

【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29年2月16日 (2017.2.16)

【公表番号】特表2016-505042(P2016-505042A)

【公表日】平成28年2月18日 (2016.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-011

【出願番号】特願2015-553839(P2015-553839)

【国際特許分類】

C 0 7 D 237/32 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 491/048 (2006.01)

C 0 7 D 407/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 237/32

C 0 7 D 403/10 C S P

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D	413/12	
C 0 7 D	407/12	
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	513/04	3 4 3
C 0 7 D	471/04	1 0 7 Z
C 0 7 D	487/04	1 4 2
C 0 7 D	471/04	1 0 6 A
C 0 7 D	487/04	1 4 0
C 0 7 D	471/04	1 0 6 C
C 0 7 D	491/048	
C 0 7 D	487/04	1 4 6
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	487/04	1 4 4
C 0 7 D	407/14	
C 0 7 D	401/14	
A 6 1 K	31/502	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	1/04	

【手続補正書】

【提出日】平成29年1月16日(2017.1.16)

【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

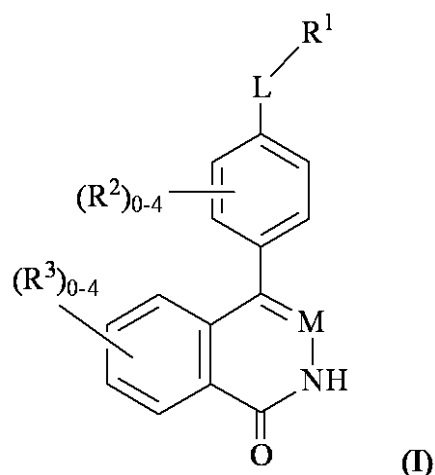
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[式中、

Mは、NおよびC R¹⁰から選択され；

Lは、-C R⁴ R⁴ C(O)-、-OC(O)-、-N R⁶ C(O)-および-N R⁶から選択され；

R¹は、N R⁵ R⁵、C₃₋₁₀炭素環および4～15員ヘテロ環（炭素原子と、N、N R⁸、OおよびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は1～4つのR⁷で置換されており；

R²は、各々独立して、ハロゲン、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルキルチオ、C₁₋₄ハロアルキル、-OH、-CH₂OH、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、CN、-NH₂、-NH(C₁₋₄アルキル)、-N(C₁₋₄アルキル)₂、-CO₂H、-CH₂CO₂H、-CO₂(C₁₋₄アルキル)、-CO(C₁₋₄アルキル)、-CH₂NH₂、-CONH₂、-CONH(C₁₋₄アルキル)、-CON(C₁₋₄アルキル)₂、-OCH₂CO₂H、-NHCO(C₁₋₄アルキル)、-NHCO₂(C₁₋₄アルキル)、-NH SO₂(C₁₋₄アルキル)、-SO₂NH₂、-C(=NH)NH₂、炭素環およびヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、炭素環およびヘテロ環は、0～4つのR⁹で置換されており；

R³は、各々独立して、ハロゲン、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルキルチオ、C₁₋₄ハロアルキル、-CH₂OH、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、CN、-NH₂、-NH(C₁₋₄アルキル)、-N(C₁₋₄アルキル)₂、-CO₂H、-CH₂CO₂H、-CO₂(C₁₋₄アルキル)、-CO(C₁₋₄アルキル)、-CH₂NH₂、-CONH₂、-CONH(C₁₋₄アルキル)、-CON(C₁₋₄アルキル)₂、-OCH₂CO₂H、-NHCO(C₁₋₄アルキル)、-NHCO₂(C₁₋₄アルキル)、-NH SO₂(C₁₋₄アルキル)、-SO₂NH₂、-C(=NH)NH₂、炭素環およびヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル、炭素環およびヘテロ環は、0～4つのR⁹で置換されており；

R⁴は、各々独立して、H、OH、NH₂、CH₂NH₂、C₁₋₄ハロアルキル、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃、-NH(C₁₋₄アルキル)、-N(C₁₋₄アルキル)₂、C₁₋₄アルコキシ、CH₂OH、CH₂O(C₁₋₄アルキル)、CH₂CO₂H、CH₂CO₂(C₁₋₄アルキル)、C₁₋₄アルキル、炭素環およびヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、炭素環およびヘテロ環は、0～4つのR⁹で置換されており；

R⁵は、各々独立して、H、C₁₋₄アルキル、-(C R⁶ R⁶)_n-C₃₋₁₀炭素環および-(C R⁶ R⁶)_n-4～10員ヘテロ環（炭素原子と、N、N R⁸、OおよびS(O)_pから選択される1～4個のヘテロ原子とを含む）から選択され、前記アルキル

、炭素環およびヘテロ環は 1 ~ 4 つの R^7 で置換されているか；あるいは、

R^5 および R^5 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、1 ~ 4 つの R^7 で置換された 4 ~ 15 員ヘテロ環を形成し；

R^6 は、各々独立して、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

R^7 は、各々独立して、H、=O、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、CN、OH、 CF_3 、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n-NR^8R^8$ 、 $-NHCO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCOCF_3$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_3O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2OH$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2NH_2$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHCO_2CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2NHCO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHC(O)NR^8R^8$ 、 $-NH SO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2OH$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n-CONR^8R^8$ 、 $-O(CH_2)_n$ -炭素環、 $-O(CH_2)_n$ -ヘテロ環、 $-NHCO$ -炭素環、 $-NHCO$ -ヘテロ環、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子とを含む）から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^8 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 $-(CH_2)_n-C(O)C_{1-4} \text{ アルキル}$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)$ -炭素環、 $-(CH_2)_n-C(O)$ -ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-C(O)NR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_n-C(O)O$ -アルキル、 $-(CH_2)_n-C(O)O$ -炭素環、 $-(CH_2)_n-C(O)O$ -ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-SO_2$ アルキル、 $-(CH_2)_n-SO_2$ 炭素環、 $-(CH_2)_n-SO_2$ ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-SO_2NR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されているか；あるいは

