

【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5年11月8日(2023.11.8)

【国際公開番号】WO2020/060914

【公表番号】特表2022-500473(P2022-500473A)

【公表日】令和4年1月4日(2022.1.4)

【出願番号】特願2021-515046(P2021-515046)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 9 3 / 0 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

A 6 1 P 3 7 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 9 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 9 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 7 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

A 6 1 P 2 7 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 1 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 9 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 2 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

30

A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 1 9 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 D 4 9 3 / 0 8 C S P

A 6 1 P 3 7 / 0 6

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 1 9 / 1 0

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 1 9 / 0 0

40

A 6 1 P 1 / 1 6

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 P 9 / 0 4

A 6 1 P 1 7 / 0 0

A 6 1 P 2 7 / 0 2

A 6 1 P 1 / 1 8

A 6 1 P 3 / 0 6

A 6 1 P 3 / 1 0

A 6 1 P 1 1 / 0 6

A 6 1 P 3 5 / 0 2

50

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 9/10 101

A 6 1 P 25/04

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/4192

## 【誤訳訂正書】

【提出日】令和5年10月30日(2023.10.30)

## 【誤訳訂正1】

10

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

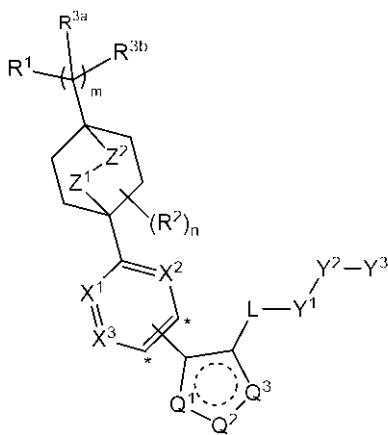
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

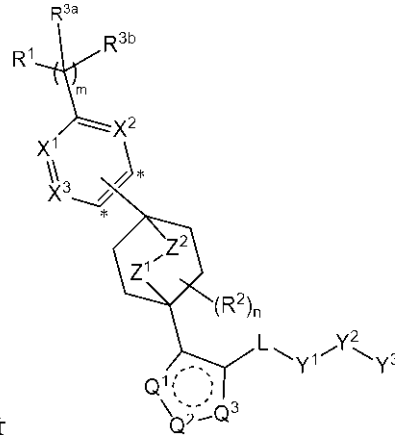
【請求項1】

式(I a)または(I b)：

【化1】



(I a) または



(I b)

20

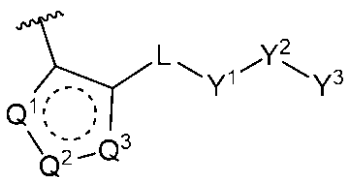
30

[式中：

 $Z^1$  および  $Z^2$  の一方が O であって、その他方が  $CH_2$  であり； $X^1$ 、 $X^2$ 、および  $X^3$  は、各々独立して、 $CR^6$  または N である；ただし、 $X^1$ 、 $X^2$  または  $X^3$  のうちの 2 個以下が N であり； $Q^1$ 、 $Q^2$ 、および  $Q^3$  は、独立して、N、O、 $NR^{5a}$ 、または  $CR^{5b}$  であって、破線の円形は芳香族環を形成する結合を意味する；ただし、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、および  $Q^3$  のうち少なくとも 1 個は  $CR^{5b}$  以外の基であり；

【化2】

40



で示される部分は、式(I a)または(I b)にある2個の星印(\*)の位置のうちの1個と結合し；

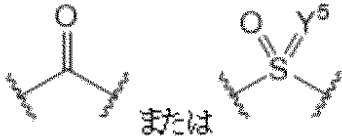
L は、独立して、共有結合または 0 ~ 4 個の  $R^9$  で置換される  $C_{1-4}$  アルキレンであり；

50

$Y^1$  は、独立して、Oまたは $NR^7$ であり；

$Y^2$  は、独立して、

【化3】



であり；

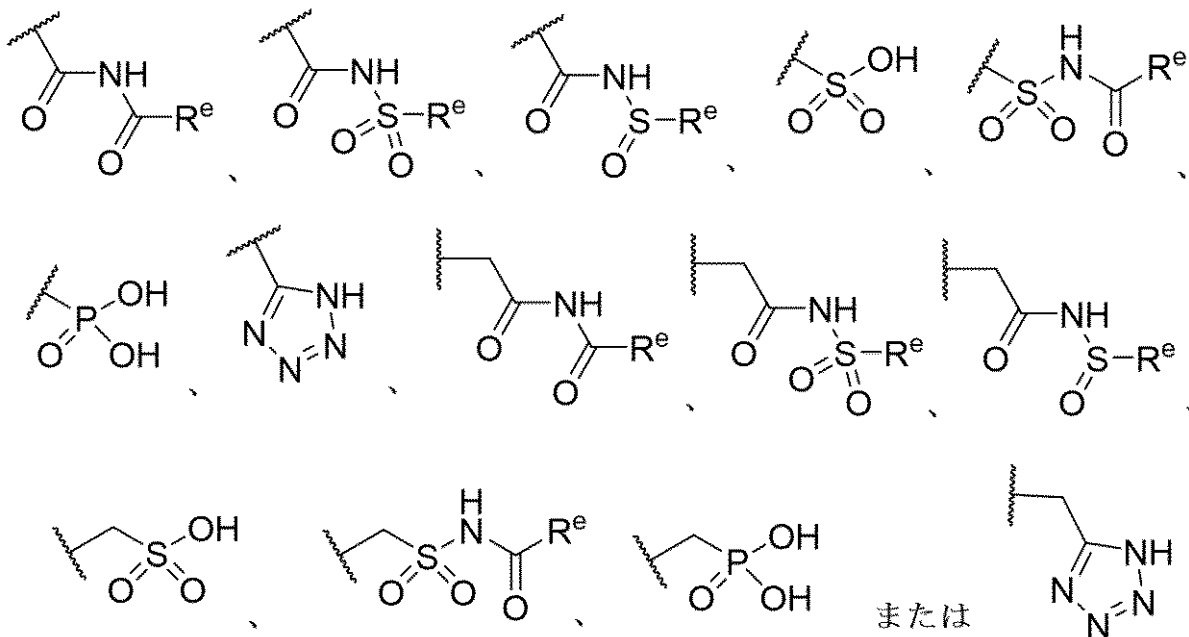
$Y^3$  は、独立して、 $OR^4$ または $NR^8R^4$ である：ただし、 $Y^1$ がOである場合、その時には $Y^3$ は $OR^4$ 以外の基であり；

