

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成24年7月12日 (2012.7.12)

【公表番号】特表2011-520915(P2011-520915A)

【公表日】平成23年7月21日 (2011.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2011-029

【出願番号】特願2011-509762(P2011-509762)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/416 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/501 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
 C 0 7 D 513/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 417/14 (2006.01)  
 C 0 7 D 417/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/14 (2006.01)  
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/12  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 3/06  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 3/08  
 A 6 1 P 3/00  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 43/00 1 2 3  
 A 6 1 K 31/437  
 A 6 1 K 31/427  
 A 6 1 K 31/416  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/497  
 A 6 1 K 31/501  
 A 6 1 K 31/506  
 C 0 7 D 513/04 3 4 3  
 C 0 7 D 417/14 C S P  
 C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 471/04 1 0 6 H

C 0 7 D 471/04 1 0 6 C

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年5月16日(2012.5.16)

## 【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

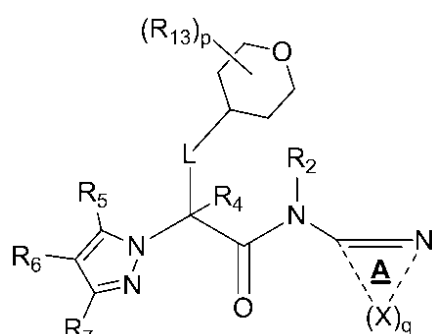
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式



を有する化合物、またはその医薬上許容される塩：

式中、

 $R_2$  は、水素であり、

$R_4$  は、それぞれ置換または非置換の水素、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、およびヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキルからなる群から選択され、

$R_5$  は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、(C<sub>4-12</sub>)アリールオキシ、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-10</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-10</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-10</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アザ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>1-10</sub>)オキサアルキル、(C<sub>1-10</sub>)オキソアルキル、イミノ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-10</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)ビスシクロアルキル、(C<sub>4-12</sub>)アリール、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アリール、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビスシクロアリールからなる群から選択され、

$R_6$  は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、(C<sub>1-10</sub>)アルコキシ、(C<sub>4-12</sub>)アリールオキシ、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-10</sub>)

アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アザ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{1-10}$ ) オキサアルキル、( $C_{1-10}$ ) オキソアルキル、イミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、( $C_{4-12}$ ) アリール、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは  $R_6$  は、 $L_1 - R_{22}$  であり、あるいは、 $R_5$ 、および  $R_6$  が一緒になって、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールを形成し、

$R_7$  は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、( $C_{1-10}$ ) アルコキシ、( $C_{4-12}$ ) アリールオキシ、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、( $C_{1-10}$ ) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ ) アルキル、ハロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、カルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アザ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{1-10}$ ) オキサアルキル、( $C_{1-10}$ ) オキソアルキル、イミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、( $C_{4-12}$ ) アリール、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは  $R_7$  は、 $L_1 - R_{22}$  であり、

$L$  は、( $CR_{24}R_{25}$ )<sub>s</sub> - からなる群から選択され、

$L_1$  は、( $CR_{24}R_{25}$ )<sub>s</sub> - 、 -  $NR_{26}$  - 、 -  $O$  - 、 -  $S$  - 、 -  $CO$  - 、 -  $CS$  - 、 -  $SO$  - 、 -  $SO_2$  - 、およびそれらの組み合わせからなる群から選択され、

各  $s$  は、1、2、3、4、5、および6からなる群から選択され、

$p$  は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、および9からなる群から選択され、

$q$  は、3、4、および5からなる群から選択され、

それぞれの  $X$  は、独立して、 $CR_{14}R_{15}$ 、 $CO$ 、 $CS$ 、 $NR_{16}$ 、 $O$ 、 $S$ 、 $SO$ 、および  $SO_2$  からなる群から選択され、

$R_{13}$  は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、( $C_{1-10}$ ) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ ) アルキル、ハロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、カルボニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、アミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、イミノ ( $C_{1-3}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは2つの  $R_{13}$  が一緒になって、置換または非置換の環を形成し、