R^8 および R^8 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、0 ~ 4 つの R^9 で置換された 4 ~ 10 員ヘテロ環を形成し；

R^9 は、各々独立して、ハロゲン、OH、 NO_2 、 CHF_2 、 CF_3 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CH_2OH 、 $CO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 CO_2H 、 $CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ -炭素環、 $-O(CH_2)_n$ -ヘテロ環、 $-O(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CR^{10}R^{10})_n-4 \sim 10$ 員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^b で置換されており；

R^{10} は、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

R^a は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $CO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $COCF_3$ 、 $CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CONH-C_{1-4} \text{ アルキレン}-CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $C_{1-4} \text{ アルキレン}-CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 R^c 、 CO_2R^c および $CONHR^c$ から選択されるか；あるいは、

R^a および R^a は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、4 ~ 10 員ヘテロ環を形成し、前記アルキル、アルキレンおよびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^b で置換されており；

R^b は、各々独立して、=O、OH、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 OCF_3 、 NH_2 、 NO_2 、 $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $CO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $CO(C_{1-4} \text{ ハロアルキル})$ 、 $CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $CONH_2$ 、 $-CONH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-CONH-C_{1-4} \text{ アルキレン}-O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-CONH-C_{1-4} \text{ アルキレン}-N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-CONH-C_{1-4} \text{ アルキレン}-N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C_{1-4} \text{ アルキレン}-O-P(O)(OH)_2$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-R^c$ 、 CO

R^c 、 CO_2R^c および $CONHR^c$ から選択され；

R^c は、各々独立して、 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n$ -フェニル、および $(CH_2)_n-5 \sim 6$ 員ヘテロ環（炭素原子と、N、NH、N(C_{1-4} アルキル)、O および $S(O)_p$ からなる群から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む）から選択され；各環部分は、0～2 つの R^d で置換されている；

R^d は、各々独立して、 $=O$ 、ハロゲン、 $-OH$ 、 C_{1-4} アルキル、 NH_2 、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルコキシおよび $-NHCO(C_{1-4}$ アルキル)、ならびにヘテロ環（炭素原子と、N、NH、N(C_{1-4} アルキル)、O および $S(O)_p$ からなる群から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む）から選択され；

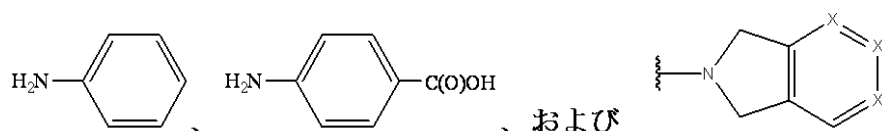
n は、各々独立して、0、1、2、3 および 4 から選択され；

p は、各々独立して、0、1 および 2 から選択される；

但し、

L が $NHC(O)$ である場合、 R^1 は、

【化 2】



（式中、 X は、N であるか、あるいは置換または非置換炭素原子である）以外であり；

L が NR^6 である場合、 R^1 は 1～4 つの R^7 により置換されたヘテロ環である】
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。

【請求項 2】

M が、 CR^{10} であり；

L が、 $-CR^4R^4C(O)-$ 、 $-OC(O)-$ および $-NR^6C(O)-$ から選択され；

R^1 が、 NR^5R^5 、 C_{3-10} 炭素環および 4～15 員ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、1～4 つの R^7 で置換されており；

R^3 が、各々独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} アルコキシから選択され；

R^4 が、H であり；

R^5 が、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CR^6R^6)_n-C_{3-10}$ 炭素環および 4～10 員ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は 1～4 つの R^7 で置換されており；あるいは、

R^5 および R^5 が、それらに結合している窒素原子と共に一緒になって、1～4 つの R^7 で置換された 4～15 員ヘテロ環を形成し；

R^7 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 $-NR^8R^8$ 、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1～4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、アルコキシ、炭素環およびヘテロ環は、0～4 つの R^9 で置換されており；

R^8 が、各々独立して、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

R^9 が、各々独立して、ハロゲン、OH、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシから選択され；

R^{10} が、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

n が、各々独立して、0、1、2、3、および 4 から選択され；ならびに

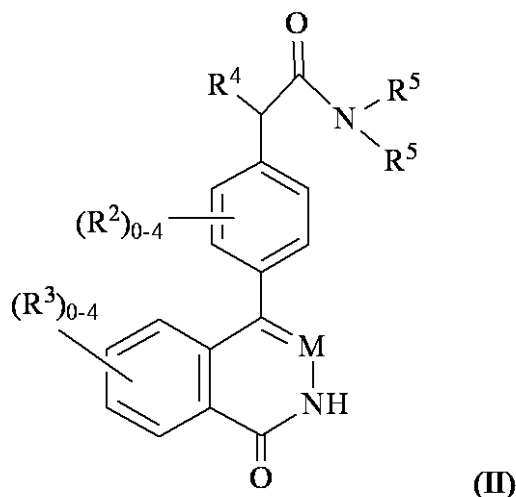
p が、各々独立して、0、1、および 2 から選択される、

請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式 (II) :

【化 3】



[式中、

Mは、NおよびC R¹⁰から選択され；

R⁵は、各々独立して、H、C₁₋₄アルキル、-(C R⁶ R⁶)_n-C₃₋₁₀炭素環および-(C R⁶ R⁶)_n-4~10員ヘテロ環（炭素原子と、N、NR⁸、OおよびS(O)_pから選択される1~4個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は1~4つのR⁷で置換されているか；あるいは、

R⁵およびR⁵は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、1~4つのR⁷で置換された4~10員ヘテロ環を形成し；

