

【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21年3月12日(2009.3.12)

【公表番号】特表2004-503538(P2004-503538A)

【公表日】平成16年2月5日(2004.2.5)

【年通号数】公開・登録公報2004-005

【出願番号】特願2002-510448(P2002-510448)

【国際特許分類】

C 07 C	237/52	(2006.01)
A 61 K	31/166	(2006.01)
A 61 K	31/341	(2006.01)
A 61 K	31/343	(2006.01)
A 61 K	31/381	(2006.01)
A 61 K	31/405	(2006.01)
A 61 K	31/4172	(2006.01)
A 61 K	31/423	(2006.01)
A 61 K	31/426	(2006.01)
A 61 K	31/427	(2006.01)
A 61 K	31/428	(2006.01)
A 61 K	31/44	(2006.01)
A 61 K	31/445	(2006.01)
A 61 K	31/4465	(2006.01)
A 61 K	31/454	(2006.01)
A 61 P	1/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	1/18	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	11/02	(2006.01)
A 61 P	11/06	(2006.01)
A 61 P	11/08	(2006.01)
A 61 P	13/10	(2006.01)
A 61 P	15/00	(2006.01)
A 61 P	15/12	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	17/02	(2006.01)
A 61 P	17/04	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	25/06	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 D	209/20	(2006.01)

C 0 7 D 211/34	(2006.01)
C 0 7 D 213/56	(2006.01)
C 0 7 D 213/73	(2006.01)
C 0 7 D 233/64	(2006.01)
C 0 7 D 263/54	(2006.01)
C 0 7 D 277/20	(2006.01)
C 0 7 D 277/46	(2006.01)
C 0 7 D 277/52	(2006.01)
C 0 7 D 277/82	(2006.01)
C 0 7 D 307/54	(2006.01)
C 0 7 D 307/81	(2006.01)
C 0 7 D 333/60	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
C 0 7 D 417/12	(2006.01)
C 0 7 D 277/30	(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 237/52	
A 6 1 K 31/166	
A 6 1 K 31/341	
A 6 1 K 31/343	
A 6 1 K 31/381	
A 6 1 K 31/405	
A 6 1 K 31/4172	
A 6 1 K 31/423	
A 6 1 K 31/426	
A 6 1 K 31/427	
A 6 1 K 31/428	
A 6 1 K 31/44	
A 6 1 K 31/445	
A 6 1 K 31/4465	
A 6 1 K 31/454	
A 6 1 P 1/00	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 1/16	
A 6 1 P 1/18	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 11/02	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 11/08	
A 6 1 P 13/10	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 15/12	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 17/02	
A 6 1 P 17/04	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 25/00	

A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 209/20
 C 0 7 D 211/34
 C 0 7 D 213/56
 C 0 7 D 213/73
 C 0 7 D 233/64 1 0 6
 C 0 7 D 263/54
 C 0 7 D 277/46
 C 0 7 D 277/52
 C 0 7 D 277/82
 C 0 7 D 307/54
 C 0 7 D 307/81
 C 0 7 D 333/60
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 277/30

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月16日(2009.1.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

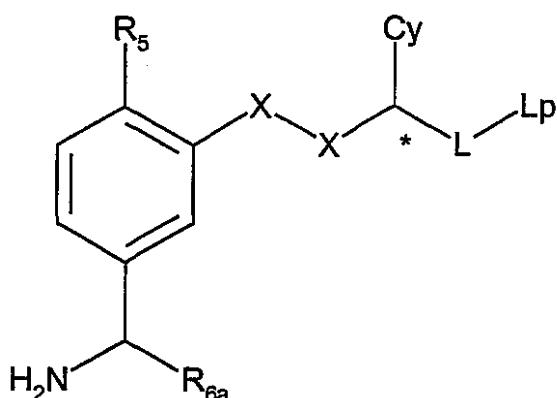
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】式(I)：

【化1】



(I)

[式中、R₅は、アミノ、ヒドロキシ、アミノメチル、ヒドロキシメチルまたは水素であり；

R_{6a}は、水素またはメチルであり；

X-Xは、-CONR_{1a}-であり；

R_{1a}は、水素、(C₁₋₆)アルキルまたはフェニル(C₁₋₆)アルキルであり；

Lは、COまたはCONR_{1d}(CH₂)_m(ここで、mは、0または1であり、R_{1d}は水素、(C₁₋₆)アルキルまたはフェニル(C₁₋₆)アルキルである)であり;

Cyは、シクロアルキル、ペリジニル、3,4メチレンジオキシフェニル、フリル、チエニル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ナフチル、ベンゾフリルまたはベンゾ[b]チエニル基であって、必要に応じてR_{3a}またはR_{3i}X_i(ここで、X_iは、結合、O、NH、CO、CONH、NHC₂、SO₂、NHSO₂またはSO₂NH、CH₂であり、R_{3i}は、必要に応じてR_{3a}で置換されるフェニルまたはピリジルである)で置換され;

