

【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 0 7 C	237/52	(2006.01)
A 6 1 K	31/166	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/405	(2006.01)
A 6 1 K	31/4172	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/428	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/4465	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/08	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 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

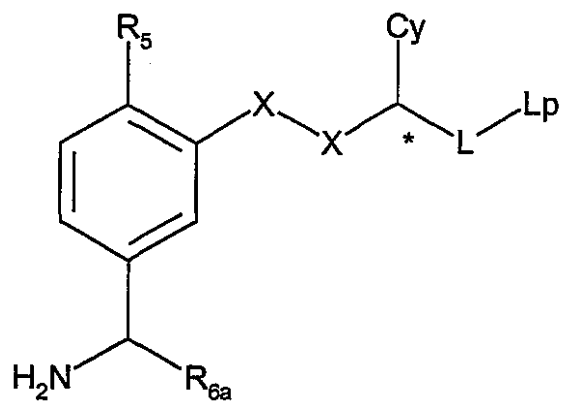
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 ( I ) :

【化 1】



(I)

[式中、 $R_5$  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、( C 1 - 6 ) アルキルまたはフェニル ( C 1 - 6 ) アルキルであり；

L は、CO または  $\text{CONR}_{1d}(\text{CH}_2)_m$  (ここで、m は、0 または 1 であり、 $\text{R}_{1d}$  は水素、(C 1 - 6) アルキルまたはフェニル (C 1 - 6) アルキルである) であり；

Cy は、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、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  $\text{R}_{3a}$  または  $\text{R}_{3i}\text{X}_i$  (ここで、 $\text{X}_i$  は、結合、O、NH、CO、CONH、NHCO、 $\text{SO}_2$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2$  または  $\text{SO}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_2$  であり、 $\text{R}_{3i}$  は、必要に応じて  $\text{R}_{3a}$  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  $\text{R}_{3a}$  は独立して、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、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CONH}_2$ 、アミノアセチル、(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、アミノ(C 1 - 6) アルカノイルアミノ、(C 1 - 6) アルキルアミノ(C 1 - 6) アルカノイルアミノ、ジ(C 1 - 6) アルキルアミノ(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) アルキルスルホンアミド、(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  $\text{C}=\text{O}$ 、O、OCO、COO、S、SO、 $\text{SO}_2$ 、 $\text{CONR}_{1e}$ 、 $\text{NR}_{1e}-\text{CO}$  - または  $\text{NR}_{1e}$  結合 (ここで、 $\text{R}_{1e}$  は、 $\text{R}_{1a}$  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  $\text{R}_3$  基 (ここで、 $\text{R}_3$  は、アミノ酸残基、N - (C 1 - 6) アルキルアミノカルボニル、N, N - ジ(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、ヒドロキシ(C 2 - 6) アルカノイルアミノ(C 1 - 6) アルカノイル、ジ(C 1 - 6) アルキルアミノスルホニル、水素、ヒドロキシル、(C 1 - 6) アルコキシ、(C 1 - 6) アルカノイルオキシ、(C 1 - 6) アルキル、(C 2 - 6) アルケニル(C 2 - 6) アルキニル、(C 3 - 6) アルケニルオキシカルボニル、(C 1 - 6) アルカノイル、アミノ(C 1 - 6) アルキル、アミド( $\text{CONH}_2$ )、アミノ(C 1 - 6) アルカノイル、アミノカルボニル(C 1 - 5) アルカノイル、ヒドロキシ(C 1 - 6) アルキル、カルボキシ、ヒドロキシ(C 1 - 6) アルカノイル、(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 - 5) アルキル、(C 1 - 6) アルコキシカルボニル、(C 1 - 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、(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的に許容しうる塩。

【請求項 2】  $\text{R}_5$  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】  $\text{R}_5$  が、水素である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】  $\text{R}_{6a}$  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  $\text{NH}_2-\text{CH}(\text{Cy})-\text{COOH}$  (ここで、 $\text{NH}_2$  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。