R⁷は、各々独立して、H、=O、NO₂、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、OH、CF₃、-(CH₂)_n-CO₂H、-(CH₂)_n-CO₂(C₁₋₄アルキル)、-(CH₂)_n-NR⁸R⁸、-NHCO(C₁₋₄アルキル)、-NHCOCF₃、-NHCO₂(C₁₋₄アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₂O(C₁₋₄アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₃O(C₁₋₄アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₂OH、-NHCO₂(CH₂)₂NH₂、-NHCO₂(CH₂)₂N(C₁₋₄アルキル)₂、-NHCO₂CH₂CO₂H、-CH₂NHCO₂(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O)NR⁸R⁸、-NH SO₂(C₁₋₄アルキル)、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C₁₋₄アルキル)、-SO₂N(C₁₋₄アルキル)₂、-SO₂NH(CH₂)₂OH、-SO₂NH(CH₂)₂O(C₁₋₄アルキル)、-(CH₂)_n-CONR⁸R⁸、-O(CH₂)_n-炭素環、-O(CH₂)_n-ヘテロ環、-NHCO-炭素環、-NHCO-ヘテロ環、-(CH₂)_n-炭素環および-(CH₂)_n-ヘテロ環（炭素原子と、N、NR⁸、OおよびS(O)_pから選択される1~4個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つのR⁹で置換されており；

R⁸は、各々独立して、H、C₁₋₄アルキル、C(O)C₁₋₄アルキル、C(O)炭素環、C(O)ヘテロ環、-(CH₂)_nC(O)NR^aR^a、C(O)O-アルキル、C(O)O-炭素環、C(O)O-ヘテロ環、SO₂アルキル、SO₂炭素環、SO₂ヘテロ環、SO₂NR^aR^a、-(CH₂)_n-炭素環および-(CH₂)_n-ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つのR⁹で置換されており；

R⁹は、各々独立して、ハロゲン、OH、NO₂、CHF₂、CF₃、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CH₂OH、CO₂H、CO₂(C₁₋₄アルキル)、CONH₂、-(CH₂)_nNR^aR^a、-(CH₂)_nCONR^aR^a、-O(CH₂)_nヘテロ環、-O(CH₂)₍₂₋₄₎NR^aR^a、-(C R¹⁰ R¹⁰)_n-4~10員ヘ

テロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0～4つの R^b で置換されており；

R^{10} は、Hおよび C_{1-4} アルキルから選択され；

R^a は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $CO(C_{1-4}$ アルキル)、 $COCF_3$ 、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 C_{1-4} アルキレン、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 R^c 、 CO_2R^c および $CONHR^c$ から選択されるか；あるいは、

R^a および R^a は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、4～10員ヘテロ環を形成し、前記アルキル、アルキレンおよびヘテロ環は、0～4つの R^b で置換されており；

R^b は、各々独立して、 $=O$ 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 OCF_3 、 NH_2 、 NO_2 、 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $CO(C_{1-4}$ アルキル)、 $CO(C_{1-4}$ ハロアルキル)、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $CONH_2$ 、 $-CONH(C_{1-4}$ アルキル)、 $-CON(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン、 $-O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン、 $-N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン、 $-N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-C_{1-4}$ アルキレン、 $-O-P(O)(OH)_2$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-R^c$ 、 COR^c 、 CO_2R^c および $CONHR^c$ から選択され；

R^c は、各々独立して、 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n$ -フェニル、および $(CH_2)_n-5\sim 6$ 員ヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_{1-4}$ アルキル)、Oおよび $S(O)_p$ からなる群から選択される1～4個のヘテロ原子を含む）から選択され；各環部分は、0～2つの R^d で置換されており；

R^d は、各々独立して、 $=O$ 、ハロゲン、 $-OH$ 、 C_{1-4} アルキル、 NH_2 、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルコキシおよび $-NHCO(C_{1-4}$ アルキル)、ならびにヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_{1-4}$ アルキル)、Oおよび $S(O)_p$ からなる群から選択される1～4個のヘテロ原子を含む）から選択され；

n は、各々独立して、0、1、2、3、および4から選択され；

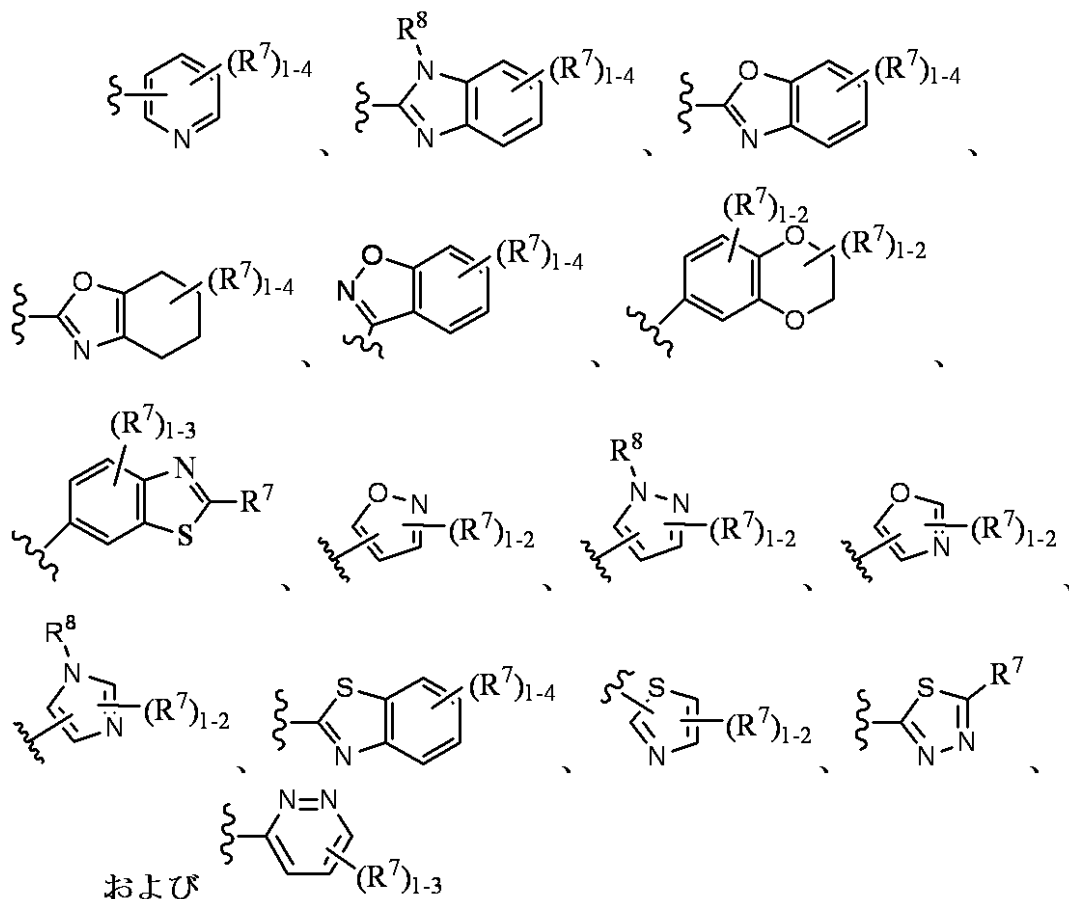
p は、各々独立して、0、1、および2から選択される]

