6 0 1}
のうちの 2 つは、2 つの R^{2 6}、2 つの R^{6 0}、2 つの R^{5 0}、2 つの R^{5 0 1} または 2
つの R^{6 0 1} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2 0 6 7】



(VI - J)

(式中、

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、- O - (C₃ ~
C₅ シクロアルキル)、- O - (C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場
合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応
じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり
；

R³ は、H、- OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン - 1 - イル、またはシクロプロピルであり；

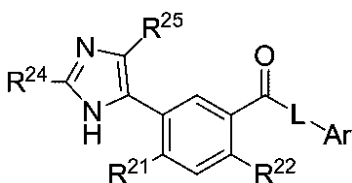
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O) - R^{3 5 1}、- C(O) - NHR^{3 5 1}、- C(O) - O - R^{3 5}
1 または S(O)₂ R^{3 5 1} であり；

R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル
、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII) :

【化 2 0 6 8】

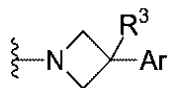
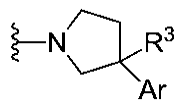
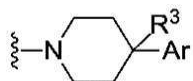
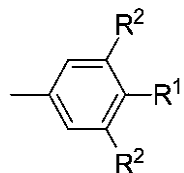
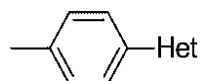
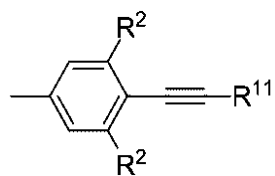
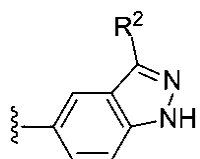


(XII)

(式中、

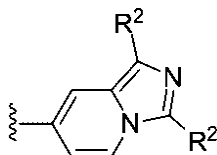
L - Ar は、

【化 2 0 6 9】


 $\frac{\text{v}}{\text{v}}$
 【化 2 0 7 0】

 または
 【化 2 0 7 1】

 であり ;
 Ar は、
 【化 2 0 7 2】

 $\frac{\text{v}}{\text{v}}$
 【化 2 0 7 3】

 $\frac{\text{v}}{\text{v}}$
 【化 2 0 7 4】

 $\frac{\text{v}}{\text{v}}$
 【化 2 0 7 5】


または

【化 2 0 7 6】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

u は、0または1であり；

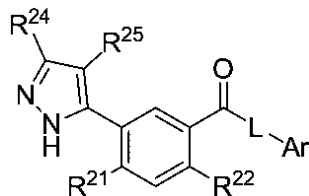
ただし、 u が1であるとき、 t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(e) 式 (XIII)：

【化 2 0 7 7】

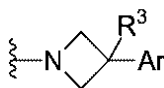


(XIII)

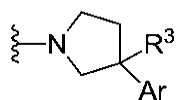
(式中、

$L-Ar$ は、

【化 2 0 7 8】

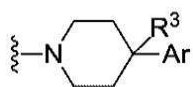


【化 2 0 7 9】



または

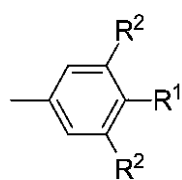
【化 2 0 8 0】



であり；

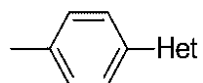
Ar は、

【化 2 0 8 1】



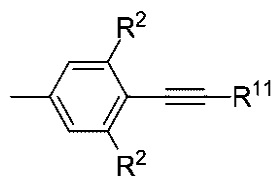
、

【化 2 0 8 2】



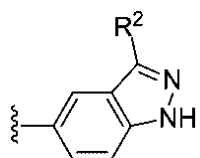
、

【化 2 0 8 3】



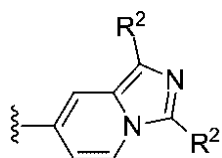
、

【化 2 0 8 4】



または

【化 2 0 8 5】



であり；

H e t は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

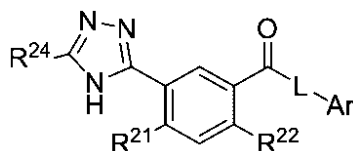
各 t は、独立して、0または1であり；

各 u は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化2086】

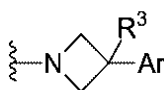


(XIV)

(式中、

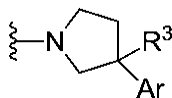
L-Ar は、

【化2087】



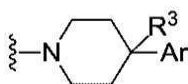
、

【化2088】



または

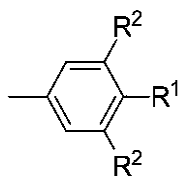
【化2089】



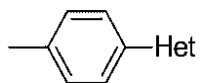
であり；

Ar は、

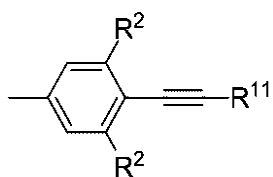
【化 2 0 9 0】



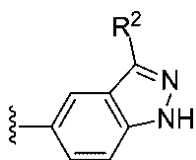
【化 2 0 9 1】



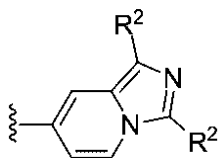
【化 2 0 9 2】



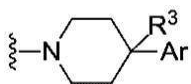
【化 2 0 9 3】



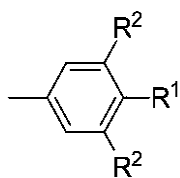
【化 2 0 9 4】



【化 2 0 9 5】



【化 2 0 9 6】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

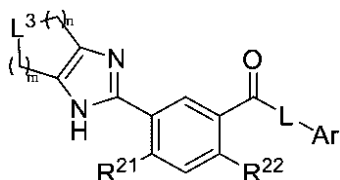
R^{24} は、 H 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t - \text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t - \text{O}_t - (\text{C}_3 \sim \text{C}_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t - \text{O}_t - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t - \text{O} - (\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化2097】



(XV)

(式中、

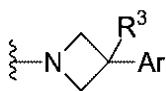
L^3 は、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CHR}^{50}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^{50}-$ 、 $-\text{NC}(\text{O})\text{R}^{50}-$ または $-\text{NC}(\text{O})\text{OR}^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

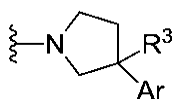
m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化2098】

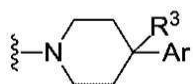


【化2099】



または

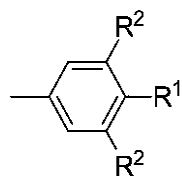
【化 2 1 0 0】



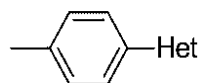
であり；

Ar は、

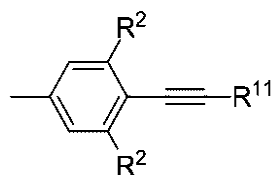
【化 2 1 0 1】



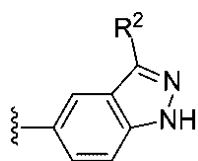
【化 2 1 0 2】



【化 2 1 0 3】

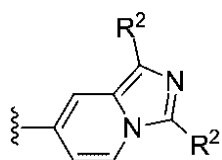


【化 2 1 0 4】



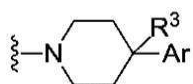
または

【化 2 1 0 5】



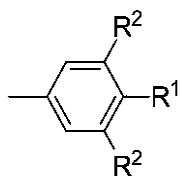
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 0 6】



であるとき、Arは

【化2107】



ではなく；

Hetは、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

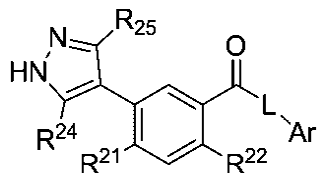
R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h)式(XVI)：

【化2108】

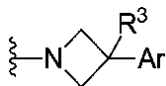


(XVI)

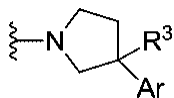
(式中、

L-Arは、

【化2109】

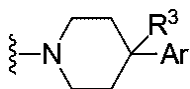


【化2110】



または

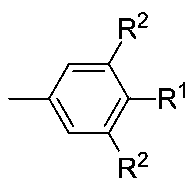
【化2111】



であり；

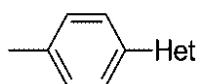
Ar は、

【化 2 1 1 2】



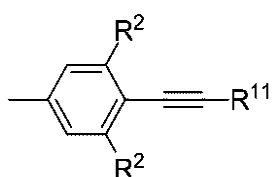
、

【化 2 1 1 3】



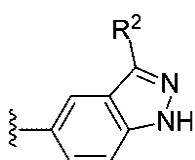
、

【化 2 1 1 4】



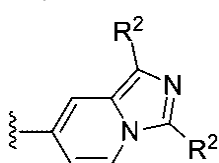
、

【化 2 1 1 5】



または

【化 2 1 1 6】



であり；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

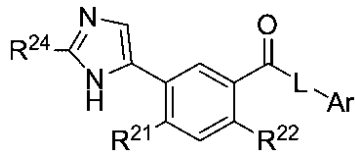
R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{24} 及び R^{25} のそれぞれは、独立して、 H 、 $-C_1 \sim C_4$ アルキルまたはハロゲンである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) :

【化 2 1 1 7】

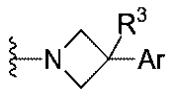


(X V I I)

(式中、

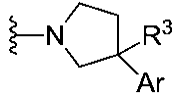
$L - Ar$ は、

【化 2 1 1 8】



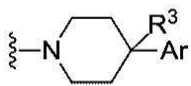
、

【化 2 1 1 9】



または

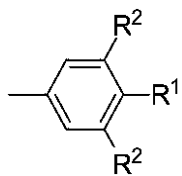
【化 2 1 2 0】



であり；

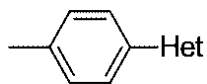
Ar は、

【化 2 1 2 1】



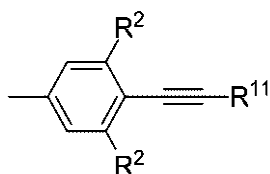
、

【化 2 1 2 2】

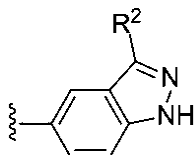


、

【化 2 1 2 3】

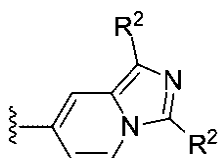


【化 2 1 2 4】



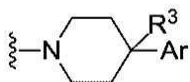
または

【化 2 1 2 5】



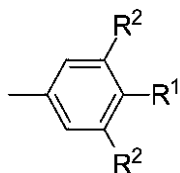
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 2 6】



であるとき、Ar は

【化 2 1 2 7】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄

アルキル) - N (R ^{2 4 1}) ₂、 - (C ₁ ~ C ₄ アルキル) _t - O _u - (C ₃ ~ C ₅ シク
ロアルキル)、 - (C ₁ ~ C ₄ アルキル) _t - O _u - (4 ~ 6 員複素環) または - (C ₁
~ C ₄ アルキル) - O - (C ₁ ~ C ₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり ;

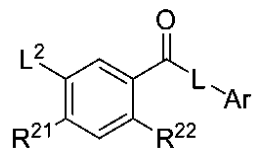
u は、0 または 1 であり ;

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり ;

R ^{2 4 1} は、H または C ₁ ~ C ₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩
; または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 1 2 8】

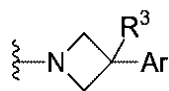


(X V I I I)

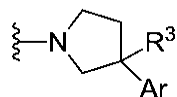
(式中、

L - A r は、

【化 2 1 2 9】

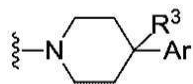


【化 2 1 3 0】



または

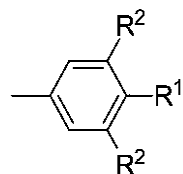
【化 2 1 3 1】



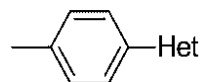
であり ;

A r は、

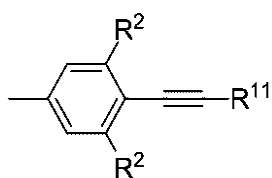
【化 2 1 3 2】



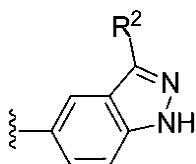
【化 2 1 3 3】



【化 2 1 3 4】

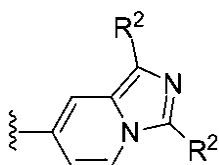


【化 2 1 3 5】



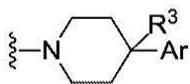
または

【化 2 1 3 6】



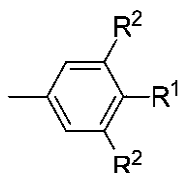
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 3 7】



であるとき、Ar は

【化 2 1 3 8】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

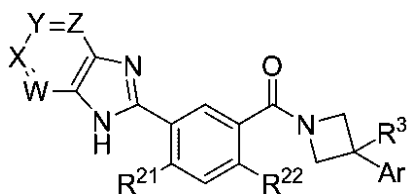
$R^{2\ 1}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

$R^{2\ 2}$ は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

$R^{3\ 5}$ は、 $-C(O)R^{3\ 5\ 1}$ 、 $-C(O)NHR^{3\ 5\ 1}$ 、 $C(O)OR^{3\ 5\ 1}$ または $S(O)_2R^{3\ 5\ 1}$ であり、この場合、 $R^{3\ 5\ 1}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 1 3 9】



(XIX)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、 $-N-$ または $-CR^{2\ 6}-$ であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、 $-N-$ であるのは 2 つ以下であり；

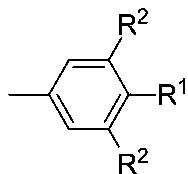
各 $R^{2\ 6}$ は、独立して、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(R^{2\ 7})_2$ 、 $-S(O)_2-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり；

各 $R^{2\ 7}$ は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、あるいは、 $R^{2\ 7}$ は、両方とも $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

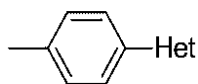
て含み、

Ar は、

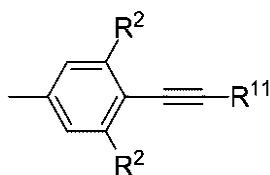
【化 2 1 4 0】



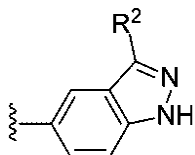
【化 2 1 4 1】



【化 2 1 4 2】

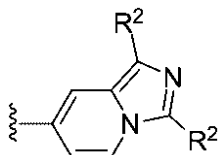


【化 2 1 4 3】



または

【化 2 1 4 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環)、-O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

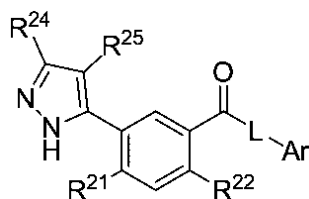
R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (XX)：

【化 2 1 4 5】

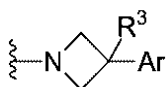


(XX)

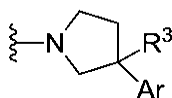
(式中、

L-Ar は、

【化 2 1 4 6】

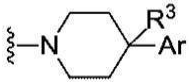


【化 2 1 4 7】



または

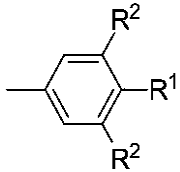
【化 2 1 4 8】



であり；

Ar は、

【化 2 1 4 9】



であり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

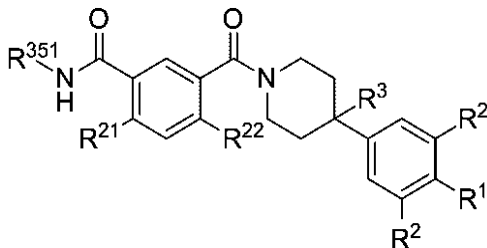
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-O-(4～6員複素環)であり、この場合、 R^{24} は、1つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{25} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 R^{25} は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 1 5 0】



(XI)

式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて

じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_2-O-(C_1$ もしくは C_2 アルキル)である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与することを含む、方法。

(項目2)

前記脂肪性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD) 及び非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH) から選択される、項目1に記載の方法。

(項目3)

前記脂肪性肝疾患が、非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH) である、項目1または2に記載の方法。

(項目4)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (IX)、(X)、(XII)、(XIV)、(XV) または (XX) を有する、項目1～3のいずれか一項に記載の方法。

(項目5)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (IX) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

(項目6)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

(項目7)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XII) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

(項目8)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XIV) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

(項目9)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XV) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

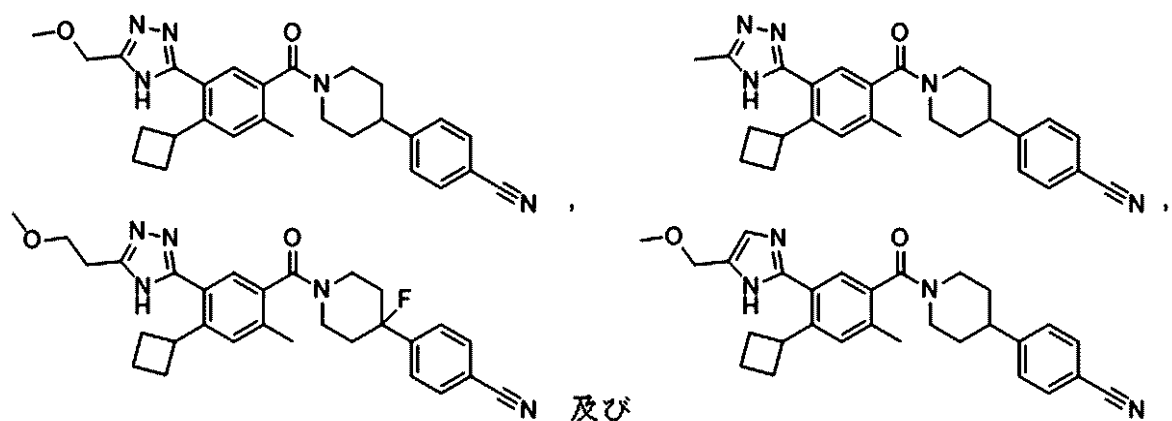
(項目10)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (XX) を有する、項目1～4のいずれか一項に記載の方法。

(項目11)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 2 1 5 1】

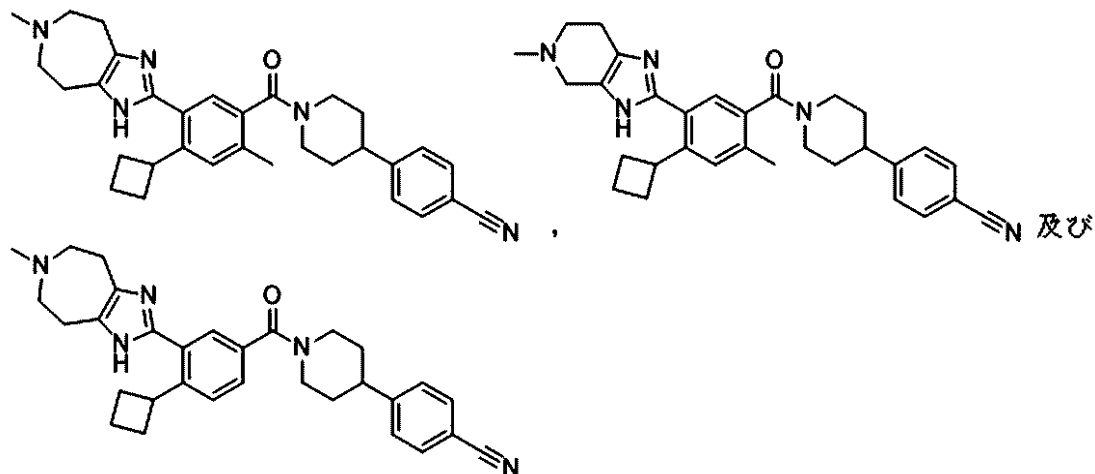


から選択される、項目 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 1 2)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 2 1 5 2】



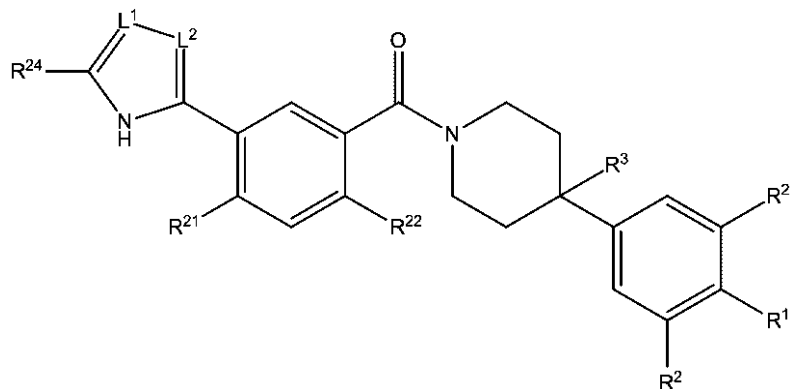
から選択される、項目 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 1 3)

非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H) を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (I X)

【化 2 1 5 3】



(I X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、 CR^{23} または N であり；

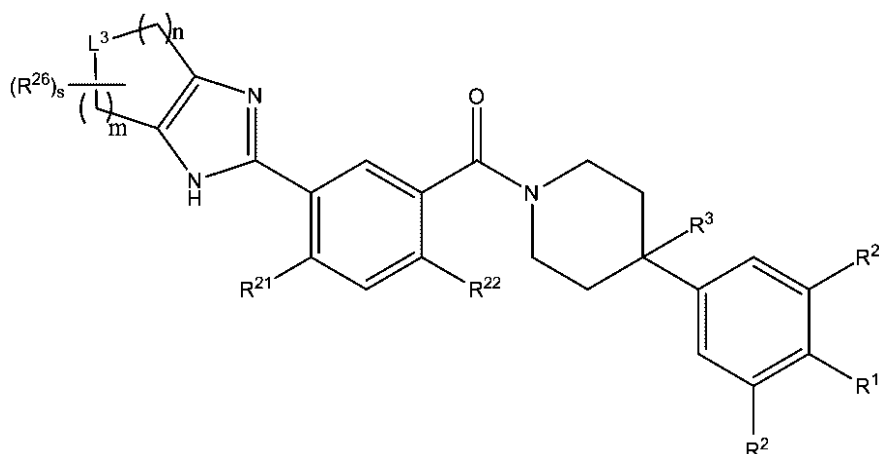
L^2 は、CH または N であり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、N であり；

R^{23} は、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 1 5 4】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、O または NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

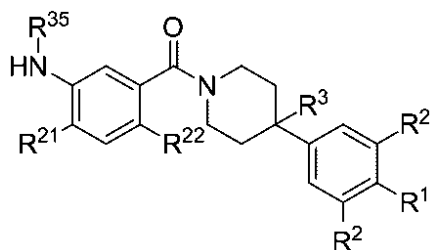
s は、0、1 または 2 であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、2 つの R^{26} 、2 つの R^{60} 、2 つの R^{50} 、2 つの R^{501} または 2 つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2155】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

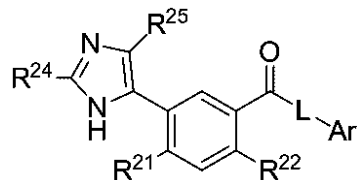
R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{35}
 1 または S(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
 (d) 式 (XII)：

【化 2 1 5 6】

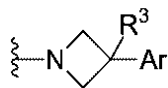


(XII)

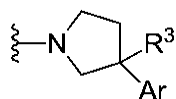
(式中、

L-Ar は、

【化 2 1 5 7】

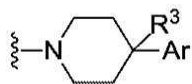


、
 【化 2 1 5 8】



または

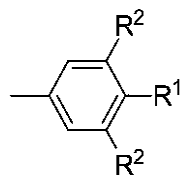
【化 2 1 5 9】



であり；

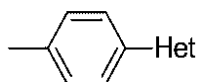
Ar は、

【化 2 1 6 0】

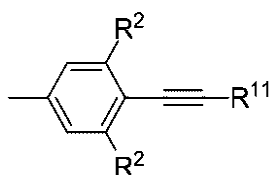


、

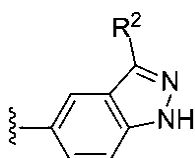
【化 2 1 6 1】



【化 2 1 6 2】

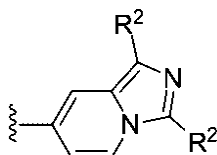


【化 2 1 6 3】



または

【化 2 1 6 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり； R^3 は、HまたはFであり； R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

 R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

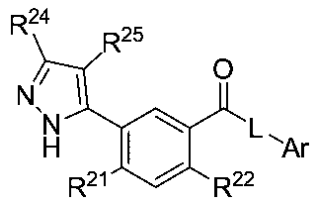
u は、0または1であり；

ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R²⁵ は、ハロゲン、-CN、-(C₁~C₄アルキル)-CN、C₁~C₂アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩;または
(e)式(XIII):

【化2165】

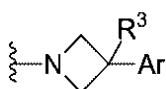


(XIII)

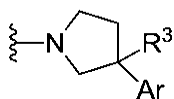
(式中、

L-Arは、

【化2166】

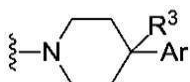


【化2167】



または

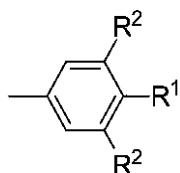
【化2168】



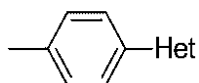
であり;

Arは、

【化2169】

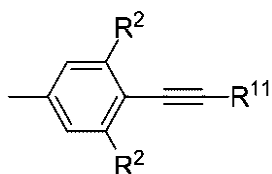


【化2170】



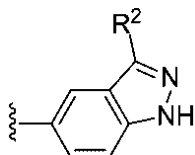
、

【化 2 1 7 1】



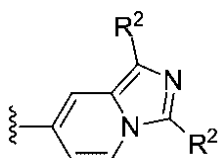
、

【化 2 1 7 2】



または

【化 2 1 7 3】



であり；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

各 R²⁴ 及び R²⁵ は、独立して、H、ハロゲン、-CN、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - CN、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N(R²⁴¹)₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

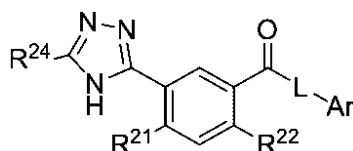
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R²⁴¹ は、独立して、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 1 7 4】

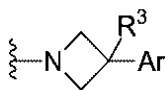


(XIV)

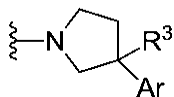
(式中、

L - Ar は、

【化 2 1 7 5】

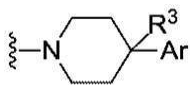

 $\frac{\text{~}}{\text{~}}$

【化 2 1 7 6】



または

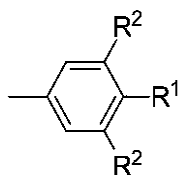
【化 2 1 7 7】



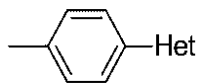
であり；

Ar は、

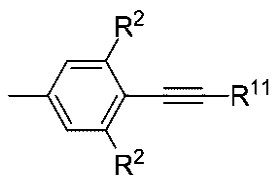
【化 2 1 7 8】


 $\frac{\text{~}}{\text{~}}$

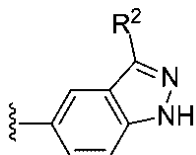
【化 2 1 7 9】


 $\frac{\text{~}}{\text{~}}$

【化 2 1 8 0】

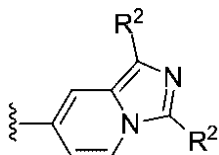

 $\frac{\text{~}}{\text{~}}$

【化 2 1 8 1】



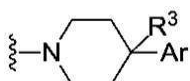
または

【化 2 1 8 2】



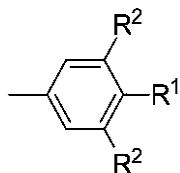
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 8 3】



であるとき、Ar は

【化 2 1 8 4】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

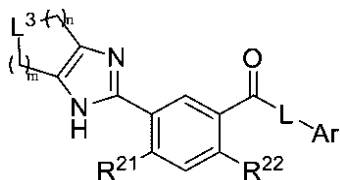
R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oₜ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oₜ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)ₜ-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

各tは、独立して、0または1であり；

各R²⁴¹は、独立して、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g)式(XV)；

【化 2 1 8 5】



(XV)

(式中、

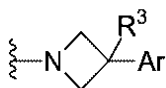
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

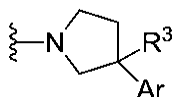
$L-Ar$ は、

【化 2 1 8 6】



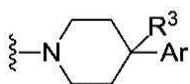
、

【化 2 1 8 7】



または

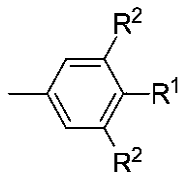
【化 2 1 8 8】



であり；

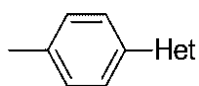
Ar は、

【化 2 1 8 9】



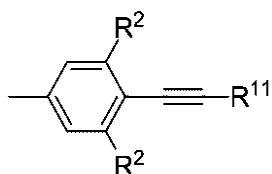
、

【化 2 1 9 0】



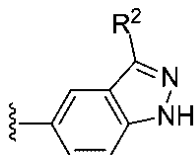
、

【化 2 1 9 1】



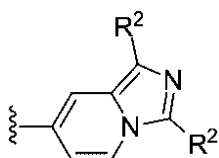
、

【化 2 1 9 2】



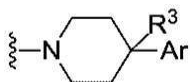
または

【化 2 1 9 3】



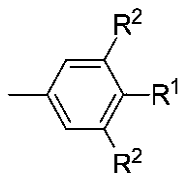
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 1 9 4】