各R_{3a}は独立して、水素、ヒドロキシル、(C₁₋₆)アルコキシ、(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、(C₂₋₆)アルキニル、(C₁₋₆)アルカノイル、(C₁₋₆)アルキルアミノアルキル、ヒドロキシ(C₁₋₆)アルキル、カルボキシ、(C₁₋₆)アルコキシアルキル、(C₁₋₆)アルコキシカルボニル、(C₁₋₆)アルキルアミノカルボニル、アミノ(C₁₋₆)アルキル、CONH₂、CH₂CONH₂、アミノアセチル、(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、ヒドロキシ(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、アミノ(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、(C₁₋₆)アルキルアミノ(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、ジ(C₁₋₆)アルキルアミノ(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、(C₁₋₆)アルコキシカルボニルアミノ、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、チオール、(C₁₋₆)アルキルチオ、(C₁₋₆)アルキルスルホニル、(C₁₋₆)アルキルスルフェニル、イミダゾリル、ヒドラジド、(C₁₋₆)アルキルイミダゾリル、(C₁₋₆)アルキルスルホニアミド、(C₁₋₆)アルキルアミノスルホニル、アミノスルホニル、(C₁₋₆)ハロアルコキシまたは(C₁₋₆)ハロアルキルであり;および

Lpは、アルキル、アルケニル、炭素環式またはヘテロ環式基、あるいはスピロ結合または単結合もしくは二重結合またはC=O、O、OCO、COO、S、SO、SO₂、CONR_{1e}、NR_{1e}-CO-またはNR_{1e}結合(ここで、R_{1e}は、R_{1a}と同意義である)によって連結されたこのような基の2つまたはそれ以上の組み合わせであり、必要に応じて、1個またはそれ以上のオキソまたはR₃基(ここで、R₃は、アミノ酸残基、N-(C₁₋₆)アルキルアミノカルボニル、N,N-ジ(C₁₋₆)アルキルアミノカルボニル、N-(C₁₋₆)アルキルアミノ(C₁₋₆)アルカノイル、N-(C₁₋₆)アルカノイルアミノ(C₁₋₆)アルカノイル、C-ヒドロキシアミノ(C₁₋₆)アルカノイル、ヒドロキシ(C₂₋₆)アルカノイルアミノ(C₁₋₆)アルカノイル、ジ(C₁₋₆)アルキルアミノスルホニル、水素、ヒドロキシル、(C₁₋₆)アルコキシ、(C₁₋₆)アルカノイルオキシ、(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル(C₂₋₆)アルキニル、(C₃₋₆)アルケニルオキシカルボニル、(C₁₋₆)アルカノイル、アミノ(C₁₋₆)アルキル、アミド(CONH₂)、アミノ(C₁₋₆)アルカノイル、アミノカルボニル(C₁₋₅)アルカノイル、ヒドロキシ(C₁₋₆)アルキル、カルボキシ、ヒドロキシ(C₁₋₆)アルカノイル、(C₁₋₆)アルコキシ(C₁₋₆)アルキル、(C₁₋₆)アルコキシカルボニル(C₁₋₅)アルキル、(C₁₋₆)アルコキシカルボニル、(C₁₋₆)アルカノイルアミノ、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、チオール、(C₁₋₆)アルキルチオ、(C₁₋₆)アルキルスルホニル、(C₁₋₆)アルキルスルフェニルおよびヒドラジドである)で置換される]

で示されるトリプターゼインヒビター化合物またはその薬理学的に許容しうる塩。

【請求項2】 R₅が、アミノまたは水素である請求項1記載の化合物。

【請求項3】 R₅が、水素である請求項1記載の化合物。

【請求項4】 R_{6a}が、水素である請求項1~3のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項5】 X-Xが、CONHである請求項1~4のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項6】 炭素原子(*)が、D-アミノ酸であるNH₂-CH(Cy)-COOH(ここで、NH₂はX-Xの部分である)からの配置から得られる配置を有する請求項1~5のいずれか1つに記載の化合物。