10

$Y^5$  は、独立して、OまたはNHであり；

$R^1$  は、独立して、シアノ、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $-C(O)NR^{12a}R^{12b}$ 、

【化4】



であり；

$R^2$  は、各々独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $-(CH_2)_0-1-(C_{3-6}$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_0-1$ -フェニル、または $C_{1-6}$ アルキルであり；

$R^{3a}$  は、独立して、水素、ハロ、ヒドロキシル、または $C_{1-4}$ アルキルであり；

$R^{3b}$  は、独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、または0~2個の $R^a$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであるか；

40

あるいはまた、 $R^{3a}$ および $R^{3b}$ は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $C_{3-4}$ カルボシクリルを形成し；

$R^4$  は $-L_1-R^{4a}$ であり；

$L_1$  は、独立して、共有結合または0~4個の $R^9$ で置換される $C_{1-4}$ アルキレンであり；

$R^{4a}$  は、独立して、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{1-10}$ ハロアルキル、 $C_{1-10}$ アルケニル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、3ないし8員のヘテロシクリル、5ないし6員のヘテロアリールであり；ここで、該アルキル、アルケニル、アルキレン、

50

シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、その各々が、独立して、0 ~ 3 個の  $R^{10}$  で置換され；

$R^{5a}$  は、独立して、水素、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $-(CH_2)_{0-1}-(C_{3-6}$  シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0-1}$ -フェニル、または 0 ~ 3 個の  $R^a$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{5b}$  は、独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、 $C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $-(CH_2)_{0-1}-(C_{3-6}$  シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0-1}$ -フェニル、または 0 ~ 3 個の  $R^b$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^6$  は、各々独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、または 0 ~ 1 個の  $R^b$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^7$  および  $R^8$  は、各々独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、または  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^9$  は、各々独立して、ハロ、オキソ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、または 0 ~ 3 個の  $R^a$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{10}$  は、各々独立して、ハロ、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、フェニル、または 5 ないし 6 員のヘテロアリール、0 ~ 3 個の  $R^b$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{11}$ 、 $R^{12a}$ 、および  $R^{12b}$  は、各々独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、またはベンジルであり；

$R^a$  は、独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、または  $C_{1-4}$  ハロアルコキシであり；

$R^b$  は、独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、または  $C_{1-4}$  ハロアルコキシであり；

$R^e$  は、独立して、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、または 0 ~ 3 個の  $R^a$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

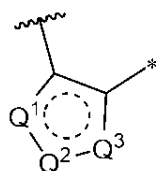
$m$  は、1 の整数であり；および

$n$  は、0、1、または 2 の整数である ]