であるとき、Ar は

【化 2 1 9 5】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

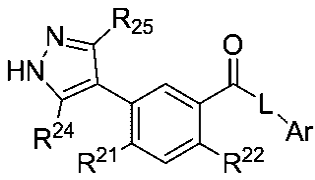
R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

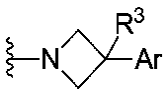
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

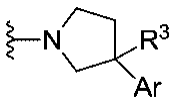
(h) 式 (X V I) :
【化 2 1 9 6】



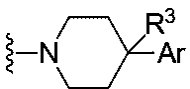
(X V I)
(式中、
L - A r は、
【化 2 1 9 7】



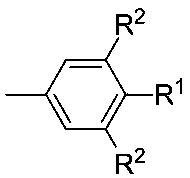
、
【化 2 1 9 8】



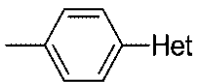
または
【化 2 1 9 9】



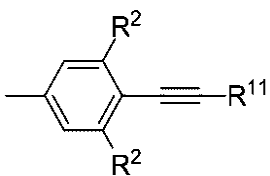
であり、
A r は、
【化 2 2 0 0】



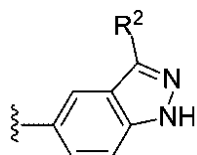
、
【化 2 2 0 1】



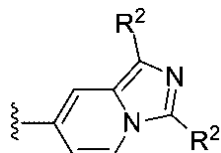
、
【化 2 2 0 2】



、
【化 2 2 0 3】



または
【化 2 2 0 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

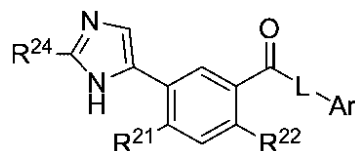
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 2 0 5】

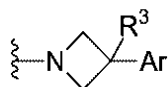


(X V I I)

(式中、

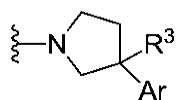
L - A r は、

【化 2 2 0 6】



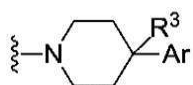
、

【化 2 2 0 7】



または

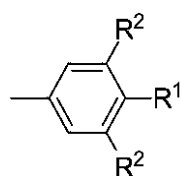
【化 2 2 0 8】



であり；

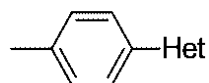
Ar は、

【化 2 2 0 9】



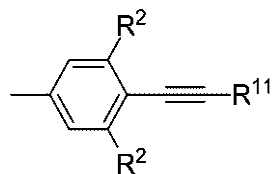
、

【化 2 2 1 0】



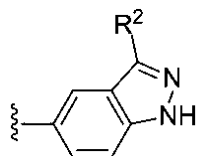
、

【化 2 2 1 1】



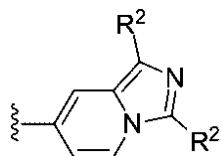
、

【化 2 2 1 2】



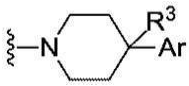
または

【化 2 2 1 3】



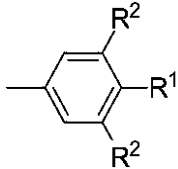
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 2 1 4】



であるとき、Ar は

【化 2 2 1 5】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R¹¹ は、H または - CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N(R²⁴¹)₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)ₜ - Oᵤ - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)ₜ - Oᵤ - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

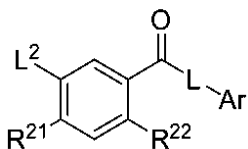
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R²⁴¹ は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (XVII I)：

【化 2 2 1 6】

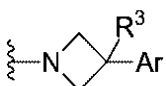


(XVII I)

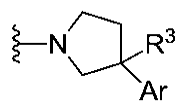
(式中、

L - Ar は、

【化 2 2 1 7】

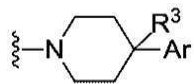


【化 2 2 1 8】



または

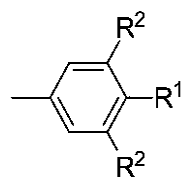
【化 2 2 1 9】



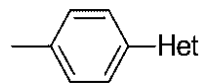
であり；

Ar は、

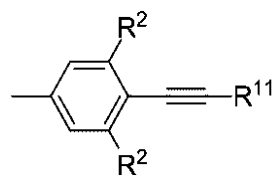
【化 2 2 2 0】



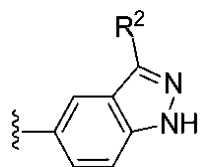
【化 2 2 2 1】



【化 2 2 2 2】

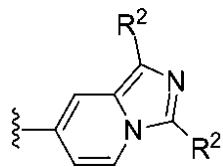


【化 2 2 2 3】



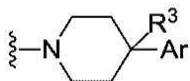
または

【化 2 2 2 4】



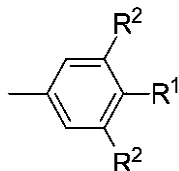
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 2 2 5】



であるとき、Ar は

【化 2 2 2 6】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

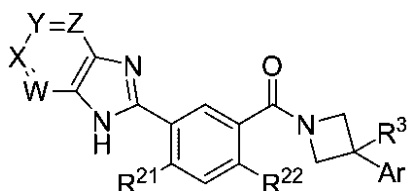
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 2 2 7】



(XIX)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - CR^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(R^{2 7})₂、- S(O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C(O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

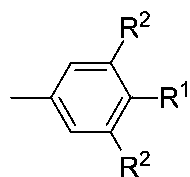
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方

とも $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3～6員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

て含み、

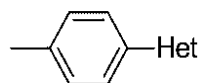
Ar は、

【化 2 2 2 8】



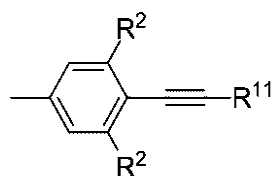
、

【化 2 2 2 9】



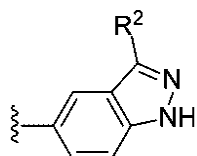
、

【化 2 2 3 0】



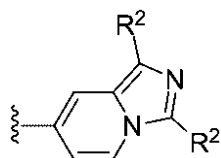
、

【化 2 2 3 1】



または

【化 2 2 3 2】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環)、-O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じ

て置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

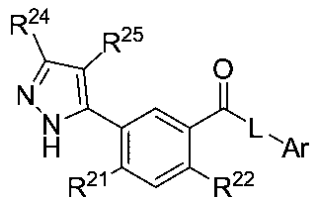
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (XX)：

【化 2 2 3 3】

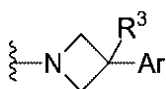


(XX)

(式中、

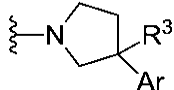
L - Ar は、

【化 2 2 3 4】



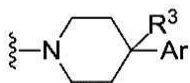
、

【化 2 2 3 5】



または

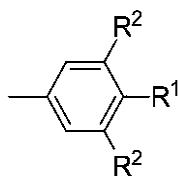
【化 2 2 3 6】



であり；

Ar は、

【化 2 2 3 7】



であり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ~ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6

員複素環であり；

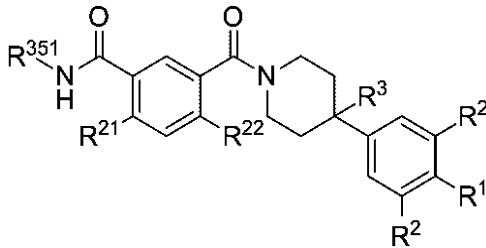
$R^{2\ 2}$ は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

$R^{2\ 4}$ は、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、または $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ であり、この場合、 $R^{2\ 4}$ は、1つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

$R^{2\ 5}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $R^{2\ 5}$ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 2 3 8】



(XI)

(式中、

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、 $-OH$ またはハロゲンであり；

$R^{2\ 1}$ は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

$R^{2\ 2}$ は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

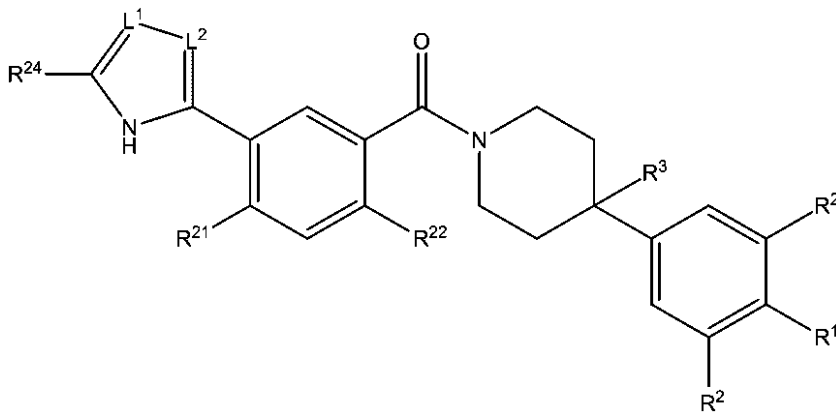
$R^{3\ 5\ 1}$ は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたは $C_2-O-(C_1 \text{ もしくは } C_2 \text{ アルキル})$ である）もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与することを含む、方法。

(項目 1 4)

非アルコール性脂肪性肝疾患 (NAFLD) を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2 2 3 9】



(IX)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、CR²³ または N であり；

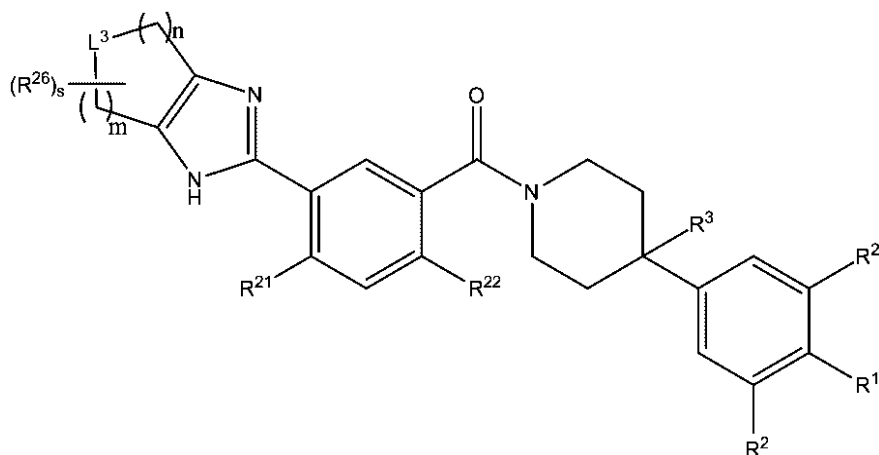
L^2 は、CH または N であり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、N であり；

R^{23} は、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式(X)：

【化 2 2 4 0】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R^{601})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_3 \sim C_5$ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃~C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R^{501})₂、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ アルキル)、または-C(O)-N(R^{501})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

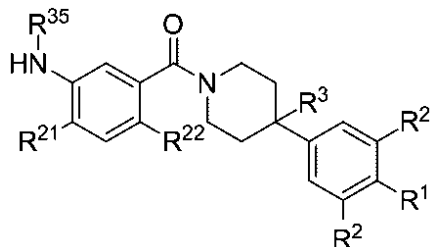
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、2 つの R^{26} 、2 つの R^{60} 、2 つの R^{50} 、2 つの R^{501} または 2 つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2 2 4 1】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン - 1 - イル、またはシクロプロピルであり；

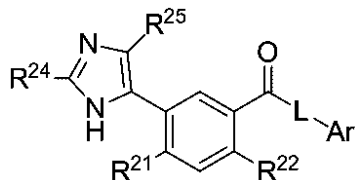
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化 2 2 4 2】

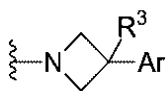


(XII)

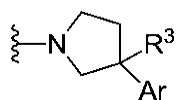
(式中、

L - Ar は、

【化 2 2 4 3】

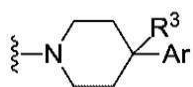


【化 2 2 4 4】



または

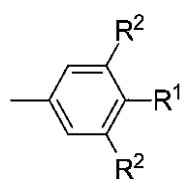
【化 2 2 4 5】



であり；

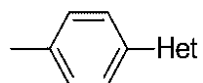
Ar は、

【化 2 2 4 6】



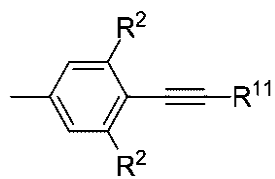
、

【化 2 2 4 7】



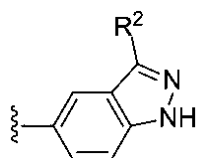
、

【化 2 2 4 8】



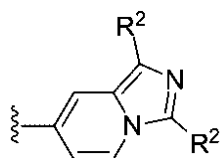
、

【化 2 2 4 9】



または

【化 2 2 5 0】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(\text{C}_3 \sim \text{C}_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

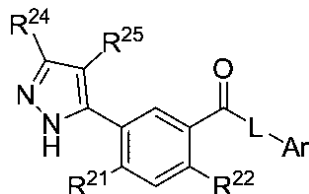
u は、0 または 1 であり；

ただし、 u が 1 であるとき、 t は 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化 2 2 5 1】

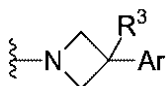


(XIII)

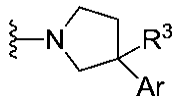
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化 2 2 5 2】

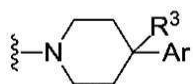


【化 2 2 5 3】



または

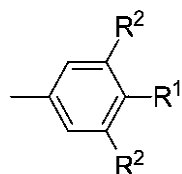
【化 2 2 5 4】



であり；

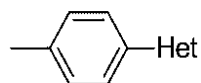
A r は、

【化 2 2 5 5】



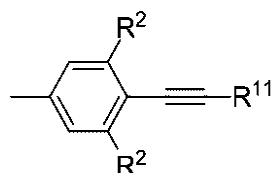
、

【化 2 2 5 6】



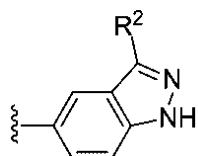
、

【化 2 2 5 7】



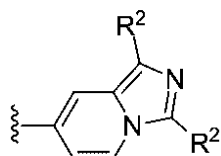
、

【化 2 2 5 8】



または

【化 2 2 5 9】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

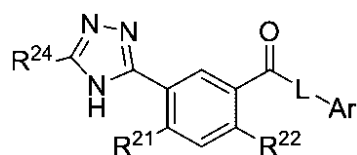
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 2 6 0】

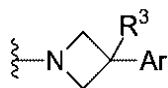


(XIV)

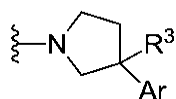
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 2 6 1】

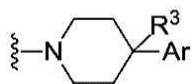


【化 2 2 6 2】



または

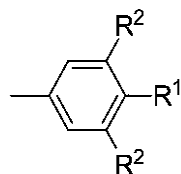
【化 2 2 6 3】



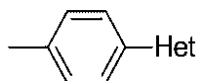
であり；

Ar は、

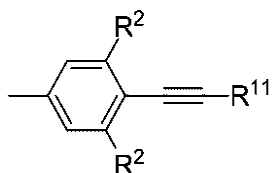
【化 2 2 6 4】



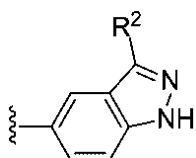
【化 2 2 6 5】



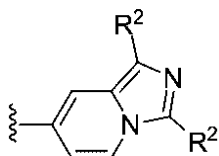
【化 2 2 6 6】



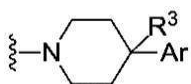
【化 2 2 6 7】



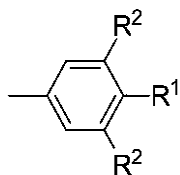
または
【化 2 2 6 8】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 2 6 9】



であるとき、A r は
【化 2 2 7 0】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

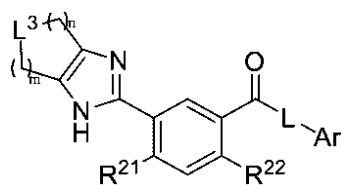
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 2 7 1】



(XV)

(式中、

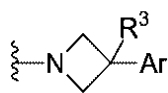
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

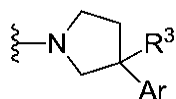
$L-Ar$ は、

【化 2 2 7 2】



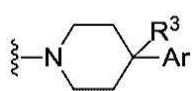
、

【化 2 2 7 3】



または

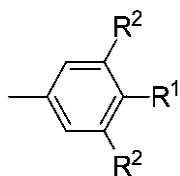
【化 2 2 7 4】



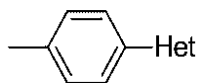
であり；

Ar は、

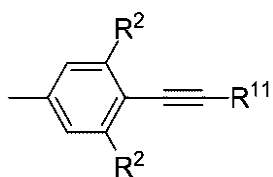
【化 2 2 7 5】



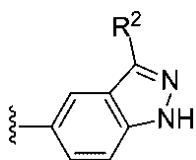
【化 2 2 7 6】



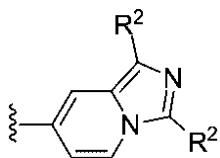
【化 2 2 7 7】



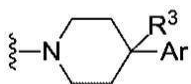
【化 2 2 7 8】



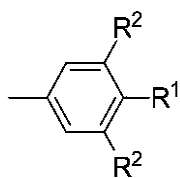
【化 2 2 7 9】



【化 2 2 8 0】



【化 2 2 8 1】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

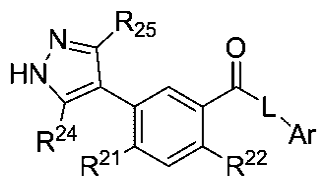
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 2 8 2】

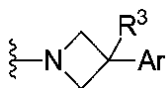


(XVI)

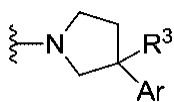
(式中、

L - Ar は、

【化 2 2 8 3】

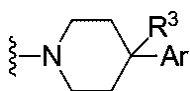


【化 2 2 8 4】



または

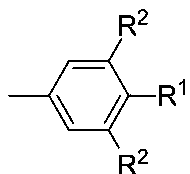
【化 2 2 8 5】



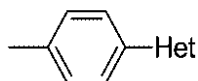
であり；

Ar は、

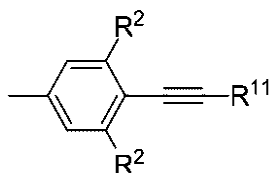
【化 2 2 8 6】



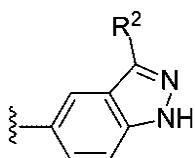
【化 2 2 8 7】



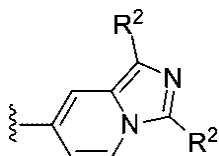
【化 2 2 8 8】



【化 2 2 8 9】



または
【化 2 2 9 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

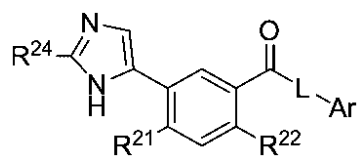
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 2 9 1】

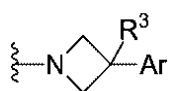


(X V I I)

(式中、

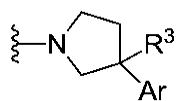
L - A r は、

【化 2 2 9 2】



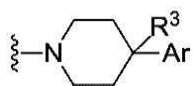
、

【化 2 2 9 3】



または

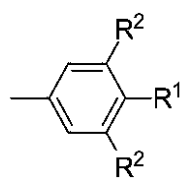
【化 2 2 9 4】



であり、

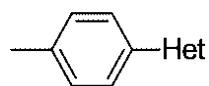
A r は、

【化 2 2 9 5】



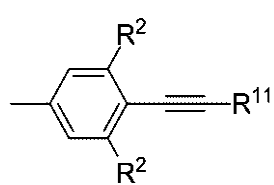
、

【化 2 2 9 6】



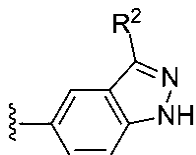
、

【化 2 2 9 7】



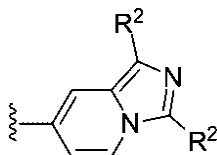
、

【化 2 2 9 8】



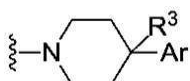
または

【化 2 2 9 9】



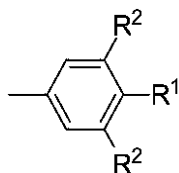
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 0 0】



であるとき、Ar は

【化 2 3 0 1】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

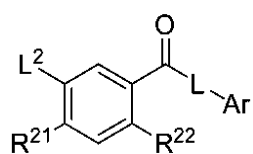
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 3 0 2】

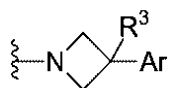


(X V I I I)

(式中、

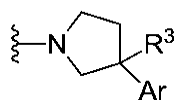
L - A r は、

【化 2 3 0 3】



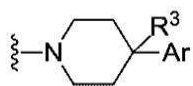
、

【化 2 3 0 4】



または

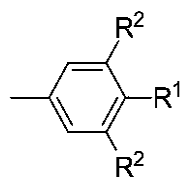
【化 2 3 0 5】



であり ;

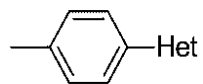
A r は、

【化 2 3 0 6】



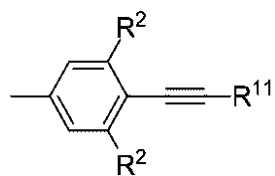
、

【化 2 3 0 7】

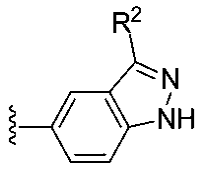


、

【化 2 3 0 8】

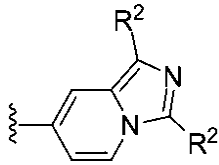


【化 2 3 0 9】



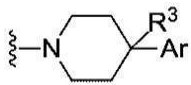
または

【化 2 3 1 0】



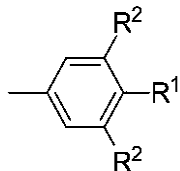
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 1 1】



であるとき、Ar は

【化 2 3 1 2】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

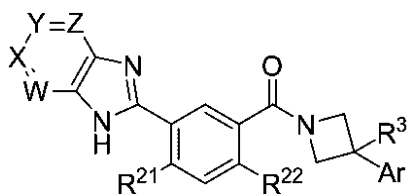
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 3 1 3】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

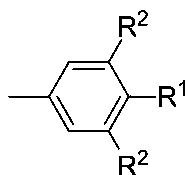
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

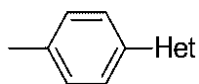
て含み、

A r は、

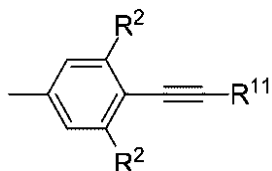
【化 2 3 1 4】



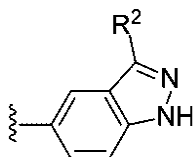
【化 2 3 1 5】



【化 2 3 1 6】

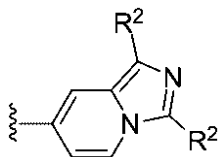


【化 2 3 1 7】



または

【化 2 3 1 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

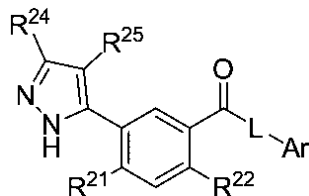
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 3 1 9】

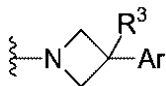


(X X)

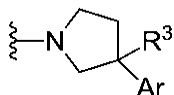
(式中、

L - A r は、

【化 2 3 2 0】

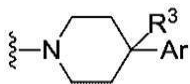


【化 2 3 2 1】



または

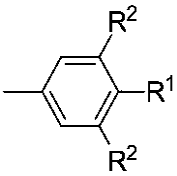
【化 2 3 2 2】



であり；

Ar は、

【化 2 3 2 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

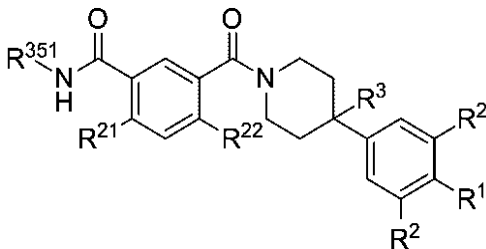
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 3 2 4】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

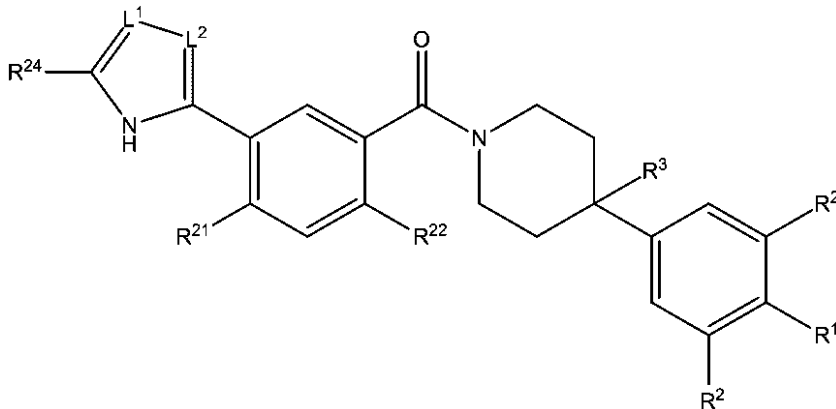
ことを含む、方法。

(項目 15)

メタボリックシンドロームを処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2325】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

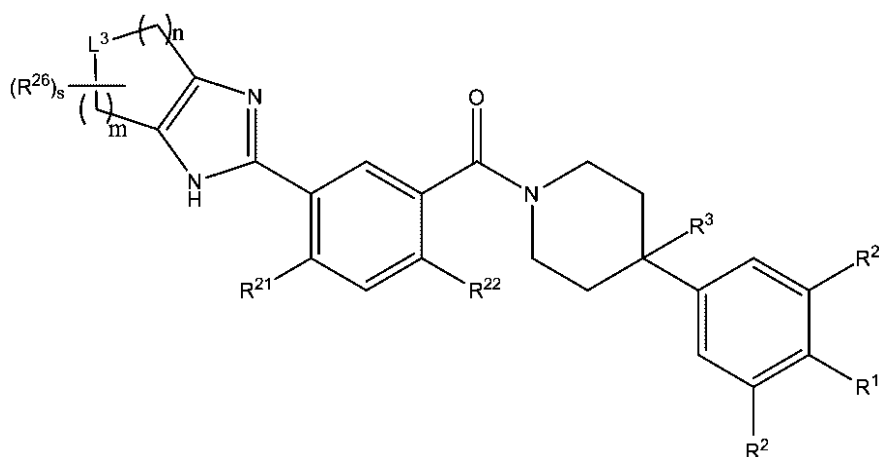
L² は、CH またはNであり；

L¹ または L² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 3 2 6】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

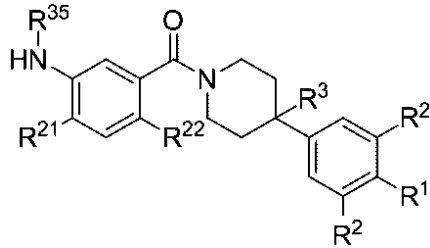
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2327】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

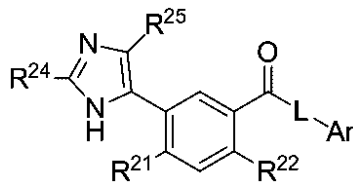
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2328】

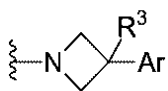


(XII)

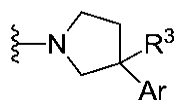
(式中、

L-Ar は、

【化2329】

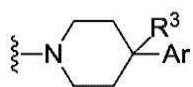


【化 2 3 3 0】



または

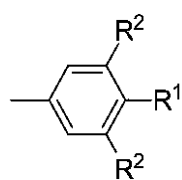
【化 2 3 3 1】



であり；

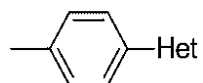
Ar は、

【化 2 3 3 2】



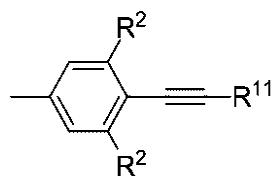
、

【化 2 3 3 3】



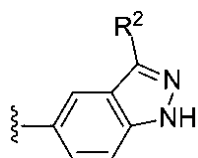
、

【化 2 3 3 4】



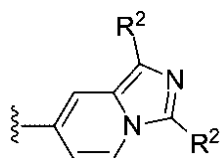
、

【化 2 3 3 5】



または

【化 2 3 3 6】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

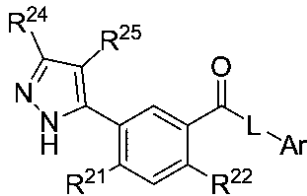
u は、0または1であり；

ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化2337】

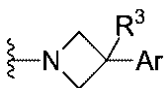


(XIII)

