

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 3 年 4 月 22 日 (2021.4.22)

【公表番号】特表 2020-515631 (P2020-515631A)

【公表日】令和 2 年 5 月 28 日 (2020.5.28)

【年通号数】公開・登録公報 2020-021

【出願番号】特願 2019-571826 (P2019-571826)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/02 (2006.01)

C 0 7 D 237/30 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/405 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

C 0 7 D 231/56 (2006.01)

C 0 7 D 239/74 (2006.01)

C 0 7 D 215/06 (2006.01)

C 0 7 D 217/04 (2006.01)

C 0 7 D 319/18 (2006.01)

C 0 7 D 215/233 (2006.01)

C 0 7 D 265/36 (2006.01)

C 0 7 D 209/08 (2006.01)

C 0 7 D 217/26 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 C 57/62 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/02

C 0 7 D 237/30 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 8 E

C 0 7 D 471/04 1 0 5

A 6 1 K 31/472

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 K	31/502	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/357	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/4192	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/405	
A 6 1 K	31/4725	
C 0 7 D	231/56	Z
C 0 7 D	239/74	
C 0 7 D	215/06	
C 0 7 D	217/04	
C 0 7 D	319/18	
C 0 7 D	215/233	
C 0 7 D	471/04	1 0 1
C 0 7 D	265/36	
C 0 7 D	471/04	1 0 8 X
C 0 7 D	209/08	
C 0 7 D	217/26	
C 0 7 D	231/56	C
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 C	57/62	

## 【手続補正書】

【提出日】令和3年3月12日(2021.3.12)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

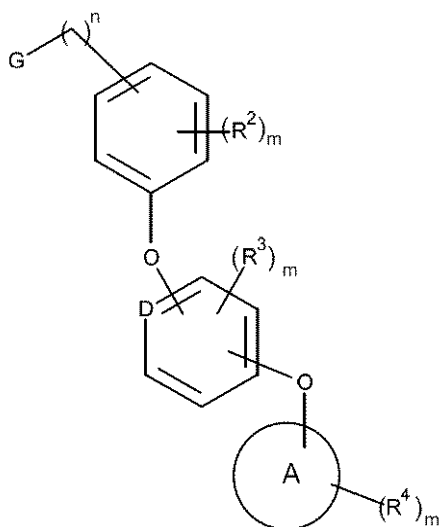
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩

## 【化 1】



式 (I)

(式中、

Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はS からそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環であり、

DはCR<sup>1</sup>又はN から選択され、

Gは-C(O)OR<sup>1</sup>、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-SO<sub>p</sub>R<sup>1</sup>、-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>又はO、N、又はS からそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5-7員環の単環式基から選択され、

R<sup>1</sup>は水素、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル又はC<sub>5-10</sub>ヘテロシクルから選択され、ここでC<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、及びC<sub>5-10</sub>ヘテロシクルは任意にC<sub>1-6</sub>アルキルで置換され、

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C(O)R<sup>1</sup>、R<sup>1</sup>C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-OC(O)R<sup>1</sup>、R<sup>6</sup>、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>C(O)R<sup>6</sup>、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>a</sup>C(O)-、-C<sub>1-6</sub>アルコキシC(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-NR<sup>a</sup>C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、C<sub>1-6</sub>アルコキシアミノ、アジド、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、ペルハロC<sub>1-6</sub>アルキル、-C(S)R<sup>a</sup>、-C(O)OR<sup>1</sup>、C<sub>1-6</sub>アルキルC(O)OR<sup>b</sup>、OC(O)C<sub>1-6</sub>アルキルオキシ、OR<sup>a</sup>C(O)OR<sup>b</sup>、C<sub>1-6</sub>アルキルOC(O)OC<sub>1-6</sub>アルキルオキシ、-SO<sub>3</sub>H、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>C<sub>1-6</sub>アルキルチオ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