で示される化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

【化 5】



で示される部分が、独立して、

10

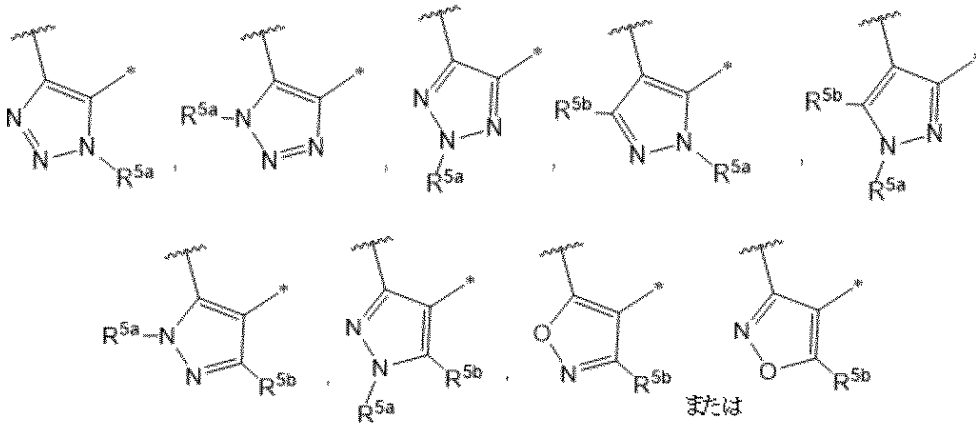
20

30

40

50

## 【化6】



10

であり；

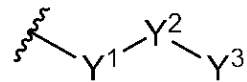
\* がLとの結合点を意味し；および

R<sup>5a</sup>およびR<sup>5b</sup>が請求項1にて定義されるとおりである、

請求項1に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項3】

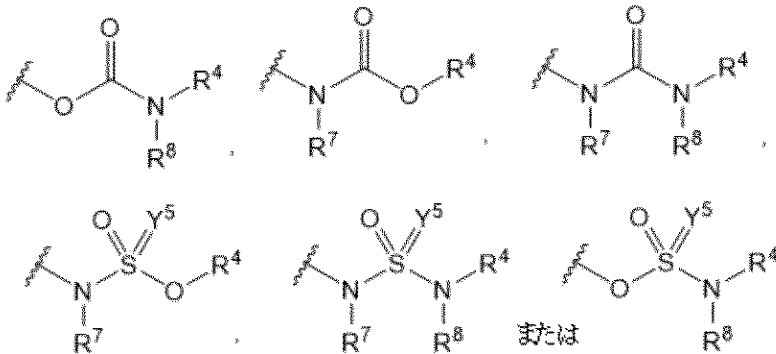
## 【化7】



20

で示される部分が、独立して、

## 【化8】



30

である、請求項1または2に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項4】

Lが、共有結合であるか、またはC<sub>1-2</sub>アルキレンである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

40

## 【請求項5】

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、およびX<sup>3</sup>が、独立して、CHまたはCR<sup>6a</sup>であるか；あるいは、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、およびX<sup>3</sup>のうちの1つがNであり、残りの基がCHまたはCR<sup>6a</sup>であって；R<sup>6a</sup>が、独立して、ハロ、ヒドロキシル、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、またはC<sub>1-4</sub>アルコキシである、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項6】

R<sup>3a</sup>およびR<sup>3b</sup>が、独立して、水素またはC<sub>1-4</sub>アルキルである、請求項1～5

50

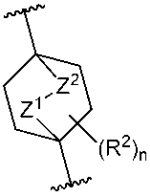
のいずれか一項に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 7】

$R^1$  が  $CO_2H$  である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 8】

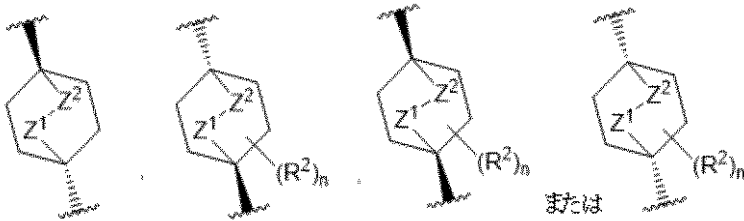
【化 9】



10

で示される部分が、独立して、

【化 10】



20

であり；

-  $Z^1 - Z^2$  - が  $-O-CH_2-$  または  $-CH_2-O-$  であって；

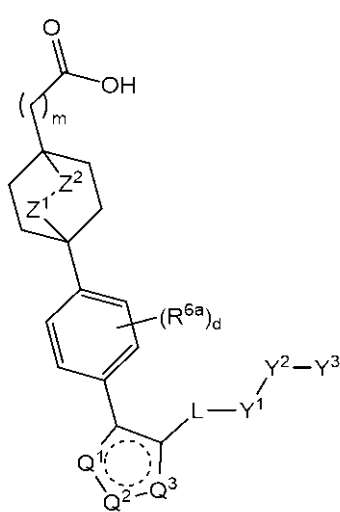
$n$  が 0 である、

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

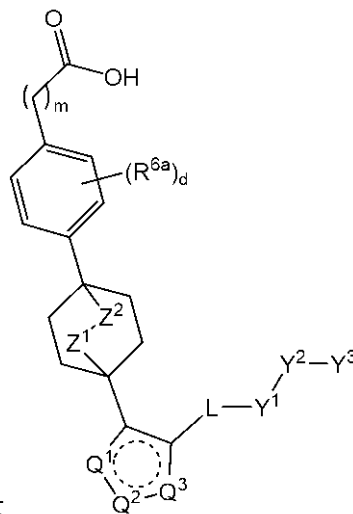
【請求項 9】

式 (I I a) または (I I b)：

【化 11】



(I I a) または



(I I b)

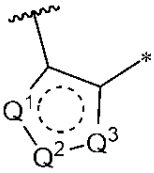
40

[ 式中：

-  $Z^1 - Z^2$  - は、 $-O-CH_2-$  または  $-CH_2-O-$  であり；

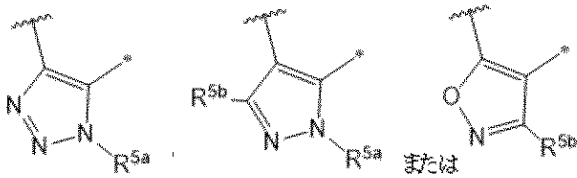
50

## 【化 1 2】



で示される部分は、独立して、

## 【化 1 3】



10

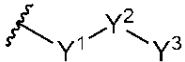
であり；

m は 1 または 2 の整数であり；

\* は L との結合点を意味し；

L は、独立して、共有結合または  $-CH_2-$  であり；

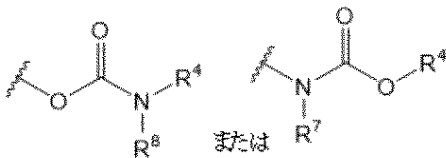
## 【化 1 4】



20

で示される部分は、独立して、

## 【化 1 5】



30

であり；

$R^4$  は、独立して、 $C_3-6$ シクロアルキル、 $-(CH_2)-C_3-6$ シクロアルキル、 $-(CH(C_{1-2}$ アルキル)) $-C_3-6$ シクロアルキル、 $-(CH_2)-$ フェニル、または $-(CH(C_{1-2}$ アルキル)) $-$ フェニルであって、ここで該シクロアルキルおよびフェニルは、各々独立して、0~3個の $R^{10}$ で置換され；