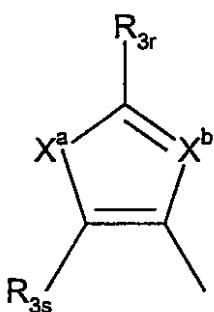
【請求項 7】 Cy が、シクロヘキシル、ピペリジン-4-イル、3,4-メチレンジオキシフェニル、フル-2-イル、チエン-2-イル、チエン-3-イル、イミダゾール-4-イル、オキサゾール-4-イル、オキサゾール-5-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、ピリド-2-イル、ピリド-3-イル、ピリド-4-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、ピラジン-2-イル、ピラジン-3-イル、ナフト-1-イル、ナフト-2-イル、インドール-5-イル、インダン-5-イル、3,4-ジヒドロベンゾフル-5-イル、ベンゾフル-2-イルまたはベンゾ[b]チエン-2-イル基であり、必要に応じて R_{3a} または $R_{3i} X_i$ (ここで、 X_i は結合、O、NHまたはCH₂であり、 R_{3i} は必要に応じて R_{3a} で置換されるフェニルである)で置換される請求項1~6のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 8】 R_{3a} が、水素；ヒドロキシル；メトキシ；エトキシ；イソプロポキシ；メチル；エチル；イソプロピル；アセチル；プロパノイル；イソプロパノイル；メチルアミノメチル；ジメチルアミノメチル；ヒドロキシメチル；カルボキシ；メトキシメチル；メトキシカルボニル；エトキシカルボニル；メチルアミノカルボニル；ジメチルアミノカルボニル；アミノメチル；CONH₂；CH₂CONH₂；アミノアセチル；ホルミルアミノ；アセチルアミノ；ヒドロキシアセチルアミノ；アミノアセチルアミノ；メチルアミノアセチルアミノ；ジメチルアミノアセチルアミノ；メトキシカルボニルアミノ；エトキシカルボニルアミノ；t-ブトキシカルボニルアミノ；アミノ；フルオロ；クロロ；シアノ；ニトロ；チオール；メチルチオ；メチルスルホニル；エチルスルホニル；メチルスルフェニル；イミダゾール-4-イル；ヒドロジド；2-メチルイミダゾール-4-イル；メチルスルホニルアミド；エチルスルホニルアミド；メチルアミノスルホニル；エチルアミノスルホニル；アミノスルホニル；トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルであり； $R_{3i} X_i$ が、フェニル、フェノキシ、フェニルアミノまたはベンジルである請求項1~7のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項 9】 Cy が、シクロヘキシル、ピペリジン-4-イル、1-アセチルピペリジン-4-イル、1-プロパノイルピペリジン-4-イル、1-イソブチリルピペリジン-4-イル、1-アミノアセチルピペリジン-4-イル、5-メチルフル-2-イル、イミダゾール-4-イル、2-メチルチアゾール-4-イル、2-アミノチアゾール-4-イル、2-ホルミルアミノチアゾール-4-イル、2-アミノチアゾール-5-イル、2-ホルミルアミノチアゾール-5-イル、2-フェニルチアゾール-4-イル、4-アミノピリド-3-イル、6-メチルピリド-2-イル、3-アミノ-ピリド-4-イル、ナフト-1-イル、ナフト-2-イル、ベンゾフル-2-イル、3-メチルベンゾチエン-2-イル、6-アミノピリド-3-イル、2-エチルチアゾール-4-イル、2-ベンジルチアゾール-4-イル、2-メチルスルホニアミドチアゾール-4-イル、2-クロロピリド-3-イル、2-ヒドロキシアセチルアミノチアゾール-4-イル、2-N,N-ジメチルアミノアセチルアミノチアゾール-4-イル、インドール-5-イル、インダン-5-イルおよび3,4-ジヒドロベンゾフル-2-イルから選ばれる請求項8記載の化合物。

【請求項 10】 Cy が、式：

【化2】



[式中、 X^a および X^b の一方はN、他方は、NHまたはSであり、各 R_{3r} および R_{3s}

は R_{3a} と同意義である】

で示される基である請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 11】 X^a が S であり、 X^b が N である請求項 10 記載の化合物。

【請求項 12】 R_{3s} が水素であり、 R_{3r} が水素、 (C_{1-6}) アルキル、 アミノ、 (C_{1-6}) アルカノイルアミノ、 ヒドロキシ (C_{1-6}) アルカノイルアミノ、 N , N -ジ (C_{1-6}) アルキルアミノアルカノイルアミノ、 (C_{1-6}) アルキルスルホニルアミノ、 フェニルまたはベンジルである請求項 10 または請求項 11 記載の化合物。

【請求項 13】 C_y が、 ピリド-2-イル、 ピリミド-2-イル、 ピリミド-4-イル、 ピラジン-2-イル、 ピラジン-3-イルまたはオキサゾール-4-イルであり、 必要に応じて R_{3a} または R_{3xi} で置換される請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 14】 C_y が、 シクロアルキル、 ピペリジニル、 3,4-メチレンジオキシフェニル、 フリル、 チエニル、 イミダゾリル、 チアゾリル、 ピリジル、 ナフチルまたはベンゾフリル基であり、 必要に応じて R_{3a} または $R_{3i} X_i$ (ここで、 X_i は結合、 O、 NH または CH₂ であり、 R_{3i} は必要に応じて R_{3a} で置換されるフェニルである) で置換され； および各 R_{3a} が独立して、 水素、 ヒドロキシル、 (C_{1-6}) アルコキシ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{2-6}) アルケニル、 (C_{2-6}) アルキニル、 (C_{1-6}) アルカノイル、 (C_{1-6}) アルキルアミノアルキル、 ヒドロキシ (C_{1-6}) アルキル、 カルボキシ、 (C_{1-6}) アルコキシアルキル、 (C_{1-6}) アルコキシカルボニル、 (C_{1-6}) アルキルアミノカルボニル、 アミノ (C_{1-6}) アルキル、 CONH₂、 CH₂CONH₂、 アミノアセチル、 (C_{1-6}) アルカノイルアミノ、 (C_{1-6}) アルコキシカルボニルアミノ、 アミノ、 ハロ、 シアノ、 ニトロ、 チオール、 (C_{1-6}) アルキルチオ、 (C_{1-6}) アルキルスルホニル、 (C_{1-6}) アルキルスルフェニル、 イミダゾリル、 ヒドラジド、 (C_{1-6}) アルキルイミダゾリル、 (C_{1-6}) アルキルスルホニアミド、 (C_{1-6}) アルキルアミノスルホニル、 アミノスルホニル、 (C_{1-6}) ハロアルコキシまたは (C_{1-6}) ハロアルキルである請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 15】 C_y が、 必要に応じて R_{3a} で置換されるシクロアルキル、 ピペリジニル、 チエニル、 チアゾリル、 ピリジルまたはナフチル基であり、 各 R_{3a} が独立して、 水素、 ヒドロキシル、 (C_{1-6}) アルコキシ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{1-6}) アルキルアミノアルキル、 ヒドロキシ (C_{1-6}) アルキル、 (C_{1-6}) アルコキシアルキル、 (C_{1-6}) アルコキシカルボニル、 (C_{1-6}) アルキルアミノカルボニル、 アミノ (C_{1-6}) アルキル、 CONH₂、 CH₂CONH₂、 アミノアセチル、 (C_{1-6}) アルカノイルアミノ、 (C_{1-6}) アルコキシカルボニルアミノ、 アミノ、 ハロ、 シアノ、 ニトロ、 チオール、 (C_{1-6}) アルキルチオ、 (C_{1-6}) アルキルスルホニル、 イミダゾリル、 ヒドラジド、 (C_{1-6}) アルキルイミダゾリル、 (C_{1-6}) アルキルスルホニアミド、 (C_{1-6}) アルキルアミノスルホニル、 アミノスルホニル、 (C_{1-6}) ハロアルコキシまたは (C_{1-6}) ハロアルキルである請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 16】 L が、 CO、 CONH、 CONCH₃ または CONHCH₂ である請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 17】 L が、 CO、 CONH または CONCH₃ である請求項 16 記載の化合物。