R<sup>6</sup>は水素、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>OR<sup>6</sup>、ハロゲン、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>C(O)R<sup>6</sup>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル又はC<sub>5-10</sub>ヘテロシクルからなる群から選ばれ、ここでC<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>5-10</sub>ヘテロシクルは任意にC<sub>1-6</sub>アルキルで置換され、ここで、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル及びC<sub>5-10</sub>ヘテロシクルは場合により、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルコシアルキル、ハロゲン、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、ペルハロC<sub>1-6</sub>アルキル、シアノ、-シアノC<sub>1-6</sub>アルキル-、アミノ、-C(O)OR<sup>1</sup>、OR<sup>5</sup>、-OC(O)R<sup>6</sup>、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>6</sup>、-SR<sup>6</sup>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>又は-NR<sup>6</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>6</sup>から選択される一つ以上の置換基で置換され、

R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>及びR<sup>8</sup>は水素、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>OR<sup>6</sup>、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-(CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)<sub>m</sub>C(O)R<sup>6</sup>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>2-6</sub>アルケニル、C<sub>2-6</sub>アルキニル、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>5-10</sub>ヘテロシクルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、C<sub>6-10</sub>アリール、C<sub>5-10</sub>ヘテロアリール、C<sub>3-6</sub>シクロアルキルおよびC<sub>5-10</sub>ヘテロシクルは場合によりC<sub>1-6</sub>アルキルで置換されるか、または

$R^7$  及び  $R^8$  は一緒になって、O、N又はSから選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を含む単環式又は二環式の飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリル環を形成し、ここで該単環式又は二環式の飽和または部分不飽和のカルボシクリルまたはヘテロシクリル環はさらに場合によりハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$  ヘテロアリールからそれぞれ選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$  ヘテロアリールは場合により $C_{1-6}$  アルキルで置換され、

$R^a$  及び  $R^b$  は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$  アルキル、 $-SO_pR^1$  及び $C_{1-6}$  アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$  及び  $R^b$  は一緒になって、O、N又はSから選ばれる 1 ~ 5 個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式基を形成し、

$m$  は 0 ~ 4 であり、

$n$  は 0 ~ 3 であり、

$p$  は 0 ~ 2 である。)

#### 【請求項 2】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はS からそれぞれ選ばれる 1 ~ 5 個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環であり、

Dは $CR^1$  又はN から選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$  又はO、N、又はS からそれぞれ選ばれる 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$  は水素、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル又は $C_{5-10}$  ヘテロシクリルから選択され、ここで $C_{6-10}$  アリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、及び $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$  アルキルで置換され、

$R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  は水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NR^aR^b$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$  アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-SO_2NR^aR^b-$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$  アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$  アルキル、 $-C(S)R^a$ 、 $-C(O)OR^1$ 、 $C_{1-6}$  アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$  アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b-$ 、 $C_{1-6}$  アルキル  $OC(O)O$   $C_{1-6}$  アルキルオキシ、 $-SO_3H$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$   $C_{1-6}$  アルキルチオ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$  は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル又は $C_{5-10}$  ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$  アルキルで置換され、ここで、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル及び $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、 $C_{1-6}$  アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$  アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$  アルキル $-$ 、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$  又は $-NR^6S(O)_2R^6$  から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$  及び  $R^8$  は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{5-10}$  ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、及び  $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは $C_{1-6}$  アルキルに任意で置換され、

並びに $R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクル又はヘテロシクルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクルまたはヘテロシクルはさらに任意にハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、

$n$ は1から3までであり、

$p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

### 【請求項3】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環であり、Dは $CR^1$ 又はNから選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$ は水素、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、又は $C_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NR^aR^b$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-SO_2NR^aR^b-$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(S)R^a$ 、 $-C(O)OR^1$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b-$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ、 $-SO_3H$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $C_{1-6}$ アルキルチオ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクルからなる群から選ばれ、ここで $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$ アルキル $-$ 、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$ ア

リール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリーール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び  $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは $C_{1-6}$ アルキルに任意で置換され、並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルはさらに任意にハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリーールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリーールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、