$R^{5a}$  は、独立して、 $C_1-6$ アルキル、または $-CH_2-(C_3-6$ シクロアルキル)であり；

$R^{5b}$  は、独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1-4$ アルキル、 $C_1-4$ アルコキシ、 $C_1-4$ ハロアルキル、または $C_1-4$ ハロアルコキシであり；

40

$R^{6a}$  は、各々独立して、ハロ、ヒドロキシル、 $C_1-6$ アルキル、 $C_1-4$ ハロアルキル、または $C_1-4$ アルコキシであり；

$R^7$  および  $R^8$  は、各々独立して、水素または $C_1-2$ アルキルであり；

$R^{10}$  は、各々独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1-6$ アルキル、 $C_1-6$ ハロアルキル、 $C_1-6$ アルコキシ、または $C_1-6$ ハロアルコキシであって；

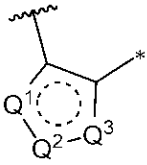
d は、独立して、0、1または2である]

で示される化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項 10】

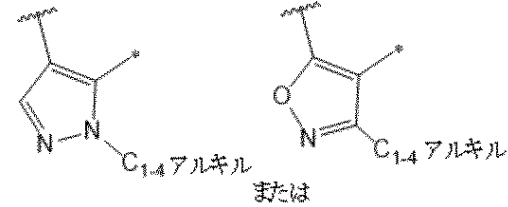
50

## 【化16】



で示される部分が、独立して、

## 【化17】



10

であり；

mが1の整数であり；および

R<sup>4</sup>が、独立して、-(CH<sub>2</sub>)-C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、-(CH(C<sub>1-2</sub>アルキル))-C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、-(CH<sub>2</sub>)-フェニル、または-(CH(C<sub>1-2</sub>アルキル))-フェニルであって、ここで該シクロアルキルおよびフェニルは、各々独立して、0~2個のR<sup>10</sup>で置換される

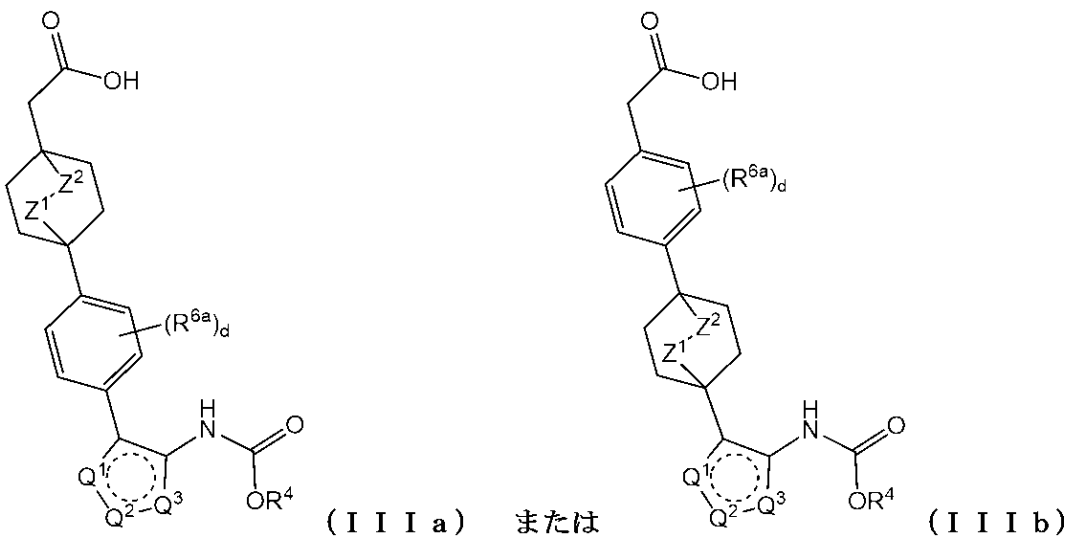
20

請求項9に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項11】

式(III a)または(III b)；

## 【化18】



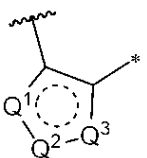
30

40

[式中：

-Z<sup>1</sup>-Z<sup>2</sup>-は-O-CH<sub>2</sub>-または-CH<sub>2</sub>-O-であり；

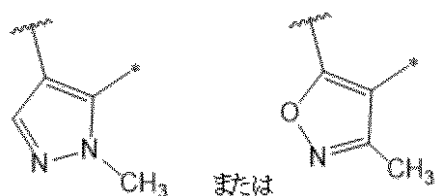
## 【化19】



50

で示される部分は、独立して、

【化 2 0】



であり；

\* は  $-NH-C(O)-OR^4$  の窒素原子との結合点を意味し；

10

$R^4$  は、独立して、 $-(CH_2)-$ フェニル、または  $-(CH(CH_3))-$ フェニル  
 であって、ここで該フェニルは、独立して、0 ~ 2 個の  $R^{10}$  で置換され；

$R^{6a}$  は、各々独立して、ハロまたは  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$R^{10}$  は、各々独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハ  
 ロアルキル、または  $C_{1-4}$  アルコキシであり；および

d は、独立して、0 または 1 である]