$R_{14}$  は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、( $C_{1-10}$ )

アルキルアミノ、スルホンアミド、カルボキサミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_{1-10})$ アルキル、ハロ $(C_{1-10})$ アルキル、カルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、チオカルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルホニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルフィニル $(C_{1-3})$ アルキル、アミノ $(C_{1-10})$ アルキル、イミノ $(C_{1-3})$ アルキル、オキサ $(C_{1-5})$ アルキル、オキソ $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、アリール $(C_{1-10})$ アルキル、ヘテロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{8-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール、およびヘテロ $(C_{4-12})$ ビスクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは $R_{14}$ は、 $L_1 - R_{22}$ であり、

$R_{15}$ は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 $(C_{1-10})$ アルキルアミノ、スルホンアミド、カルボキサミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_{1-10})$ アルキル、ハロ $(C_{1-10})$ アルキル、カルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、チオカルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルホニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルフィニル $(C_{1-3})$ アルキル、アミノ $(C_{1-10})$ アルキル、イミノ $(C_{1-3})$ アルキル、オキサ $(C_{1-5})$ アルキル、オキソ $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、アリール $(C_{1-10})$ アルキル、ヘテロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{8-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール、およびヘテロ $(C_{4-12})$ ビスクロアリールからなる群から選択されるが、但し、 $R_{15}$ は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成する場合は存在せず、

$R_{16}$ は、それぞれ置換または非置換の水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、 $(C_{1-10})$ アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_{1-10})$ アルキル、ハロ $(C_{1-10})$ アルキル、カルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、チオカルボニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルホニル $(C_{1-3})$ アルキル、スルフィニル $(C_{1-3})$ アルキル、アミノ $(C_{1-10})$ アルキル、イミノ $(C_{1-3})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、アリール $(C_{1-10})$ アルキル、ヘテロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{8-12})$ ビスクロアリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ ビスクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリール、およびヘテロ $(C_{4-12})$ ビスクロアリールからなる群から選択されるが、但し、 $R_{16}$ は、それが結合する原子が二重結合の一部を形成する場合は存在せず、

あるいは、任意の2つの $R_{14}$ 、 $R_{15}$ 、および $R_{16}$ が一緒になって、置換または非置換の環を形成し、

$R_{22}$ は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、 $(C_{1-10})$ アルコキシ、 $(C_{4-12})$ アリールオキシ、ヘテロ $(C_{1-10})$ アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、 $(C_{1-10})$ アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、 $(C_{1-10})$ アルキル、ハロ $(C_{1-10})$ アルキル、ヒドロキシ $(C_{1-10})$ アルキル、カルボニル $(C_{1-10})$ アルキル、チオカルボニル $(C_{1-10})$ アルキル、スルホニル $(C_{1-10})$ アルキル、スルフィニル $(C_{1-10})$ アルキル、アザ $(C_{1-10})$ アルキル、 $(C_{1-10})$ オキサアルキル、 $(C_{1-10})$ オキソアルキル、イミノ $(C_{1-10})$ アルキル、 $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-5})$ アルキル、ヘテロ $(C_{3-12})$ シクロアルキル $(C_{1-10})$ アルキル、アリール $(C_{1-10})$ アルキル、ヘテロ $(C_{1-10})$ アリール $(C_{1-5})$ アルキル、 $(C_{9-12})$ ビスクロアリー

ル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、( $C_{4-12}$ ) アリール、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは  $R_{22}$  は、 $NR_{27}R_{28}$  であり、

$R_{24}$  および  $R_{25}$  は、それぞれ独立して、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、( $C_{1-10}$ ) アルコキシ、( $C_{4-12}$ ) アリールオキシ、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、( $C_{1-10}$ ) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ ) アルキル、ハロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、カルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アザ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{1-10}$ ) オキサアルキル、( $C_{1-10}$ ) オキソアルキル、イミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、( $C_{4-12}$ ) アリール、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択され、