を有する化合物、あるいはその立体異性体、互変異性体またはその医薬的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

R^5 が、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CH_2)_n-C_{3-10}$ 炭素環、 $-(CH_2)_n$ -アリール、 $-(CH_2)_n-4\sim 10$ 員ヘテロ環（

【化 4】

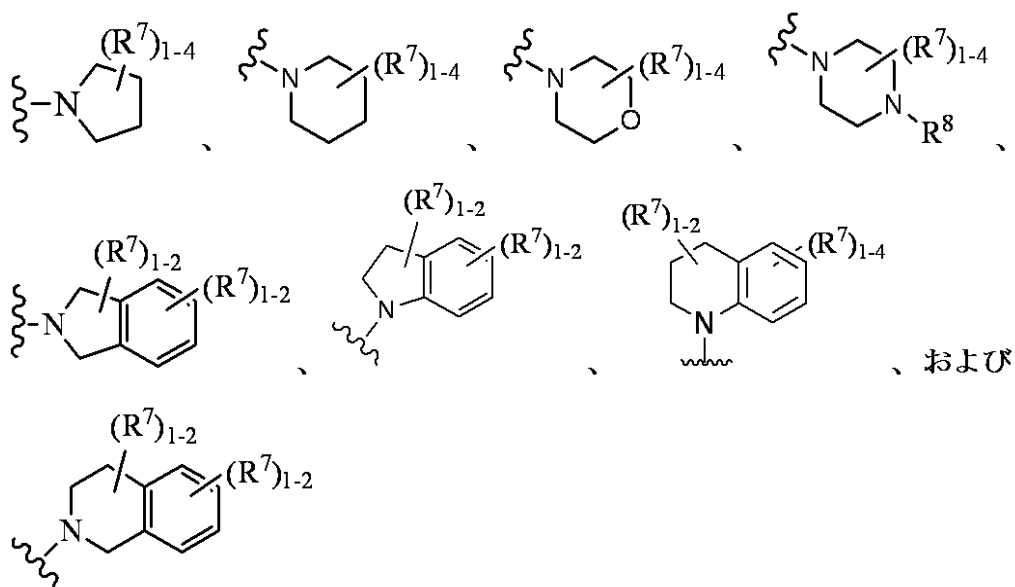


から選択される) から選択され; 前記アルキル、シクロアルキル、アリールは、1 ~ 4 つの R^7 により置換されている、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

R^5 および R^5 が、それらに結合している窒素原子と共に一緒になって、

【化 5】



から選択されるヘテロ環を形成し;

R^7 が、各々独立して、H、= O、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ

、CN、OH、CF₃、-(CH₂)_n-CO₂H、-(CH₂)_n-CO₂(C₁-4アルキル)、-(CH₂)_n-NR⁸R⁸、-CH₂NH₂、-NHCO(C₁-4アルキル)、-NHCOCF₃、-NHCO₂(C₁-4アルキル)、-NHC(O)NH₂、-NHC(O)NH(C₁-4アルキル)、-NHC(O)N(C₁-4アルキル)₂、-NH₂SO₂(C₁-4アルキル)、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C₁-4アルキル)、-SO₂N(C₁-4アルキル)₂、-SO₂NH(CH₂)₂OH、-SO₂NH(CH₂)₂O(C₁-4アルキル)、-(CH₂)_n-CONR⁸R⁸、-O(CH₂)_n-炭素環、-O(CH₂)_n-ヘテロ環、-NHCO-炭素環、-NHCO-ヘテロ環、-(CH₂)_n-炭素環および-(CH₂)_n-ヘテロ環(炭素原子と、N、NR⁸、OおよびS(O)_pから選択される1~4個のヘテロ原子を含む)から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つのR⁹で置換されており；

R⁸が、各々独立して、H、C₁-4アルキル、C(O)C₁-4アルキル、C(O)炭素環、C(O)ヘテロ環、-(CH₂)_n-C(O)NR^aR^a、C(O)O-アルキル、C(O)O-炭素環、C(O)O-ヘテロ環、SO₂アルキル、SO₂炭素環、SO₂ヘテロ環、SO₂NR^aR^a、-(CH₂)_n-炭素環および-(CH₂)_n-ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つのR⁹で置換されているか；あるいは、