で示される化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩も  
 しくは溶媒和物。

【請求項 1 2】

下記：

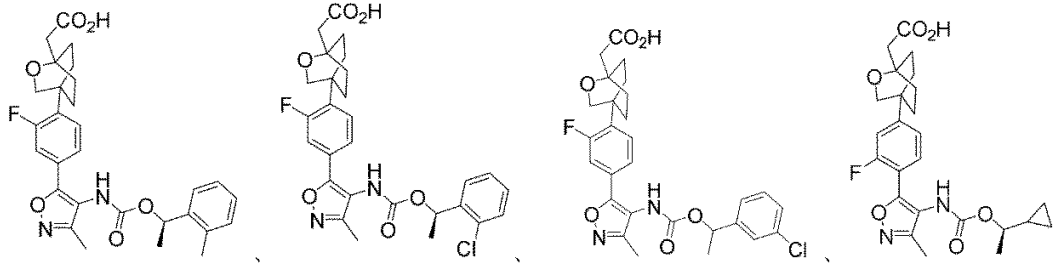
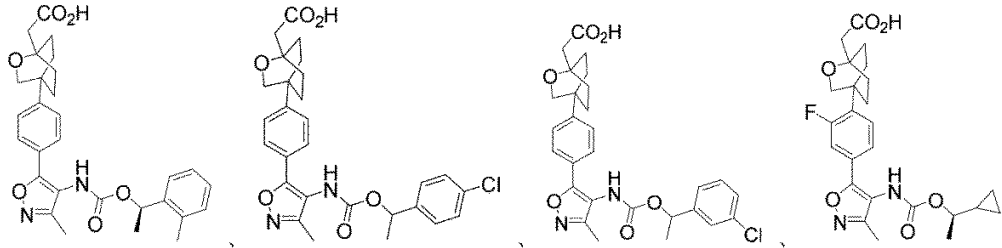
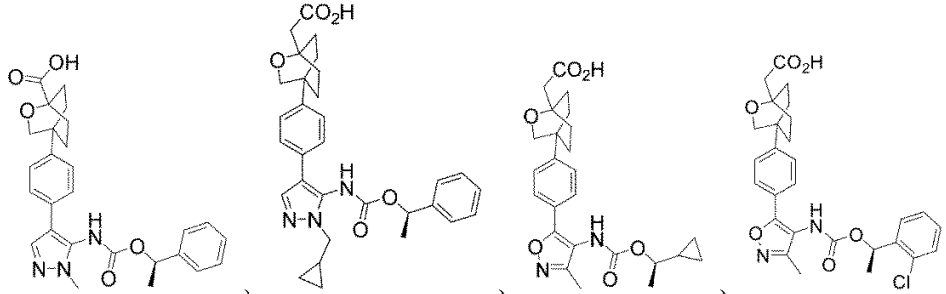
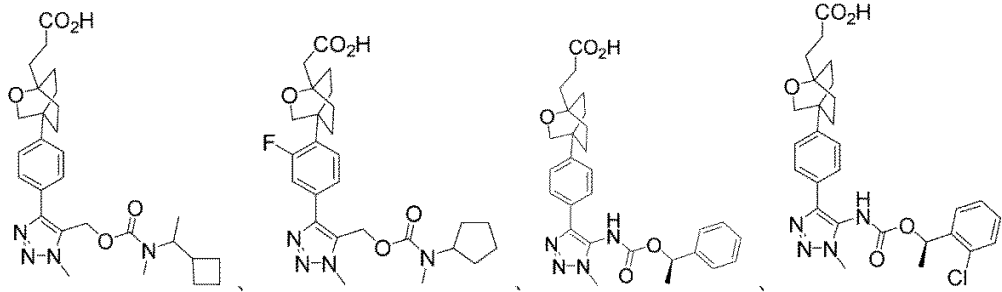
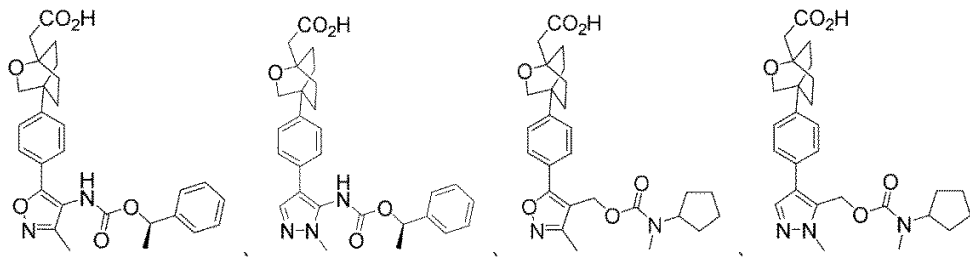
20