$n$ は1から3までであり、

$p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

#### 【請求項4】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む不飽和複素環を完全に又は部分的に有し、

Dは $CR^1$ 又はNから選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$ は水素、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリーール、又は $C_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び $C_{5-10}$ ヘテロアリーールは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NR^aR^b$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-SO_2NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(S)R^a$ 、 $-C(O)OR^1$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ、又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリーール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリーール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリーール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$ アルキル $-$ 、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリーール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリーール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$ ア

リール、 $C_{5-10}$  ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び  $C_{5-10}$  ヘテロシクリルは $C_{1-6}$ アルキルに任意で置換され、並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルさらに任意にハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、 $n$ は1から3までであり、 $p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

#### 【請求項5】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む不飽和複素環を完全に又は部分的に有し、

Dは $CR^1$ 又はNから選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$ は水素、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、又は $C_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NH_2$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$ アルキル、 $-$ アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び  $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは $C_{1-6}$ アルキルに任意で置換され、

並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不

飽和のカルボシクル又はヘテロシクルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクルまたはヘテロシクルさらに任意にハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)_mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、 $n$ は1から3までであり、 $p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

#### 【請求項6】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む不飽和複素環を完全に又は部分的に有し、

Dは $CR^1$ 又はNから選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$ は水素、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、又は $C_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NH_2$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR_aC(O)OR_b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクルからなる群から選ばれ、ここで $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$ アルキル $-$ 、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $C_{3-5}$ シクロアルキル、5-7員環ヘテロシクルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $C_{3-5}$ シクロアルキル、及び5-7員環ヘテロシクルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクル又はヘテロシクルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクルまたはヘテロシクルさらに任意にハロ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニ

トロ、シアノ、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{OR}^6$ 、 $-\text{SR}^6$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{NR}^7\text{R}^8$ 、オキソ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{COOR}^6$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリールは $\text{C}_{1-6}$ アルキルで置換され、

$\text{R}^a$ 及び $\text{R}^b$ は水素、 $-\text{OR}^6$ 、ハロゲン、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{SO}_p\text{R}^1$ 及び $\text{C}_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $\text{R}^a$ 及び $\text{R}^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、 $n$ は1から3までであり、 $p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

#### 【請求項7】

式中Aは置換又は非置換の $\text{C}_{5-10}$ の二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む不飽和複素環を完全に又は部分的に有し、

式中Dは $\text{CR}^1$ 又はNから選択され、

Gは $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^1$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^1\text{SO}_2\text{R}^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$\text{R}^1$ は水素、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリール、又は $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、及び $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリールは任意に $\text{C}_{1-6}$ アルキルで置換され、

$\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ は水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^1$ 、 $\text{R}^1\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^1$ 、 $\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^1$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}_{1-6}$ アルコキシ $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ 、 $\text{NR}^a\text{OH}$ 、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル $\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{C}_{1-6}$ アルキルオキシ、 $\text{OR}^a\text{C}(\text{O})\text{OR}^b-$ 、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル $\text{OC}(\text{O})\text{O}$   $\text{C}_{1-6}$ アルキルオキシ、 $\text{OR}^a\text{C}(\text{O})\text{OR}^b-$   $\text{C}_{1-6}$ アルキル $\text{OC}(\text{O})\text{O}$   $\text{C}_{1-6}$ アルキルオキシ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$\text{R}^6$ は水素、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{OR}^6$ 、ハロゲン、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル又は $\text{C}_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $\text{C}_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{6-10}$ アリール、 $\text{C}_{5-10}$ ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル及び $\text{C}_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシアルキル、ハロゲン、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $\text{C}_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-\text{シアノ}$   $\text{C}_{1-6}$ アルキル-、アミノ、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^1$ 、 $\text{OR}^5$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{C}(\text{O})\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $-\text{SR}^6$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 又は $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$\text{R}^5$ 、 $\text{R}^7$ 及び $\text{R}^8$ は水素、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{OR}^6$ 、 $\text{C}_{1-4}$ ハロアルキル、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $\text{C}_{2-4}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-4}$ アルキニル、 $\text{C}_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-5}$ シクロアルキル、5-7員環ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $\text{C}_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-5}$ シクロアルキル、及び5-7員環ヘテロシクリルは任意に $\text{C}_{1-6}$ アルキルで置換され、ここで、 $\text{C}_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $\text{C}_{3-5}$ シクロアルキル、及び5-7員環ヘテロシクリルは任意に $\text{C}_{1-6}$ アルキルで置換され、並びに、