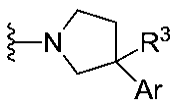
(式中、

L-Ar は、

【化2338】

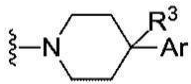


【化2339】



または

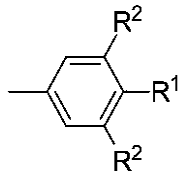
【化 2 3 4 0】



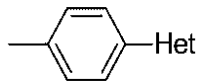
であり；

Ar は、

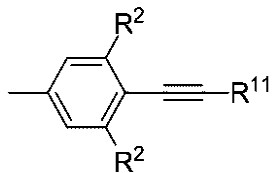
【化 2 3 4 1】



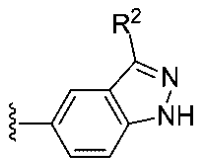
【化 2 3 4 2】



【化 2 3 4 3】

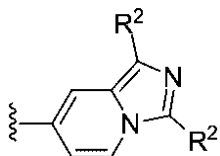


【化 2 3 4 4】



または

【化 2 3 4 5】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

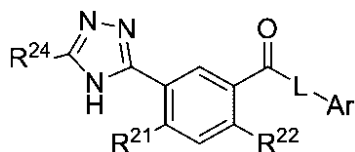
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 3 4 6】

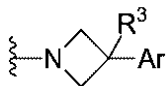


(XIV)

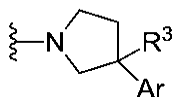
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 3 4 7】

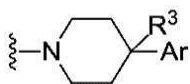


【化 2 3 4 8】



または

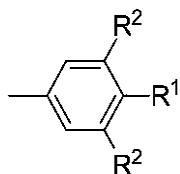
【化 2 3 4 9】



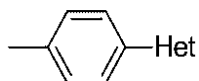
であり；

Ar は、

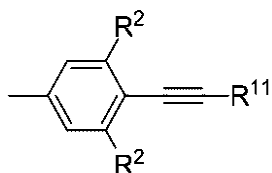
【化 2 3 5 0】



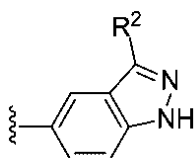
【化 2 3 5 1】



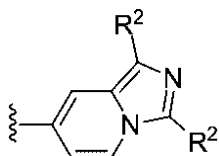
【化 2 3 5 2】



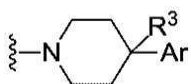
【化 2 3 5 3】



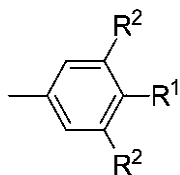
または
【化 2 3 5 4】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 3 5 5】



であるとき、A r は
【化 2 3 5 6】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

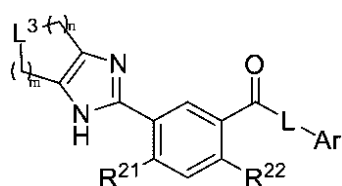
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 3 5 7】



(XV)

(式中、

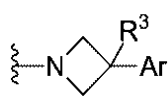
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \geq 3$ であり；

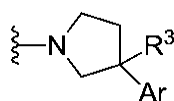
$L-Ar$ は、

【化 2 3 5 8】



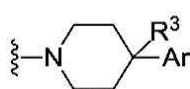
、

【化 2 3 5 9】



または

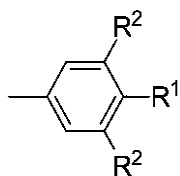
【化 2 3 6 0】



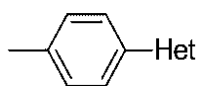
であり；

Ar は、

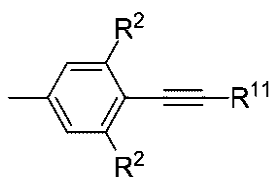
【化 2 3 6 1】



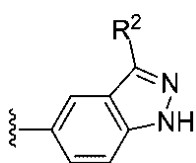
【化 2 3 6 2】



【化 2 3 6 3】

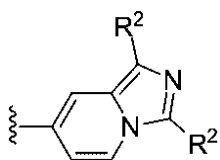


【化 2 3 6 4】



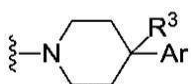
 または

【化 2 3 6 5】



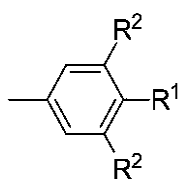
 であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 6 6】



 であるとき、Ar は

【化 2 3 6 7】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

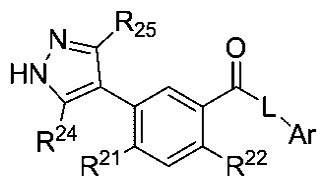
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 3 6 8】

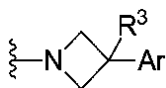


(XVI)

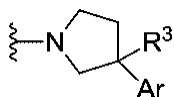
(式中、

L - Ar は、

【化 2 3 6 9】

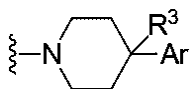


【化 2 3 7 0】



または

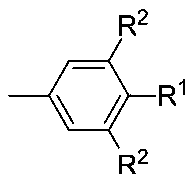
【化 2 3 7 1】



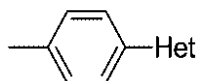
であり；

Ar は、

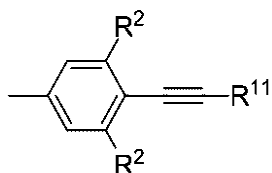
【化 2 3 7 2】



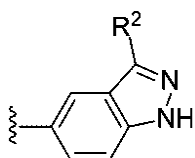
【化 2 3 7 3】



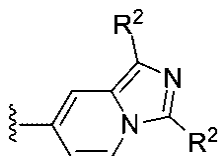
【化 2 3 7 4】



【化 2 3 7 5】



または
【化 2 3 7 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

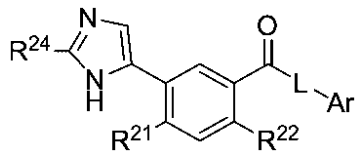
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 3 7 7】

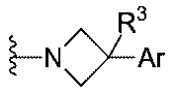


(X V I I)

(式中、

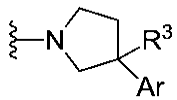
L - A r は、

【化 2 3 7 8】



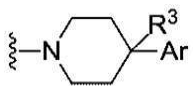
、

【化 2 3 7 9】



または

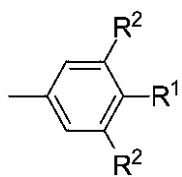
【化 2 3 8 0】



であり；

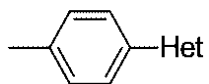
A r は、

【化 2 3 8 1】



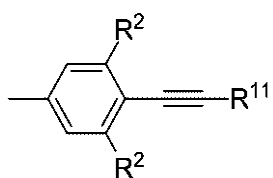
、

【化 2 3 8 2】



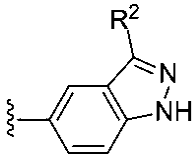
、

【化 2 3 8 3】



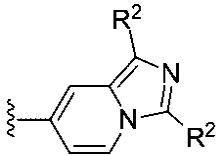
、

【化 2 3 8 4】



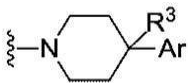
または

【化 2 3 8 5】



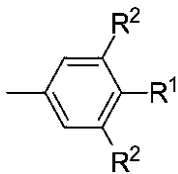
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 8 6】



であるとき、Ar は

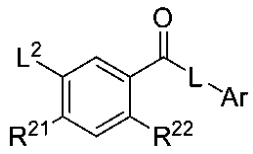
【化 2 3 8 7】



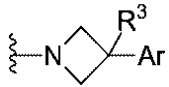
ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、t は、0 または 1 であり；u は、0 または 1 であり；ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

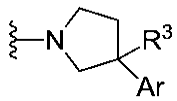
(j) 式 (X V I I I) :
【化 2 3 8 8】



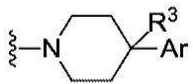
(X V I I I)
(式中、
L - A r は、
【化 2 3 8 9】



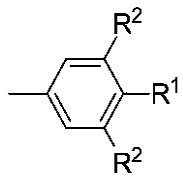
、
【化 2 3 9 0】



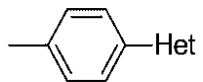
または
【化 2 3 9 1】



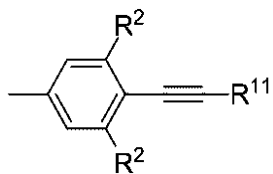
であり ;
A r は、
【化 2 3 9 2】



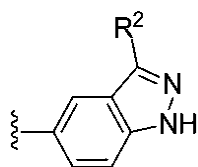
、
【化 2 3 9 3】



、
【化 2 3 9 4】

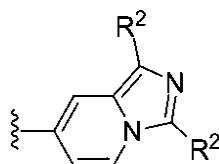


【化 2 3 9 5】



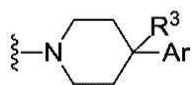
または

【化 2 3 9 6】



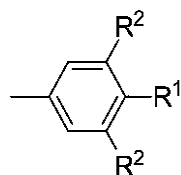
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 3 9 7】



であるとき、Ar は

【化 2 3 9 8】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

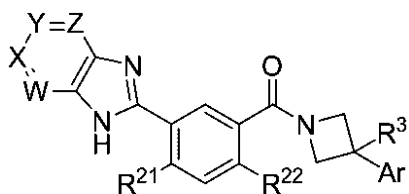
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 3 9 9】



(X I X)

(式中、

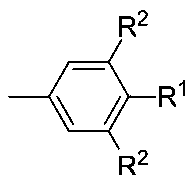
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

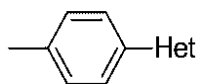
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じて含み、

Ar は、

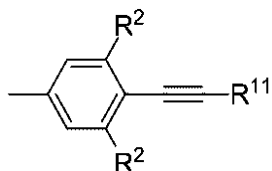
【化 2 4 0 0】



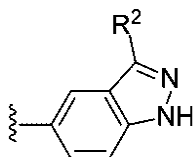
、
【化 2 4 0 1】



、
【化 2 4 0 2】

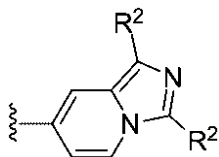


、
【化 2 4 0 3】



または

【化 2 4 0 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

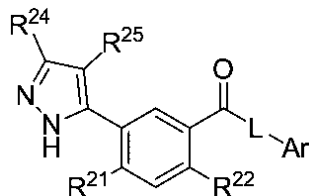
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 4 0 5】

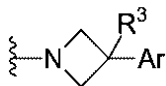


(X X)

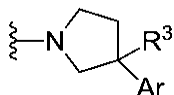
(式中、

L - A r は、

【化 2 4 0 6】

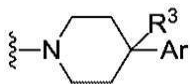


【化 2 4 0 7】



または

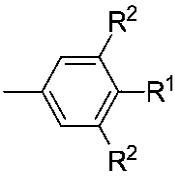
【化 2 4 0 8】



であり；

Ar は、

【化 2 4 0 9】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

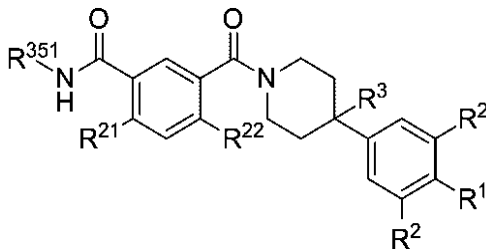
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 4 1 0】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

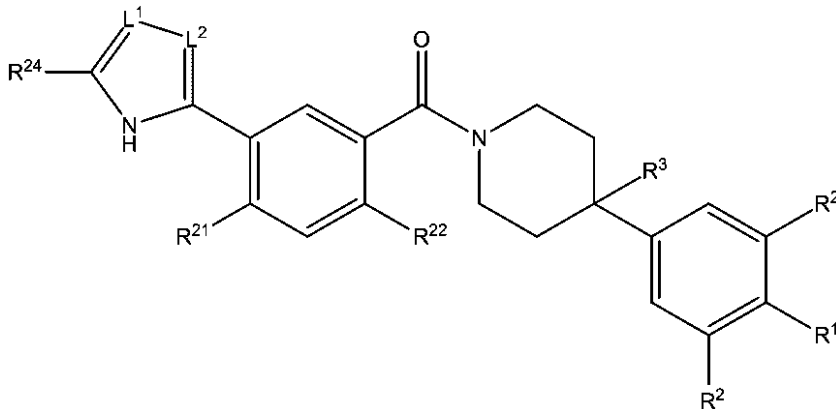
ことを含む、方法。

(項目 16)

肝硬変を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2 4 1 1】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

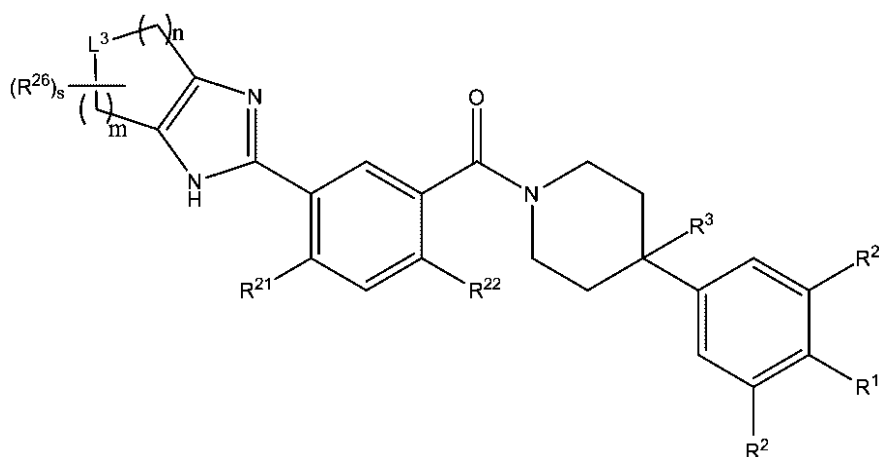
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 4 1 2】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

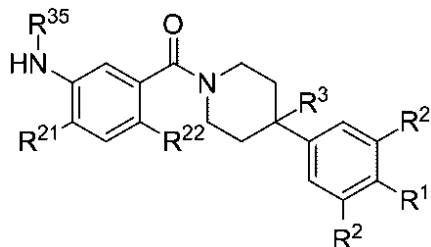
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2413】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

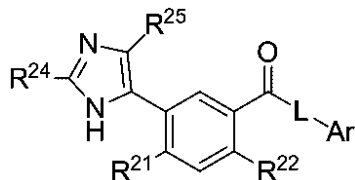
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2414】

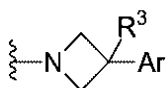


(XII)

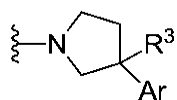
(式中、

L-Ar は、

【化2415】

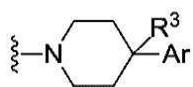


【化 2 4 1 6】



または

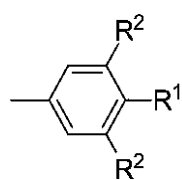
【化 2 4 1 7】



であり；

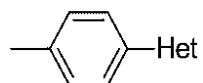
Ar は、

【化 2 4 1 8】



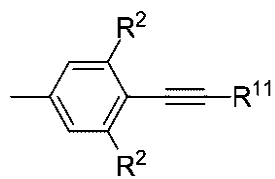
、

【化 2 4 1 9】



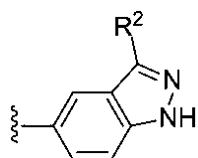
、

【化 2 4 2 0】



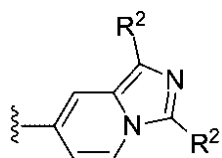
、

【化 2 4 2 1】



または

【化 2 4 2 2】



であり；

$H e t$ は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(C_3 \sim C_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0または1であり；

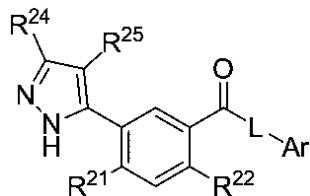
u は、0または1であり；

ただし、 u が1であるとき、 t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化2423】

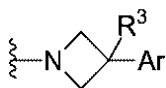


(XIII)

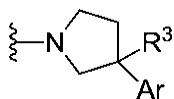
(式中、

$L-Ar$ は、

【化2424】

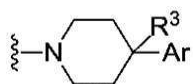


【化2425】



または

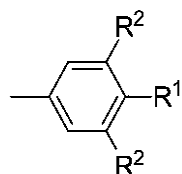
【化 2 4 2 6】



であり；

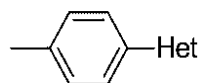
A r は、

【化 2 4 2 7】



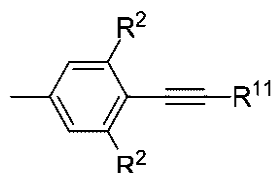
、

【化 2 4 2 8】



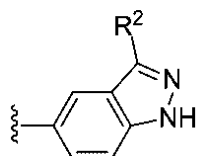
、

【化 2 4 2 9】



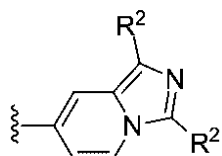
、

【化 2 4 3 0】



または

【化 2 4 3 1】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

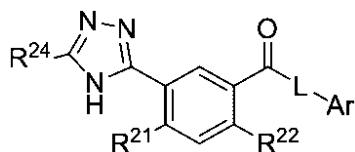
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 4 3 2】

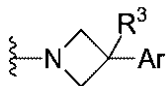


(XIV)

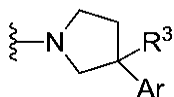
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 4 3 3】

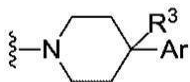


【化 2 4 3 4】



または

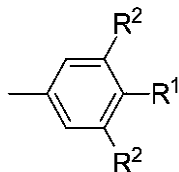
【化 2 4 3 5】



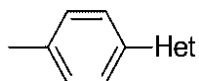
であり；

Ar は、

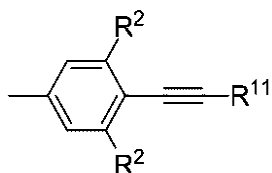
【化 2 4 3 6】



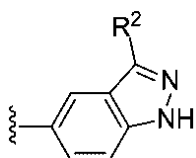
【化 2 4 3 7】



【化 2 4 3 8】



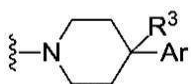
【化 2 4 3 9】



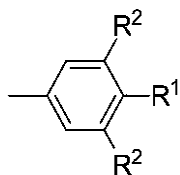
または
【化 2 4 4 0】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 4 4 1】



であるとき、A r は
【化 2 4 4 2】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

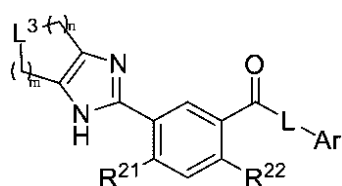
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2443】



(XV)

(式中、

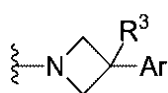
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

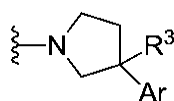
$L-Ar$ は、

【化2444】



、

【化2445】



または

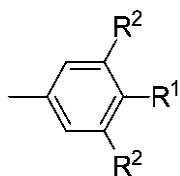
【化2446】



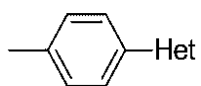
であり；

Ar は、

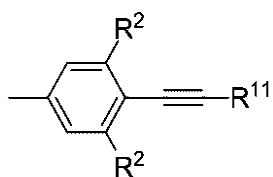
【化 2 4 4 7】



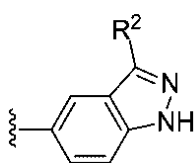
【化 2 4 4 8】



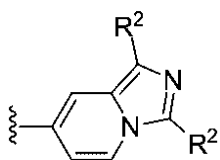
【化 2 4 4 9】



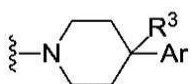
【化 2 4 5 0】



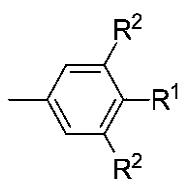
【化 2 4 5 1】



【化 2 4 5 2】



【化 2 4 5 3】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環) または -O-(C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

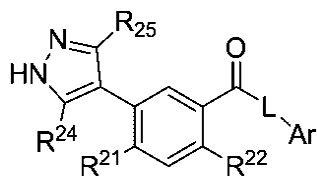
R¹¹ は、H または -CH₃ であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI) :

【化 2 4 5 4】

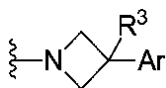


(XVI)

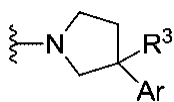
(式中、

L - Ar は、

【化 2 4 5 5】

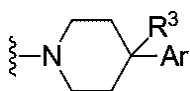


【化 2 4 5 6】



または

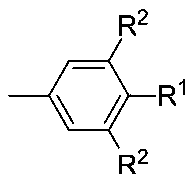
【化 2 4 5 7】



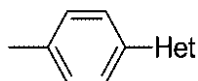
であり；

Ar は、

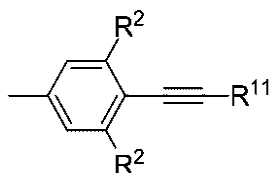
【化 2 4 5 8】



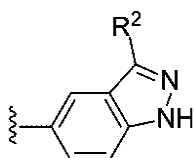
【化 2 4 5 9】



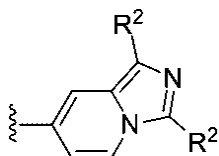
【化 2 4 6 0】



【化 2 4 6 1】



または
【化 2 4 6 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

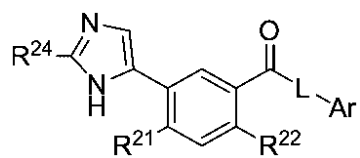
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 4 6 3】

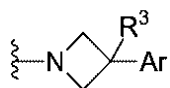


(X V I I)

(式中、

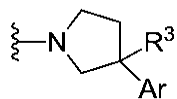
L - A r は、

【化 2 4 6 4】



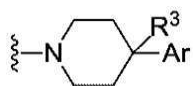
、

【化 2 4 6 5】



または

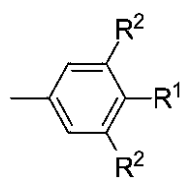
【化 2 4 6 6】



であり、

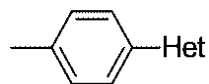
A r は、

【化 2 4 6 7】



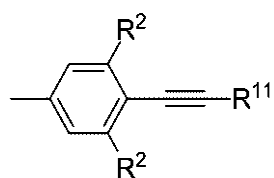
、

【化 2 4 6 8】



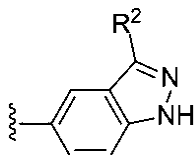
、

【化 2 4 6 9】



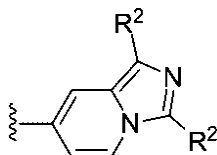
、

【化 2 4 7 0】



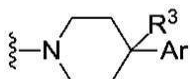
または

【化 2 4 7 1】



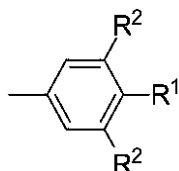
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 4 7 2】



であるとき、Ar は

【化 2 4 7 3】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

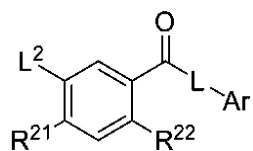
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 4 7 4】

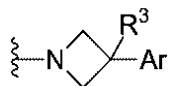


(X V I I I)

(式中、

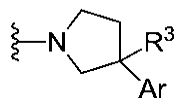
$L - Ar$ は、

【化 2 4 7 5】



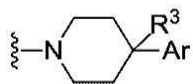
、

【化 2 4 7 6】



または

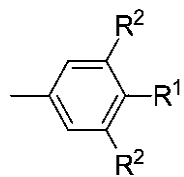
【化 2 4 7 7】



であり ;

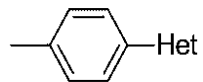
Ar は、

【化 2 4 7 8】



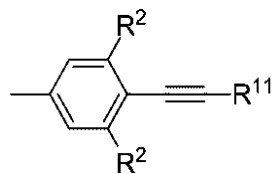
、

【化 2 4 7 9】

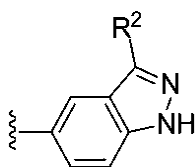


、

【化 2 4 8 0】

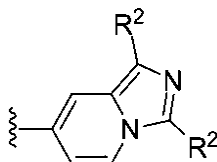


【化 2 4 8 1】



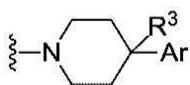
または

【化 2 4 8 2】



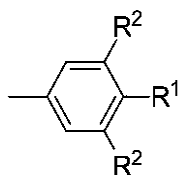
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 4 8 3】



であるとき、Ar は

【化 2 4 8 4】



ではなく；

L^{21} は、 $-NHR^{351}$ または $-C(O)NHR^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

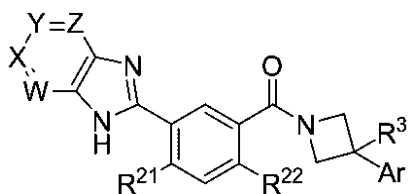
R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$ または $S(O)_2R^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 4 8 5】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

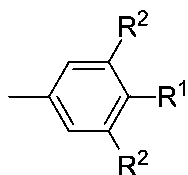
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

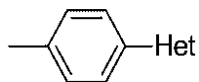
て含み、

A r は、

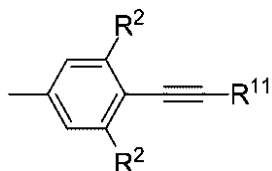
【化 2 4 8 6】



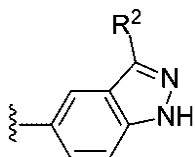
、
【化 2 4 8 7】



、
【化 2 4 8 8】

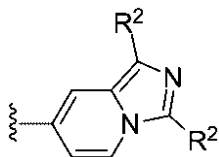


、
【化 2 4 8 9】



または

【化 2 4 9 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じ

て置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

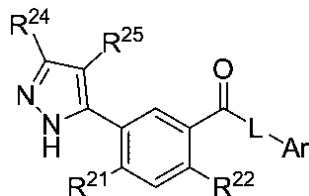
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 4 9 1】

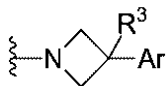


(X X)

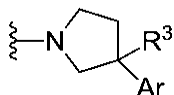
(式中、

L - A r は、

【化 2 4 9 2】

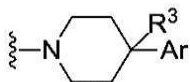


【化 2 4 9 3】



または

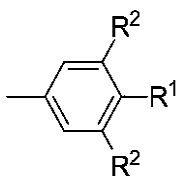
【化 2 4 9 4】



であり；

Ar は、

【化 2 4 9 5】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

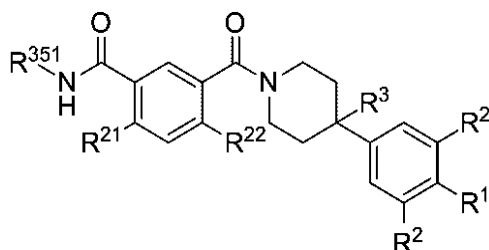
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 4 9 6】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

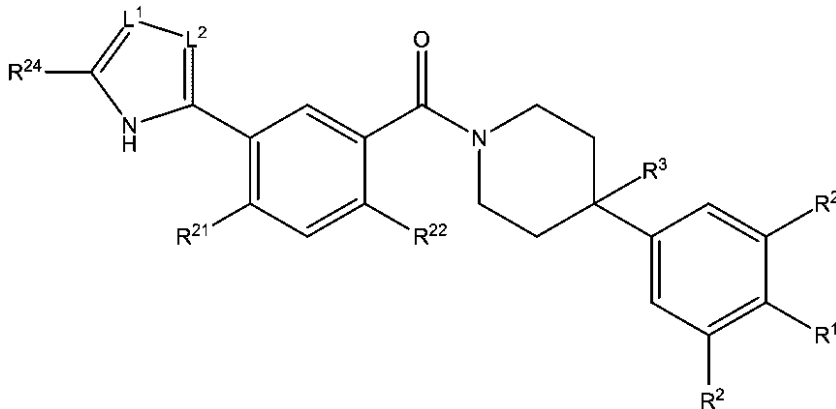
ことを含む、方法。

(項目 17)

肝線維症を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2 4 9 7】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でも ハロゲン でも ない とき、R¹ は、1 つ 以上 の ハロゲン で 必要 に 応 じて 置 換 さ れ て お り ；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH または ハロゲン であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