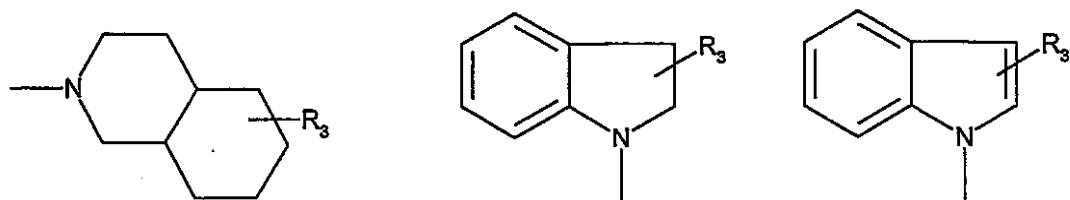
【請求項 18】

(a) L が CO であり、 L p が

【化 3】



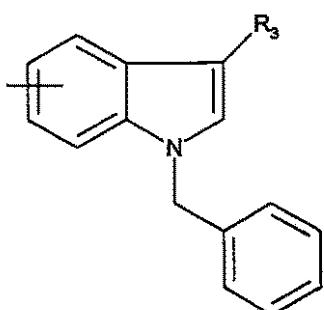
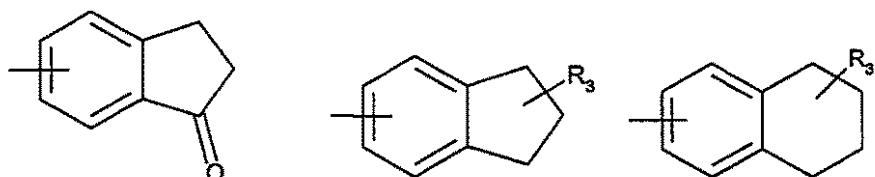
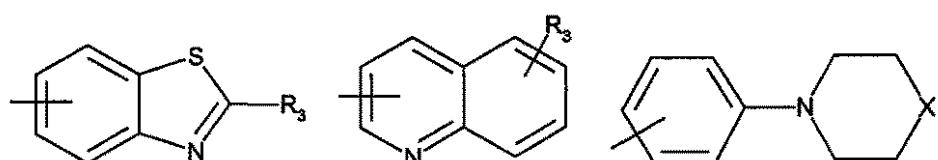
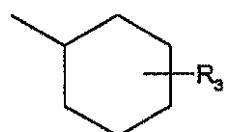
【化4】



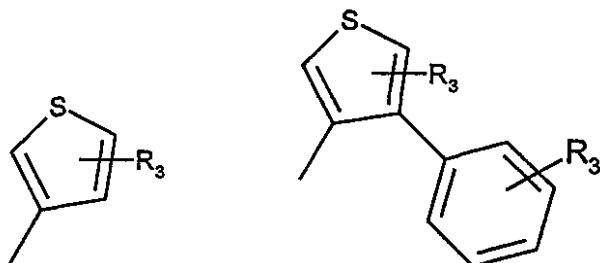
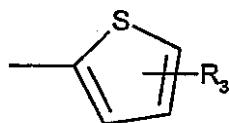
である；または

(b) L が CONH であり、 L_p が

【化 5】



【化 6】

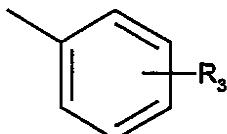


[ここで、XはCHまたはNである]