$\text{R}^7$ 及び $\text{R}^8$ はO、N又はSから選択される1～4個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルさらに任意にハロ、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{OR}^6$ 、 $-\text{SR}^6$ 、 $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_m\text{NR}^7\text{R}^8$ 、 $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $-\text{SR}^6$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^7\text{R}^8$ 又は $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_2\text{R}^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

<sup>b</sup>)  $mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)_mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、 $R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、 $n$ は1から3までであり、 $p$ は0～2である、

請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

#### 【請求項8】

式中Aは置換又は非置換の5-10員環二環式又は多環式でO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～5個のヘテロ原子を含む不飽和複素環を完全に又は部分的に有し、

式中Dは $CR^1$ 又はNから選択され、

Gは $-C(O)OR^1$ 、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^1SO_2R^1$ 又はO、N、又はSからそれぞれ選ばれる1～4個のヘテロ原子を含む完全にまたは部分的に不飽和の複素環である5員環の単環式から選択され、

$R^1$ は水素、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、又は $C_{3-6}$ シクロアルキルから選択され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NH_2$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b-$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR^aC(O)OR^b-C_{1-6}$ アルキル $OC(O)OC_{1-6}$ アルキルオキシ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノC_{1-6}$ アルキル-、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)_mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)_mC(O)R^6$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{2-4}$ アルケニル、 $C_{2-4}$ アルキニル、 $C_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $C_{3-5}$ シクロアルキル、5-7員環ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $C_{3-5}$ シクロアルキル、及び5-7員環ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、ここで、 $C_{6-8}$ アリール、5-7員環ヘテロアリール、 $C_{3-5}$ シクロアルキル、及び5-7員環ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキル又で置換され、並びに、

$R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～4個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、

ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルさらに任意にハロ、 $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-(CR^aR^b)_mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、オキソ、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及

び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、  
 $R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、  
 $m$ は0～4であり、 $n$ は1から3までであり、 $p$ は0～2である、  
 請求項1に記載の式(I)で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

【請求項9】

以下からなる群：

- 2-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A1),  
 2-[3-[4-フタラジン-5-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A2),  
 3-[3-[4-フタラジン-5-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A3),  
 2-[3-[4-(8-クロロフタラジン-5-イル)オキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A4),  
 2-[3-[4-(1-メチルイミダゾール-7-イル)オキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A5),  
 2-[3-[4-(6-キノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A6),  
 ,  
 3-[3-[4-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-8-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A7),  
 2-[3-[4-[(5-フルオロ-8-イソキノリル)オキシ]-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A8),  
 2-[3-[4-キナゾリン-5-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A9),  
 3-[3-[4-[(2-メチル-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-8-yl)オキシ]-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A10),  
 3-[3-[4-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾキノリン-5-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A11),  
 3-[3-[4-(8-キノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A12),  
 3-[3-[4-(4-キノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A13),  
 3-[3-[4-(5-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]プロパン酸 (A14),  
 2-[3-[4-(2-メチルイミダゾール-4-イル)オキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A15),  
 2-[3-[4-(1-メチルイミダゾール-4-イル)オキシ-2-トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A16),  
 2-[3-[4-([1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-5-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A17),  
 2-[3-[4-(3,4-ジヒドロ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A18),  
 2-[3-[4-([1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン-7-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A19),  
 2-[3-[4-[1-(オキセタン-3-イル)インドール-6-イル]オキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A20),  
 2-[3-[4-[1-(オキセタン-3-イル)インダゾール-6-イル]オキシ-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A21),