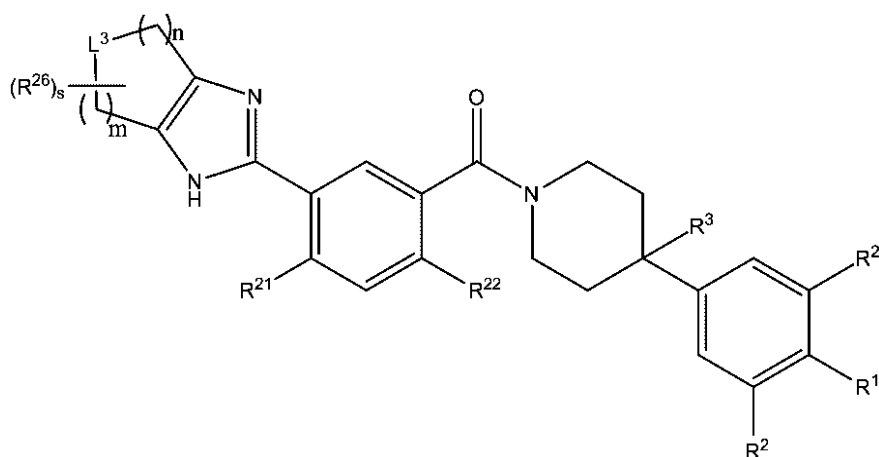
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 4 9 8】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

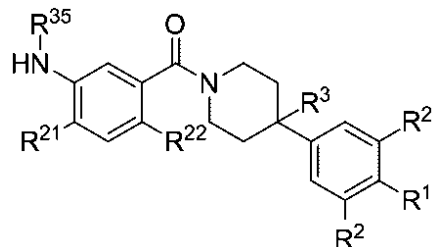
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2499】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

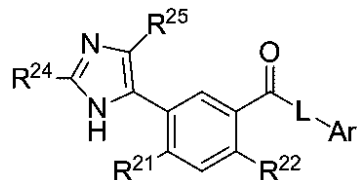
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2500】

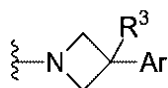


(XII)

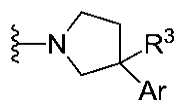
(式中、

L-Ar は、

【化2501】

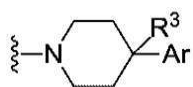


【化 2 5 0 2】



または

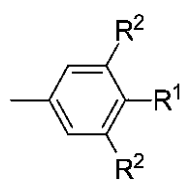
【化 2 5 0 3】



であり；

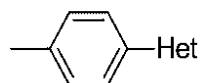
Ar は、

【化 2 5 0 4】



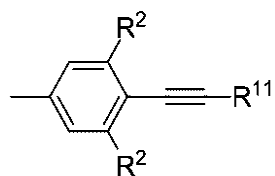
、

【化 2 5 0 5】



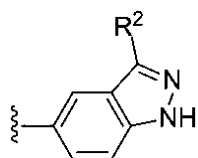
、

【化 2 5 0 6】



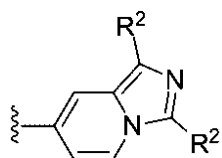
、

【化 2 5 0 7】



または

【化 2 5 0 8】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(\text{C}_3 \sim \text{C}_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

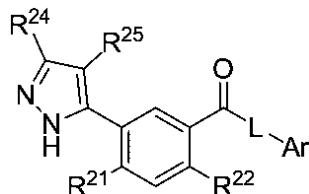
u は、0 または 1 であり；

ただし、 u が 1 であるとき、 t は 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化2509】

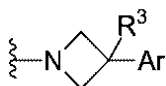


(XIII)

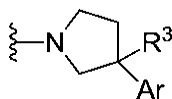
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化2510】

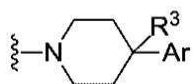


【化2511】



または

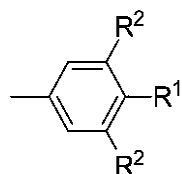
【化 2 5 1 2】



であり；

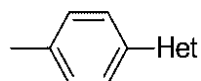
A r は、

【化 2 5 1 3】



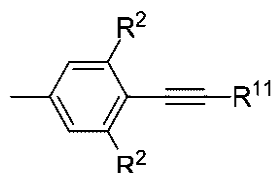
、

【化 2 5 1 4】



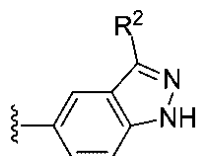
、

【化 2 5 1 5】



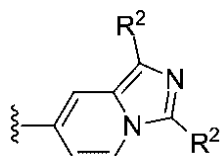
、

【化 2 5 1 6】



または

【化 2 5 1 7】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

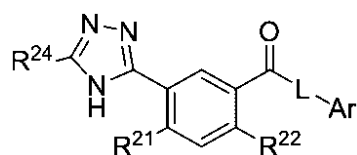
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 5 1 8】

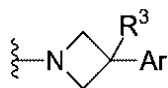


(XIV)

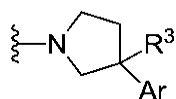
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 5 1 9】

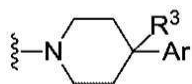


【化 2 5 2 0】



または

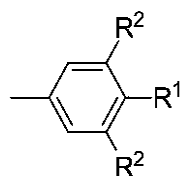
【化 2 5 2 1】



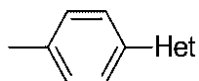
であり；

Ar は、

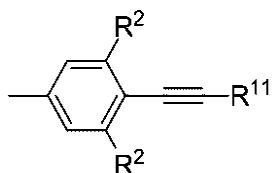
【化 2 5 2 2】



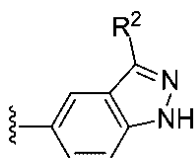
【化 2 5 2 3】



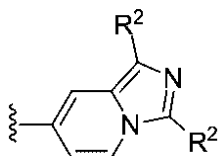
【化 2 5 2 4】



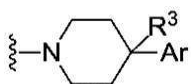
【化 2 5 2 5】



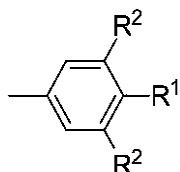
または
【化 2 5 2 6】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 5 2 7】



であるとき、A r は
【化 2 5 2 8】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

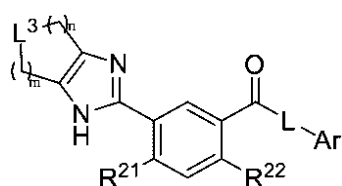
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化2529】



(XV)

(式中、

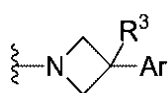
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

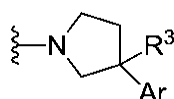
$L-Ar$ は、

【化2530】



、

【化2531】



または

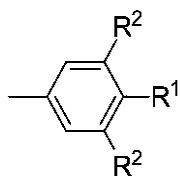
【化2532】



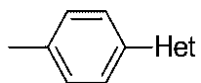
であり；

Ar は、

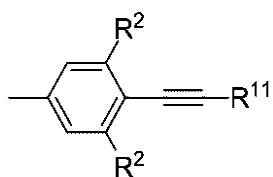
【化 2 5 3 3】



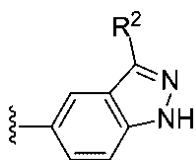
【化 2 5 3 4】



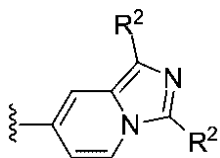
【化 2 5 3 5】



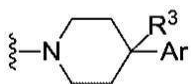
【化 2 5 3 6】



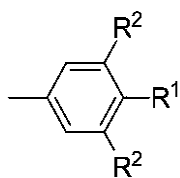
【化 2 5 3 7】



【化 2 5 3 8】



【化 2 5 3 9】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

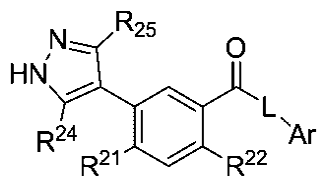
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化2540】

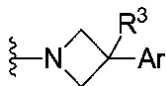


(XVI)

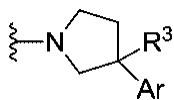
(式中、

L - Ar は、

【化2541】

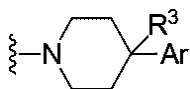


【化2542】



または

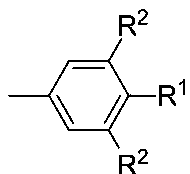
【化2543】



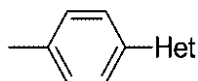
であり；

Ar は、

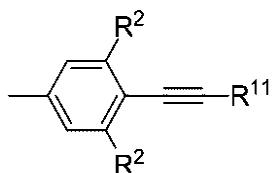
【化2544】



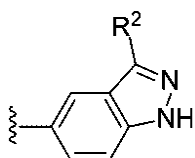
【化 2 5 4 5】



【化 2 5 4 6】

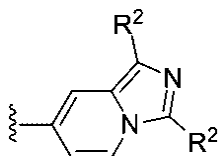


【化 2 5 4 7】



または

【化 2 5 4 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

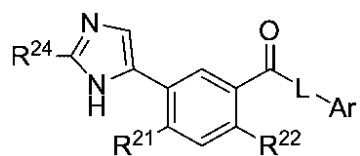
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 5 4 9】

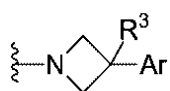


(X V I I)

(式中、

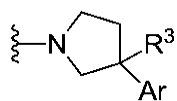
L - A r は、

【化 2 5 5 0】



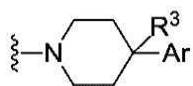
、

【化 2 5 5 1】



または

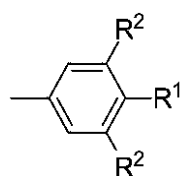
【化 2 5 5 2】



であり、

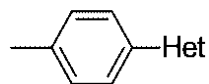
A r は、

【化 2 5 5 3】



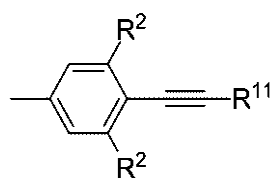
、

【化 2 5 5 4】



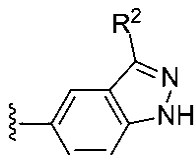
、

【化 2 5 5 5】



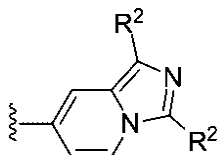
、

【化 2 5 5 6】



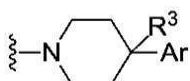
または

【化 2 5 5 7】



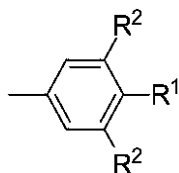
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 5 5 8】



であるとき、Ar は

【化 2 5 5 9】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；R³は、HまたはFであり；R^{1 1}は、Hまたは-CH₃であり；

R^{2 1}は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{2 2}は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R^{2 4}は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R^{2 4 1})₂、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

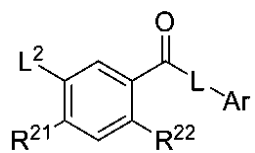
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R^{2 4 1}は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 5 6 0】

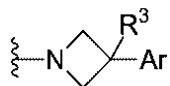


(X V I I I)

(式中、

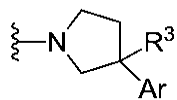
L - A r は、

【化 2 5 6 1】



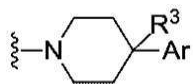
、

【化 2 5 6 2】



または

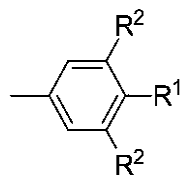
【化 2 5 6 3】



であり ;

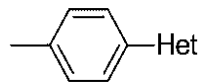
A r は、

【化 2 5 6 4】



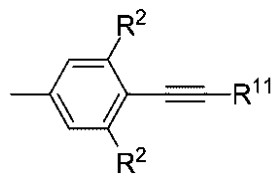
、

【化 2 5 6 5】

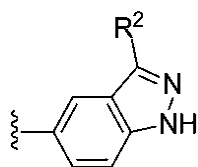


、

【化 2 5 6 6】

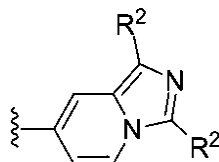


【化 2 5 6 7】



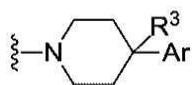
または

【化 2 5 6 8】



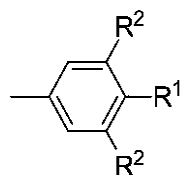
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 5 6 9】



であるとき、Ar は

【化 2 5 7 0】



ではなく；

L² は、-NHR^{3 5 1} または -C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環)、-O-(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

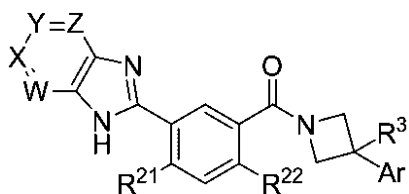
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、-C(O)R^{3 5 1}、-C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 5 7 1】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

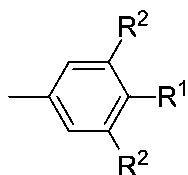
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

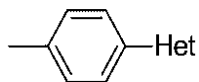
て含み、

A r は、

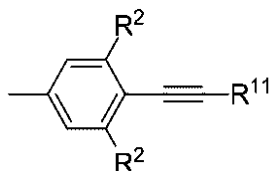
【化 2 5 7 2】



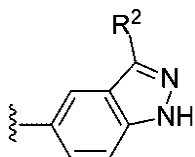
【化 2 5 7 3】



【化 2 5 7 4】

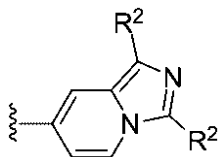


【化 2 5 7 5】



または

【化 2 5 7 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じ

て置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

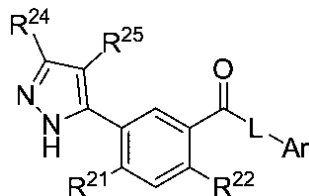
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 5 7 7】

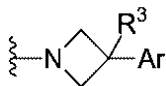


(X X)

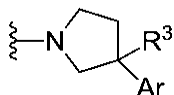
(式中、

L - A r は、

【化 2 5 7 8】

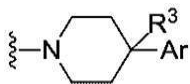


【化 2 5 7 9】



または

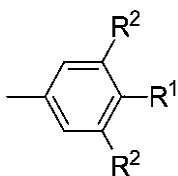
【化 2 5 8 0】



であり；

Ar は、

【化 2 5 8 1】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

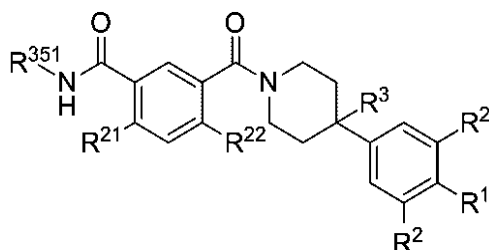
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 5 8 2】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

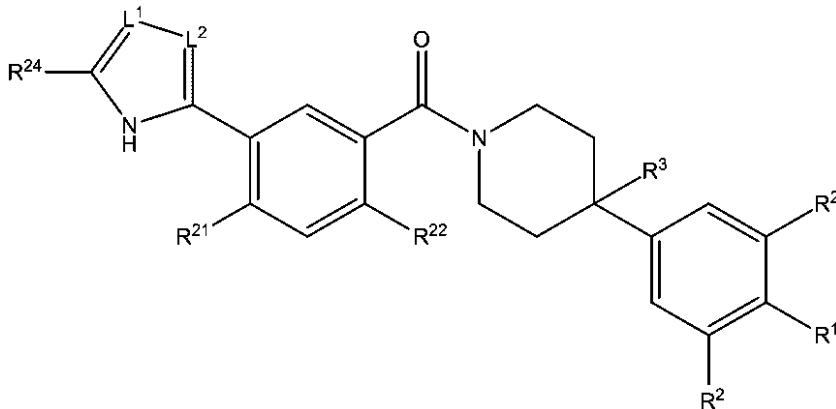
ことを含む、方法。

(項目 18)

肝臓癌を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2583】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

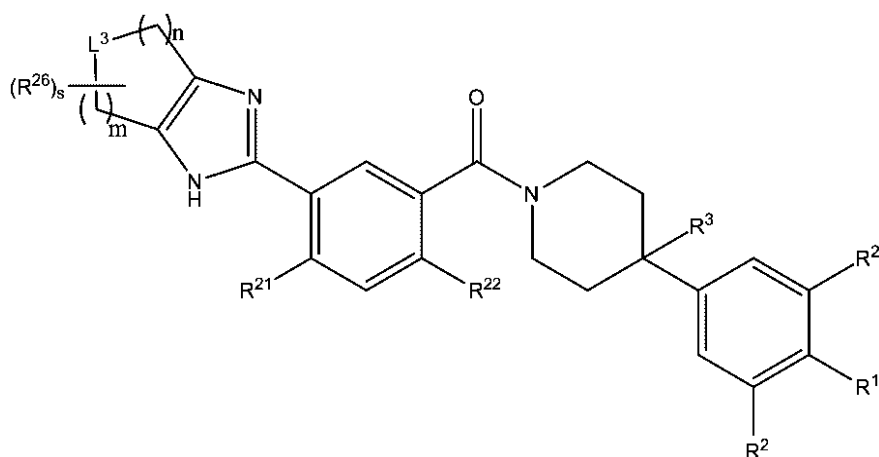
L² は、CHまたはNであり；

L¹ またはL² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 5 8 4】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、O または NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

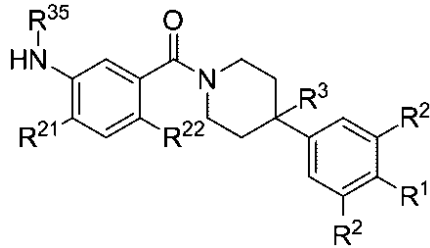
s は、0、1 または 2 であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2585】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

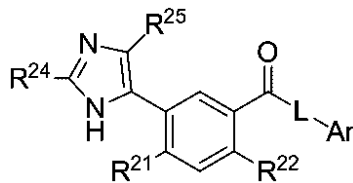
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII) :

【化2586】

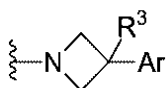


(XII)

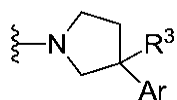
(式中、

L-Ar は、

【化2587】

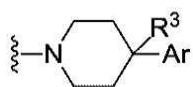


【化 2 5 8 8】



または

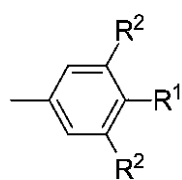
【化 2 5 8 9】



であり；

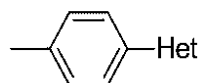
Ar は、

【化 2 5 9 0】



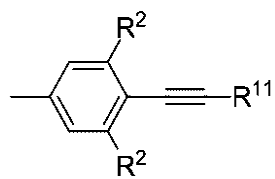
、

【化 2 5 9 1】



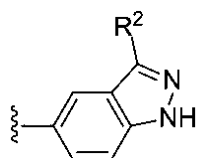
、

【化 2 5 9 2】



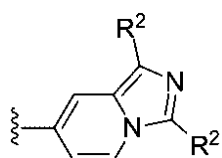
、

【化 2 5 9 3】



または

【化 2 5 9 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

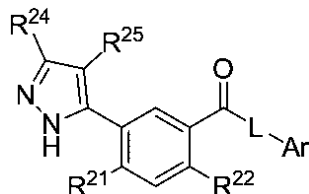
u は、0または1であり；

ただし、 u が1であるとき、 t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e)式(XIII)：

【化2595】

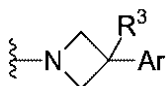


(XIII)

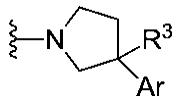
(式中、

L-Arは、

【化2596】

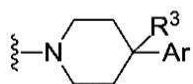


【化2597】



または

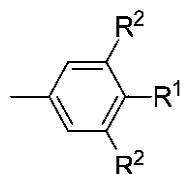
【化 2 5 9 8】



であり；

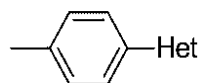
A r は、

【化 2 5 9 9】



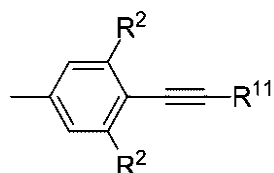
、

【化 2 6 0 0】



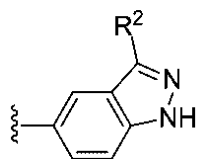
、

【化 2 6 0 1】



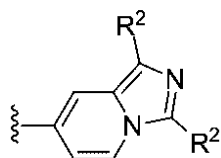
、

【化 2 6 0 2】



または

【化 2 6 0 3】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

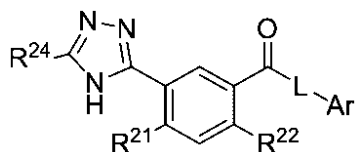
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 6 0 4】

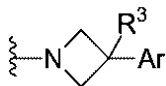


(XIV)

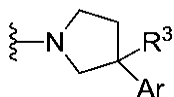
(式中、

$L-Ar$ は、

【化 2 6 0 5】

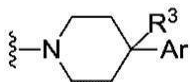


【化 2 6 0 6】



または

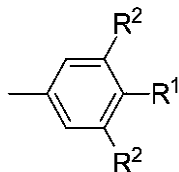
【化 2 6 0 7】



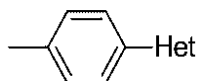
であり；

Ar は、

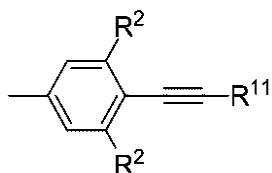
【化 2 6 0 8】



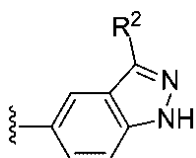
【化 2 6 0 9】



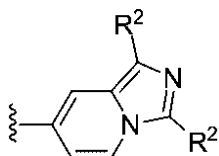
【化 2 6 1 0】



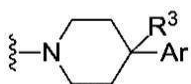
【化 2 6 1 1】



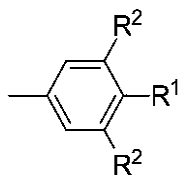
または
【化 2 6 1 2】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 6 1 3】



であるとき、A r は
【化 2 6 1 4】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

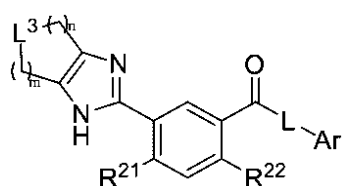
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2 6 1 5】



(XV)

(式中、

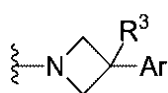
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

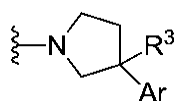
$L-Ar$ は、

【化 2 6 1 6】



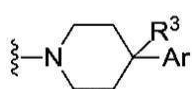
、

【化 2 6 1 7】



または

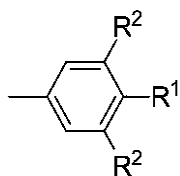
【化 2 6 1 8】



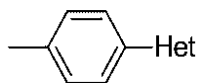
であり；

Ar は、

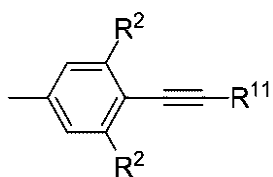
【化 2 6 1 9】



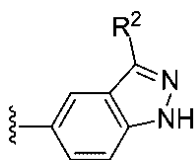
【化 2 6 2 0】



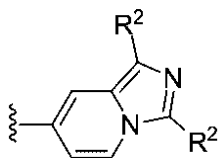
【化 2 6 2 1】



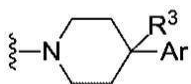
【化 2 6 2 2】



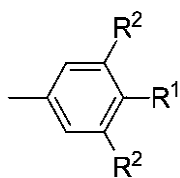
【化 2 6 2 3】



【化 2 6 2 4】



【化 2 6 2 5】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

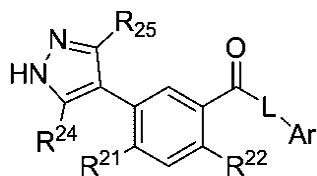
R^{11} は、H または -CH₃ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 6 2 6】

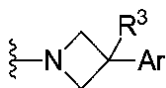


(XVI)

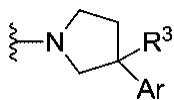
(式中、

L - Ar は、

【化 2 6 2 7】

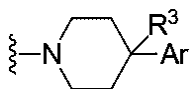


【化 2 6 2 8】



または

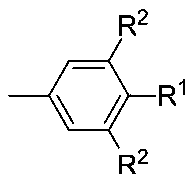
【化 2 6 2 9】



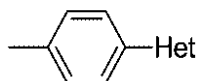
であり；

Ar は、

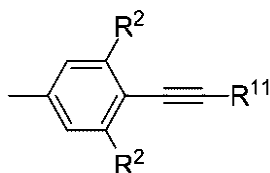
【化 2 6 3 0】



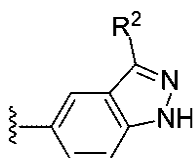
【化 2 6 3 1】



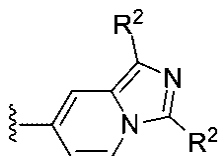
【化 2 6 3 2】



【化 2 6 3 3】



または
【化 2 6 3 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

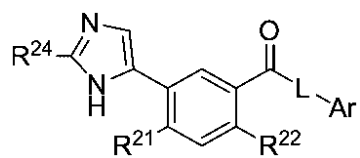
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 6 3 5】

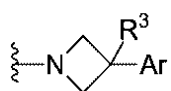


(X V I I)

(式中、

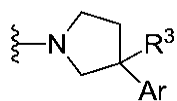
L - A r は、

【化 2 6 3 6】



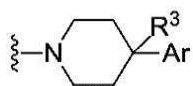
、

【化 2 6 3 7】



または

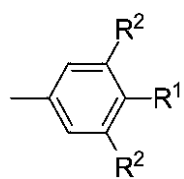
【化 2 6 3 8】



であり、

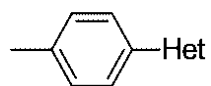
A r は、

【化 2 6 3 9】



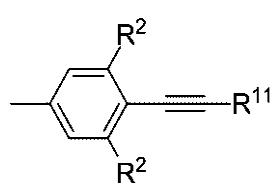
、

【化 2 6 4 0】



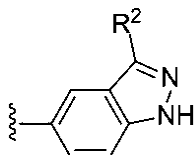
、

【化 2 6 4 1】



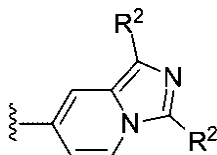
、

【化 2 6 4 2】



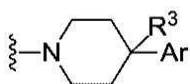
または

【化 2 6 4 3】



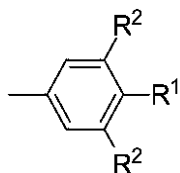
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 6 4 4】



であるとき、Ar は

【化 2 6 4 5】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

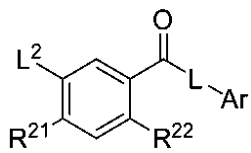
tは、0または1であり；

uは、0または1であり；

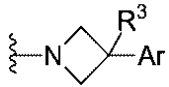
ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

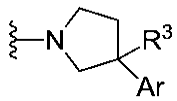
(j) 式 (X V I I I) :
【化 2 6 4 6】



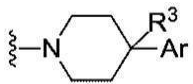
(X V I I I)
(式中、
L - A r は、
【化 2 6 4 7】



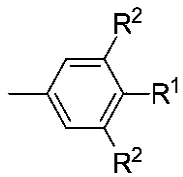
、
【化 2 6 4 8】



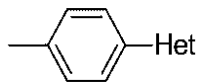
または
【化 2 6 4 9】



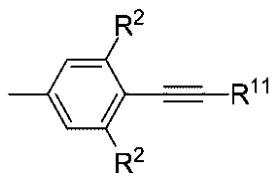
であり ;
A r は、
【化 2 6 5 0】



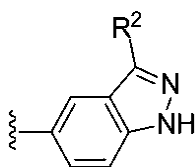
、
【化 2 6 5 1】



、
【化 2 6 5 2】

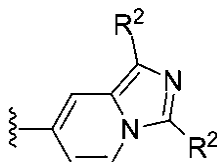


【化 2 6 5 3】



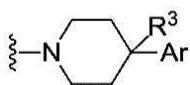
または

【化 2 6 5 4】



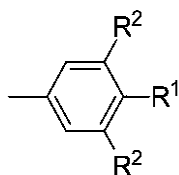
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 6 5 5】



であるとき、Ar は

【化 2 6 5 6】



ではなく；

L^{22} は、 $-NHR^{35}$ または $-C(O)NHR^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

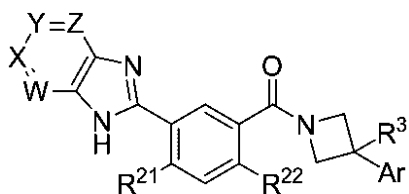
R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$ または $S(O)_2R^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 6 5 7】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