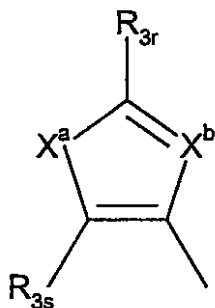
【請求項 7】 Cy が、シクロヘキシル、ピペリジン - 4 - イル、3, 4 - メチレンジオキシフェニル、フル - 2 - イル、チエン - 2 - イル、チエン - 3 - イル、イミダゾール - 4 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジン - 2 - イル、ピラジン - 3 - イル、ナフト - 1 - イル、ナフト - 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  $CH_2$  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； $CONH_2$ ； $CH_2CONH_2$ ；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；ヒドラジド；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 - メチルスルホンアミドチアゾール - 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  $CH_2$  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、 $CONH_2$ 、 $CH_2CONH_2$ 、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) アルキルスルホンアミド、(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、 $CONH_2$ 、 $CH_2CONH_2$ 、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) アルキルスルホンアミド、(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。

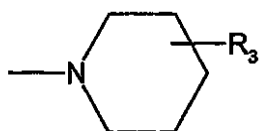
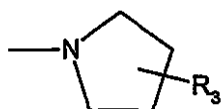
【請求項 16】 L が、CO、CONH、CONCH<sub>3</sub> またはCONHCH<sub>2</sub> である請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 17】 L が、CO、CONH またはCONCH<sub>3</sub> である請求項 16 記載の化合物。

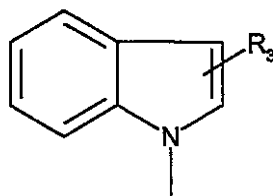
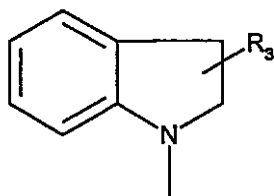
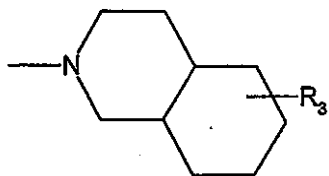
【請求項 18】

(a) L が CO であり、Lp が

【化 3】



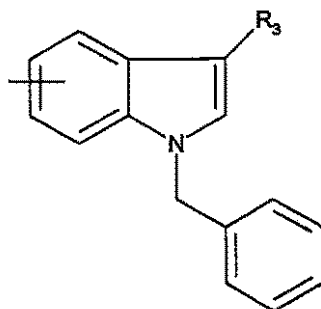
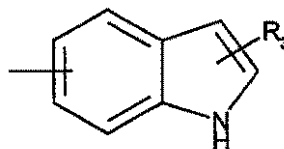
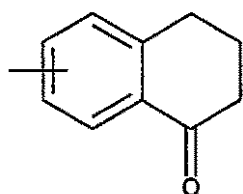
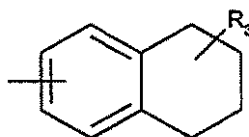
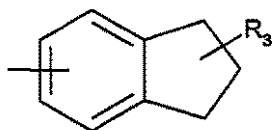
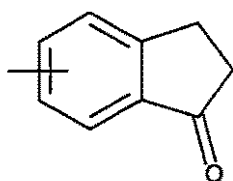
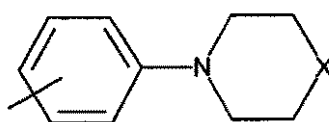
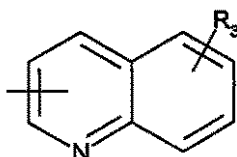
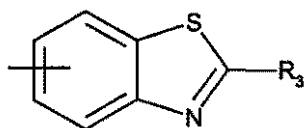
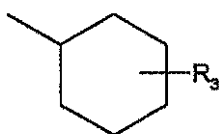
【化 4】



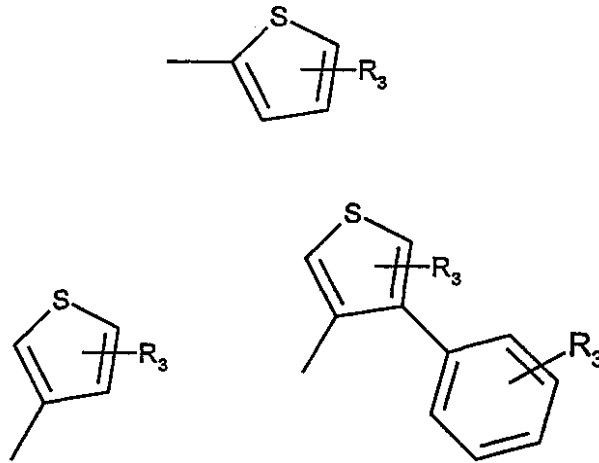
である；または

(b) L が CONH であり、L p が

【化 5】



【化 6】

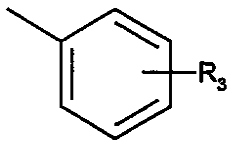


[ここで、XはCHまたはNである]