- 2-[3-[4-[2-(オキセタン-3-イル)インダゾール-6-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A22),
- 2-[3-[4-[1-(オキセタン-3-イル)インダゾール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A23),
- 2-[3-[4-[2-(オキセタン-3-イル) インダゾール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A24),
- 2-[3-[4-[3-(オキセタン-3-イル)ベンゾトリダゾール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A25),
- 2-[3-[4-[3-(オキセタン-3-イル) ベンゾトリダゾール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A26),
- 2-[3-[4-[2-メチル-3-(オキセタン-3-イル) ベンゾトリダゾール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A27),
- 2-[3-[2-(ジフルオロメチル)-4-[2-メチル-3-(オキセタン-3-イル) ベンゾトリダゾール-5-yl] オキシ-フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A28),
- 2-[3-[4-[1-(オキセタン-3-イル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A29),
- 2-[3-[4-[1-(オキセタン-3-イル)ピロロ[2,3-b]ピリジン-6-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A30),
- 6-[4-[3-(カルボキシメチル)フェノキシ]-3-(トリフルオロメチル) フェノキシ]イミダゾ[1,5-a]ピリジン-3-カルボン酸 (A31),
- 2-[3-[4-[1-(カルボキシメチル)インドール-5-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A32),
- 2-[3-[4-[1-(カルボキシメチル)インドール-6-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A33),
- 3-[4-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]プロパン酸 (A34),
- 3-[3-[4-(2-メチルインダゾール-5-イル) オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]プロパン酸 (A35),
- 2-[3-[5-(8-イソキノリルオキシ)-3-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]オキシ] フェニル] 酢酸 (A36),
- 3-[3-[4-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-5-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]プロパン酸 (A37),
- 2-[3-[2-シクロプロピル-4-(8-イソキノリルオキシ)フェノキシ]フェニル]酢酸 (A38),
- 2-[3-[2-シクロプロピル-4-[2-メチル-3-(オキセタン-3-イル)ベンゾイミダゾール-5-イル]オキシ-フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A39),
- 2-[3-[4-[(1-クロロ-8-イソキノリル)オキシ]-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A40),
- 2-[3-[4-[(1-メチル-8-イソキノリル) オキシ]-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A41),
- 3-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]プロパン酸 (A42),
- 3-[3-[4-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-8-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] プロパン酸 (A43),
- 3-[3-[4-インダン-1-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] プロパン酸 (A44),
- 3-[3-[4-(1H-インダゾール-5-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] プロパン酸 (A45),
- 2-[3-[4-[(3-シアノ-1H-インダゾール-5-イル) オキシ]-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A46),
- 5-[4-[3-(カルボキシメチル)フェノキシ]-3-(トリフルオロメチル) フェノキシ]-1H-イン

ダゾール-3-カルボン酸 (A47),  
 2-[3-[4-(1Hインダゾール-4-イルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (A48),  
 2-[3-[4-イミダゾ[1,5-a]ピリジン-5-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (B1),  
 2-[3-[4-イミダゾ[1,5-a]ピリジン-8-イルオキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (B2),  
 2-[3-[4-(3-メチルイミダゾ[1,5-a]ピリジン-5-イル) オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (B3),  
 2-[3-[4-(3-メチルイミダゾ[1,5-a]ピリジン-8-イル) オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (B4),  
 2-[3-[4-[3-(オキセタン-3-イル)イミダゾ[1,5-a]ピリジン-6-イル] オキシ-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル] 酢酸 (B5),  
 2-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ]フェニル]-N-メチルスルホニル-酢酸塩 (C1),  
 3-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]プロパン酸塩 (C2),  
 2-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェノキシ] フェニル]酢酸塩 (C3),  
 8-[4-[3-[2-(4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)エチル] フェノキシ]-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]イソキノリン (D1),  
 8-[4-[3-[2-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル] フェノキシ]-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]イソキノリン (D2),  
 8-[4-[3-(1H-テトラゾール-5-イルメチル)フェノキシ]-3-(トリフルオロメチル) フェノキシ]イソキノリン (D3), 及び  
 2-[3-[4-(8-イソキノリルオキシ)-3-(トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル]酢酸 (E1)