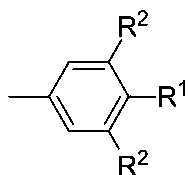
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキル であり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキル であり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

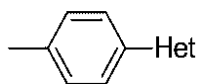
て含み、

A r は、

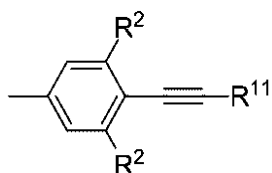
【化 2 6 5 8】



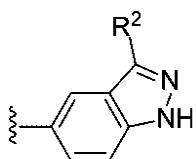
【化 2 6 5 9】



【化 2 6 6 0】

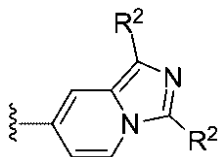


【化 2 6 6 1】



または

【化 2 6 6 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

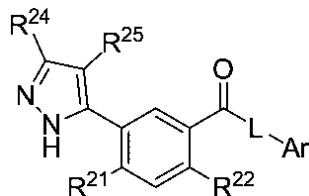
R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 6 6 3】

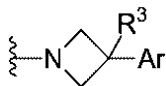


(X X)

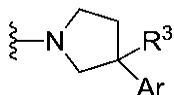
(式中、

L - A r は、

【化 2 6 6 4】

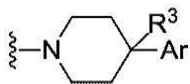


【化 2 6 6 5】



または

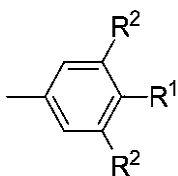
【化 2 6 6 6】



であり；

Ar は、

【化 2 6 6 7】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

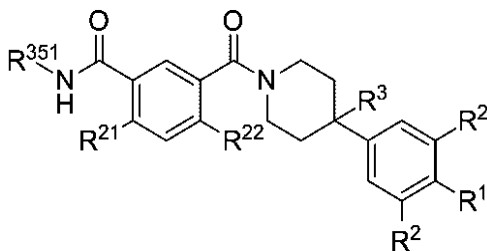
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) - O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 6 6 8】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

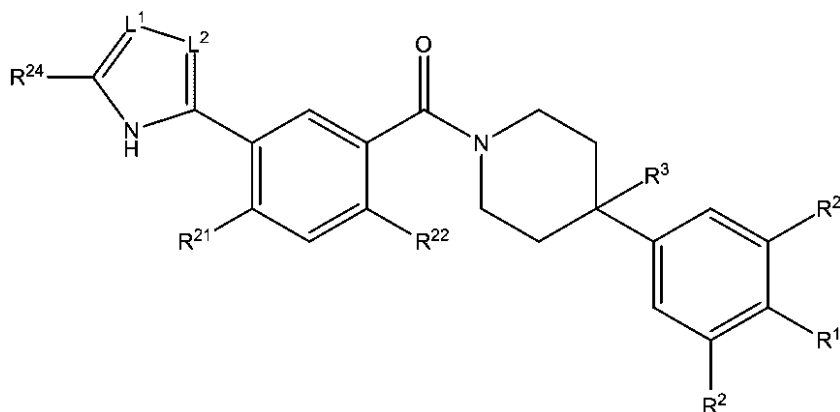
ことを含む、方法。

(項目 19)

インターロイキン 1 ベータ (IL1) レベルが上昇している疾患または状態を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2669】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

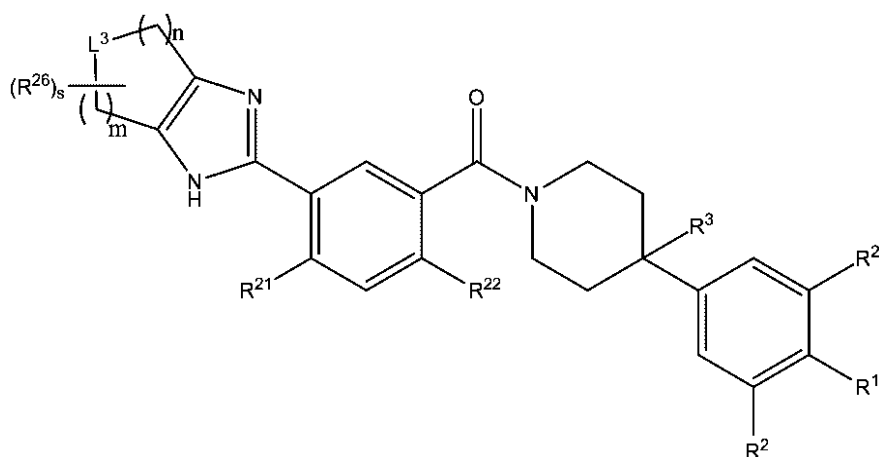
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 6 7 0】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、O または NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

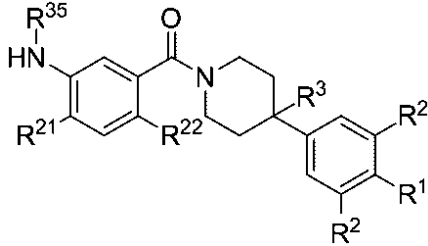
s は、0、1 または 2 であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、2 つの R^{26} 、2 つの R^{60} 、2 つの R^{50} 、2 つの R^{501} または 2 つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2671】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

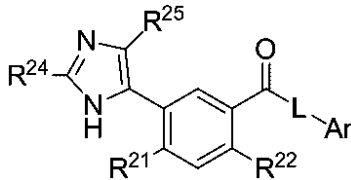
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または S(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化 2672】

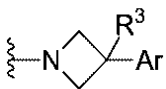


(XII)

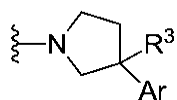
(式中、

L - Ar は、

【化 2673】

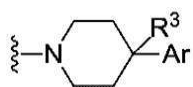


【化 2 6 7 4】



または

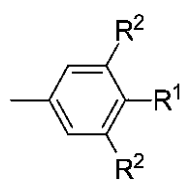
【化 2 6 7 5】



であり；

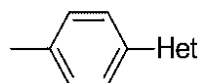
Ar は、

【化 2 6 7 6】



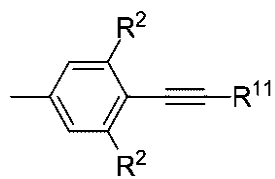
、

【化 2 6 7 7】



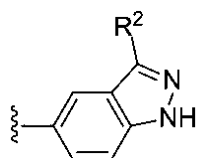
、

【化 2 6 7 8】



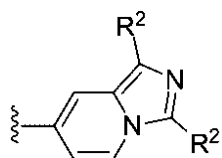
、

【化 2 6 7 9】



または

【化 2 6 8 0】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-N(R^{241})₂、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_u-(4～6員複素環)または-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-O-($C_1 \sim C_4$ アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

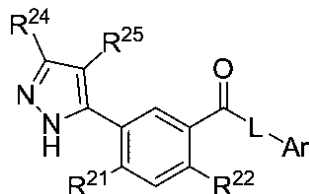
u は、0または1であり；

ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)-CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e)式(XIII)：

【化2681】

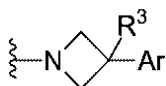


(XIII)

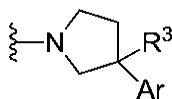
(式中、

L-Ar は、

【化2682】

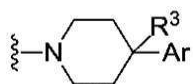


【化2683】



または

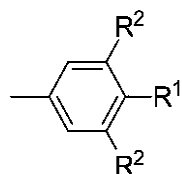
【化 2 6 8 4】



であり；

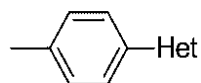
Ar は、

【化 2 6 8 5】



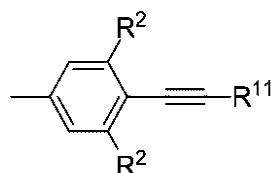
、

【化 2 6 8 6】



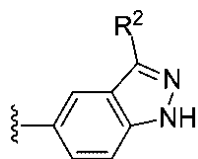
、

【化 2 6 8 7】



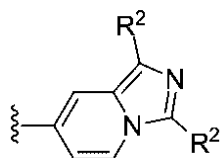
、

【化 2 6 8 8】



または

【化 2 6 8 9】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

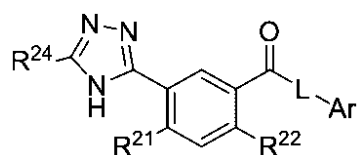
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 6 9 0】

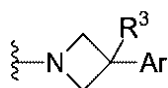


(XIV)

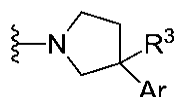
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 6 9 1】

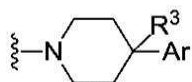


【化 2 6 9 2】



または

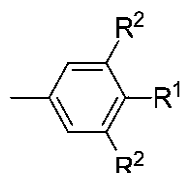
【化 2 6 9 3】



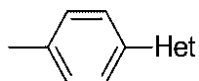
であり；

Ar は、

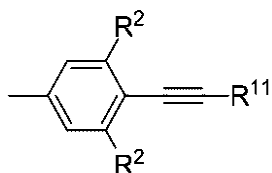
【化 2 6 9 4】



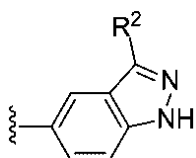
【化 2 6 9 5】



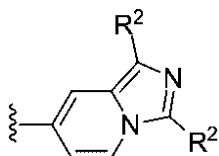
【化 2 6 9 6】



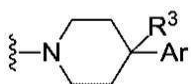
【化 2 6 9 7】



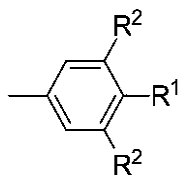
または
【化 2 6 9 8】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 6 9 9】



であるとき、A r は
【化 2 7 0 0】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

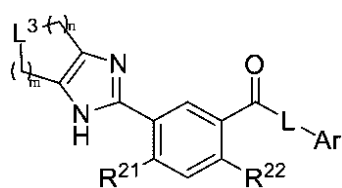
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2701】



(XV)

(式中、

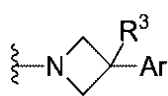
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

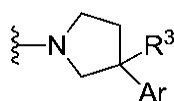
$L-Ar$ は、

【化 2702】



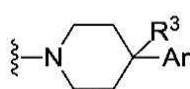
、

【化 2703】



または

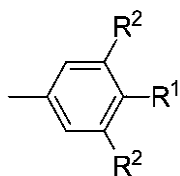
【化 2704】



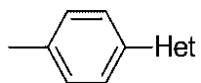
であり；

Ar は、

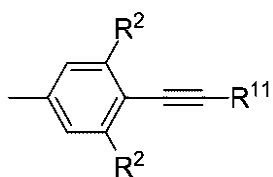
【化 2 7 0 5】



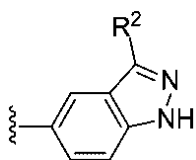
【化 2 7 0 6】



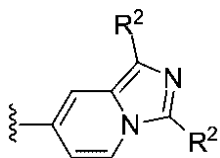
【化 2 7 0 7】



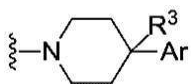
【化 2 7 0 8】



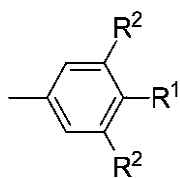
【化 2 7 0 9】



【化 2 7 1 0】



【化 2 7 1 1】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、-O-($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

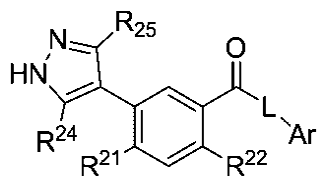
R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式(XVI)：

【化2712】

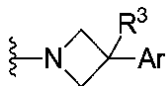


(XVI)

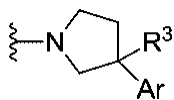
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化2713】

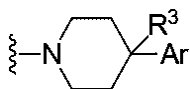


【化2714】



または

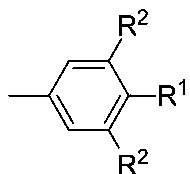
【化2715】



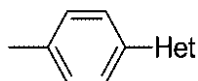
であり；

Ar は、

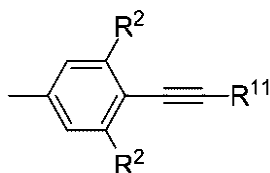
【化2716】



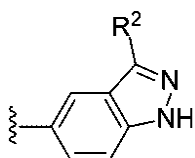
【化 2 7 1 7】



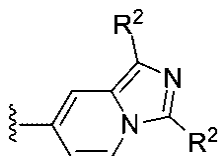
【化 2 7 1 8】



【化 2 7 1 9】



または
【化 2 7 2 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

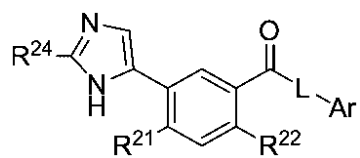
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 7 2 1】

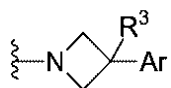


(X V I I)

(式中、

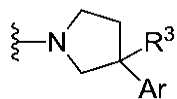
L - A r は、

【化 2 7 2 2】



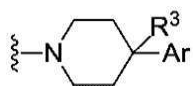
、

【化 2 7 2 3】



または

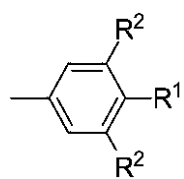
【化 2 7 2 4】



であり；

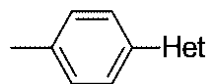
A r は、

【化 2 7 2 5】



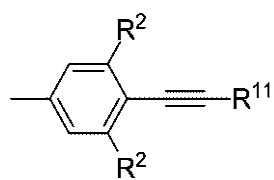
、

【化 2 7 2 6】



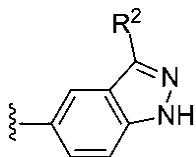
、

【化 2 7 2 7】



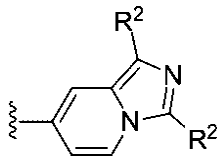
、

【化 2 7 2 8】



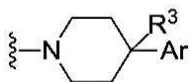
または

【化 2 7 2 9】



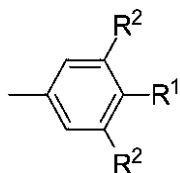
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 7 3 0】



であるとき、Ar は

【化 2 7 3 1】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R²は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁～C₄アルキルであり；

R³は、HまたはFであり；

R¹¹は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹は、H、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、C₃～C₅シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R²²は、H、ハロゲンまたはC₁～C₂アルキルであり；

R²⁴は、H、C₁～C₄アルキル、-(C₁～C₄アルキル)-OH、-(C₁～C₄アルキル)-N(R²⁴¹)₂、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(C₃～C₅シクロアルキル)、-(C₁～C₄アルキル)ₜ-Oᵤ-(4～6員複素環)または-(C₁～C₄アルキル)-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、

tは、0または1であり；

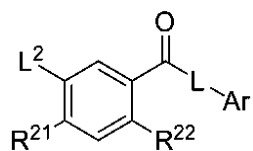
uは、0または1であり；

ただし、uが1であるとき、tは1であり；

R²⁴¹は、HまたはC₁～C₂アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 7 3 2】

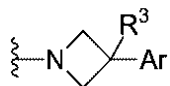


(X V I I I)

(式中、

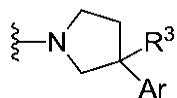
L - A r は、

【化 2 7 3 3】



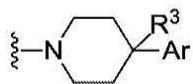
、

【化 2 7 3 4】



または

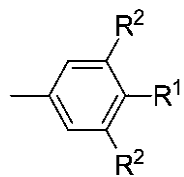
【化 2 7 3 5】



であり ;

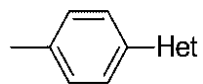
A r は、

【化 2 7 3 6】



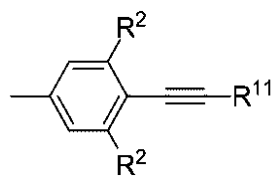
、

【化 2 7 3 7】

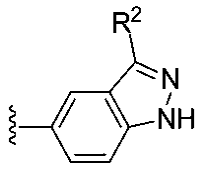


、

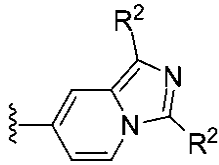
【化 2 7 3 8】



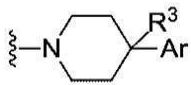
【化 2 7 3 9】



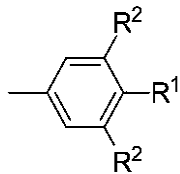
または
【化 2 7 4 0】



であり、ただし、L - Ar が
【化 2 7 4 1】



であるとき、Ar は
【化 2 7 4 2】



ではなく；

L^{22} は、 $-NHR^{35}$ または $-C(O)NHR^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

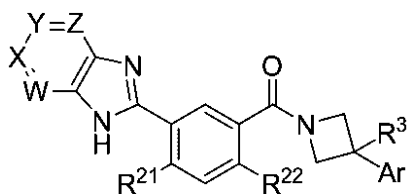
R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$ または $S(O)_2R^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 7 4 3】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

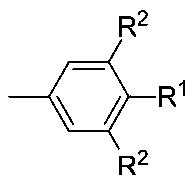
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

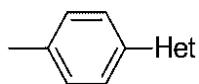
て含み、

Ar は、

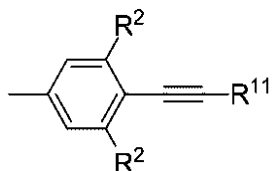
【化 2 7 4 4】



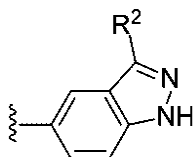
【化 2 7 4 5】



【化 2 7 4 6】

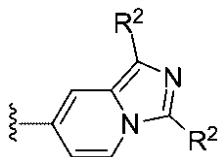


【化 2 7 4 7】



または

【化 2 7 4 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

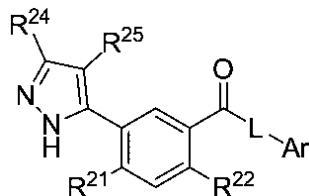
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 7 4 9】

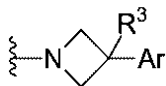


(X X)

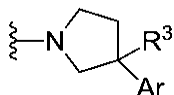
(式中、

L - A r は、

【化 2 7 5 0】

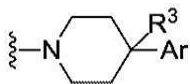


【化 2 7 5 1】



または

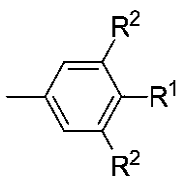
【化 2 7 5 2】



であり；

Ar は、

【化 2 7 5 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

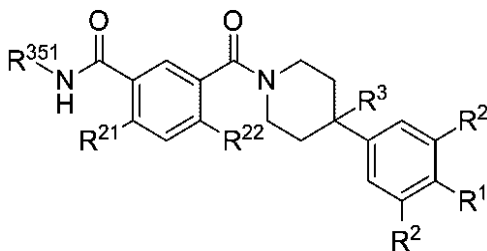
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 7 5 4】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

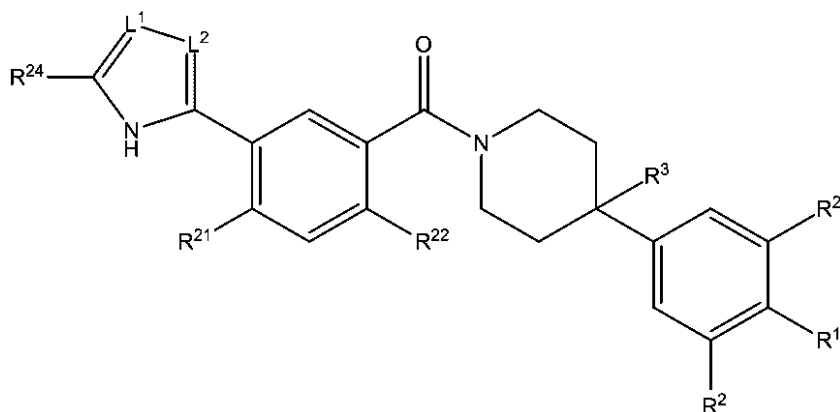
ことを含む、方法。

(項目 20)

ヘルパーT細胞 (T_h) レベルが上昇している疾患または状態を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2755】



(IX)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -OH、-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -O $_t$ -($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、または-($C_1 \sim C_4$ アルキル) $_t$ -O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0または1であり；

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L^1 は、C R^{23} またはNであり；

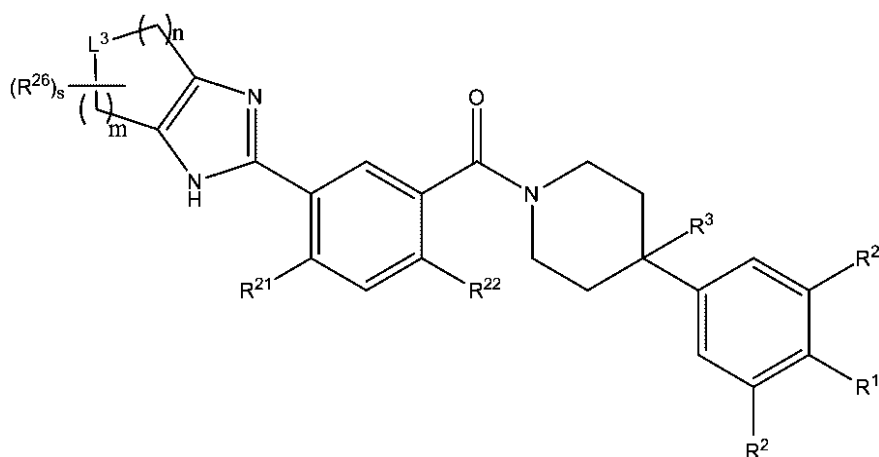
L^2 は、CHまたはNであり；

L^1 または L^2 のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R^{23} は、Hまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 7 5 6】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R^{601})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_3 \sim C_5$ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する- $C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、-C(O)-N(R^{501})₂、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ アルキル)、または-C(O)-N(R^{501})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

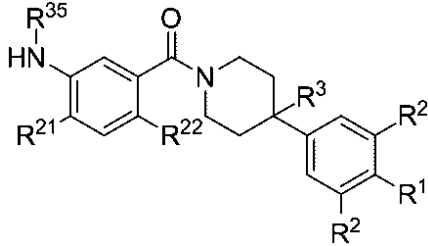
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2757】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

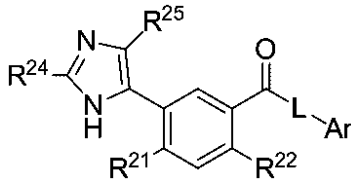
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O- R^{351} または S(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2758】

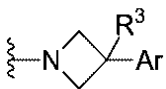


(XII)

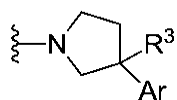
(式中、

L - Ar は、

【化2759】

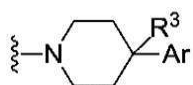


【化 2 7 6 0】



または

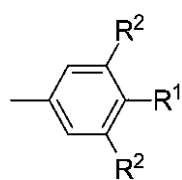
【化 2 7 6 1】



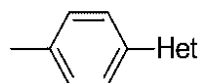
であり；

Ar は、

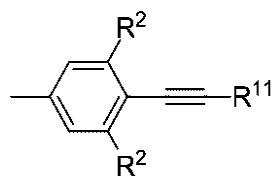
【化 2 7 6 2】


 $\frac{\text{ }^{\sim}}{\text{ }}$

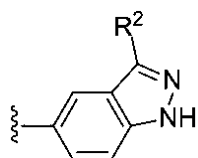
【化 2 7 6 3】


 $\frac{\text{ }^{\sim}}{\text{ }}$

【化 2 7 6 4】

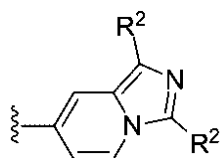

 $\frac{\text{ }^{\sim}}{\text{ }}$

【化 2 7 6 5】



または

【化 2 7 6 6】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(\text{C}_3 \sim \text{C}_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

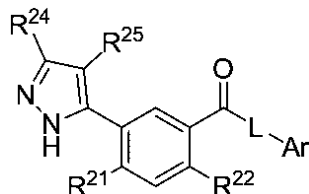
u は、0 または 1 であり；

ただし、 u が 1 であるとき、 t は 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化 2767】

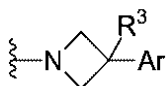


(XIII)

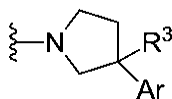
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化 2768】

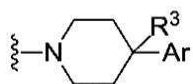


【化 2769】



または

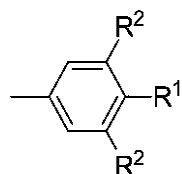
【化 2 7 7 0】



であり；

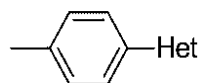
A r は、

【化 2 7 7 1】



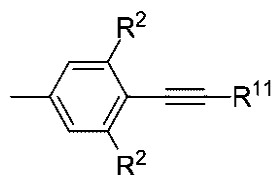
、

【化 2 7 7 2】



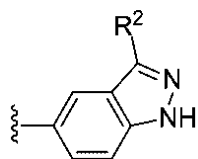
、

【化 2 7 7 3】



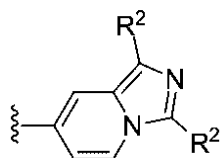
、

【化 2 7 7 4】



または

【化 2 7 7 5】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

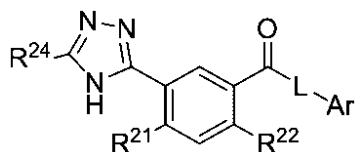
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2776】

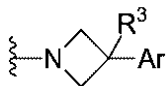


(XIV)

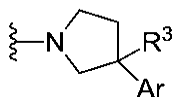
(式中、

$L-Ar$ は、

【化 2777】

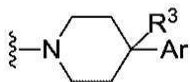


【化 2778】



または

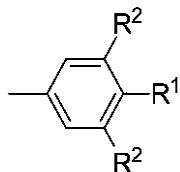
【化 2779】



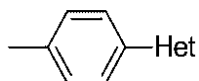
であり；

Ar は、

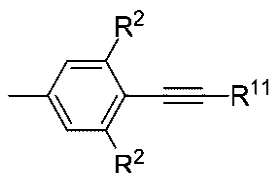
【化 2780】



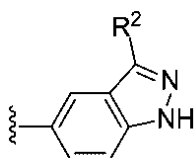
【化 2 7 8 1】



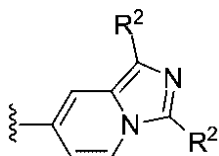
【化 2 7 8 2】



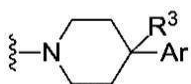
【化 2 7 8 3】



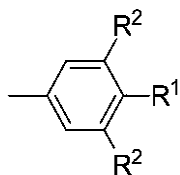
または
【化 2 7 8 4】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 7 8 5】



であるとき、A r は
【化 2 7 8 6】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

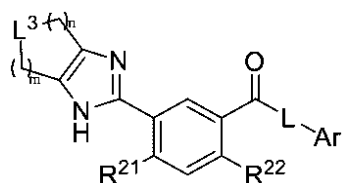
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 2787】



(XV)

(式中、

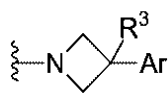
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

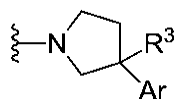
$L-Ar$ は、

【化 2788】



、

【化 2789】



または

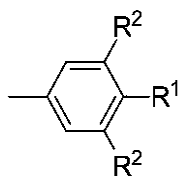
【化 2790】



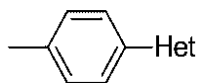
であり；

Ar は、

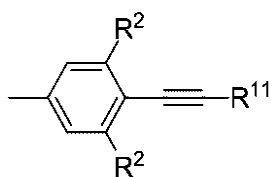
【化 2 7 9 1】



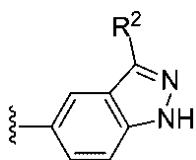
【化 2 7 9 2】



【化 2 7 9 3】

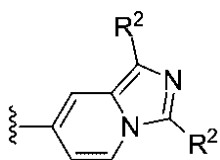


【化 2 7 9 4】



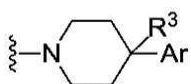
または

【化 2 7 9 5】



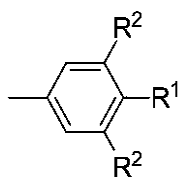
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 7 9 6】



であるとき、Ar は

【化 2 7 9 7】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

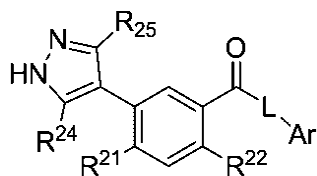
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化 2 7 9 8】

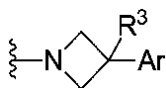


(XVI)