である；または

(c) LがCONR<sub>1d</sub>であり、L<sub>p</sub>が

【化7】

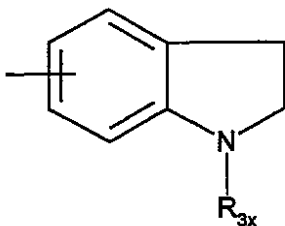


[ここで、R<sub>3</sub>は、(C1-6)アルキルアミノカルボニル、N-(C1-6)アルキルアミノ(C1-6)アルカノイル、N-(C1-6)アルカノイルアミノ(C1-6)アルカノイル、C-ヒドロキシアミノ(C1-6)アルカノイル、水素、(C1-6)アルコキシ、(C1-6)アルキル、アミノ(C1-6)アルキル、アミノカルボニル、ヒドロキシ(C1-6)アルキル、(C1-6)アルコキシ(C1-6)アルキル、(C1-6)アルコキシカルボニル、(C1-6)αアシルオキシメトキシカルボニル、(C1-6)アルキルアミノ、アミノ、ハロ、シアノ、ニトロ、チオール、(C1-6)アルキルチオ、(C1-6)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)アルキルスルホンアミド、(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CONR<sub>1d</sub>であり、L<sub>p</sub>が

【化8】



[式中、R<sub>3x</sub>は、R<sub>3</sub>または式： $-(X_{1y})_p-(G_1)-R_j$

(ここで、pは0または1；X<sub>1y</sub>はCO、COO、CONHまたはSO<sub>2</sub>；G<sub>1</sub>は(C1-3)アルカンジイル、CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>またはpが1である場合に結合；およびR<sub>j</sub>は必要に応じてR<sub>3</sub>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。

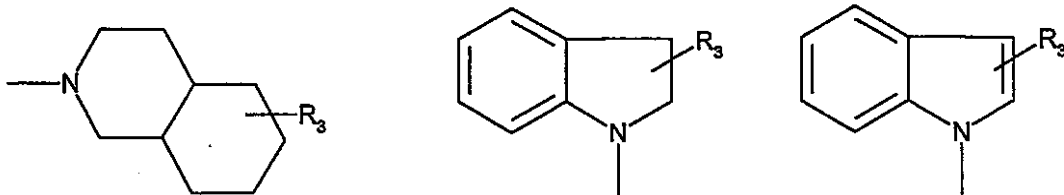
【請求項 19】  $R_3$  が、N - アセチルアラニノイル；セリノイル；トレオニノイル；アスパルトイル；グルタモイル；N - (1, 3 - ジメチル) プチルアミノカルボニル；N - メチル - N - エチルアミノカルボニル；N - メチルアセチル；2 - N - アセチルアミノアセチル、2 - N - アセチルアミノプロパノイル；2 - N - (2 - メチルプロパノイル) アミノアセチル；2 - アミノ - 3 - ヒドロキシプロパノイル；2 - アミノ - 3 - ヒドロキシブタニル；2 - ヒドロキシアセチルアミノアセチル；ジメチルアミノスルホニル；水素；ヒドロキシル；メトキシ；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； $CONH_2$ ；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 CO であり、L p が