である；または

(c) LがCONR1dであり、Lpが

【化7】

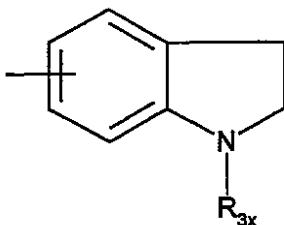


[ここで、R3は、(C1-6)アルキルアミノカルボニル、N-(C1-6)アルキルアミノ(C1-6)アルカノイル、N-(C1-6)アルカノイルアミノ(C1-6)アルカノイル、C-ヒドロキシアミノ(C1-6)アルカノイル、水素、(C1-6)アルコキシ、(C1-6)アルキル、アミノ(C1-6)アルキル、アミノカルボニル、ヒドロキシ(C1-6)アルキル、(C1-6)アルコキシ(C1-6)アルキル、(C1-6)アルコキシカルボニル、(C1-6)aアシルオキシメトキシカルボニル、(C1-6)アルキルアミノ、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、チオール、(C1-6)アルキルチオ、(C1-6)アルキルスルホニル、(C1-6)アルキルスルフェニル、トリアゾリル、イミダゾリル、テトラゾリル、ヒドラジド、(C1-6)アルキルイミダゾリル、チアゾリル、(C1-6)アルキルチアゾリル、(C1-6)アルキルオキサゾリル、オキサゾリル、(C1-6)アルキルスルホニアミド、(C1-6)アルキルアミノスルホニル、アミノスルホニル、(C1-6)ハロアルコキシまたは(C1-6)ハロアルキルである]

である；または

(d) LがCONR1dであり、Lpが

【化8】



[式中、R3xは、R3または式：-(X1y)p-(G1)-Rj]

(ここで、pは0または1；X1yはCO、COO、CONHまたはSO2；G1は(C1-3)アルカンジイル、CH2OCH2またはpが1である場合に結合；およびRjは必要に応じてR3で置換される炭素環式またはヘテロ環式基)

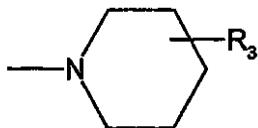
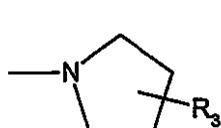
である】

である請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 つに記載の化合物。

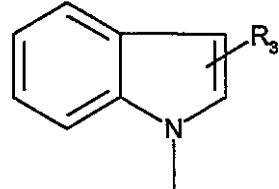
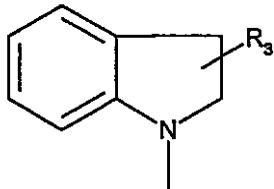
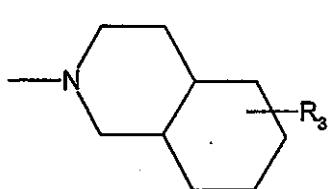
【請求項 19】 R_3 が、N - アセチルアラニノイル；セリノイル；トレオニノイル；アスパルトイル；グルタモイル；N - (1, 3 - ジメチル) ブチルアミノカルボニル；N - メチル - N - エチルアミノカルボニル；N - メチルアセチル；2 - N - アセチルアミノアセチル、2 - N - アセチルアミノプロパノイル；2 - N - (2 - メチルプロパノイル) アミノアセチル；2 - アミノ - 3 - ヒドロキシプロパノイル；2 - アミノ - 3 - ヒドロキシブタニル；2 - ヒドロキシアセチルアミノアセチル；ジメチルアミノスルホニル；水素；ヒドロキシル；メトキシ；アセトキシ；メチル、エチル、プロピル、2 - プロピル；2, 2 - ジメチルエチル；アリル；プロピニル；アリルオキシカルボニル；アセチル；プロピオニル；イソブチリル；アミノメチル；CONH₂；アミノアセチル；アミノプロピオニル；2 - アミノプロピオニル；アミノカルボニルアセチル；ヒドロキシメチル；1 - ヒドロキシエチル；カルボキシ；2 - ヒドロキシアセチル；2 - ヒドロキシプロパノイル；メトキシメチル；メトキシカルボニルメチル；メトキシカルボニル；エトキシカルボニル；ホルミルアミノ；アセチルアミノ；アミノ；クロロ；シアノ；ニトロ；チオール；メチルチオ；メチルスルホニル；エチルスルホニル；メチルスルフェニル；およびヒドラジドから選ばれる請求項 18 記載の化合物。