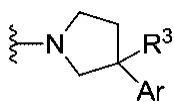
(式中、

L - Ar は、

【化 2 7 9 9】

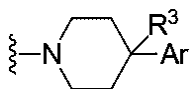


【化 2 8 0 0】



または

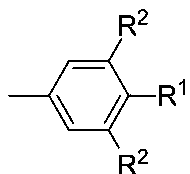
【化 2 8 0 1】



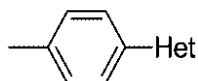
であり；

Ar は、

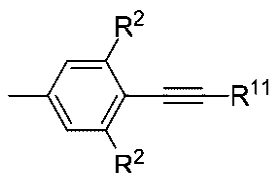
【化 2 8 0 2】



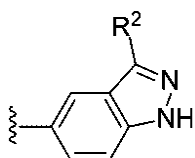
【化 2 8 0 3】



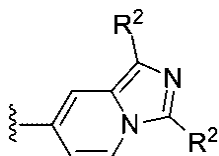
【化 2 8 0 4】



【化 2 8 0 5】



または
【化 2 8 0 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

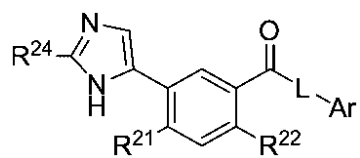
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 8 0 7】

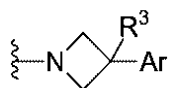


(X V I I)

(式中、

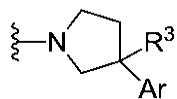
L - A r は、

【化 2 8 0 8】



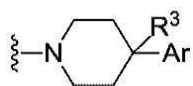
、

【化 2 8 0 9】



または

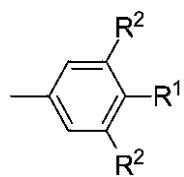
【化 2 8 1 0】



であり、

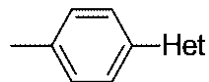
A r は、

【化 2 8 1 1】



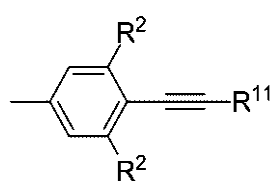
、

【化 2 8 1 2】



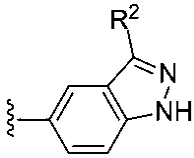
、

【化 2 8 1 3】



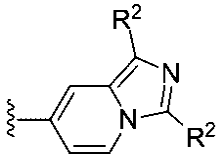
、

【化 2 8 1 4】



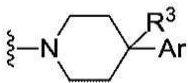
または

【化 2 8 1 5】



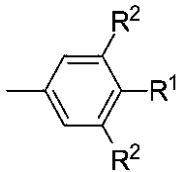
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 8 1 6】



であるとき、Ar は

【化 2 8 1 7】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

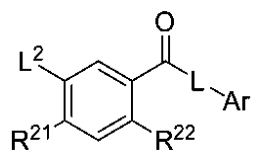
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 2 8 1 8】

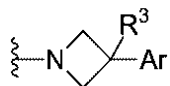


(X V I I I)

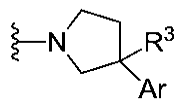
(式中、

L - A r は、

【化 2 8 1 9】

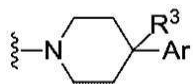


【化 2 8 2 0】



または

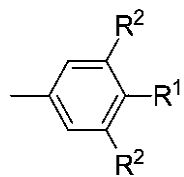
【化 2 8 2 1】



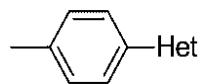
であり ;

A r は、

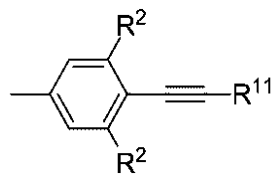
【化 2 8 2 2】



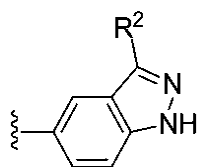
【化 2 8 2 3】



【化 2 8 2 4】

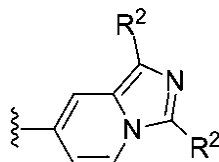


【化 2 8 2 5】



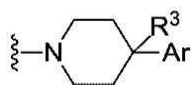
または

【化 2 8 2 6】



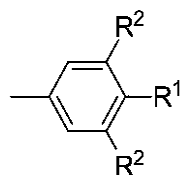
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 8 2 7】



であるとき、Ar は

【化 2 8 2 8】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

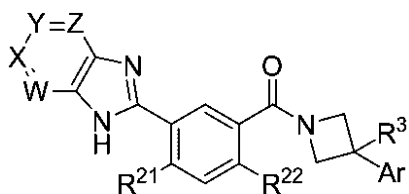
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 8 2 9】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

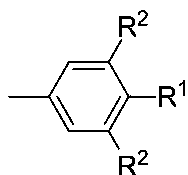
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

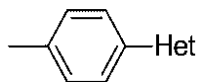
て含み、

A r は、

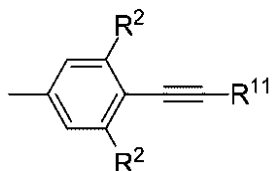
【化 2 8 3 0】



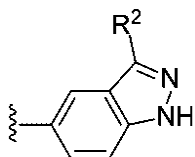
、
【化 2 8 3 1】



、
【化 2 8 3 2】

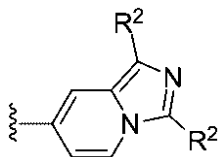


、
【化 2 8 3 3】



または

【化 2 8 3 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環)、-O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

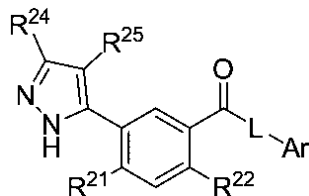
R^{11} は、Hまたは-CH₃であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (XX)：

【化 2 8 3 5】

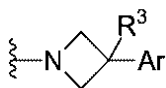


(XX)

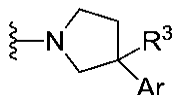
式中、

$L-Ar$ は、

【化 2 8 3 6】

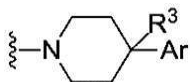


【化 2 8 3 7】



または

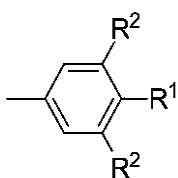
【化 2 8 3 8】



であり；

Ar は、

【化 2 8 3 9】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

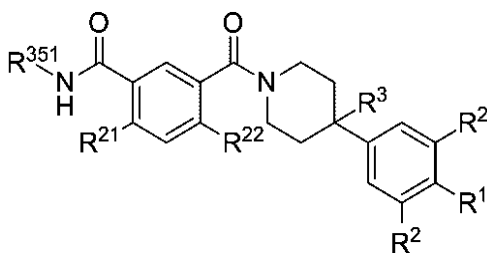
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 8 4 0】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

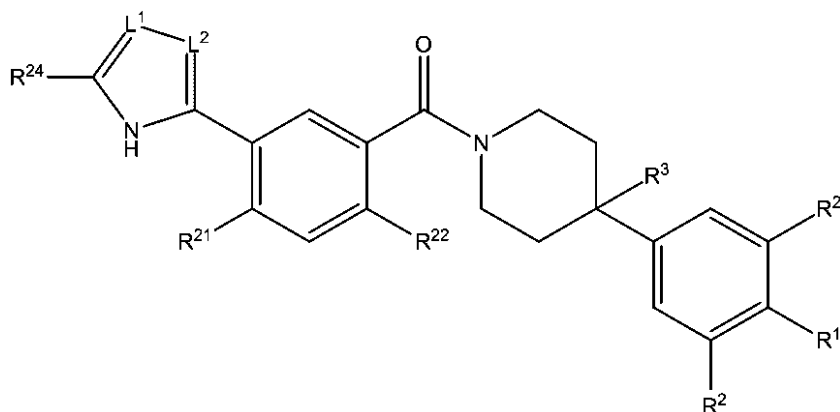
ことを含む、方法。

(項目 21)

制御性 T 細胞 (T_{reg}) が減少または抑制されている疾患または状態を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2841】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

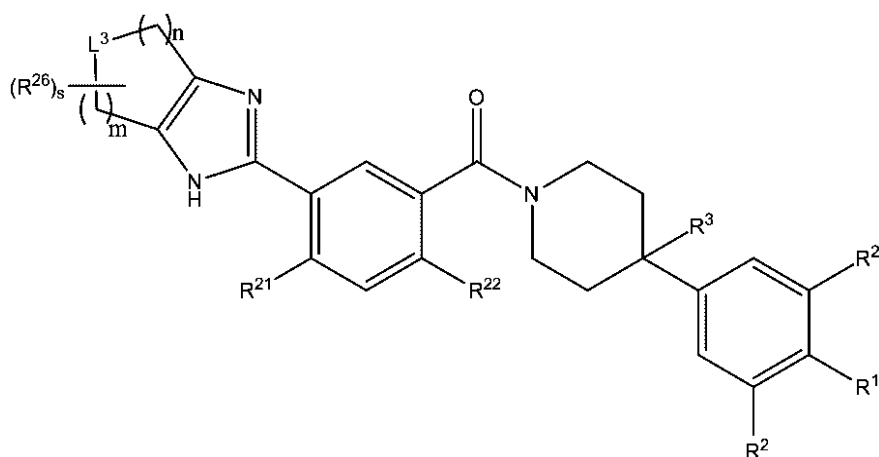
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 8 4 2】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

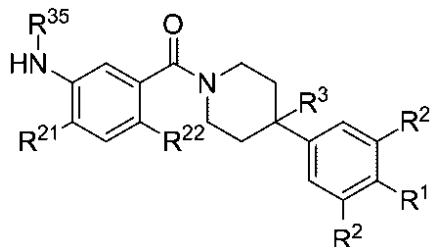
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化2843】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

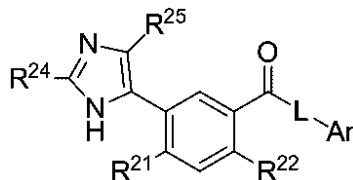
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化2844】

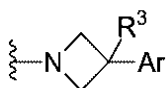


(XII)

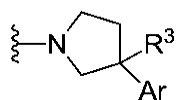
(式中、

L-Ar は、

【化2845】

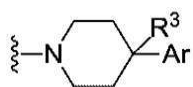


【化 2 8 4 6】



または

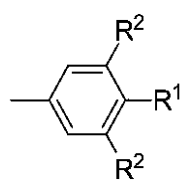
【化 2 8 4 7】



であり；

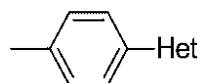
Ar は、

【化 2 8 4 8】



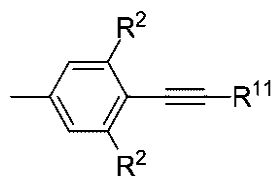
、

【化 2 8 4 9】



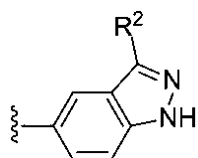
、

【化 2 8 5 0】



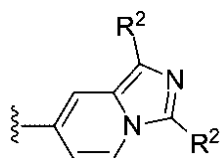
、

【化 2 8 5 1】



または

【化 2 8 5 2】



であり；

$H e t$ は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(C_3 \sim C_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0または1であり；

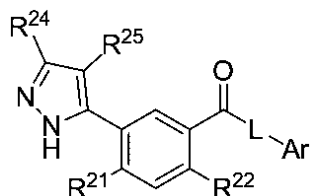
u は、0または1であり；

ただし、 u が1であるとき、 t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化2853】

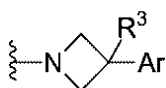


(XIII)

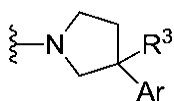
(式中、

$L-Ar$ は、

【化2854】

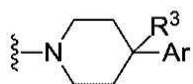


【化2855】



または

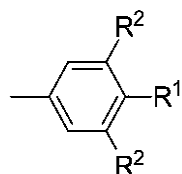
【化 2 8 5 6】



であり；

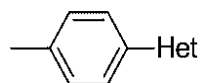
Ar は、

【化 2 8 5 7】



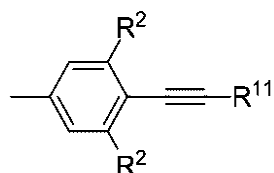
、

【化 2 8 5 8】



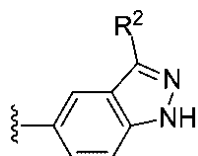
、

【化 2 8 5 9】



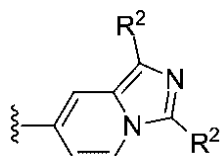
、

【化 2 8 6 0】



または

【化 2 8 6 1】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

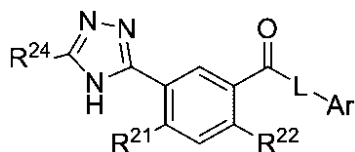
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 8 6 2】

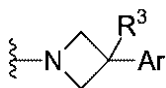


(XIV)

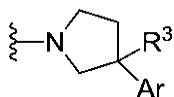
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 8 6 3】

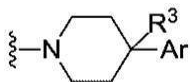


【化 2 8 6 4】



または

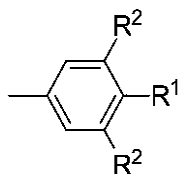
【化 2 8 6 5】



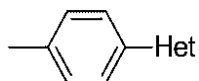
であり；

Ar は、

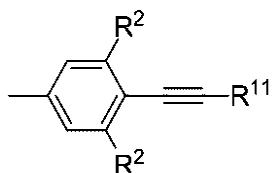
【化 2 8 6 6】



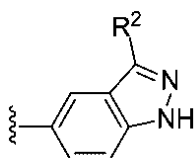
【化 2 8 6 7】



【化 2 8 6 8】



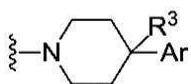
【化 2 8 6 9】



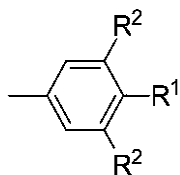
または
【化 2 8 7 0】



であり、ただし、L - A r が
【化 2 8 7 1】



であるとき、A r は
【化 2 8 7 2】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

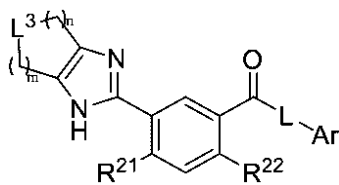
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化2873】



(XV)

(式中、

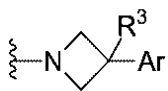
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

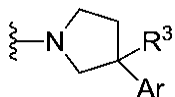
$L-Ar$ は、

【化2874】



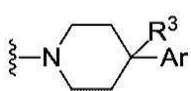
、

【化2875】



または

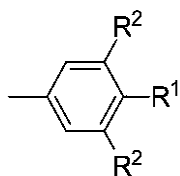
【化2876】



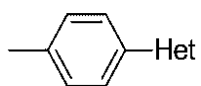
であり；

Ar は、

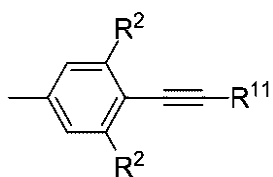
【化 2 8 7 7】



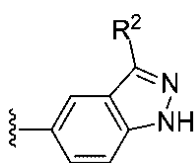
【化 2 8 7 8】



【化 2 8 7 9】

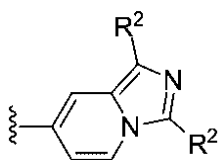


【化 2 8 8 0】



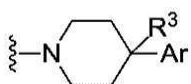
または

【化 2 8 8 1】



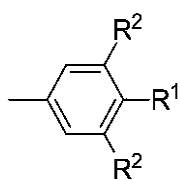
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 8 8 2】



であるとき、Ar は

【化 2 8 8 3】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

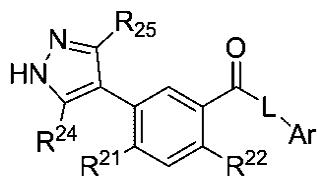
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化2884】

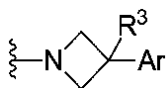


(XVI)

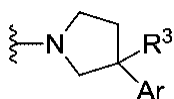
(式中、

L-Arは、

【化2885】

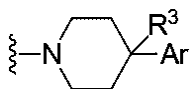


【化2886】



または

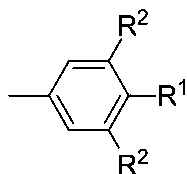
【化2887】



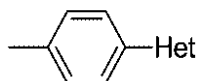
であり；

Arは、

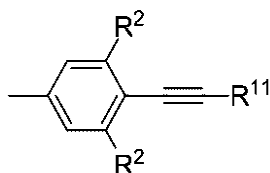
【化2888】



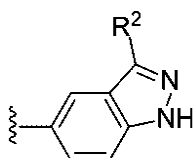
【化 2 8 8 9】



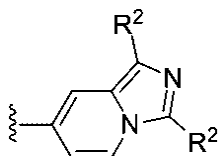
【化 2 8 9 0】



【化 2 8 9 1】



または
【化 2 8 9 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

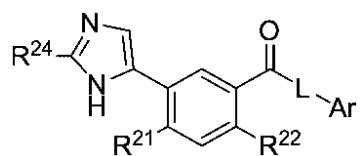
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 8 9 3】

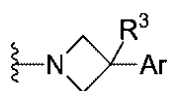


(X V I I)

(式中、

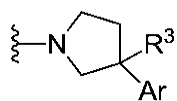
L - A r は、

【化 2 8 9 4】



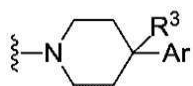
、

【化 2 8 9 5】



または

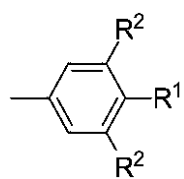
【化 2 8 9 6】



であり、

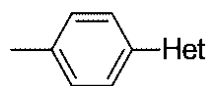
A r は、

【化 2 8 9 7】



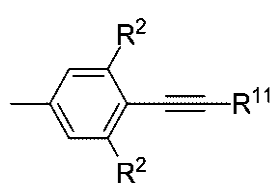
、

【化 2 8 9 8】



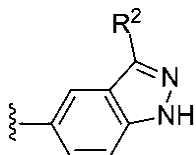
、

【化 2 8 9 9】



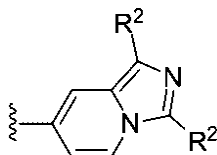
、

【化 2 9 0 0】



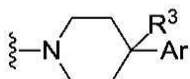
または

【化 2 9 0 1】



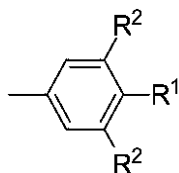
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 0 2】



であるとき、Ar は

【化 2 9 0 3】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

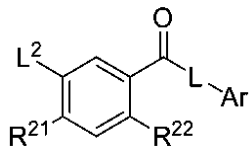
t は、0 または 1 であり；

u は、0 または 1 であり；

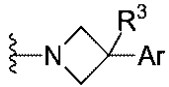
ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

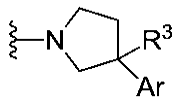
(j) 式 (X V I I I) :
【化 2 9 0 4】



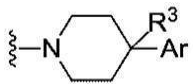
(X V I I I)
(式中、
L - A r は、
【化 2 9 0 5】



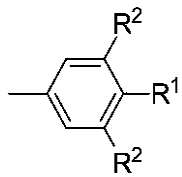
、
【化 2 9 0 6】



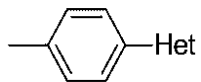
または
【化 2 9 0 7】



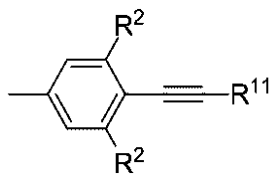
であり ;
A r は、
【化 2 9 0 8】



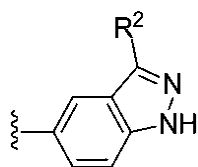
、
【化 2 9 0 9】



、
【化 2 9 1 0】

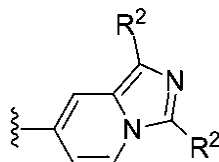


【化 2 9 1 1】



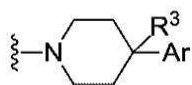
または

【化 2 9 1 2】



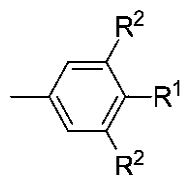
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 1 3】



であるとき、Ar は

【化 2 9 1 4】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

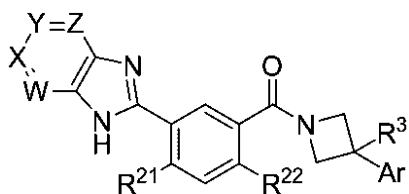
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 2 9 1 5】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

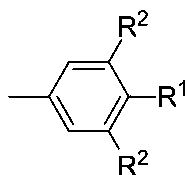
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

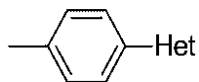
て含み、

Ar は、

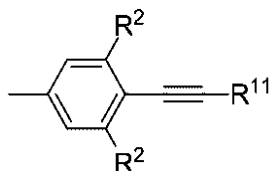
【化 2 9 1 6】



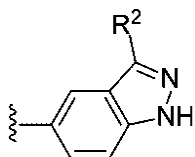
【化 2 9 1 7】



【化 2 9 1 8】

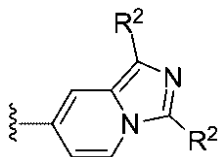


【化 2 9 1 9】



または

【化 2 9 2 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

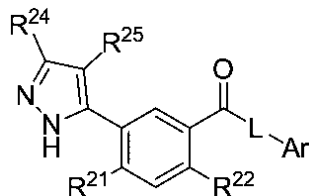
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 2 9 2 1】

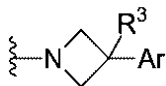


(X X)

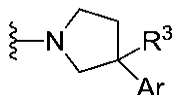
(式中、

L - A r は、

【化 2 9 2 2】

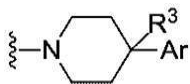


【化 2 9 2 3】



または

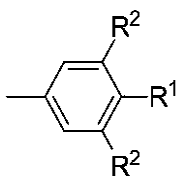
【化 2 9 2 4】



であり；

Ar は、

【化 2 9 2 5】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

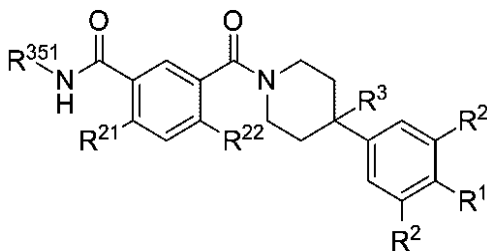
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 2 9 2 6】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

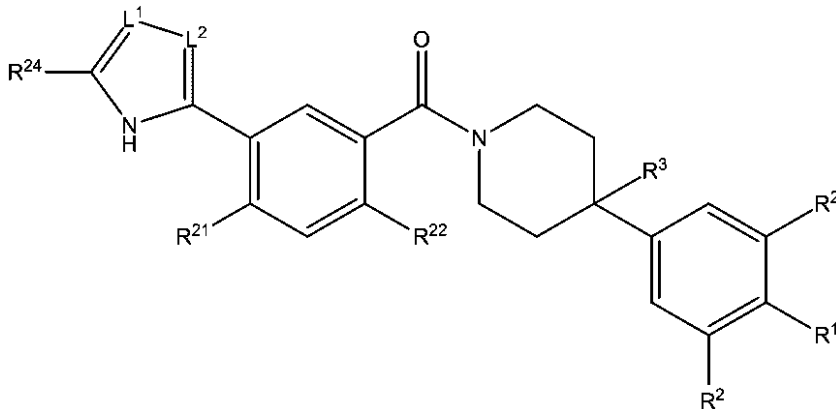
ことを含む、方法。

(項目 22)

確立された非アルコール性脂肪性肝炎 (NASH) を逆転させる方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 2927】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

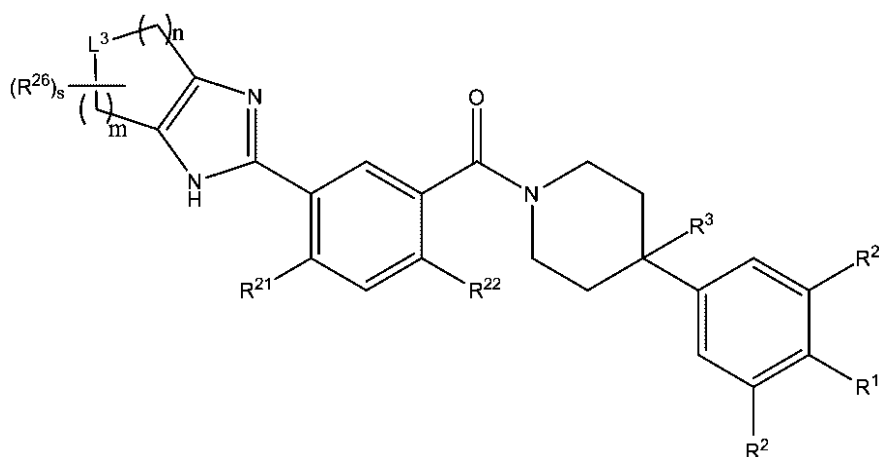
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 2 9 2 8】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R^{601})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_3 \sim C_5$ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃~C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R^{501})₂、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O_t-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-($C_1 \sim C_4$ アルキル)、または-C(O)-N(R^{501})₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

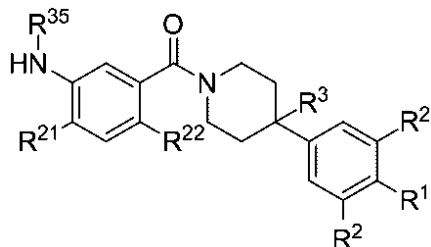
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの 2 つは、2 つの R^{26} 、2 つの R^{60} 、2 つの R^{50} 、2 つの R^{501} または 2 つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化 2929】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O-($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

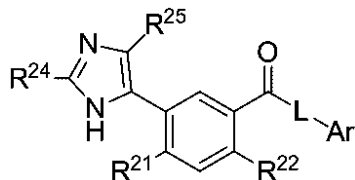
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化 2930】

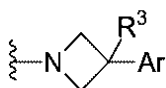


(XII)

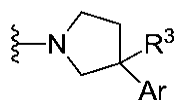
(式中、

L-Ar は、

【化 2931】

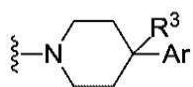


【化 2 9 3 2】



または

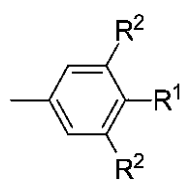
【化 2 9 3 3】



であり；

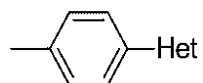
Ar は、

【化 2 9 3 4】



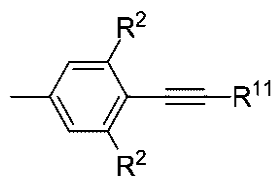
、

【化 2 9 3 5】



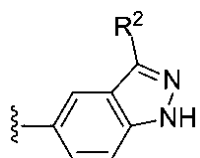
、

【化 2 9 3 6】



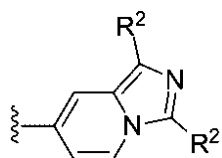
、

【化 2 9 3 7】



または

【化 2 9 3 8】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(\text{C}_3 \sim \text{C}_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

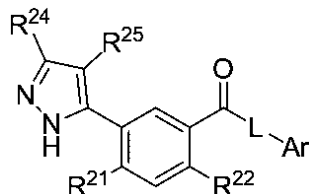
u は、0 または 1 であり；

ただし、 u が 1 であるとき、 t は 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化2939】

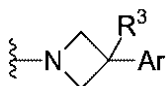


(XIII)

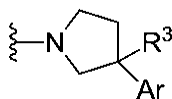
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化2940】

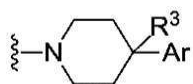


【化2941】



または

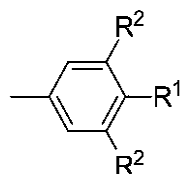
【化 2 9 4 2】



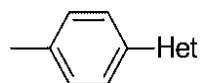
であり；

Ar は、

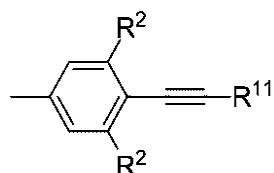
【化 2 9 4 3】



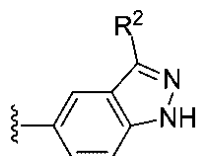
【化 2 9 4 4】



【化 2 9 4 5】

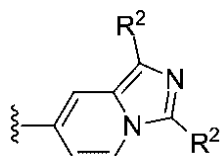


【化 2 9 4 6】



または

【化 2 9 4 7】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリアルであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

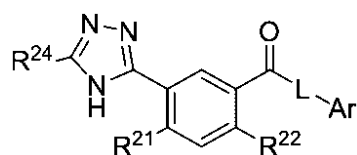
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 2 9 4 8】

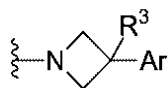


(XIV)

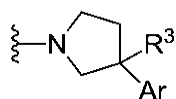
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 2 9 4 9】

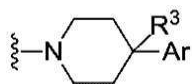


【化 2 9 5 0】



または

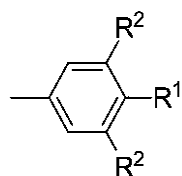
【化 2 9 5 1】



であり；

Ar は、

【化 2 9 5 2】



*c1ccccc1Het
$$\text{---} \text{C}_6\text{H}_2(\text{R}^2)_2 \text{---C}\equiv\text{C---R}^{11}$$
*c1ccc2c(c1)c(c[nH]2)C(=N)R2

Chemical structure of a substituted piperidine ring. The nitrogen atom is on the left, connected to a wavy line. The carbon atom at the 2-position is substituted with R^3 and an Ar group.