から選択される、請求項 1 に記載の式 (I) で示される化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、または薬剤学的に許容される塩。

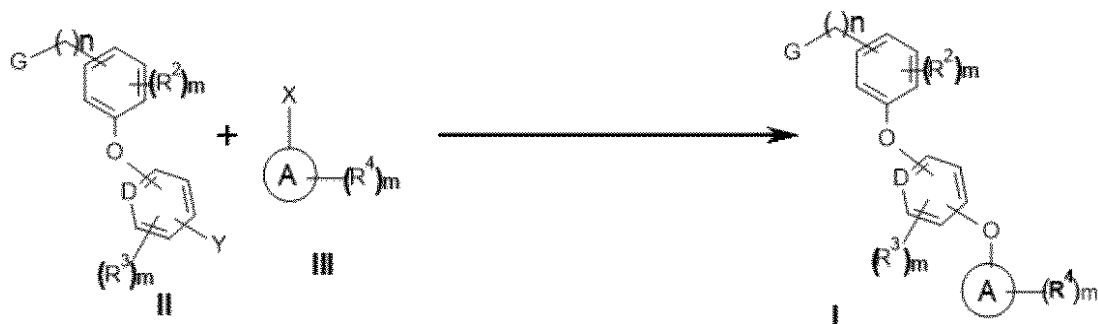
【請求項 10】

請求項 1 から 9 のいずれかに記載される式 (I) の化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、共結晶、又は薬剤学的に許容される塩の製造方法。

【請求項 11】

式 I の化合物が、式 I I の化合物と式 I I I の化合物との反応

【化 2】



により得られる、請求項 10 に記載の製造方法。

【請求項 12】

式 I I の G は -C(O)OR<sup>1</sup>、-C(O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-NR<sup>1</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>、又は O、N 又は S からそれぞれ選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する完全に又は部分的に不飽和の 5-7 員環の単環式より選ばれ、

R<sup>1</sup> は水素、C<sub>1-6</sub> ハロアルキル、C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>6-10</sub> アリール、C<sub>5-10</sub> ヘテロアリール、C

$C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクルから選択され、ここで $C_{6-10}$ アリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^2$ 及び $R^3$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NH_2$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $R^6$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-SO_2NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(S)R^a$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $-SO_3H$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $C_{1-6}$ アルキルチオ又はニトロからそれぞれ選ばれ、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $-C_{1-6}$ アルキル、シアノ、 $-シアノ$   $C_{1-6}$ アルキル $-$ 、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルはさらに任意にハロ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、 $R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、

$m$ は0～4であり、

$n$ は0～3であり、

$p$ は0～2であり、

式 I I I のAはO、N又はSからそれぞれ選択される1～5個のヘテロ原子を有する完全に又は部分的に不飽和の複素環を含む置換又は非置換の5-10員環の二環式又は多環式を意味し、

式 I I I の $R^4$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C(O)R^1$ 、 $R^1C(O)NH_2$ 、 $-OC(O)R^1$ 、 $R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、 $-NR^aC(O)-$ 、 $-C_{1-6}$ アルコキシ $C(O)NR^aR^b$ 、 $-SO_2NR^aR^b$ 、 $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、 $NR^aOH$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシアミノ、アジ化、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキルヒドロキシ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(S)R^a$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $C(O)OR^b$ 、 $OC(O)C_{1-6}$ アルキルオキシ、 $OR_aC(O)OR_b$ 、 $C_{1-6}$ アルキル $OC(O)O$   $C_{1-6}$ アルキロキシ、 $-SO_3H$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 、 $C_{1-6}$ アルキロチオ又はニトロからそれぞれ選択され、