【化 9】



【化 10】

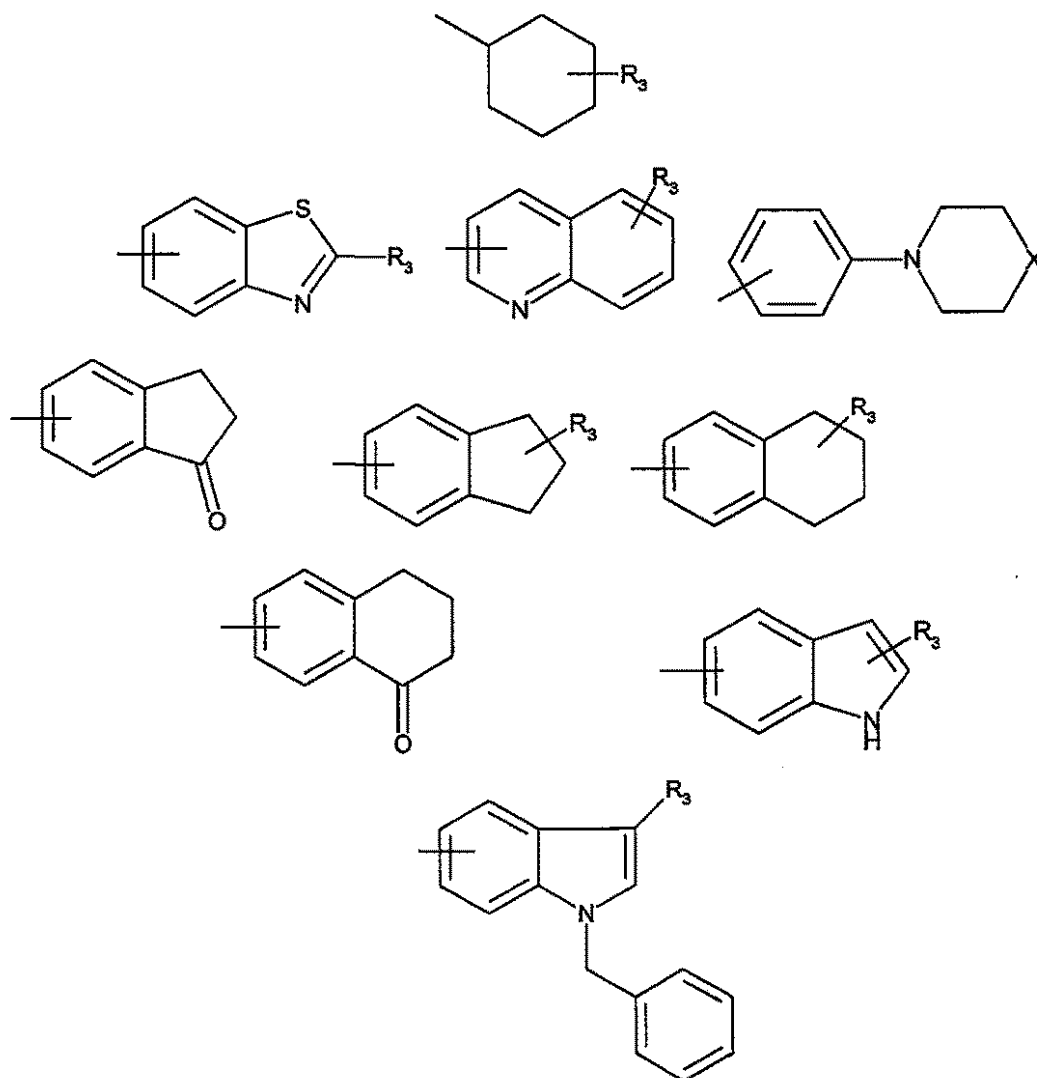


である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

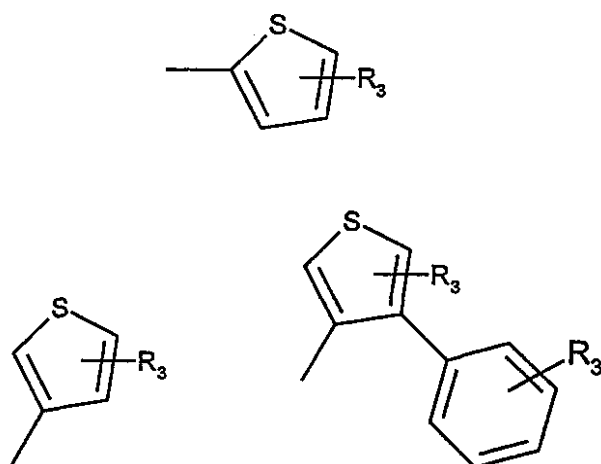
【請求項 21】  $R_3$  が、水素、ヒドロキシまたは (C 1 - 6) アルキルアミノカルボニルである請求項 19 記載の化合物。

【請求項 22】 L が CONH であり、L p が

【化 11】



## 【化 1 2】

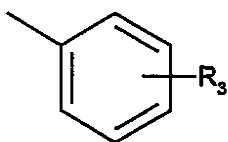


[ここで、XはCHまたはNである]