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ~ 6 員複素環) または -O-(C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

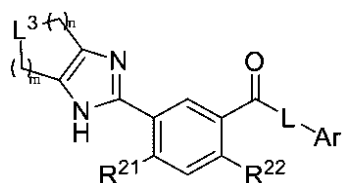
R^{241} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化2959】



(XV)

(式中、

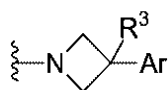
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \geq 3$ であり；

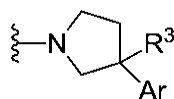
$L-Ar$ は、

【化2960】



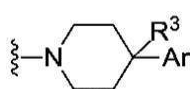
、

【化2961】



または

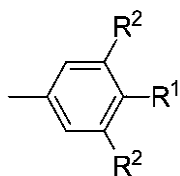
【化2962】



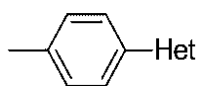
であり；

Ar は、

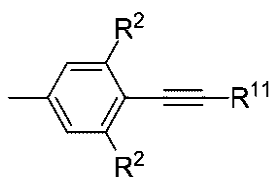
【化 2 9 6 3】



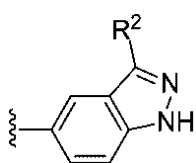
【化 2 9 6 4】



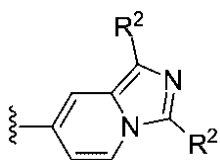
【化 2 9 6 5】



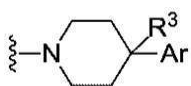
【化 2 9 6 6】



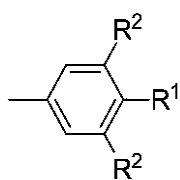
【化 2 9 6 7】



【化 2 9 6 8】



【化 2 9 6 9】



ではなく；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、-O-($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル)であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

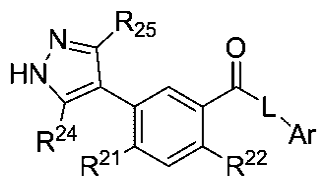
R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化2970】

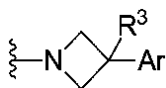


(XVI)

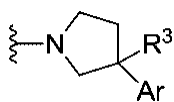
(式中、

L-Arは、

【化2971】

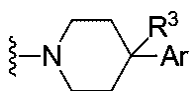


【化2972】



または

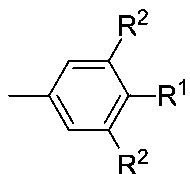
【化2973】



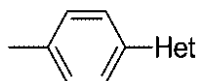
であり；

Arは、

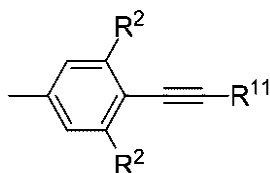
【化2974】



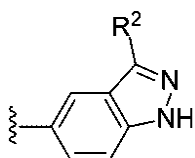
【化 2 9 7 5】



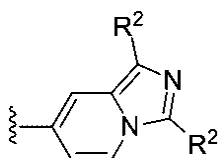
【化 2 9 7 6】



【化 2 9 7 7】



または
【化 2 9 7 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

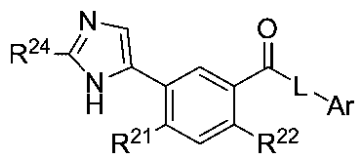
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 2 9 7 9】

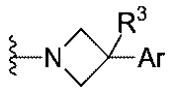


(X V I I)

(式中、

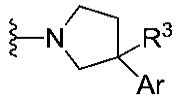
L - A r は、

【化 2 9 8 0】



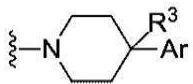
、

【化 2 9 8 1】



または

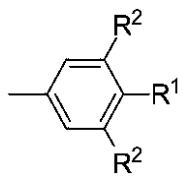
【化 2 9 8 2】



であり、

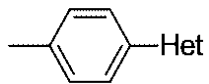
A r は、

【化 2 9 8 3】



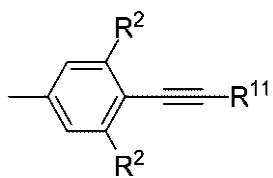
、

【化 2 9 8 4】



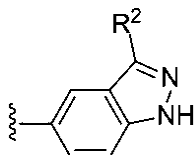
、

【化 2 9 8 5】



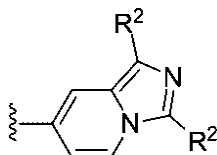
、

【化 2 9 8 6】



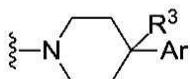
または

【化 2 9 8 7】



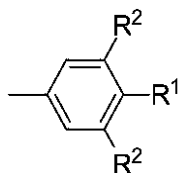
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 8 8】



であるとき、Ar は

【化 2 9 8 9】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

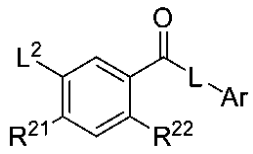
t は、0 または 1 であり；

u は、0 または 1 であり；

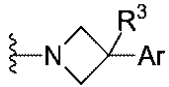
ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

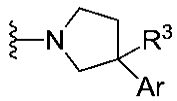
(j) 式 (X V I I I) :
【化 2 9 9 0】



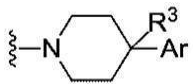
(X V I I I)
(式中、
 $L - Ar$ は、
【化 2 9 9 1】



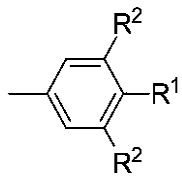
【化 2 9 9 2】



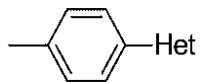
または
【化 2 9 9 3】



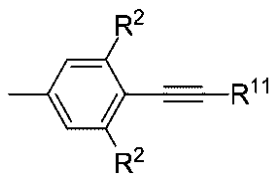
であり ;
 Ar は、
【化 2 9 9 4】



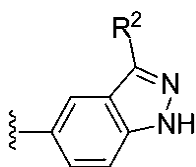
【化 2 9 9 5】



【化 2 9 9 6】

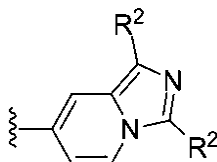


【化 2 9 9 7】



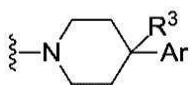
または

【化 2 9 9 8】



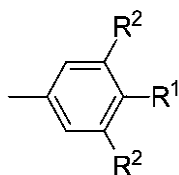
であり、ただし、L - Ar が

【化 2 9 9 9】



であるとき、Ar は

【化 3 0 0 0】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

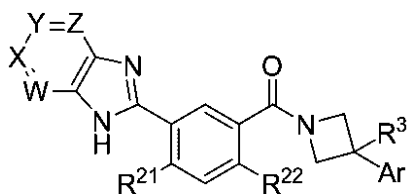
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 0 0 1】



(X I X)

(式中、

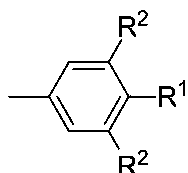
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

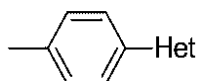
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じて含み、

A r は、

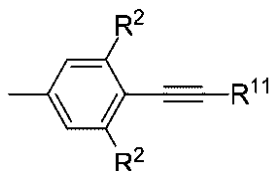
【化 3 0 0 2】



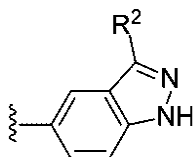
【化 3 0 0 3】



【化 3 0 0 4】

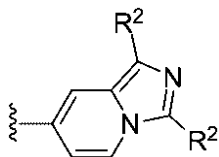


【化 3 0 0 5】



または

【化 3 0 0 6】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

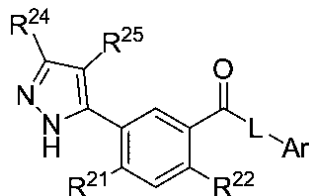
R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 0 0 7】

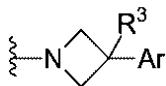


(X X)

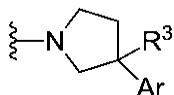
(式中、

L - A r は、

【化 3 0 0 8】

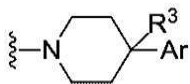


【化 3 0 0 9】



または

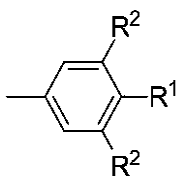
【化 3 0 1 0】



であり；

Ar は、

【化 3 0 1 1】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

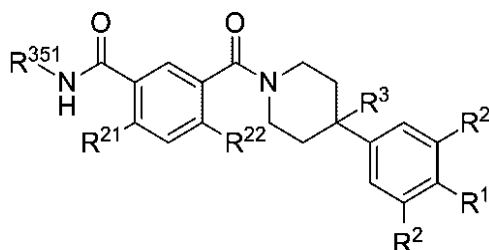
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 3 0 1 2】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

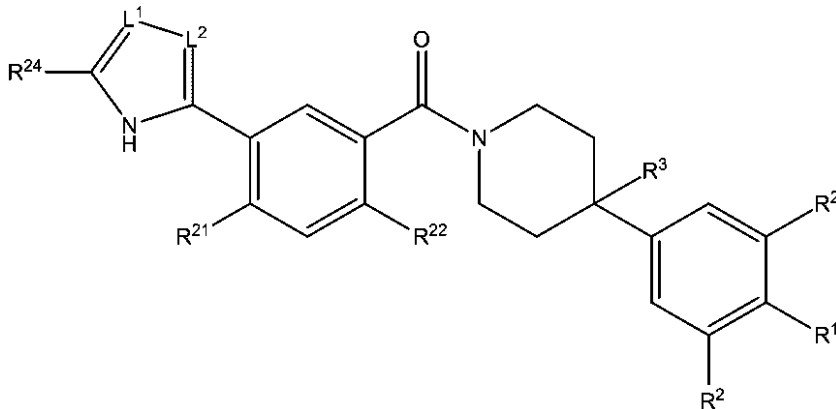
ことを含む、方法。

(項目 23)

線維症遺伝子発現を低下させる方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 3013】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたはC₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、CR²³ またはNであり；

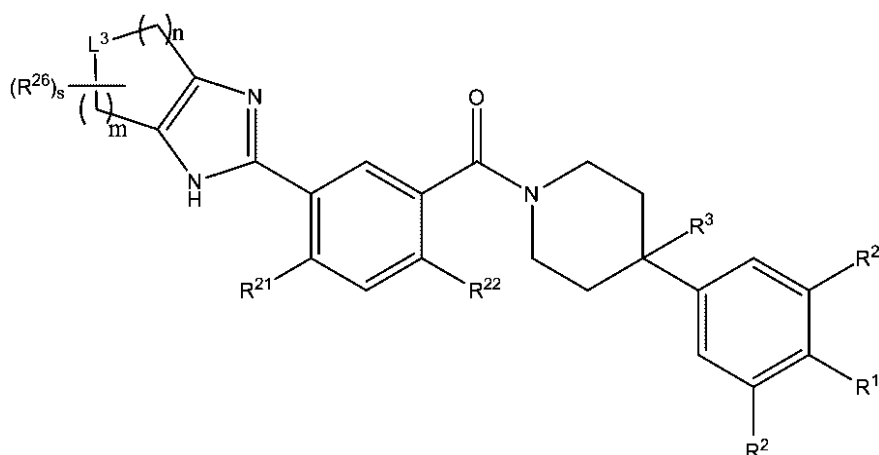
L² は、CHまたはNであり；

L¹ またはL² のうちの少なくとも1つは、Nであり；

R²³ は、HまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 3 0 1 4】



(X)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各R² は、独立して、水素、ハロゲンまたはC₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L³ は、C(R⁶⁰)₂、OまたはNR⁵⁰であり；

各R⁶⁰ は、独立して、H、-OH、-CN、-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、または-C(O)-N(R⁶⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各R⁵⁰ は、独立して、H、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₃ ~ C₅ 環式アルキル)、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する-C₃ ~ C₅ 環式アルキル、-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₂ アルキルであり；

各R²⁶ は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)、-C(O)-O_t-(C₁ ~ C₄ アルキル)、または-C(O)-N(R⁵⁰¹)₂であり、この場合、

t は、0または1であり、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

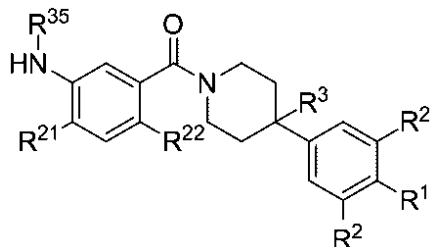
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化3015】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

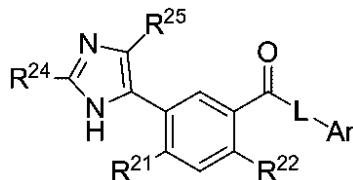
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 またはS(O) $_2$ R^{351} であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化3016】

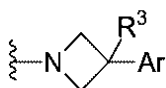


(XII)

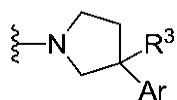
(式中、

L-Ar は、

【化3017】

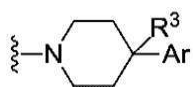


【化 3 0 1 8】



または

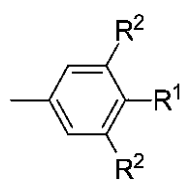
【化 3 0 1 9】



であり；

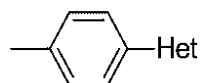
Ar は、

【化 3 0 2 0】



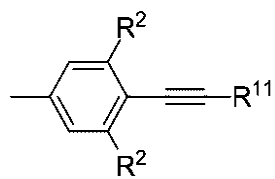
、

【化 3 0 2 1】



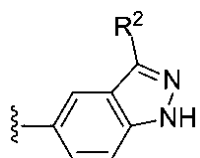
、

【化 3 0 2 2】



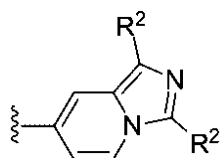
、

【化 3 0 2 3】



または

【化 3 0 2 4】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- (4～6員複素環) または -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは- CH_3 であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{24} は、H、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -OH、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -N (R^{241})₂、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - ($C_3 \sim C_6$ シクロアルキル)、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル)_t -O_u - (4～6員複素環) または - ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -O- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) であり、この場合、

t は、0または1であり；

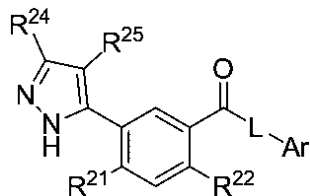
u は、0または1であり；

ただし、u が1であるとき、t は1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、-CN、- ($C_1 \sim C_4$ アルキル) -CN、 $C_1 \sim C_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化3025】

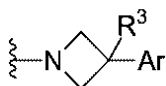


(XIII)

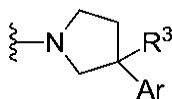
(式中、

L-Ar は、

【化3026】

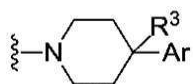


【化3027】



または

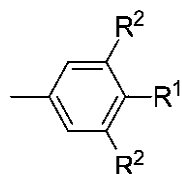
【化 3 0 2 8】



であり；

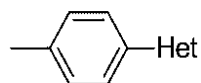
Ar は、

【化 3 0 2 9】



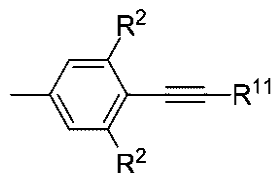
、

【化 3 0 3 0】



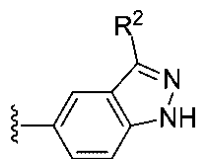
、

【化 3 0 3 1】



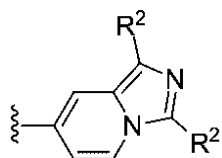
、

【化 3 0 3 2】



または

【化 3 0 3 3】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

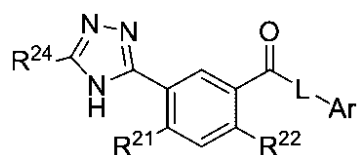
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、H または $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 3034】

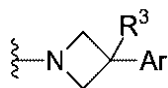


(XIV)

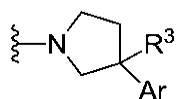
(式中、

$L-Ar$ は、

【化 3035】

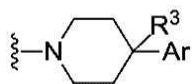


【化 3036】



または

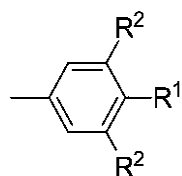
【化 3037】



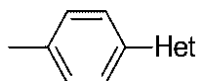
であり；

Ar は、

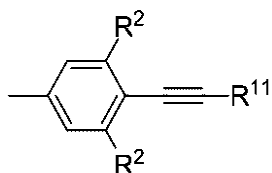
【化 3038】



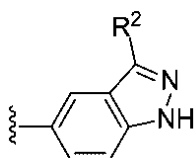
【化 3 0 3 9】



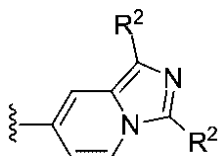
【化 3 0 4 0】



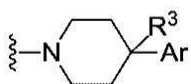
【化 3 0 4 1】



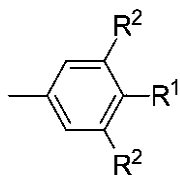
または
【化 3 0 4 2】



であり、ただし、L - A r が
【化 3 0 4 3】



であるとき、A r は
【化 3 0 4 4】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

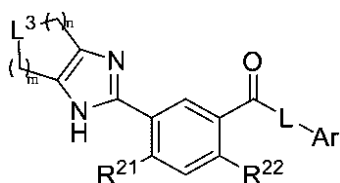
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式 (XV)：

【化 3 0 4 5】



(XV)

(式中、

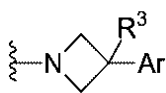
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

n は、1、2 または 3 であり；

m は、1 または 2 であり、ただし、 $n + m \leq 3$ であり；

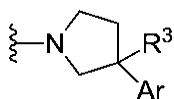
$L-Ar$ は、

【化 3 0 4 6】



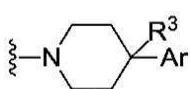
、

【化 3 0 4 7】



または

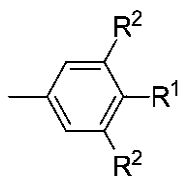
【化 3 0 4 8】



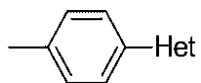
であり；

Ar は、

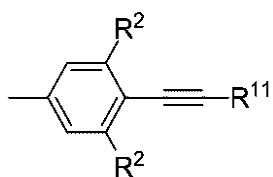
【化 3 0 4 9】



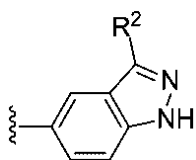
【化 3 0 5 0】



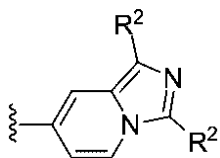
【化 3 0 5 1】



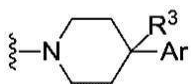
【化 3 0 5 2】



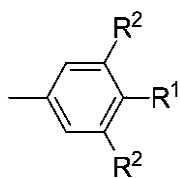
【化 3 0 5 3】



【化 3 0 5 4】



【化 3 0 5 5】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

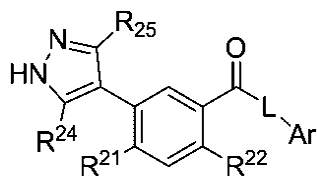
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化3056】

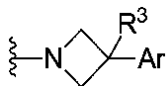


(XVI)

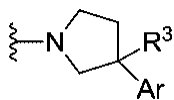
(式中、

L-Arは、

【化3057】

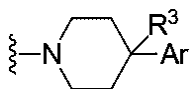


【化3058】



または

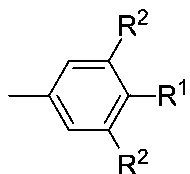
【化3059】



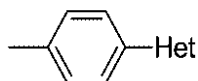
であり；

Arは、

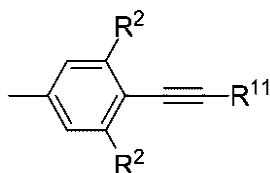
【化3060】



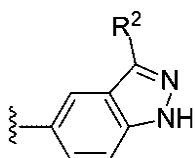
【化 3 0 6 1】



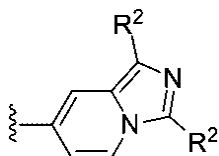
【化 3 0 6 2】



【化 3 0 6 3】



または
【化 3 0 6 4】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

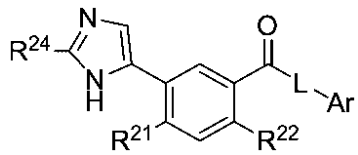
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 3 0 6 5】

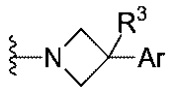


(X V I I)

(式中、

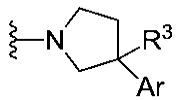
L - A r は、

【化 3 0 6 6】



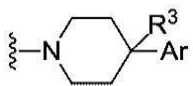
、

【化 3 0 6 7】



または

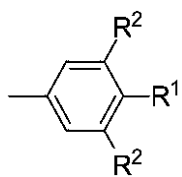
【化 3 0 6 8】



であり、

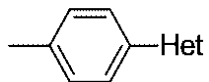
A r は、

【化 3 0 6 9】



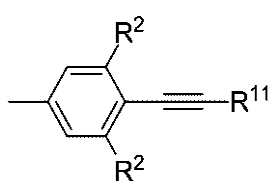
、

【化 3 0 7 0】



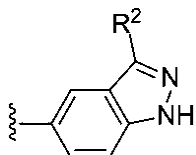
、

【化 3 0 7 1】



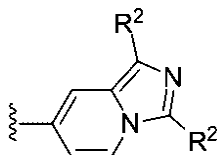
、

【化 3 0 7 2】



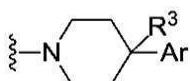
または

【化 3 0 7 3】



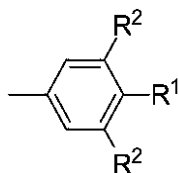
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 0 7 4】



であるとき、Ar は

【化 3 0 7 5】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

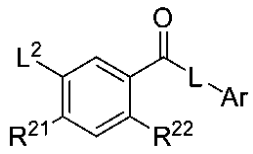
t は、0 または 1 であり；

u は、0 または 1 であり；

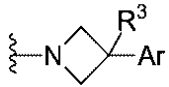
ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

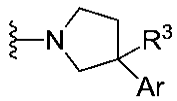
(j) 式 (X V I I I) :
【化 3 0 7 6】



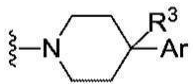
(X V I I I)
(式中、
L - A r は、
【化 3 0 7 7】



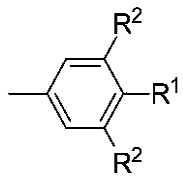
、
【化 3 0 7 8】



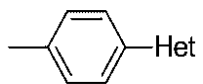
または
【化 3 0 7 9】



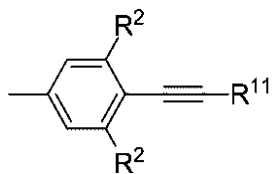
であり ;
A r は、
【化 3 0 8 0】



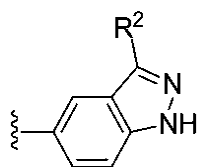
、
【化 3 0 8 1】



、
【化 3 0 8 2】

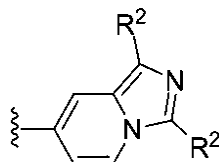


【化 3 0 8 3】



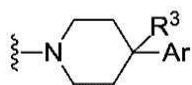
または

【化 3 0 8 4】



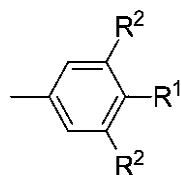
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 0 8 5】



であるとき、Ar は

【化 3 0 8 6】



ではなく；

L^{21} は、 $-NHR^{351}$ または $-C(O)NHR^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、H、 $-CN$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、 R^1 が H でも $-CN$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、H または F であり；

R^{11} は、H または $-CH_3$ であり；

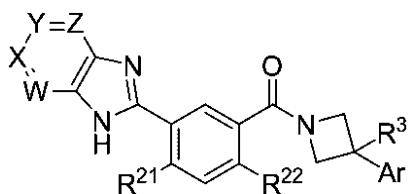
R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、 $-C(O)R^{351}$ 、 $-C(O)NHR^{351}$ 、 $C(O)OR^{351}$ または $S(O)_2R^{351}$ であり、この場合、 R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキル、4～6員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 0 8 7】



(X I X)

(式中、

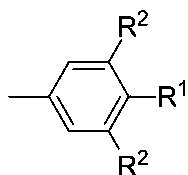
各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

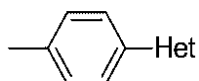
各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じて含み、

A r は、

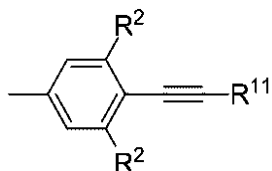
【化 3 0 8 8】



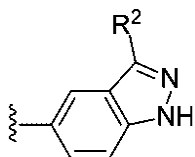
、
【化 3 0 8 9】



、
【化 3 0 9 0】

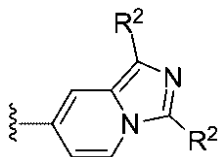


、
【化 3 0 9 1】



または

【化 3 0 9 2】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

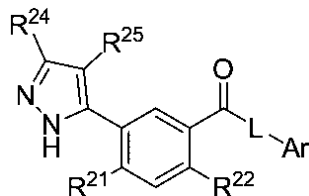
R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 0 9 3】

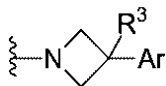


(X X)

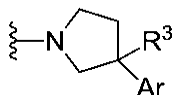
(式中、

L - A r は、

【化 3 0 9 4】

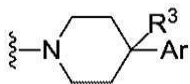


【化 3 0 9 5】



または

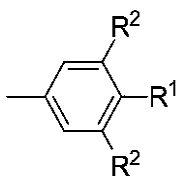
【化 3 0 9 6】



であり；

Ar は、

【化 3 0 9 7】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

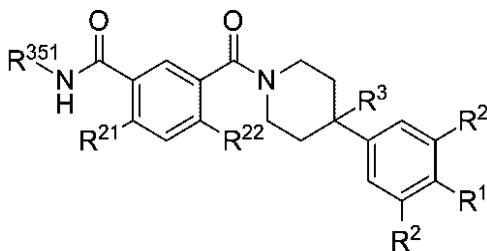
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 3 0 9 8】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

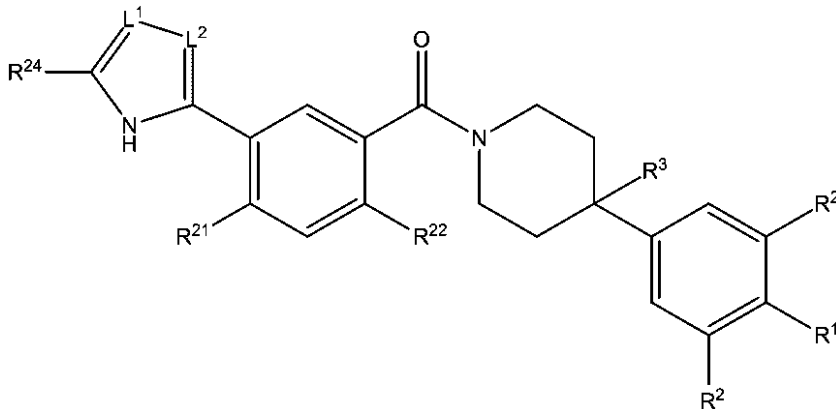
ことを含む、方法。

(項目 24)

皮膚線維症を処置する方法であって、それを必要とする対象に、

(a) 式 (IX)

【化 3099】



(IX)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル)であり、この場合、

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でも ハロゲン でも ない とき、R¹ は、1 つ 以上 の ハロゲン で 必要 に 応 じて 置 換 さ れ て お り ；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH または ハロゲン であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルであり、この場合、C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R²⁴ は、H、C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-OH、-(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O_t-(C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、または -(C₁ ~ C₄ アルキル)_t-O-(C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル)であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