$R^6$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群から選ばれ、ここで $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

ここで、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは任意に、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシアルキル、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ- $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、-シアノ  $C_{1-6}$ アルキル-、アミノ、 $-C(O)OR^1$ 、 $OR^5$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $-NR^6C(O)R^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_pR^6$ 、 $-S(O)_2NR^7R^8$ 又は $-NR^6S(O)_2R^6$ から選択される一つ以上の置換基で置換され、

$R^5$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は水素、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-(CR^aR^b)mC(O)R^6$ 、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリルからなる群からそれぞれ選択され、ここで、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロアリール、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び $C_{5-10}$ ヘテロシクリルは $C_{1-6}$ アルキルに任意で置換され、並びに $R^7$ 及び $R^8$ はO、N又はSから選択される1～5個のヘテロ原子を含む飽和又は部分不飽和のカルボシクリル又はヘテロシクリルを有する単環式又は二環式の形態にまとめられ、ここで単環式又は二環式のカルボシクリルまたはヘテロシクリルはさらに任意にハロ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、ニトロ、シアノ、 $-(CR^aR^b)mOR^6$ 、 $-SR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mNR^7R^8$ 、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル、 $-(CR^aR^b)mCOOR^6$ 、 $-(CR^aR^b)mC(O)NR^7R^8$ 、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル又は $C_{5-10}$ ヘテロアリールからそれぞれ選択される1～4個の置換基で置換され、ここで $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{5-10}$ ヘテロシクリル及び $C_{5-10}$ ヘテロアリールは $C_{1-6}$ アルキルで置換され、

$R^a$ 及び $R^b$ は水素、 $-OR^6$ 、ハロゲン、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、ペルハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_pR^1$ 及び $C_{1-6}$ アルキルからなる群からそれぞれ選ばれ、若しくは $R^a$ 及び $R^b$ はO、N又はSから選ばれる1～5個のヘテロ原子を任意に有する飽和または部分不飽和の単環式又は二環式の形態にまとめることができ、 $m$ は0～4であり、

$X$ 及び $Y$ はハロゲン、 $CF_3SO_3-$ 、ボロン酸エステル又はボロン酸からそれぞれ選択されるが、 $X$ 及び $Y$ が同じものであることはない、

請求項11に記載の製造方法。

#### 【請求項13】

請求項1から9のいずれかに記載される式(I)の化合物、その互変異性体、多形体、立体異性体、溶媒和物、薬剤学的に許容される塩を、薬剤学的に許容される担体と共に含有し、場合により一つ以上の他の医薬組成物との組み合わせられる、医薬組成物。

#### 【請求項14】

剤形が錠剤、カプセル、粉末、シロップ、溶液、エアロゾル、または懸濁剤である、請求項13に記載の医薬組成物。

#### 【請求項15】

GPR91により媒介される病態の治療薬の製造のための、請求項1から9のいずれか1つに記載の化合物の使用。

#### 【請求項16】

癌及び感染症を含む、種々の疾病の治療及び/又は予防のための医薬組成物であって、治療的有効量の請求項1から9のいずれかに記載される化合物と、他の臨床的に関連する細胞毒性薬剤又は非細胞毒性薬剤とを含む、医薬組成物。

#### 【請求項17】

新血管形成、黄斑変性、糖尿病性腎障害、肝臓病、炎症、癌、代謝性疾患、循環器系疾患、高血圧症、非アルコール性脂肪性肝炎(NASH)、脂肪肝疾患(FLD)、非アルコール性脂肪性肝疾患(NAFLD)または網膜新生血管の治療のための請求項16に記載の医薬組成物。

#### 【請求項18】

他の臨床的に関連する免疫調節剤をさらに含む、請求項 13、14 および 16 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物とを含む、医薬組成物。