30

40

50

【化 2 1】



10

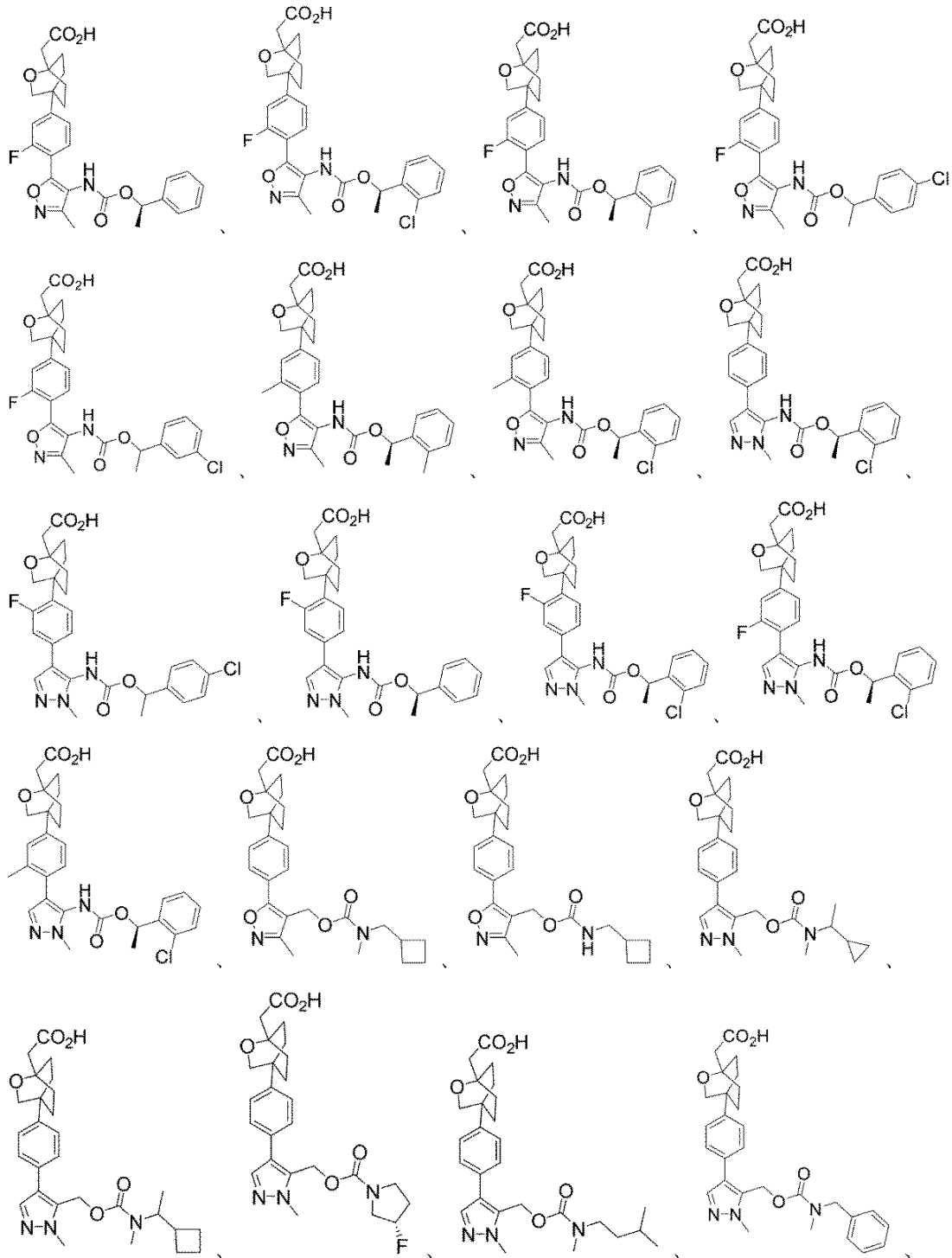
20

30

40

50

【化 2 2】



10

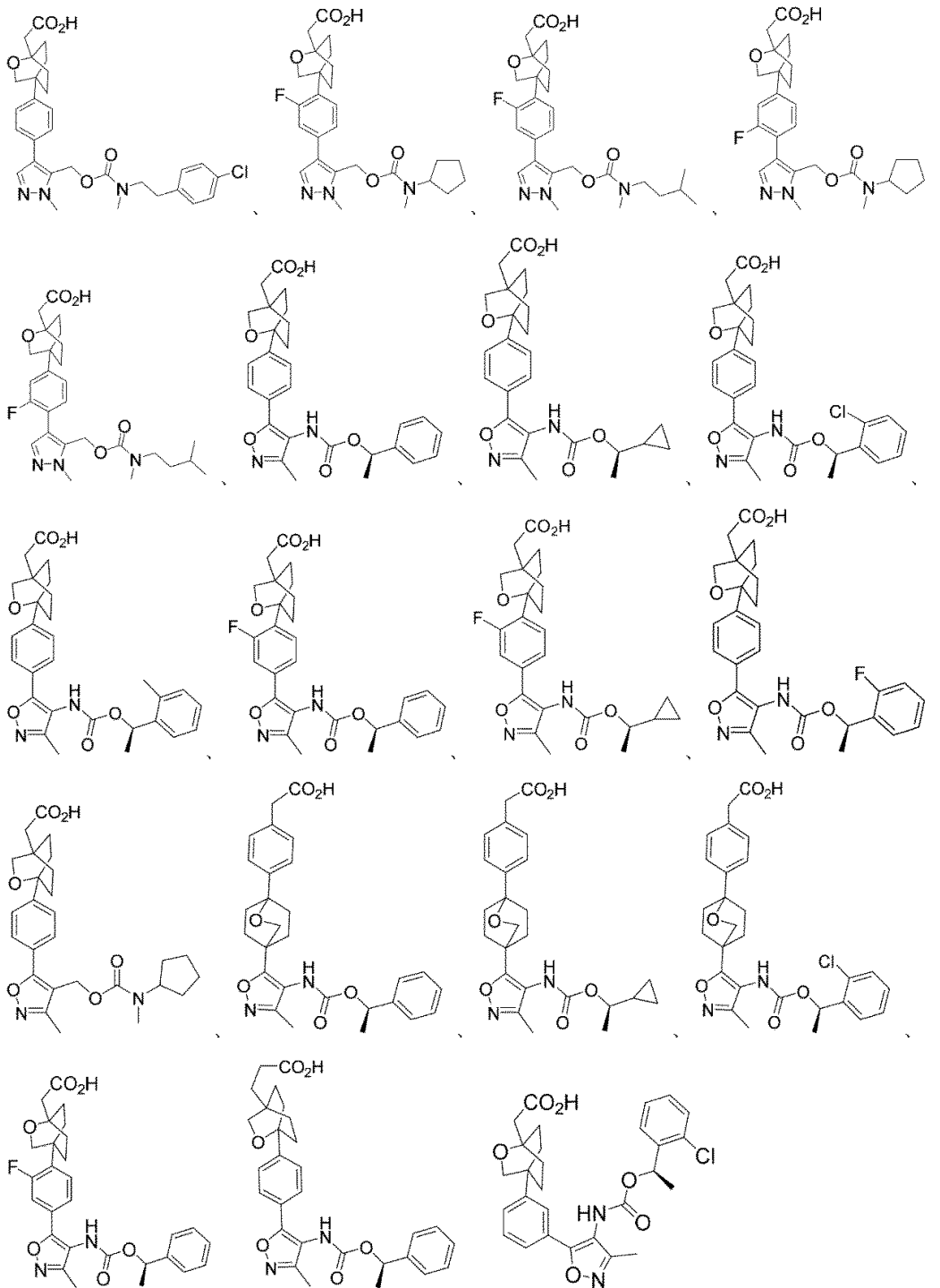
20

30

40

50

## 【化 2 3】



より選択される、請求項 1 に記載の化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の 1 または複数の化合物、あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物と、医薬的に許容される担体または希釈体とを含む、医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

治療のための、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物、あるいは

請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

リゾホスファチジン酸受容体 1 ( L P A 1 ) の調節不全に付随する疾患、障害、または症状を治療するための、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物、あるいは請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

疾患、障害、または症状が、病理学的線維症、移植片拒絶、がん、骨粗鬆症、または炎症性障害に関連付けられる、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

病理学的線維症が、肺、肝臓、腎臓、心臓、皮膚、眼、または膵臓の線維症である、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

疾患、障害、または症状が、特発性肺線維症 ( I P F )、非アルコール性脂肪性肝炎 ( N A S H )、非アルコール性脂肪性肝疾患 ( N A F L D )、慢性腎疾患、糖尿病性腎疾患、および全身性硬化症である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

がんが、膀胱、血液、骨、脳、乳房、中枢神経系、頸部、結腸、子宮内膜、食道、胆嚢、生殖器、泌尿生殖器、頭部、腎臓、喉頭、肝臓、肺、筋肉組織、首部、口腔または鼻粘膜、卵巣、膵臓、前立腺、皮膚、脾臓、小腸、大腸、胃、精巣、または甲状腺のがんである、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

線維症を治療するための、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物、あるいは請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

線維症が、特発性肺線維症 ( I P F )、非アルコール性脂肪性肝炎 ( N A S H )、慢性腎疾患、糖尿病性腎疾患、および全身性硬化症である、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