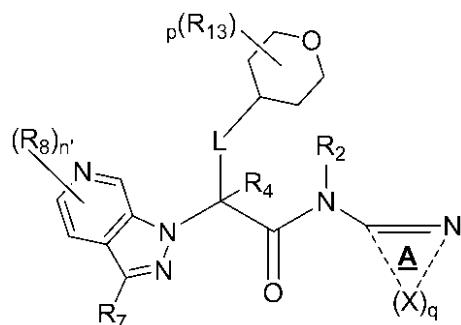
$R_{26}$  は、それぞれ置換または非置換の水素、シアノ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、( $C_{1-10}$ ) アルコキシ、( $C_{4-12}$ ) アリールオキシ、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、( $C_{1-10}$ ) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ ) アルキル、ハロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、カルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アザ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{1-10}$ ) オキサアルキル、( $C_{1-10}$ ) オキソアルキル、イミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-10}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、( $C_{4-12}$ ) アリール、ヘテロ ( $C_{1-10}$ ) アリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択され、

$R_{27}$  および  $R_{28}$  は、それぞれ独立して、それぞれ置換または非置換の水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、( $C_{1-10}$ ) アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ ) アルキル、ハロ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、カルボニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、チオカルボニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、スルホニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、スルフィニル ( $C_{1-3}$ ) アルキル、アミノ ( $C_{1-10}$ ) アルキル、イミノ ( $C_{1-3}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル ( $C_{1-5}$ ) アルキル、アリール ( $C_{1-10}$ ) アルキル、ヘテロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、ヘテロ ( $C_{8-12}$ ) ビシクロアリール ( $C_{1-5}$ ) アルキル、( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) シクロアルキル、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアルキル、ヘテロ ( $C_{3-12}$ ) ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、( $C_{9-12}$ ) ビシクロアリール、およびヘテロ ( $C_{4-12}$ ) ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは  $R_{27}$  および  $R_{28}$  が一緒にあって、置換または非置換の環を形成するが、

但し、 $R_5$  および  $R_6$  が、それらが結合する環と一緒にあって、非置換のインダゾール - 1 - イルを形成する場合、 $A$  は、5 - (3 - アセトアミドシクロブチル) - 1H - ピラゾー

ル - 3 - イルではない。

【請求項 2】



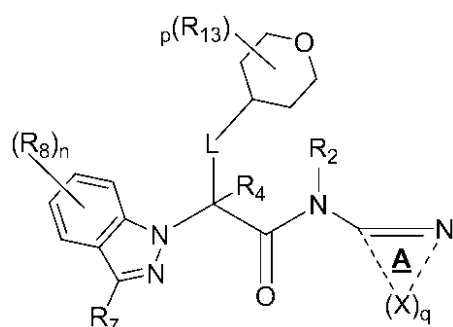
から成る、請求項 1 に記載の化合物であって、

式中、

n は、0、1、2、および 3 からなる群から選択され、

R<sub>8</sub> は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキルスルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R<sub>8</sub> は L<sub>1</sub> - R<sub>22</sub> であるか、あるいは R<sub>8</sub> および R<sub>7</sub>、または 2 つの R<sub>8</sub> が一緒になって、置換または非置換の環を形成する。

【請求項 3】



から成る、請求項 1 に記載の化合物であって、

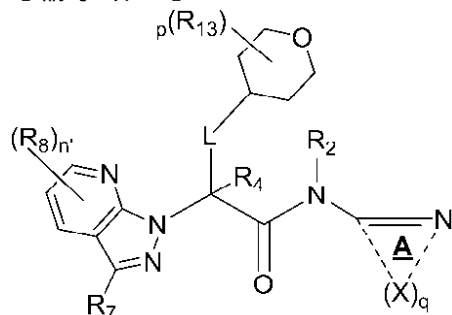
式中、

n は、0、1、2、3、および 4 からなる群から選択され、

R<sub>8</sub> は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーロキシ、ヘテロアリーロキシ、カルボニル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキルスルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)

アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR<sub>8</sub>はL<sub>1</sub>-R<sub>22</sub>であるか、あるいはR<sub>8</sub>およびR<sub>7</sub>、または2つのR<sub>8</sub>が一緒になって、置換または非置換の環を形成する。

【請求項4】



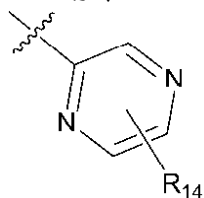
から成る、請求項1に記載の化合物であって、  
式中、

n は、0、1、2、および3からなる群から選択され、

R<sub>8</sub>は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキルスルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビスシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)ビスシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C<sub>9-12</sub>)ビスシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビスシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR<sub>8</sub>はL<sub>1</sub>-R<sub>22</sub>であるか、あるいはR<sub>8</sub>およびR<sub>7</sub>、または2つのR<sub>8</sub>が一緒になって、置換または非置換の環を形成する。

【請求項5】

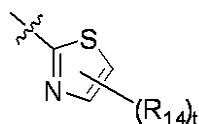
Aが、



から構成される、請求項1～4のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

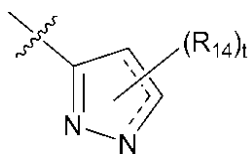
Aが、下記式から構成される、請求項1～4のうちのいずれか1項に記載の化合物：



式中、tは、0、1、および2からなる群から選択される。

【請求項7】

Aが、下記式から構成される、請求項1～4のうちのいずれか1項に記載の化合物：



式中、 $t$ は、0、1、および2からなる群から選択される。

【請求項8】

$L$ は $CH_2$ -である、請求項1～7のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

$R_4$ は水素である、請求項1～8のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

$R_5$ は、水素、ハロ、および置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキルからなる群から選択される、請求項1および5～9のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

$R_6$ は、水素、ハロ、置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキル、置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキルスルホニル、および置換または非置換の( $C_{1-6}$ )シクロアルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項1および5～10のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

$R_6$ が、 $L_1 - R_{22}$ である、請求項1および5～10のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

$R_7$ は、水素、ハロ、および置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキルからなる群から選択される、請求項1～12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項14】

$R_7$ が、 $L_1 - R_{22}$ である、請求項1～12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項15】

$R_8$ は、水素、ハロ、置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキル、置換または非置換のスルホニル( $C_{1-3}$ )アルキル、置換または非置換の( $C_{1-3}$ )アルキルスルホニル、および置換または非置換の( $C_{3-12}$ )シクロアルキルスルホニルからなる群から選択される、請求項2～14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項16】

$R_8$ は、それぞれ置換または非置換のスルホニルメチル、メチルスルホニル、シクロプロピルスルホニル、およびシクロペンチルスルホニルからなる群から選択される、請求項2～14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項17】

$R_8$ は、 $L_1 - R_{22}$ である、請求項2～14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項18】

$R_8$ は、 $SO_2 - R_{22}$ であり、 $R_{22}$ は、それぞれ置換または非置換の水素、ハロ、ニトロ、シアノ、チオ、オキシ、ヒドロキシ、カルボニルオキシ、( $C_{1-10}$ )アルコキシ、( $C_{4-12}$ )アリールオキシ、ヘテロ( $C_{1-10}$ )アリールオキシ、カルボニル、オキシカルボニル、アミド、アミノ、( $C_{1-10}$ )アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、( $C_{1-10}$ )アルキル、ハロ( $C_{1-10}$ )アルキル、ヒドロキシ( $C_{1-10}$ )アルキル、カルボニル( $C_{1-10}$ )アルキル、チオカルボニル( $C_{1-10}$ )アルキル、スルホニル( $C_{1-10}$ )アルキル、スルフィニル( $C_{1-10}$ )アルキル、アザ( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{1-10}$ )オキサアルキル、( $C_{1-10}$ )オキソアルキル、イミノ( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル( $C_{1-5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル( $C_{1-10}$ )アルキル、アリール( $C_{1-10}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{1-10}$ )アリール( $C_{1-5}$ )アルキル、( $C_{9-12}$ )ビスシクロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{8-12}$ )ビスシクロアリール( $C_{1-5}$ )アルキル、ヘテロ( $C_{1-10}$ )アルキル、( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )シクロアルキル、( $C_{9-12}$ )ビスシクロアルキル、ヘテロ( $C_{3-12}$ )ビスシクロア