【請求項 20】 L が CON であり、L p が

【化 9】



【化 10】

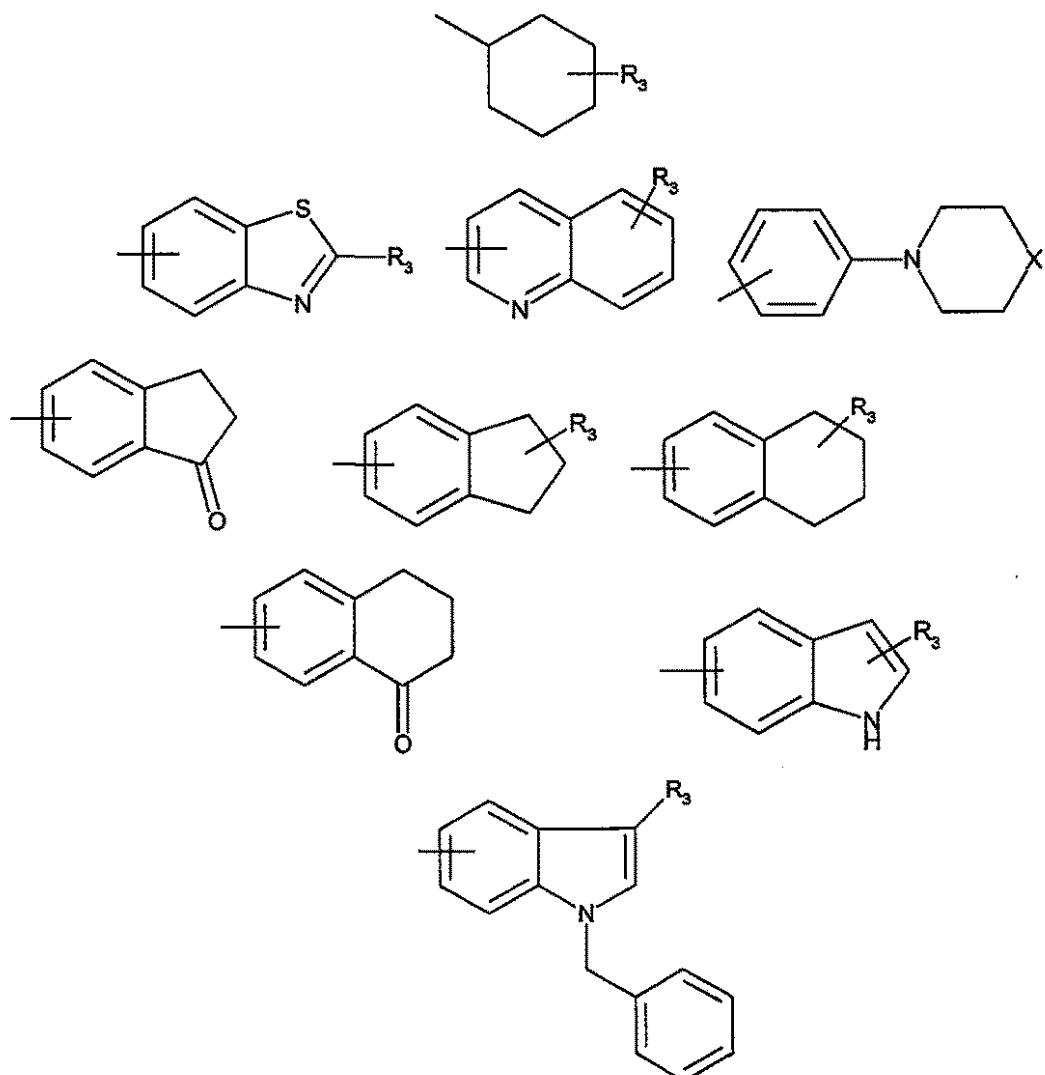


である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

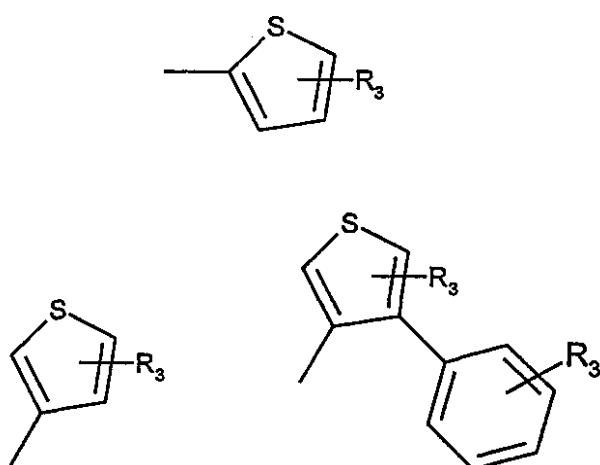
【請求項 21】 R_3 が、水素、ヒドロキシまたは (C 1 - 6) アルキルアミノカルボニルである請求項 19 記載の化合物。

【請求項 22】 L が CONH であり、L p が

【化 11】



【化12】

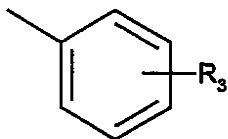


[ここで、XはCHまたはNである]

である請求項18または請求項19記載の化合物。

【請求項23】 R_3 が独立して、水素、アミノ、ヒドロキシ、(C1-6)アルキル、(C1-6)アルカノイル、(C1-6)アルカノイルオキシ、(C1-5)アルコキシカルボニル(C1-6)アルキル、アミノ(C1-6)アルキルおよびシアノから選ばれる請求項22記載の化合物。