肺線維症 ( 特発性肺線維症 )、喘息、慢性閉塞性肺疾患 ( C O P D )、腎線維症、急性腎傷害、慢性腎疾患、肝線維症 ( 非アルコール性脂肪性肝炎 )、皮膚線維症、腸線維症、乳がん、膵臓がん、卵巣がん、前立腺がん、神経膠芽腫、骨がん、結腸がん、腸がん、頭頸部がん、黒色腫、多発性骨髄腫、慢性リンパ性白血病、がん性疼痛、腫瘍転移、移植臓器拒絶反応、強皮症、眼線維症、加齢黄斑変性症 ( A M D )、糖尿病性網膜症、コラーゲン性血管疾患、アテローム性動脈硬化症、レイノー現象、または神経障害性疼痛を治療するための、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物、あるいは請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 5】

I . 発明の化合物

第 1 の態様において、本発明は、とりわけ、式 ( I a ) または ( I b ) :

10

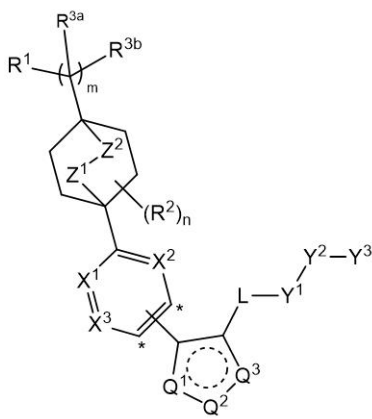
20

30

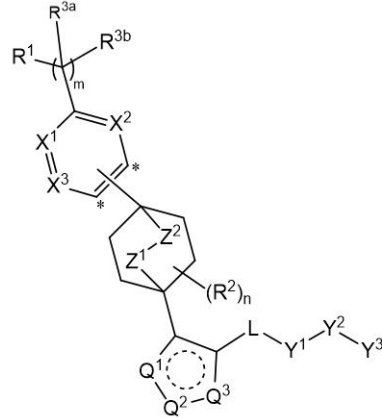
40

50

## 【化 1】



(I a) または



(I b)

10

[ 式中 :

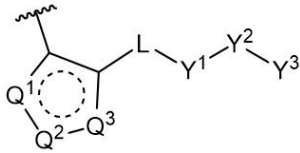
Z<sup>1</sup> および Z<sup>2</sup> の一方が O であって、他方が C H<sub>2</sub> であり ;

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、および X<sup>3</sup> は、各々独立して、C R<sup>6</sup> または N である ; ただし、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、または X<sup>3</sup> のうちの 2 個以下が N であり ;

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、および Q<sup>3</sup> は、独立して、N、O、N R<sup>5 a</sup>、または C R<sup>5 b</sup> であり、破線の円形は芳香族環を形成する結合を意味する ; ただし、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、および Q<sup>3</sup> のうち少なくとも 1 個は C R<sup>5 b</sup> 以外の基であり ;

20

## 【化 2】



で示される部分は、式 ( I a ) または ( I b ) にある 2 個の星印 ( \* ) の位置のうちの 1 個と結合し ;

30

L は、独立して、共有結合または 0 ~ 4 個の R<sup>9</sup> で置換される C<sub>1</sub> - 4 アルキレンであり ;

Y<sup>1</sup> は、独立して、O または N R<sup>7</sup> であり ;