ルキル、(C<sub>4-12</sub>)アリール、ヘテロ(C<sub>1-10</sub>)アリール、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR<sub>22</sub>は、NR<sub>27</sub>R<sub>28</sub>であり、R<sub>27</sub>およびR<sub>28</sub>は、それぞれ独立して、それぞれ置換または非置換の水素、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル、アミノ、(C<sub>1-10</sub>)アルキルアミノ、スルホンアミド、イミノ、スルホニル、スルフィニル、(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、カルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、チオカルボニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルホニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、スルフィニル(C<sub>1-3</sub>)アルキル、アミノ(C<sub>1-10</sub>)アルキル、イミノ(C<sub>1-3</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル(C<sub>1-5</sub>)アルキル、アリール(C<sub>1-10</sub>)アルキル、ヘテロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、ヘテロ(C<sub>8-12</sub>)ビシクロアリール(C<sub>1-5</sub>)アルキル、(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)シクロアルキル、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアルキル、ヘテロ(C<sub>3-12</sub>)ビシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C<sub>9-12</sub>)ビシクロアリール、およびヘテロ(C<sub>4-12</sub>)ビシクロアリールからなる群から選択されるか、あるいはR<sub>27</sub>およびR<sub>28</sub>が一緒になって、置換または非置換の環を形成する、請求項2～14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

R<sub>8</sub>は、置換または非置換のシクロプロピルスルホニルである、請求項4～14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

R<sub>22</sub>は、置換または非置換の(C<sub>1-5</sub>)アルキル、置換または非置換の(C<sub>3-6</sub>)シクロアルキル、置換または非置換の(C<sub>4-8</sub>)アリール、および置換または非置換のヘテロ(C<sub>1-6</sub>)アリールからなる群から選択される、請求項1～19のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項21】

R<sub>22</sub>は、シクロプロピルである、請求項1～19のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

R<sub>22</sub>は、NR<sub>27</sub>R<sub>28</sub>である、請求項1～19のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

L<sub>1</sub>は、-SO<sub>2</sub>-である、請求項1～22のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項24】

前記化合物は、医薬上許容される塩の形態である、請求項1～23のうちのいずれか1項に記載の化合物。

【請求項25】

下記群から選択される請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩：

- 1) 2-(3-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 2) (S)-2-(3-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 3) (R)-2-(3-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 4) N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 5) N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロペンチルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 8) 4-クロロ-1-(1-(5-クロロチアゾール-2-イルアミノ)-1-オキソ-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン-2-イル)-N-シクロプロピル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド
- 9) N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロパンスルホンアミド)-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

- 10) N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(5-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 12) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-6-(ジフルオロメトキシ)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 13) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 14) 6-(2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド)ニコチンアミド
- 15) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-メトキシ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 16) 2-(6-アミノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 19) 2-(6-シアノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 20) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 21) 4-(シクロプロピルスルホニル)-1-(1-(5-フルオロチアゾール-2-イルアミノ)-1-オキソ-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン-2-イル)-1H-インダゾール-6-カルボン酸
- 22) 2-(5-クロロ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 23) 2-(7-クロロ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 24) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 25) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 26) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 27) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 28) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 29) 2-(4-(4-クロロフェニルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 30) 2-(4-(4-クロロフェニルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-メトキシチアゾロ[5,4-b]ピリジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 31) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 32) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 37) 2-(4-(シクロペンチルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 40) (R)-N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 41) N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-2-(4-(メチルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 42) (S)-N-(5-クロロチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラ

[illegible]

- [illegible]

- [illegible]

- 134) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1,5-ジメチル-1H-  
-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 135) N-(5-シアノピリジン-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 136) (S)-N-(5-シアノチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-イン  
ダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 137) (R)-N-(5-シアノチアゾール-2-イル)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-イン  
ダゾール-1-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 138) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(  
5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 139) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(  
5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 141) (S)-2-(6-クロロ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-  
フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 142) 2-(6-アミノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-フル  
オロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 143) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-6-(ジフルオロメトキシ)-1H-インダゾール-1-  
イル)-N-(5-フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパン  
アミド
- 144) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-ヒドロキシ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-  
フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 145) (R)-2-(6-クロロ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-  
フルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 146) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-(メチルスルホ  
ニル)-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 147) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(6-フルオロピリ  
ジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 149) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-フ  
ルオロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 150) 2-(5-ブromo-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-インダゾール-1-イル)-N-(5-フル  
オロチアゾール-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 151) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(1-メ  
チル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 152) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メ  
チル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 154) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(ピラ  
ジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 155) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-エ  
チル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 157) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-メチル-1H-インダゾール-1-イル)-N-(ピラジ  
ン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 158) 2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-メチル-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチ  
ル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 159) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(  
1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 160) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(  
1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 161) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(  
ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド
- 162) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(

ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

163) (R)-2-(6-アミノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

164) (S)-2-(6-アミノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

165) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

166) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-5-フルオロ-1H-インダゾール-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

170) 2-(6-アミノ-4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-1-イル)-N-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド

171) (S)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド、及び

172) (R)-2-(4-(シクロプロピルスルホニル)-1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン-1-イル)-N-(ピラジン-2-イル)-3-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)プロパンアミド。

【請求項 26】

有効成分として請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物と、1 つ以上の医薬上許容される賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 27】

医薬として使用するための、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 28】

グルコキナーゼを活性化するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 29】

高血糖を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 30】

糖尿病を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 31】

脂質異常症を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 32】

肥満を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 33】

インスリン抵抗性を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 34】

メタボリックシンドローム X を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 35】

耐糖能障害を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 36】

多嚢胞性卵巣症候群を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 37】

心血管疾患を処置するための医薬の製造における、請求項 1～25 のうちのいずれか 1

項に記載の化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0493

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0493】

4 - (シクロプロピルスルホニル) - 1 - (1 - (5 - フルオロチアゾール - 2 - イルアミノ) - 1 - オキソ - 3 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル)プロパン - 2 - イル) - 1 H - インダゾール - 6 - カルボン酸 21 (0.1 g、0.19 ミリモル)、ジフェニルホスホルアジデート (0.05 g、0.19 ミリモル)、トリエチルアミン (0.03 g、0.3 ミリモル)、および t Bu OH (0.016 g、0.21 ミリモル) をトルエン (10 mL) 中に混合し、2 時間還流させた。溶媒を除去し、残渣を TFA / DCM (1 / 1) で 15 分間処理した。この混合物を減圧下で濃縮し、分取 HPLC (Waters System: カラムは Phenomenex の C18、5  $\mu$ 、150  $\times$  50 mm、移動相 A は H<sub>2</sub>O 中 0.05 % TFA、移動相 B はアセトニトリル中 0.035 % TFA) を用いて精製して、赤褐色の固体として化合物 142 を得た (50 mg)。[M + H] C<sub>21</sub>H<sub>25</sub>FN<sub>5</sub>O<sub>4</sub>S<sub>2</sub> に対する計算値 494.1; 実測値 494.4。

化合物 22: 2 - (5 - クロロ - 4 - (シクロプロピルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 1 - イル) - N - (5 - フルオロチアゾール - 2 - イル) - 3 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) プロパンアミド

化合物 23: 2 - (7 - クロロ - 4 - (シクロプロピルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 1 - イル) - N - (5 - フルオロチアゾール - 2 - イル) - 3 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) プロパンアミド