R⁸およびR⁸が、それらに結合している窒素原子と共に一緒になって、0~4つのR⁹で置換された4~10員ヘテロ環を形成し；ならびに

R⁹が、各々独立して、ハロゲン、OH、NO₂、CHF₂、CF₃、C₁-4アルキル、C₁-4アルコキシ、CH₂OH、CO₂H、CO₂(C₁-4アルキル)、CONH₂、-(CH₂)_nNR^aR^a、-(CH₂)_nCONR^aR^a、-O(CH₂)_nヘテロ環、-O(CH₂)₍₂₋₄₎NR^aR^a、-(CR¹⁰R¹⁰)_n-4~10員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つのR^bで置換されており；

R^aが、各々独立して、H、C₁-4アルキル、-(CH₂)_nOH、CO(C₁-4アルキル)、COCF₃、CO₂(C₁-4アルキル)、-CONH₂、-CONH-C₁-4アルキレン-CO₂(C₁-4アルキル)、C₁-4アルキレン-CO₂(C₁-4アルキル)、R^c、CO₂R^cおよびCONHR^cから選択されるか；あるいは、

R^aおよびR^aが、それらに結合している窒素原子と共に一緒になって、4~10員ヘテロ環を形成し、ここで前記アルキル、アルキレンおよびヘテロ環は、0~4つのR^bで置換されており；

R^bが、各々独立して、=O、ハロゲン、C₁-4アルキル、C₁-4アルコキシ、O、CF₃、NH₂、NO₂、N(C₁-4アルキル)₂、CO(C₁-4アルキル)、CO(C₁-4ハロアルキル)、CO₂(C₁-4アルキル)、CONH₂、-CONH(C₁-4アルキル)、-CON(C₁-4アルキル)₂、-CONH-C₁-4アルキレン-O(C₁-4アルキル)、-CONH-C₁-4アルキレン-N(C₁-4アルキル)₂、-CONH-C₁-4アルキレン-N(C₁-4アルキル)₂、-C₁-4アルキレン-O-P(O)(OH)₂、-NHCO₂(C₁-4アルキル)、-R^c、COR^c、CO₂R^cおよびCONHR^cから選択され；

R^cが、各々独立して、-(CH₂)_n-C₃-6シクロアルキル、-(CH₂)_n-フェニルおよび(CH₂)_n-5~6員ヘテロ環(炭素原子と、N、NH、N(C₁-4アルキル)、OおよびS(O)_pから選択される1~4個のヘテロ原子を含む)からなる群から選択され；各環部分は、0~2つのR^dで置換されており；ならびに、

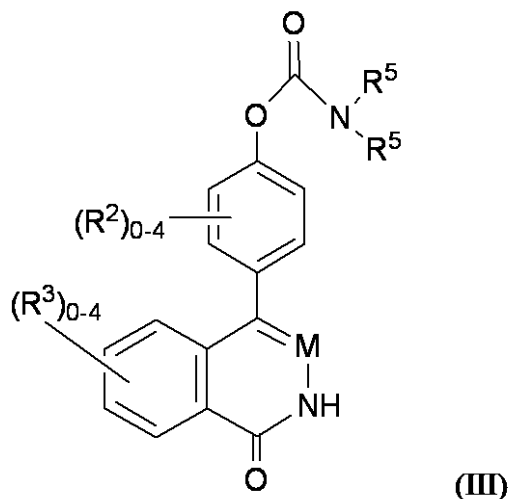
R^dが、各々独立して、=O、ハロゲン、-OH、C₁-4アルキル、NH₂、NH(C₁-4アルキル)、N(C₁-4アルキル)₂、C₁-4アルコキシおよび-NHCO(C₁-4アルキル)ならびにヘテロ環(炭素原子と、N、NH、N(C₁-4アルキル)、O、およびS(O)_pからなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含む)から選択される、

請求項 3 記載の化合物。

【請求項 6】

式 (III) :

【化 6】



[式中、

M は、N および CR^{10} から選択され；

R^5 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CR^6R^6)_n-C_{3-10}$ 炭素環および $-(CR^6R^6)_n-4 \sim 10$ 員ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は 1 ~ 4 つの R^7 で置換されているか；あるいは、

R^5 および R^5 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、1 ~ 4 つの R^7 で置換された 4 ~ 10 員ヘテロ環を形成し；

R^6 は、各々独立して、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

R^7 は、各々独立して、H、=O、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、CN、OH、 CF_3 、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n-NR^8R^8$ 、 $-NHCO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCOCF_3$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_3O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2OH$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2NH_2$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-NHCO_2CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2NHCO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NHC(O)NR^8R^8$ 、 $-NH SO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-SO_2N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2OH$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-(CH_2)_n-CONR^8R^8$ 、 $-O(CH_2)_n$ -炭素環、 $-O(CH_2)_n$ -ヘテロ環、 $-NHCO$ -炭素環、 $-NHCO$ -ヘテロ環、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^8 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $C(O)C_{1-4}$ アルキル、 $C(O)$ 炭素環、 $C(O)$ ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)O$ -アルキル、 $C(O)O$ -炭素環、 $C(O)O$ -ヘテロ環、 SO_2 アルキル、 SO_2 炭素環、 SO_2 ヘテロ環、 $SO_2NR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^9 は、各々独立して、ハロゲン、OH、 NO_2 、 CHF_2 、 CF_3 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CH_2OH 、 CO_2H 、 $CO_2(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 CON

H_2 、 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ ヘテロ環、 $-O(CH_2)_{(2-4)}NR^aR^a$ 、 $-(CR^{10}R^{10})_n$ - 4 ~ 10 員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^b で置換されており；

n は、各々独立して、0、1、2、3、および4から選択され；ならびに

p は、各々独立して、0、1、および2から選択される]

を有する化合物、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である、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