【請求項 24】 L が $C_1 O N R_{1-d}$ であり、 L_p が
【化 13】

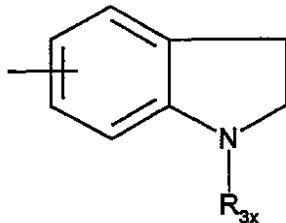


[ここで、 R_3 は、 (C 1 - 6) アルキルアミノカルボニル、 N - (C 1 - 6) アルキルアミノ (C 1 - 6) アルカノイル、 N - (C 1 - 6) アルカノイルアミノ (C 1 - 6) アルカノイル、 C - ヒドロキシアミノ (C 1 - 6) アルカノイル、 水素、 (C 1 - 6) アルコキシ、 (C 1 - 6) アルキル、 アミノ (C 1 - 6) アルキル、 アミノカルボニル、 ヒドロキシ (C 1 - 6) アルキル、 (C 1 - 6) アルコキシ (C 1 - 6) アルキル、 (C 1 - 6) アルコキシカルボニル、 (C 1 - 6) α アシルオキシメトキシカルボニル、 (C 1 - 6) アルキルアミノ、 アミノ、 ハロ、 シアノ、 ニトロ、 チオール、 (C 1 - 6) アルキルチオ、 (C 1 - 6) アルキルスルホニル、 (C 1 - 6) アルキルスルフェニル、 トリアゾリル、 イミダゾリル、 テトラゾリル、 ヒドラジド、 (C 1 - 6) アルキルイミダゾリル、 チアゾリル、 (C 1 - 6) アルキルチアゾリル、 (C 1 - 6) アルキルオキサゾリル、 オキサゾリル、 (C 1 - 6) アルキルスルホニアミド、 (C 1 - 6) アルキルアミノスルホニル、 アミノスルホニル、 (C 1 - 6) ハロアルコキシまたは (C 1 - 6) ハロアルキルである]

である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

【請求項 25】 L_p が、 フェニル、 3 - シアノ - 4 - メチルフェニル、 3 - アミノカルボニルフェニル、 4 - アミノカルボニルフェニル、 4 - クロロ - 3 - アミノカルボニルフェニル、 4 - クロロフェニル、 3, 5 - ジクロロフェニル、 3 - アミノメチルフェニル、 4 - メチル - 3 - アセチルアミノフェニル、 4 - (1 - ヒドロキシエチル) フェニルおよび 4 - イソプロピルフェニルである請求項 24 記載の化合物。

【請求項 26】 L が $C_1 O N R_{1-d}$ であり、 L_p が
【化 14】

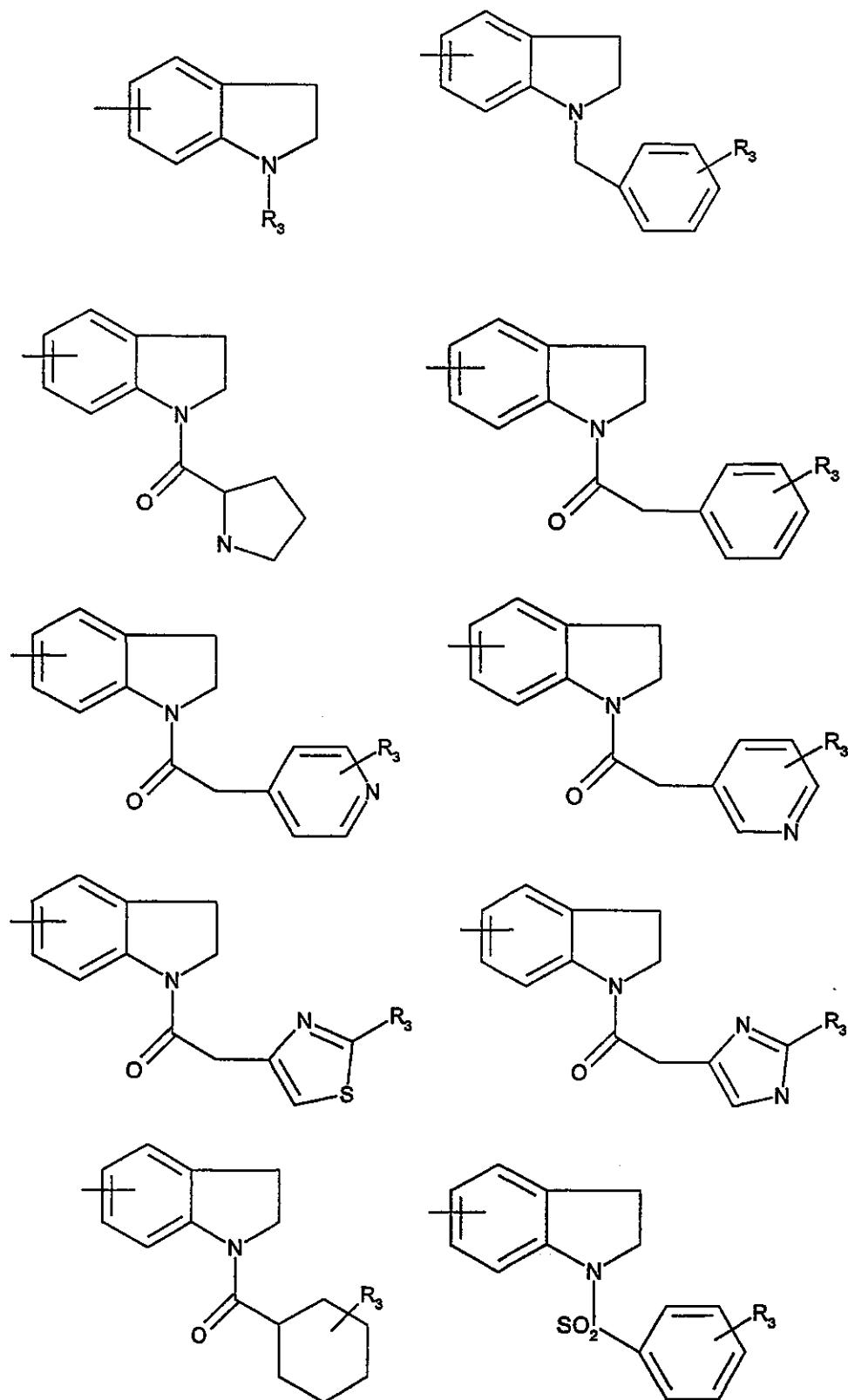


[式中、 R_{3x} は、 R_3 または式 : - (X_{1y}) p - (G_1) - R_j
(ここで、 p は 0 または 1 ; X_{1y} は $C O$ 、 $C O O$ 、 $C O N H$ または $S O_2$; G_1 は (C 1 - 3) アルカンジイル、 $C H_2 O C H_2$ または p が 1 である場合に結合 ; および R_j は必要に応じて R_3 で置換される炭素環式またはヘテロ環式基)
である]