C₃ ~ C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

L¹ は、C R²³ または N であり；

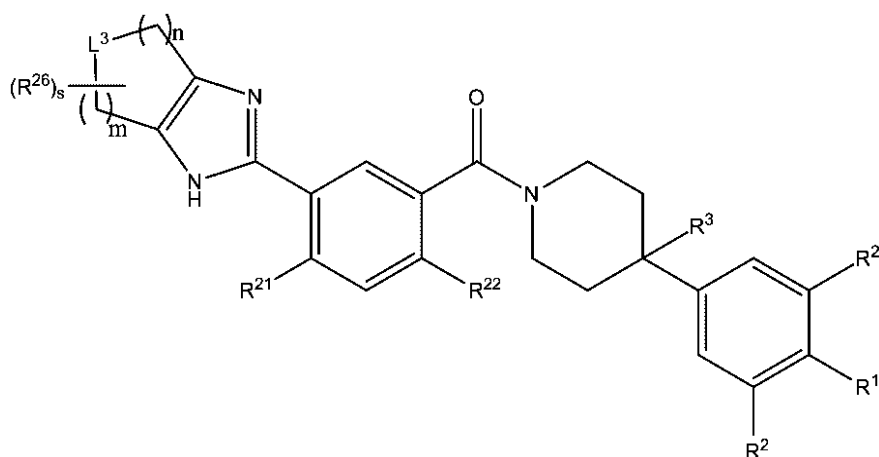
L² は、CH または N であり；

L¹ または L² のうちの少なくとも 1 つは、N であり；

R²³ は、H または C₁ ~ C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(b) 式 (X)：

【化 3 1 0 0】



(X)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $-O-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OHまたはハロゲンであり；

L^3 は、 $C(R^{60})_2$ 、Oまたは NR^{50} であり；

各 R^{60} は、独立して、H、-OH、-CN、 $-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{601})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

各 R^{50} は、独立して、H、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖または分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ 環式アルキル})$ 、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含有する $-C_3 \sim C_5$ 環式アルキル、 $-C(O)-N(R^{501})_2$ 、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキルであり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルであり、この場合、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^{22} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{26} は、独立して、-OH、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル})$ 、 $-C(O)-O_t-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、または $-C(O)-N(R^{501})_2$ であり、この場合、

t は、0または1であり、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

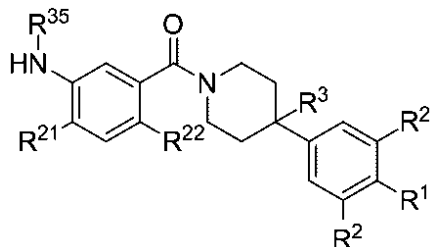
s は、0、1または2であり；

各 R^{601} 及び R^{501} は、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

ここで、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、必要に応じて連結して環を形成しており、この場合、 R^{26} 、 R^{60} 、 R^{50} 、 R^{501} 及び R^{601} のうちの2つは、2つの R^{26} 、2つの R^{60} 、2つの R^{50} 、2つの R^{501} または2つの R^{601} であってよい）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(c) 式 (VI - J)

【化3101】



(VI - J)

(式中、

R^1 は、H、-CN、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- ($C_3 \sim C_5$ シクロアルキル)、-O- ($C_1 \sim C_4$ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

$C_3 \sim C_5$ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R^1 がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R^3 は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{21} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

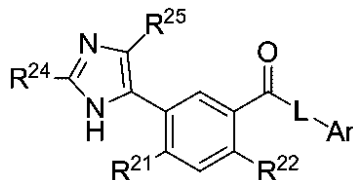
R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

R^{35} は、-C(O)- R^{351} 、-C(O)-NHR 351 、-C(O)-O-R 351 または S(O) $_2$ R 351 であり；

R^{351} は、 $C_1 \sim C_6$ 直鎖もしくは分枝鎖アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(d) 式 (XII)：

【化3102】

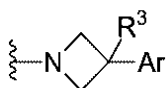


(XII)

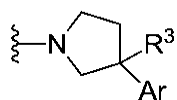
(式中、

L-Ar は、

【化3103】

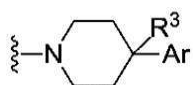


【化 3 1 0 4】



または

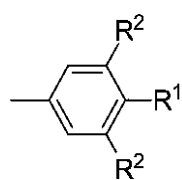
【化 3 1 0 5】



であり；

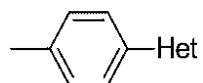
Ar は、

【化 3 1 0 6】



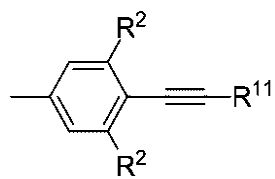
、

【化 3 1 0 7】



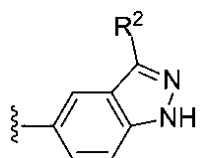
、

【化 3 1 0 8】



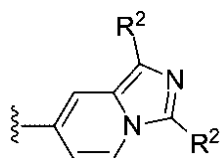
、

【化 3 1 0 9】



または

【化 3 1 1 0】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R^1 は、 H 、 $-\text{CN}$ 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-\text{O}-$ ($\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキル)、 $-\text{O}-$ (4～6員複素環) または $-\text{O}-$ ($\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル) であり、この場合、 R^1 が H でも $-\text{CN}$ でもハロゲンでもないとき、 R^1 は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり；

R^3 は、 H または F であり；

R^{11} は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R^{21} は、 H 、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、 H 、ハロゲンまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{24} は、 H 、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{N}(\text{R}^{241})_2$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(\text{C}_3 \sim \text{C}_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_t-\text{O}_u-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{O}-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

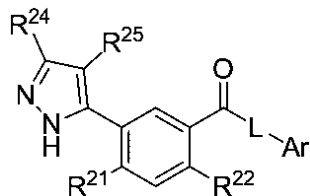
u は、0 または 1 であり；

ただし、 u が 1 であるとき、 t は 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、 H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルであり；

R^{25} は、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})-\text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_2$ アルキルまたはシクロプロピルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または
(e) 式 (XIII)：

【化3111】

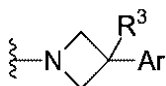


(XIII)

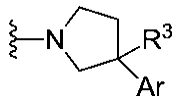
(式中、

$\text{L}-\text{Ar}$ は、

【化3112】

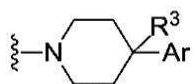


【化3113】



または

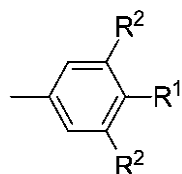
【化 3 1 1 4】



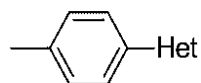
であり；

Ar は、

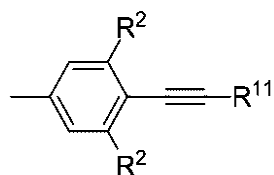
【化 3 1 1 5】



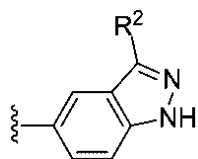
【化 3 1 1 6】



【化 3 1 1 7】

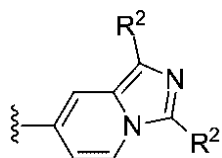


【化 3 1 1 8】



または

【化 3 1 1 9】



であり；

Het は、5～6員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄アルキル、-O-(C₃～C₅シクロアルキル)、-O-(4～6員複素環)または-O-(C₁～C₄アルキル)であり、この場合、R¹がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

各 R^{24} 及び R^{25} は、独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - CN$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}) - N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O_u - (4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t - O - (C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

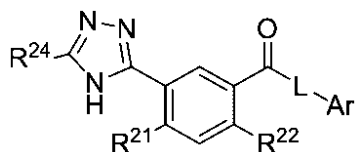
各 t は、独立して、0 または 1 であり；

各 u は、独立して、0 または 1 であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(f) 式 (XIV)：

【化 3 1 2 0】

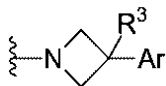


(XIV)

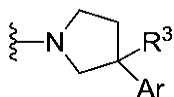
(式中、

$L - Ar$ は、

【化 3 1 2 1】

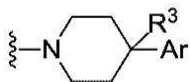


【化 3 1 2 2】



または

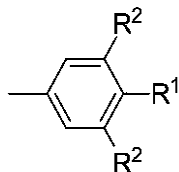
【化 3 1 2 3】



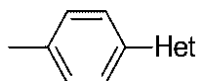
であり；

Ar は、

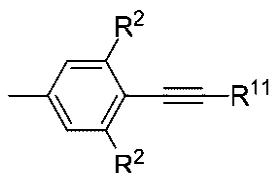
【化 3 1 2 4】



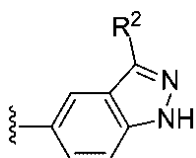
【化 3 1 2 5】



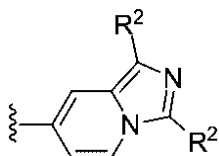
【化 3 1 2 6】



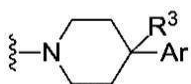
【化 3 1 2 7】



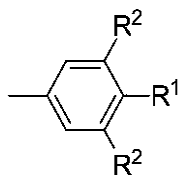
または
【化 3 1 2 8】



であり、ただし、L - A r が
【化 3 1 2 9】



であるとき、A r は
【化 3 1 3 0】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R ¹ は、H、- C N、ハロゲン、C ₁ ～ C ₄ アルキル、- O - (C ₃ ～ C ₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C ₁ ～ C ₄ アルキル) であり、この場合、R ¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R ¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に

応じて置換されており；

各 R^2 は、独立して、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R^3 は、HまたはFであり；

R^{11} は、Hまたは $-CH_3$ であり；

R^{21} は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

R^{22} は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

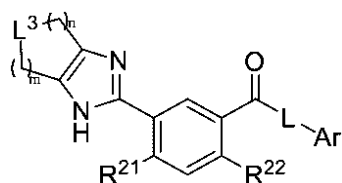
R^{24} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})-OH$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-N(R^{241})_2$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(C_3 \sim C_5 \text{ シクロアルキル})$ 、 $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O_t-(4 \sim 6 \text{ 員複素環})$ または $-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_t-O-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ であり、この場合、

各 t は、独立して、0または1であり；

各 R^{241} は、独立して、Hまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルである）もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(g) 式(XV)：

【化3131】



(XV)

(式中、

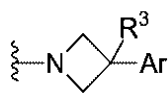
L^3 は、 $-CH_2-$ 、 $-CHR^{50}-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{50}-$ 、 $-NC(O)R^{50}-$ または $-NC(O)OR^{50}-$ であり、この場合、 R^{50} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ シクロアルキルまたは4～6員複素環であり；

n は、1、2または3であり；

m は、1または2であり、ただし、 $n+m \leq 3$ であり；

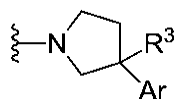
$L-Ar$ は、

【化3132】



、

【化3133】



または

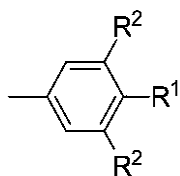
【化3134】



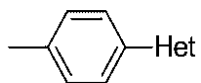
であり；

Ar は、

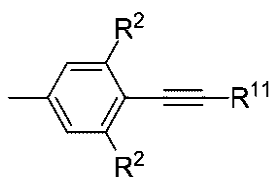
【化 3 1 3 5】



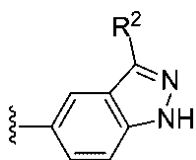
【化 3 1 3 6】



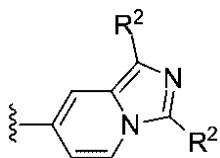
【化 3 1 3 7】



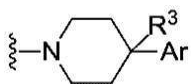
【化 3 1 3 8】



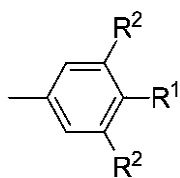
【化 3 1 3 9】



【化 3 1 4 0】



【化 3 1 4 1】



ではなく；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O-(C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O-(4 ～ 6 員複素環)または-O-(C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ がHでも-CNでもハロゲンでもないとき、R¹ は、1つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、HまたはFであり；

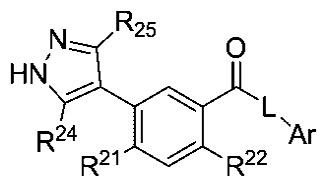
R¹¹ は、Hまたは-CH₃であり；

R²¹ は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは4 ～ 6 員複素環であり；

R²² は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである)もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(h) 式 (XVI)：

【化3142】

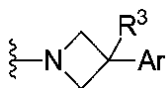


(XVI)

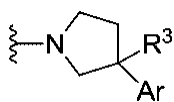
(式中、

L-Arは、

【化3143】

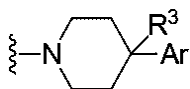


【化3144】



または

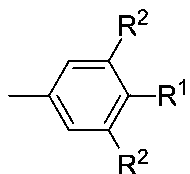
【化3145】



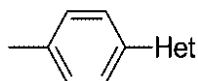
であり；

Arは、

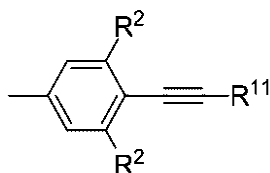
【化3146】



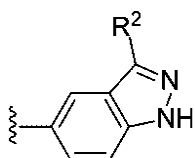
【化 3 1 4 7】



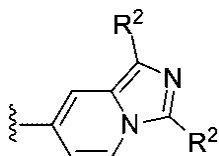
【化 3 1 4 8】



【化 3 1 4 9】



または
【化 3 1 5 0】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- C N、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環) または - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - C N でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - C H₃ であり；

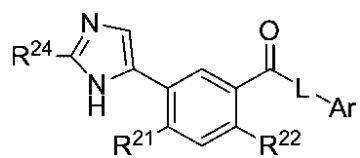
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} 及び R^{2 5} のそれぞれは、独立して、H、- C₁ ～ C₄ アルキルまたはハロゲンである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(i) 式 (X V I I) ；

【化 3 1 5 1】

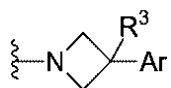


(X V I I)

(式中、

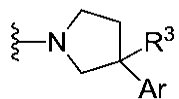
L - A r は、

【化 3 1 5 2】



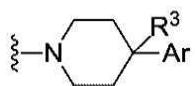
、

【化 3 1 5 3】



または

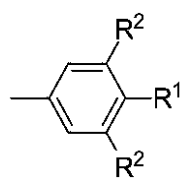
【化 3 1 5 4】



であり、

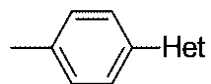
A r は、

【化 3 1 5 5】



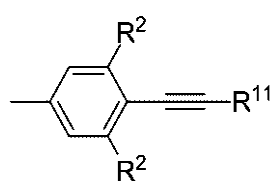
、

【化 3 1 5 6】



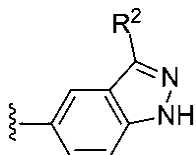
、

【化 3 1 5 7】



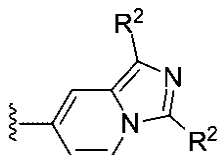
、

【化 3 1 5 8】



または

【化 3 1 5 9】



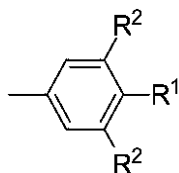
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 1 6 0】



であるとき、Ar は

【化 3 1 6 1】



ではなく；

Het は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、-O- (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、-O- (4 ～ 6 員複素環) または -O- (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；R³ は、H または F であり；R^{1 1} は、H または -CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、H、C₁ ～ C₄ アルキル、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - OH、- (C₁ ～ C₄ アルキル) - N (R^{2 4 1})₂、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- (C₁ ～ C₄ アルキル)_t - O_u - (4 ～ 6 員複素環) または - (C₁ ～ C₄ アルキル) - O - (C₁ ～ C₄ アルキル) であり、この場合、

t は、0 または 1 であり；

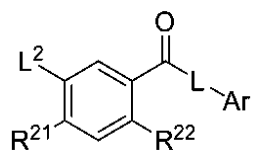
u は、0 または 1 であり；

ただし、u が 1 であるとき、t は 1 であり；

R^{2 4 1} は、H または C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(j) 式 (X V I I I) :

【化 3 1 6 2】

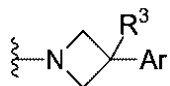


(X V I I I)

(式中、

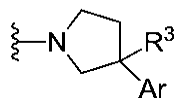
L - A r は、

【化 3 1 6 3】



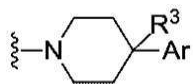
、

【化 3 1 6 4】



または

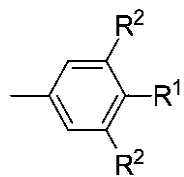
【化 3 1 6 5】



であり ;

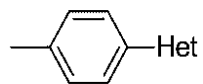
A r は、

【化 3 1 6 6】



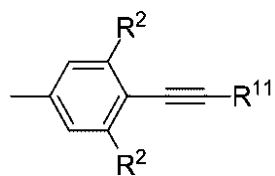
、

【化 3 1 6 7】

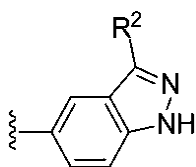


、

【化 3 1 6 8】

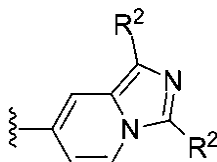


【化 3 1 6 9】



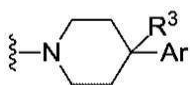
または

【化 3 1 7 0】



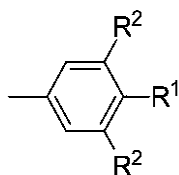
であり、ただし、L - Ar が

【化 3 1 7 1】



であるとき、Ar は

【化 3 1 7 2】



ではなく；

L² は、- NHR^{3 5 1} または - C(O)NHR^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールであり；

Het は、5 ~ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₃ ~ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ~ 6 員複素環)、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

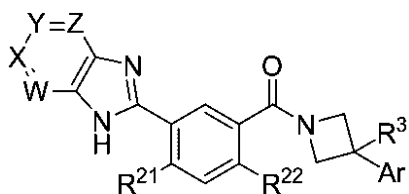
R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₄ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキルまたは 4 ~ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ~ C₂ アルキルであり；

R^{3 5} は、- C(O)R^{3 5 1}、- C(O)NHR^{3 5 1}、C(O)OR^{3 5 1} または S(O)₂R^{3 5 1} であり、この場合、R^{3 5 1} は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₅ シクロアルキル、4 ~ 6 員複素環、アリールまたはヘテロアリールである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(k) 式 (XIX)：

【化 3 1 7 3】



(X I X)

(式中、

各 W、X、Y 及び Z は、独立して、- N - または - C R^{2 6} - であり、ただし、W、X、Y 及び Z のうち、- N - であるのは 2 つ以下であり；

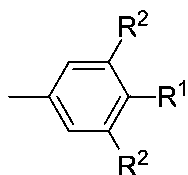
各 R^{2 6} は、独立して、H、C₁ ~ C₄ アルキル、- O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (R^{2 7})₂、- S (O)₂ - (C₁ ~ C₄ アルキル)、または - C (O) - (C₁ ~ C₄ アルキル) であり；

各 R^{2 7} は、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであり、あるいは、R^{2 7} は、両方とも C₁ ~ C₄ アルキルであり、それらが結合している N と一緒になって互いに連結して、3 ~ 6 員環を形成し、この場合、環は、環員の 1 つとして 1 つの酸素原子を必要に応じ

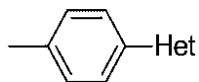
て含み、

A r は、

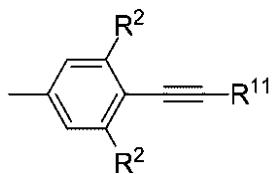
【化 3 1 7 4】



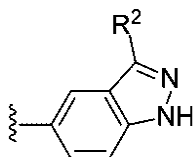
【化 3 1 7 5】



【化 3 1 7 6】

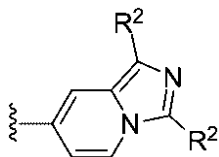


【化 3 1 7 7】



または

【化 3 1 7 8】



であり；

H e t は、5 ～ 6 員ヘテロアリールであり；

R¹ は、H、- CN、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、- O - (C₃ ～ C₅ シクロアルキル)、- O - (4 ～ 6 員複素環)、- O - (C₁ ～ C₄ アルキル)であり、この場合、R¹ が H でも - CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じ

て置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁ ～ C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

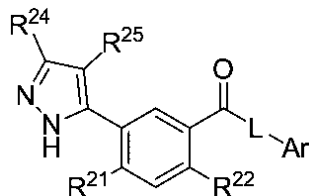
R^{1 1} は、H または - CH₃ であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁ ～ C₄ アルキル、C₃ ～ C₅ シクロアルキルまたは 4 ～ 6 員複素環であり；

R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁ ～ C₂ アルキルである) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(1) 式 (X X) ；

【化 3 1 7 9】

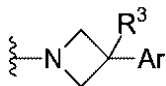


(X X)

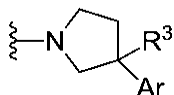
(式中、

L - A r は、

【化 3 1 8 0】

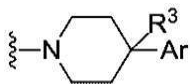


【化 3 1 8 1】



または

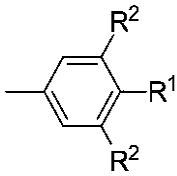
【化 3 1 8 2】



であり；

Ar は、

【化 3 1 8 3】



であり；

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (4～6 員複素環) または -O- (C₁～C₄ アルキル) であり、この場合、R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、水素、ハロゲンまたは C₁～C₄ アルキルであり；

R³ は、H または F であり；

R^{2 1} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキル、C₃～C₅ シクロアルキルまたは 4～6 員複素環であり；

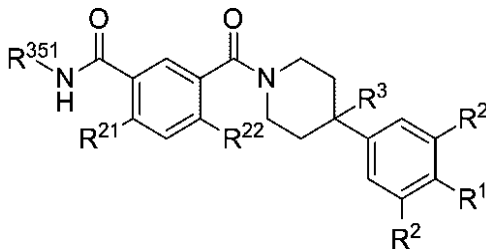
R^{2 2} は、H、ハロゲンまたは C₁～C₂ アルキルであり；

R^{2 4} は、-O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₁～C₄ アルキル) -O- (C₁～C₄ アルキル)、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、または -O- (4～6 員複素環) であり、この場合、R^{2 4} は、1 つ以上のヒドロキシルまたはハロゲンで必要に応じて置換されており；

R^{2 5} は、H、ハロゲン、C₁～C₄ アルキルまたは C₃～C₅ シクロアルキルであり、この場合、R^{2 5} は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されている) もしくはその薬学的に許容され得る塩；または

(m) 式 (XI)：

【化 3 1 8 4】



(XI)

(式中、

R¹ は、H、-CN、ハロゲン、C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル、-O- (C₃～C₅ シクロアルキル)、-O- (C₁～C₄ 直鎖または分枝鎖アルキル) であり、この場合、

C₃～C₅ シクロアルキルは、酸素または窒素ヘテロ原子を必要に応じて含み；

R¹ が H でも -CN でもハロゲンでもないとき、R¹ は、1 つ以上のハロゲンで必要に応じて置換されており；

各 R² は、独立して、H、ハロゲンまたは C₁～C₄ 直鎖もしくは分枝鎖アルキルであり；

R³ は、H、-OH またはハロゲンであり；

R^{2 1} は、シクロブチル、アゼチジン-1-イル、またはシクロプロピルであり；

R^{2 2} は、H、ハロゲン、C₁～C₂ アルキルであり；

R^{3 5 1} は、C₁～C₂ アルキルまたは C₂-O- (C₁ もしくは C₂ アルキル) である) もしくはその薬学的に許容され得る塩の式を有する脂肪酸シンターゼ阻害剤を投与する

ことを含む、方法。

(項目 2 5)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (I X)、(X)、(X I I)、(X I V)、(X V) または (X X) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 2 6)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (I X) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 2 7)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 2 8)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X I I) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 2 9)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X I V) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 3 0)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X V) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

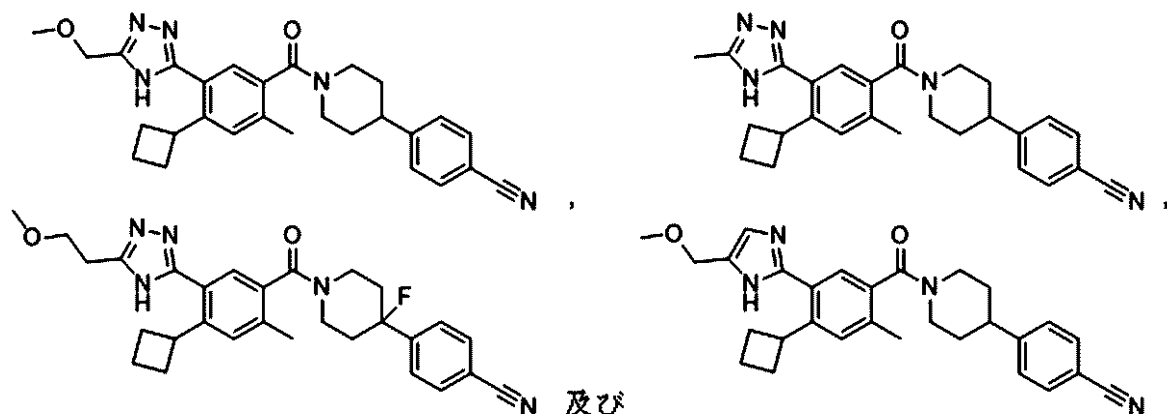
(項目 3 1)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、式 (X X) を有する、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 3 2)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 3 1 8 5】

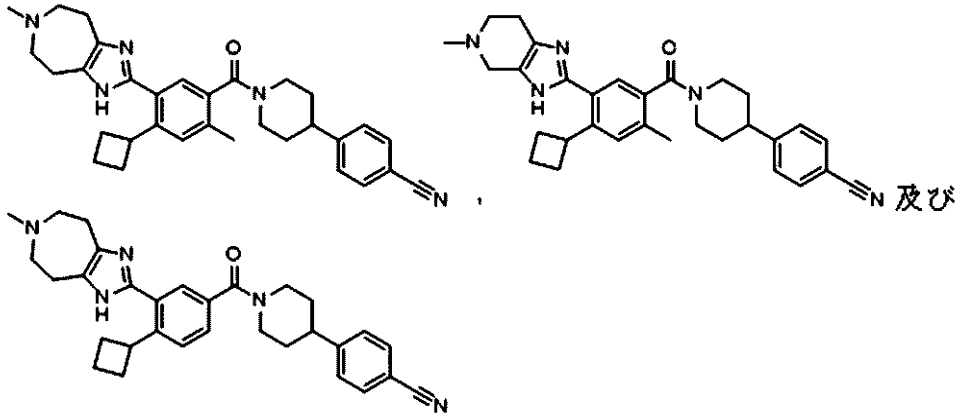


から選択される、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 3 3)

前記脂肪酸シンターゼ阻害剤が、

【化 3 1 8 6】



から選択される、項目 1 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の方法。

(項目 3 4)

前記疾患または状態が、家族性地中海熱 (F M F)、化膿性関節炎、壊疽性膿皮症、ざ瘡 (P A P A)、クリオピリン関連周期熱症候群 (C A P S)、高 I g D 症候群 (H I D S)、成人及び若年スチル病、シュニッツラー症候群、T N F 受容体関連周期性症候群 (T R A P S)、ブラウ症候群、スウィート症候群、I L - 1 受容体拮抗分子欠損症 (D I R A)、再発性特発性心膜炎、マクロファージ活性化症候群 (M A S)、蕁麻疹様血管炎、抗合成酵素症候群、再発性軟骨炎、ベーチェット病、エルドハイム・チェスター症候群 (組織球症)、滑膜炎、ざ瘡、膿疱症、骨化症、骨炎 (S A P H O)、関節リウマチ、周期熱、アフタ性口内炎、咽頭炎、リンパ節炎症候群 (P F A P A)、尿酸結晶性関節炎 (痛風)、2 型糖尿病、くすぶり型多発性骨髄腫、心筋梗塞後心不全、骨関節炎、輸血関連急性肺障害、人工呼吸器誘発肺損傷、特発性を含む肺線維症、慢性閉塞性肺疾患、ならびに喘息から選択される、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 3 5)

前記疾患または状態が、乾癬、関節リウマチ、多発性硬化症、強直性脊椎炎、炎症性腸疾患、喘息、腫瘍形成及び移植拒絶反応から選択される、項目 2 0 または 2 1 に記載の方法。

(項目 3 6)

前記上昇したヘルパー T 細胞が、 $T_h 1$ 、 $T_h 2$ 、 $T_h 9$ または $T_h 17$ である、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 3 7)

前記上昇したヘルパー T 細胞が、 T_{17} である、項目 3 6 に記載の方法。

(項目 3 8)

T_{reg} 細胞が抑制されている、項目 2 1 に記載の方法。

(項目 3 9)

前記非アルコール性脂肪性肝炎を処置することが、確立された非アルコール性脂肪性肝炎の少なくとも 1 つの症状を逆転させることを含む、項目 1 3 に記載の方法。

(項目 4 0)

前記非アルコール性脂肪性肝炎を処置することが、非アルコール性脂肪性肝炎の少なくとも 1 つの症状の進行を防ぐことを含む、項目 1 3 に記載の方法。

(項目 4 1)

前記症状が、A S T レベルの上昇、A L T レベルの上昇、肝臓トリグリセリドレベルの上昇、コレステロールレベルの上昇、肝脂肪化、肝炎症、肝臓風船化、肝線維化及び N A F L D 活動性スコアから選択される、項目 3 9 または 4 0 に記載の方法。