L が、 $-NR^6-$ であり；

R^1 が、1 ~ 4 つの R^7 で置換されたヘテロアリールであり；

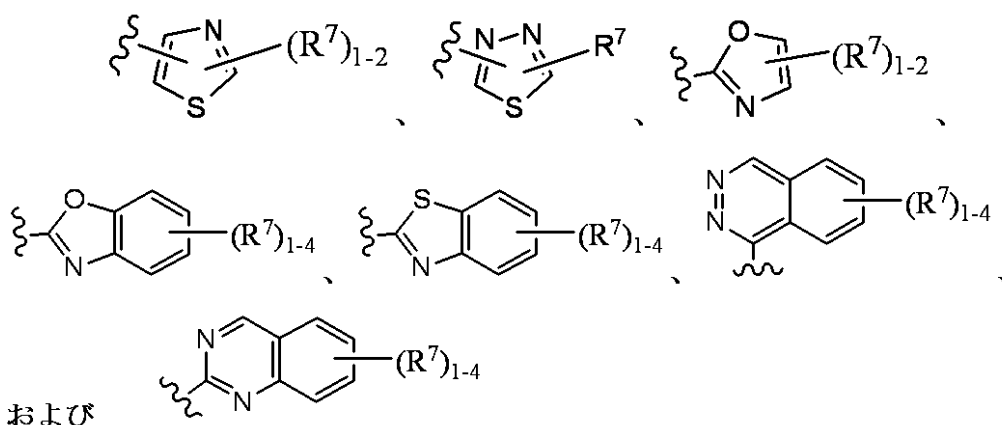
R^7 が、各々独立して、 H 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CN 、 OH 、 $-(CH_2)_n$ - 炭素環および $-(CH_2)_n$ - ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

L が、 $-NR^6-$ であり；かつ

R^1 が、

【化7】



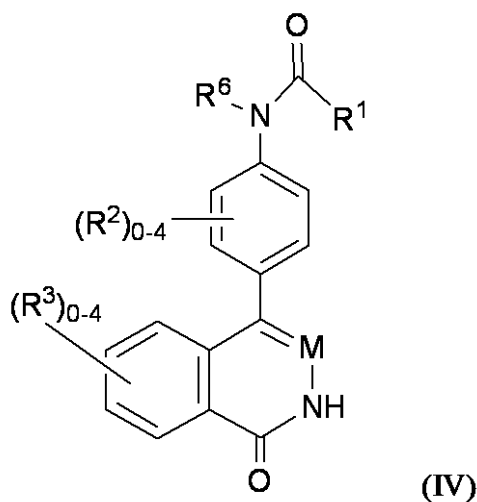
および

から選択される、
請求項7記載の化合物。

【請求項9】

式(IV)：

【化8】



[式中、

R^1 は、 NR^5R^5 、 C_{3-10} 炭素環および 5 ~ 10 員ヘテロ環から選択され、前記炭素環およびヘテロ環が 1 ~ 4 つの R^7 で置換されており；

R^5 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(CR^6R^6)_n-C_{3-10}$ 炭素環および $-(CR^6R^6)_n-4 \sim 10$ 員ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は 1 ~ 4 つの R^7 で置換されているか；あるいは、

R^5 および R^5 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、1 ~ 4 つの R^7 で置換された 4 ~ 10 員ヘテロ環を形成し；

R^6 は、各々独立して、H および C_{1-4} アルキルから選択され；

R^7 は、各々独立して、H、 $=O$ 、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CN 、 OH 、 CF_3 、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-(CH_2)_n-NR^8R^8$ 、 $-NHCO(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHCOCF_3$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_2O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_3O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_2OH$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2NH_2$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-NHCO_2CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2NHCO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHC(O)NR^8R^8$ 、 $-NHSO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $-SO_2N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2OH$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-(CH_2)_n-CONR^8R^8$ 、 $-O(CH_2)_n$ -炭素環、 $-O(CH_2)_n$ -ヘテロ環、 $-NHCO$ -炭素環、 $-NHCO$ -ヘテロ環、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環（炭素原子と、N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^8 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 $C(O)C_{1-4}$ アルキル、 $C(O)$ 炭素環、 $C(O)$ ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)O$ -アルキル、 $C(O)O$ -炭素環、 $C(O)O$ -ヘテロ環、 SO_2 アルキル、 SO_2 炭素環、 SO_2 ヘテロ環、 $SO_2NR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_n$ -炭素環および $-(CH_2)_n$ -ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルケニル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^9 は、各々独立して、ハロゲン、 OH 、 NO_2 、 CHF_2 、 CF_3 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CH_2OH 、 CO_2H 、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $CONH_2$ 、 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ ヘテロ環、 $-O(CH_2)_{(2-4)}NR^aR^a$ 、 $-(CR^{10}R^{10})_n-4 \sim 10$ 員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^b で置換されており；