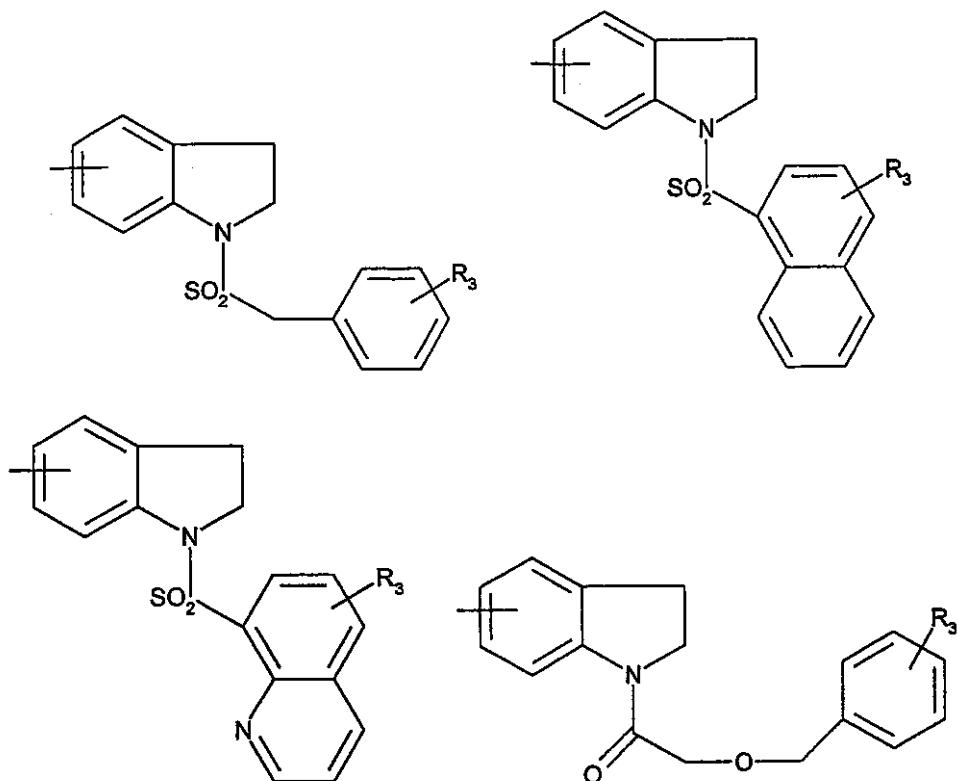
である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

【請求項 27】 L が $C O N H$ であり、 R_{3x} が、 R_3 または式 : - ($C O$) p - (G_1) - R_j
(ここで、 p は 0 または 1 および G_1 は (C 1 - 3) アルカンジイルまたは p が 1 である場合に結合 ; および R_j は必要に応じて R_3 で置換される炭素環式またはヘテロ環式基)
である請求項 26 記載の化合物。

【請求項 28】 L_p が
【化 15】



【化16】



[式中、(i) R_3 が、2,3-ジヒドロインドリル基の1位における置換基である場合、 R_3 はアミノ酸残基；(C1-6)アルキルアミノカルボニル；N-(C1-6)アルキルアミノ(C1-6)アルカノイル；N-アルカノイルアミノアルカノイル；C-ヒドロキシアミノ(C1-6)アルカノイル；ヒドロキシ(C1-6)アルカノイルアミノ(C1-6)アルカノイル；ジ(C1-6)アルキルアミノスルホニル；水素；(C1-6)アルキル；(C1-6)アルカノイル；(C1-6)アルコキシカルボニル；(C1-6)アシルオキシメトキシカルボニル；アミノ(C1-6)アルキル；アミド(CO NH₂)；アミノ(C1-6)アルカノイル；アミノカルボニル(C1-6)アルカノイル；ヒドロキシ(C1-6)アルキル；ヒドロキシ(C1-6)アルカノイル；(C1-6)アルコキシ(C1-6)アルキル；(C1-6)アルコキシカルボニル(C1-6)アルキル；(C1-6)アルコキシカルボニル；(C1-6)アルカノイルアミノ；または(C1-6)アルキルスルホニルであり；および(ii) R_3 が、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジルまたはキノリニル基における置換基である場合、 R_3 は水素、ヒドロキシ、アミノ、アルカノイルアミノ、アルキル、アミノアルキルまたはアルカノイルアミノアルキルである]

から選ばれる請求項26記載の化合物。

【請求項29】 請求項1～28のいずれか1つに記載の化合物および少なくとも1種の医薬的に許容しうる担体または賦形剤を含む医薬組成物。