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  $\text{CONR}_{1d}$  であり、Lp が  
【化 13】

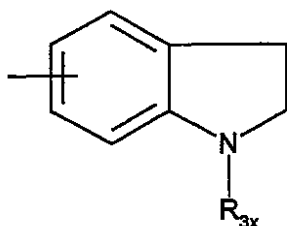


[ここで、 $R_3$  は、(C1 - 6) アルキルアミノカルボニル、N - (C1 - 6) アルキルアミノ (C1 - 6) アルカノイル、N - (C1 - 6) アルカノイルアミノ (C1 - 6) アルカノイル、C - ヒドロキシアミノ (C1 - 6) アルカノイル、水素、(C1 - 6) アルコキシ、(C1 - 6) アルキル、アミノ (C1 - 6) アルキル、アミノカルボニル、ヒドロキシ (C1 - 6) アルキル、(C1 - 6) アルコキシ (C1 - 6) アルキル、(C1 - 6) アルコキシカルボニル、(C1 - 6) aアシルオキシメトキシカルボニル、(C1 - 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) アルキルスルホンアミド、(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]

である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

【請求項 25】 Lp 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  $\text{CONR}_{1d}$  であり、Lp が  
【化 14】

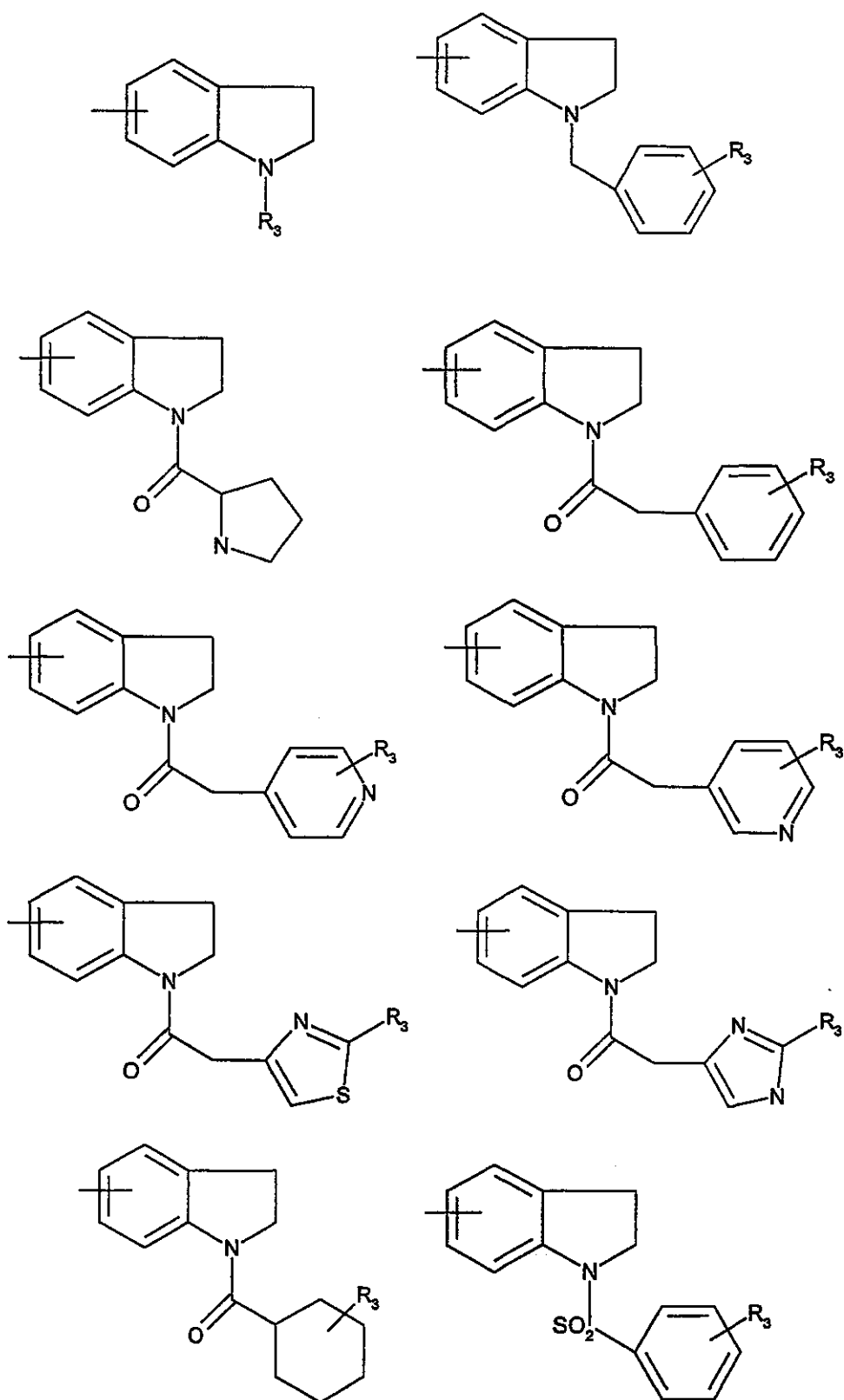


[式中、 $R_{3x}$  は、 $R_3$  または式： $-(X_{1y})_p - (G_1) - R_j$  (ここで、p は 0 または 1； $X_{1y}$  は CO、COO、CONH または  $\text{SO}_2$ ； $G_1$  は (C1 - 3) アルカンジイル、 $\text{CH}_2\text{OCH}_2$  または p が 1 である場合に結合；および  $R_j$  は必要に応じて  $R_3$  で置換される炭素環式またはヘテロ環式基) である]

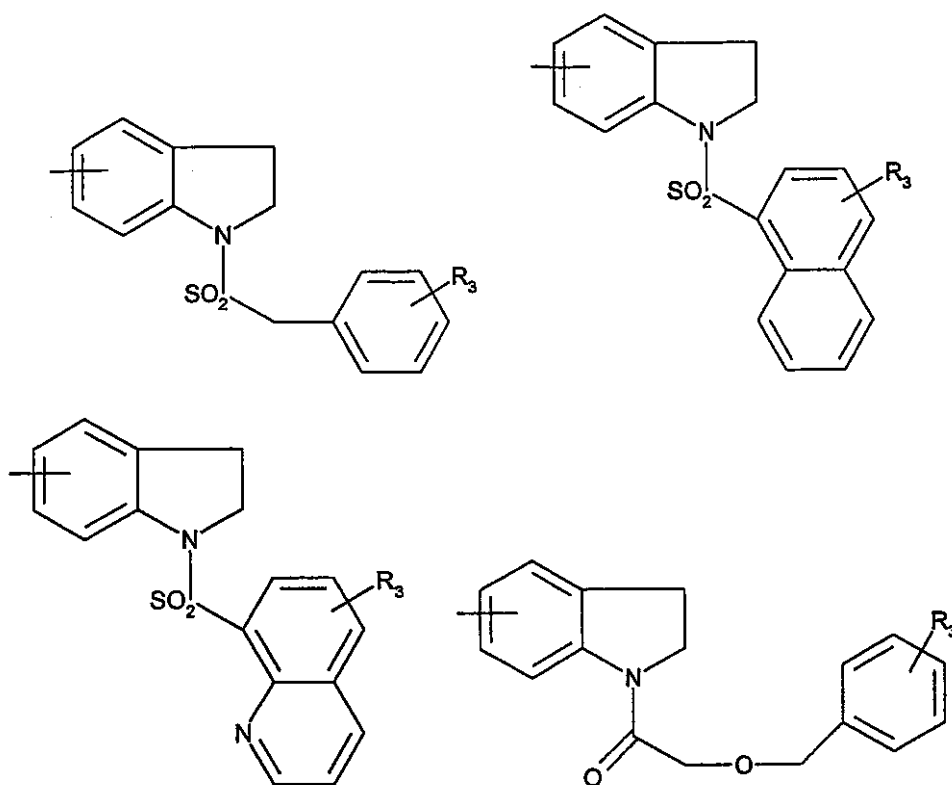
である請求項 18 または請求項 19 記載の化合物。

【請求項 27】 L が CONH であり、 $R_{3x}$  が、 $R_3$  または式： $-(\text{CO})_p - (G_1) - R_j$  (ここで、p は 0 または 1 および  $G_1$  は (C1 - 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】 Lp が  
【化 15】



【化 1 6】



[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(CONH<sub>2</sub>)；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。