n は、各々独立して、0、1、2、3、および 4 から選択され；

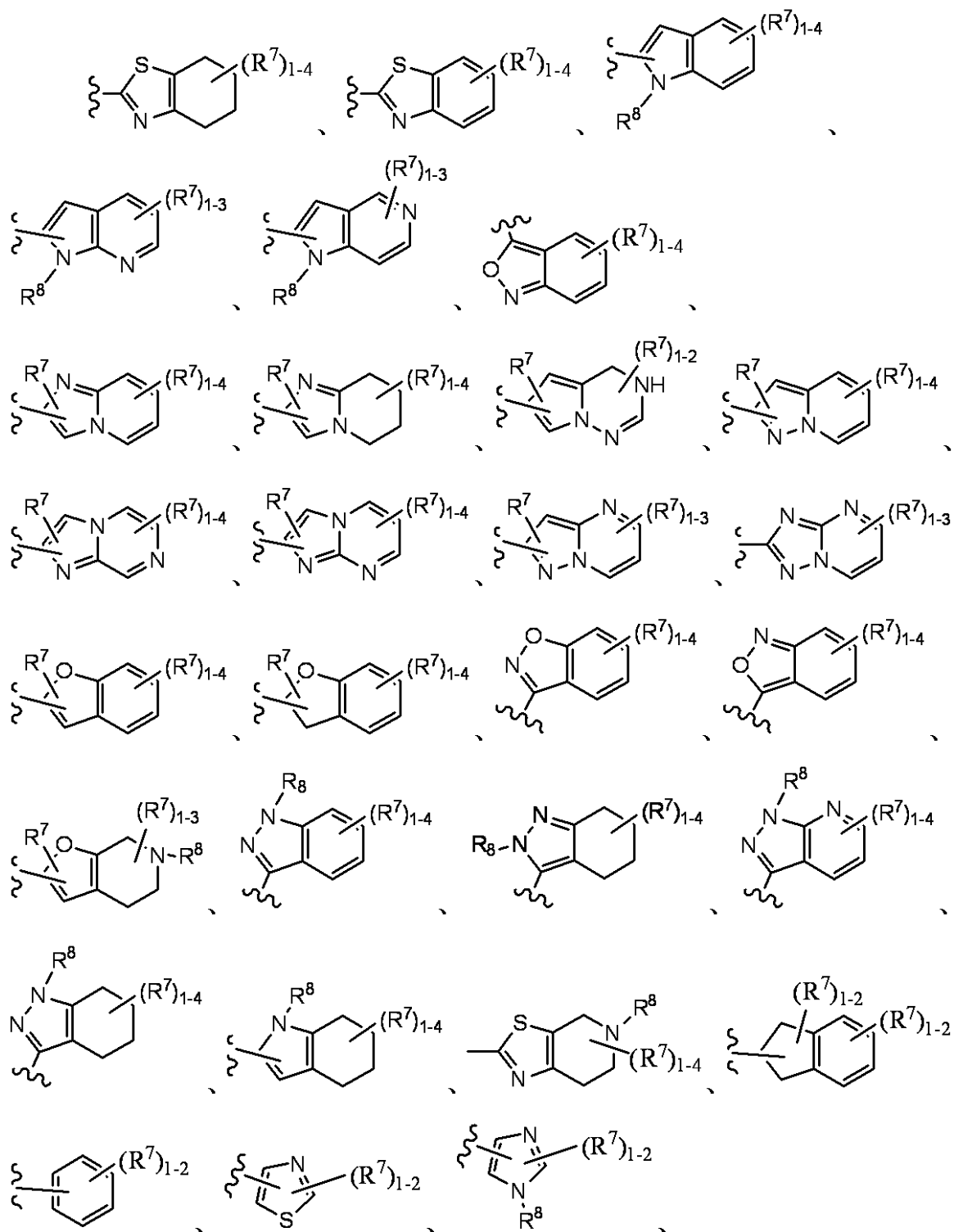
p は、各々独立して、0、1、および 2 から選択される]

を有する化合物、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である、請求項 2 記載の化合物。

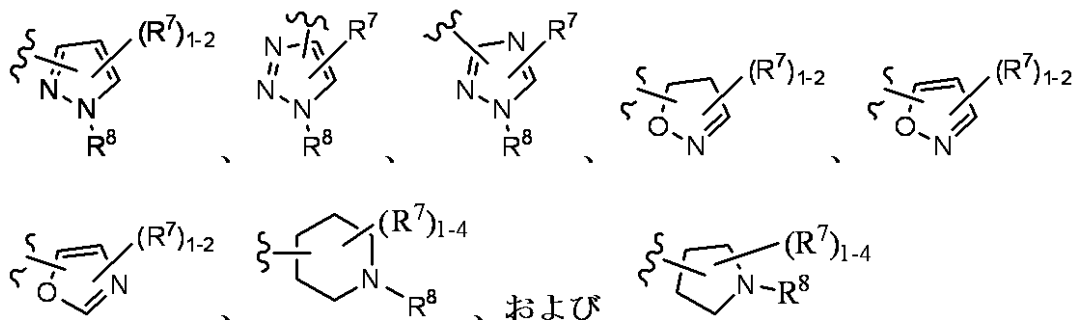
【請求項 10】

R^1 が、

【化 9】



【化 10】



[式中、

R^7 は、各々独立して、H、=O、 NO_2 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CN 、 OH 、 CF_3 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}_2$ (C_{1-4} アルキル)、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}^8\text{R}^8$ 、 $-\text{NHCO}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{NHCOCF}_3$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_3\text{O}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHCO}_2(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{NHCO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^8$ 、 $-\text{NHSO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}(\text{CH}_2)_2\text{O}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CONR}^8\text{R}^8$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n$ -炭素環、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロ環、 $-\text{NHCO}$ -炭素環、 $-\text{NHCO}$ -ヘテロ環、 $-(\text{CH}_2)_n$ -炭素環および $-(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロ環(炭素原子と、N、 NR^8 、Oおよび $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される1~4個のヘテロ原子を含む)から選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つの R^9 で置換されており；

R^8 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $\text{C}(\text{O})$ 炭素環、 $\text{C}(\text{O})$ ヘテロ環、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ -アルキル、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ -炭素環、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ -ヘテロ環、 SO_2 アルキル、 SO_2 炭素環、 SO_2 ヘテロ環、 $\text{SO}_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_n$ -炭素環および $-(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つの R^9 で置換されるか；あるいは、

R^8 および R^8 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、0~4つの R^9 で置換された4~10員ヘテロ環を形成し；ならびに

R^9 は、各々独立して、ハロゲン、 OH 、 NO_2 、 CHF_2 、 CF_3 、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CH_2OH 、 CO_2H 、 $\text{CO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 CONH_2 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{CONR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n$ ヘテロ環、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_{(2-4)}\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-(\text{CR}^{10}\text{R}^{10})_n$ -4~10員ヘテロ環から選択される、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つの R^b で置換されており；

R^a は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $-(\text{CH}_2)_n\text{OH}$ 、 $\text{CO}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 COCF_3 、 $\text{CO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{CONH}-\text{C}_{1-4}$ アルキレン- $\text{CO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 C_{1-4} アルキレン- $\text{CO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 R^c 、 CO_2R^c および CONHR^c から選択されるか；あるいは、