Y<sup>2</sup> は、独立して、

## 【化 3】



40

であり ;

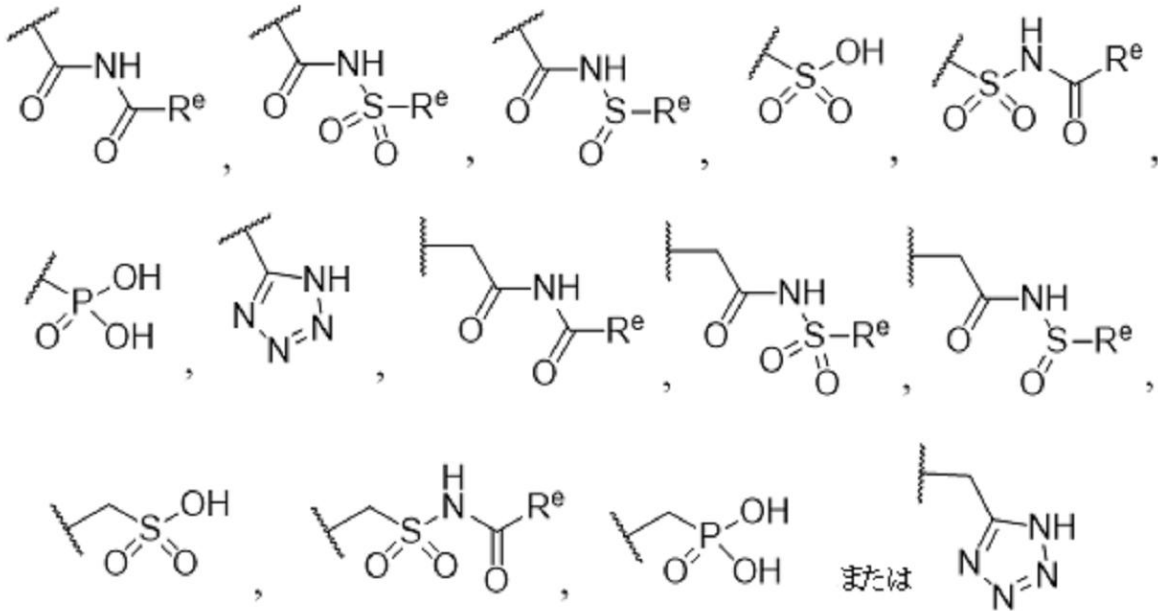
Y<sup>3</sup> は、独立して、O R<sup>4</sup> または N R<sup>8</sup> R<sup>4</sup> である ; ただし、Y<sup>1</sup> が O である場合、その時には Y<sup>3</sup> は O R<sup>4</sup> 以外の基であり ;

Y<sup>5</sup> は、独立して、O または N H であり ;

R<sup>1</sup> は、独立して、シアノ、- C ( O ) O R<sup>1 1</sup>、- C ( O ) N R<sup>1 2 a</sup> R<sup>1 2 b</sup>、

50

## 【化 4】



10

であり；

20

$R^2$  は、各々独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $-(CH_2)_{0-1}-(C_{3-6}$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0-1}$ -フェニル、または0～3個の $R^c$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであり；

$R^{3a}$  は、独立して、水素、ハロ、ヒドロキシル、または $C_{1-4}$ アルキルであり；

$R^{3b}$  は、独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、または0～2個の $R^a$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであるか；

あるいはまた、 $R^{3a}$ および $R^{3b}$ は、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、 $C_{3-4}$ カルボシクリルを形成し；

30

$R^4$  は $-L_1-R^{4a}$ であり；

$L_1$  は、独立して、共有結合または0～4個の $R^9$ で置換される $C_{1-4}$ アルキレンであり；

$R^{4a}$  は、独立して、 $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{1-10}$ ハロアルキル、 $C_{1-10}$ アルケニル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、3ないし8員のヘテロシクリル、5ないし6員のヘテロアリールであり；ここで、該アルキル、アルケニル、アルキレン、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、およびヘテロアリールは、その各々が、それ自体または他の部分の一部として、独立して、0～3個の $R^{10}$ で置換され；

$R^{5a}$  は、独立して、水素、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-(CH_2)_{0-1}-(C_{3-6}$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0-1}$ -フェニル、または0～3個の $R^a$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであり；

40

$R^{5b}$  は、独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $-(CH_2)_{0-1}-(C_{3-6}$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_{0-1}$ -フェニル、または0～3個の $R^b$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであり；

$R^6$  は、各々独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$ アルキルアミノ、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ ハロアルコキシ、または0～1個の $R^b$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであり；

$R^7$ および $R^8$ は、各々独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、または0～1個の $R^c$ で置換される $C_{1-6}$ アルキルであり；

50

$R^9$  は、各々独立して、ハロ、オキソ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、または 0 ~ 3 個の  $R^a$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{10}$  は、各々独立して、ハロ、ヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルコキシ、フェニル、または 5 ないし 6 員のヘテロアリアル、0 ~ 3 個の  $R^b$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{11}$ 、 $R^{12^a}$  および  $R^{12^b}$  は、各々独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、またはベンジルであり；

$R^a$  は、独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、または  $C_{1-4}$  ハロアルコキシであり；

$R^b$  は、独立して、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、または  $C_{1-4}$  ハロアルコキシであり；

$R^e$  は、独立して、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、または 0 ~ 3 個の  $R^a$  で置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$m$  は、0、1、または 2 の整数であり；および

$n$  は、0、1、または 2 の整数である ]

で示される化合物あるいはその立体異性体、互変異性体、または医薬的に許容される塩もしくは溶媒和物を提供する。

10

20

30

40

50