R^a および R^a は、それらが結合している窒素原子と共に一緒になって、4~10員ヘテロ環を形成し、前記アルキル、アルキレンおよびヘテロ環は、0~4つの R^b で置換されており；

R^b は、各々独立して、=O、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 O 、 CF_3 、 NH_2 、 NO_2 、 $\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $\text{CO}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $\text{CO}(\text{C}_{1-4}$ ハロアルキル)、 $\text{CO}_2(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 CONH_2 、 $-\text{CONH}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)

C_{1-4} アルキル)、 $-CON(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン
 $-O(C_{1-4}$ アルキル)、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン $-N(C_{1-4}$ アルキル)
 $_2$ 、 $-CONH-C_{1-4}$ アルキレン $-N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-C_{1-4}$ アルキレン
 $-O-P(O)(OH)_2$ 、 $-NHCO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-R^c$ 、 COR^c 、
 CO_2R^c および $CONHR^c$ から選択され；

R^c は、各々独立して、 $-(CH_2)_n-C_{3-6}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n$ -
 フェニルおよび $(CH_2)_n$ - 5 ~ 6 員ヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_{1-4}$ アルキル)、
 O、および $S(O)_p$ からなる群から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）
 から選択され；各環部分は、0 ~ 2 つの R^d で置換されており；ならびに

R^d は、各々独立して、 $=O$ 、ハロゲン、 $-OH$ 、 C_{1-4} アルキル、 NH_2 、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、
 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルコキシおよび $-NHCO(C_{1-4}$ アルキル)、
 ならびにヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_{1-4}$ アルキル)、
 O および $S(O)_p$ からなる群から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）
 から選択される]

から選択される、請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

R^1 が NR^5R^5 であり；

R^5 および R^5 が、それらに結合している窒素原子と共に一緒になって、1 ~ 4 つの R^7 で置換された 4 ~ 10 員ヘテロ環を形成し；

R^7 が、各々独立して、H、 $=O$ 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、
 CN 、 OH 、 CF_3 、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、
 $-(CH_2)_n-NR^8R^8$ 、 $-NHCO(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHCOCF_3$ 、
 $-NHCO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $-NHC(O)NH_2$ 、 $-NHC(O)NH(C_{1-4}$ アルキル)、
 $-NHC(O)N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 $-NH SO_2(C_{1-4}$ アルキル)、
 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $-SO_2N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、
 $-SO_2NH(CH_2)_2OH$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2O(C_{1-4}$ アルキル)、
 $-CONH_2$ 、 $-CONH(C_{1-4}$ アルキル)、 $-CON(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、
 $-CH_2CONH_2$ 、 $-(CH_2)_n$ - 炭素環、 $-O(CH_2)_n$ - 炭素環、
 $-O(CH_2)_n$ - ヘテロ環および $-(CH_2)_n$ - ヘテロ環（炭素原子と、
 N、 NR^8 、O および $S(O)_p$ から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む）
 から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、
 0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；

R^8 が、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、 $C(O)C_{1-4}$ アルキル、 $C(O)$ 炭素環、
 $C(O)$ ヘテロ環、 $-(CH_2)_n-C(O)NR^aR^a$ 、 $C(O)O$ - アルキル、
 $C(O)O$ - 炭素環、 $C(O)O$ - ヘテロ環、 SO_2 アルキル、 SO_2 炭素環、
 SO_2 ヘテロ環、 $SO_2NR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_n$ - シクロアルキル、 $-(CH_2)_n$ -
 フェニル、および $(CH_2)_n$ - ヘテロ環から選択され、前記アルキル、炭素環およびヘテロ環は、
 0 ~ 4 つの R^9 で置換されており；ならびに

R^9 が、各々独立して、ハロゲン、 OH 、 NO_2 、 CHF_2 、 CF_3 、 C_{1-4} アルキル、
 C_{1-4} アルコキシ、 CH_2OH 、 CO_2H 、 $CO_2(C_{1-4}$ アルキル)、 $CONH_2$ 、
 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ ヘテロ環、
 $-O(CH_2)_{(2-4)}NR^aR^a$ 、 $-(CR^{10}R^{10})_n$ - 4 ~ 10 員ヘテロ環から選択されており、
 前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 4 つの R^b で置換されている、

請求項 9 記載の化合物。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の 1 以上の化合物、ならびに医薬上許容し得る担体
 または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 14】

異常な R h o キナーゼ活性と関連のある疾患の予防および / または治療のための、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 15】

疾患が、心血管疾患、平滑筋関連疾患、線維性疾患、炎症性疾患、神経障害性疾患、腫瘍疾患および自己免疫疾患からなる群から選択される、請求項 14 記載の医薬組成物。

【請求項 16】

心血管疾患が、狭心症、アテローム性動脈硬化症、卒中、脳血管疾患、心不全、冠動脈疾患、心筋梗塞、末梢血管性疾患、狭窄症、血管痙攣、高血圧症および肺高血圧症からなる群から選択される、請求項 15 記載の医薬組成物。

【請求項 17】

平滑筋関連疾患が、緑内障、勃起不全および気管支喘息からなる群から選択される、請求項 15 記載の医薬組成物。

【請求項 18】

自己免疫疾患が、リウマチ関節炎、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、過敏性大腸症候群および全身性硬化症からなる群から選択される、請求項 15 記載の医薬組成物。

【請求項 19】

R h o キナーゼ活性を阻害するための、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物であって、該阻害が、

(a) 標的細胞および前記組成物を提供すること ; ならびに

(b) 前記標的細胞が前記組成物と結合して標的細胞内の R h o キナーゼ活性を阻害できるような条件下において、標的細胞を組成物に暴露すること、
により達成される、医薬組成物。