

【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 07 D 237/32	(2006.01)
C 07 D 403/10	(2006.01)
C 07 D 401/10	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 407/12	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 513/04	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
C 07 D 491/048	(2006.01)
C 07 D 407/14	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/502	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)
A 61 P 9/08	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 15/10	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 21/02	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 237/32	
C 07 D 403/10	C S P
C 07 D 401/10	
C 07 D 401/12	
C 07 D 417/12	
C 07 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

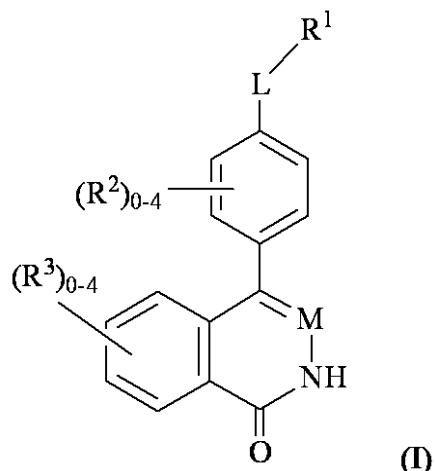
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

Mは、NおよびCR¹₀から選択され；Lは、-CR⁴R⁴C(O)-、-OC(O)-、-NR⁶C(O)-および-NR⁶-から選択され；R¹は、NR⁵R⁵、C₃₋₁₀炭素環および4～15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、-OCH₂F₂、-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、-NHC(O)(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O₂)(C₁₋₄アルキル)、-NHSO₂(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、-OCH₂F₂、-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、-NHC(O)(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O₂)(C₁₋₄アルキル)、-NHSO₂(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、OCH₂F₂、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、-(CR⁶R⁶)_n-C₃₋₁₀炭素環および-(CR⁶R⁶)_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4～15員ヘテロ環を形成し；

R⁶は、各々独立して、HおよびC_{1～4}アルキルから選択され；

R⁷は、各々独立して、H、=O、NO₂、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(C_{1～4}アルキル)、-(CH₂)_n-NR⁸R⁸、-NHC(O)(C_{1～4}アルキル)、-NHCOCF₃、-NHC(O)₂(C_{1～4}アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₂O(C_{1～4}アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₃O(C_{1～4}アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₂OH、-NHC(O)₂(CH₂)₂NH₂、-NHC(O)₂(CH₂)₂N(C_{1～4}アルキル)₂、-NHC(O)₂CH₂CO₂H、-CH₂NHC(O)₂(C_{1～4}アルキル)、-NHC(O)NR⁸R⁸、-NH₂SO₂(C_{1～4}アルキル)、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C_{1～4}アルキル)、-SO₂N(C_{1～4}アルキル)₂、-SO₂NH(CH₂)₂OH、-SO₂NH(CH₂)₂O(C_{1～4}アルキル)、-(CH₂)_n-CONR⁸R⁸、-O(CH₂)_n-炭素環、-O(CH₂)_n-ヘテロ環、-NHC(O)-炭素環、-NHC(O)-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、アルコキシリ、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、C_{1～4}アルキル、C_{2～4}アルケニル、C_{2～4}アルキニル、-(CH₂)_n-C(O)C_{1～4}アルキル、-(CH₂)_n-C(O)炭素環、-(CH₂)_n-C(O)ヘテロ環、-(CH₂)_n-C(O)NR^aR^a、-(CH₂)_n-C(O)O-アルキル、-(CH₂)_n-C(O)O-炭素環、-(CH₂)_n-C(O)O-ヘテロ環、-(CH₂)_n-SO₂アルキル、-(CH₂)_nSO₂炭素環、-(CH₂)_n-SO₂ヘテロ環、-(CH₂)_n-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R⁹で置換された4～10員ヘテロ環を形成し；

R⁹は、各々独立して、ハロゲン、OH、NO₂、CHF₂、CF₃、C_{1～4}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、CH₂OH、CO(C_{1～4}アルキル)、CO₂H、CO₂(C_{1～4}アルキル)、-(CH₂)_nNR^aR^a、-(CH₂)_nCONR^aR^a、-O(CH₂)_n炭素環、-O(CH₂)_nヘテロ環、-O(CH₂)_nNR^aR^a、-(CR¹⁰R¹⁰)_n-4～10員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシリ、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；

R¹⁰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、-(CH₂)_nOH、CO(C_{1～4}アルキル)、CO₂CF₃、CO₂(C_{1～4}アルキル)、-CONH₂、-CONH-C_{1～4}アルキレン-CO₂(C_{1～4}アルキル)、C_{1～4}アルキレン-CO₂(C_{1～4}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、OCF₃、NH₂、NO₂、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)、CO₂(C_{1～4}アルキル)、CONH₂、-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-O-N(C_{1～4}アルキル)₂、-C_{1～4}アルキレン-O-P(O)(OH)₂、-NHC(O)₂(C_{1～4}アルキル)、-R^c、CO

R^c 、 CO_2R^c および $C(=O)NR^c$ から選択され；

R^c は、各々独立して、 $-CH_2\cdots_n-C_3\cdots_6$ シクロアルキル、 $-CH_2\cdots_n-$ フェニル、および $(CH_2\cdots_n\cdots_5\cdots_6$ 員ヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_1\cdots_4$ 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個のヘテロ原子とを含む）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、 $C_1\cdots_4$ アルキル、 NH_2 、 $NH(C_1\cdots_4$ アルキル)、 $N(C_1\cdots_4$ アルキル)₂、 $C_1\cdots_4$ アルコキシおよび-NHCO($C_1\cdots_4$ アルキル)、ならびにヘテロ環（炭素原子と、N、NH、 $N(C_1\cdots_4$ 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個のヘテロ原子とを含む）から選択され；

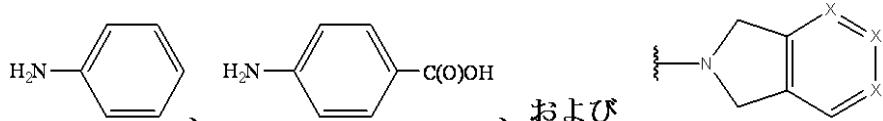
nは、各々独立して、0、1、2、3および4から選択され；

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、 $CR^{1\cdots 0}$ 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 、 $C_3\cdots_1\cdots_0$ 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、 $C_1\cdots_6$ アルキル、 $C_1\cdots_4$ 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、 $C_1\cdots_4$ アルキル、 $-CR^6R^6\cdots_n-C_3\cdots_1\cdots_0$ 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、 $C_1\cdots_4$ アルキル、 $C_1\cdots_4$ アルコキシ、 $-NR^8R^8$ 、 $-CH_2\cdots_n-$ 炭素環および $-CH_2\cdots_n-$ 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、アルコキシリ、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 $C_1\cdots_4$ アルキルから選択され；

R^9 が、各々独立して、ハロゲン、OH、 $C_1\cdots_4$ アルキル、 $C_1\cdots_4$ アルコキシから選択され；

$R^{1\cdots 0}$ が、Hおよび $C_1\cdots_4$ 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

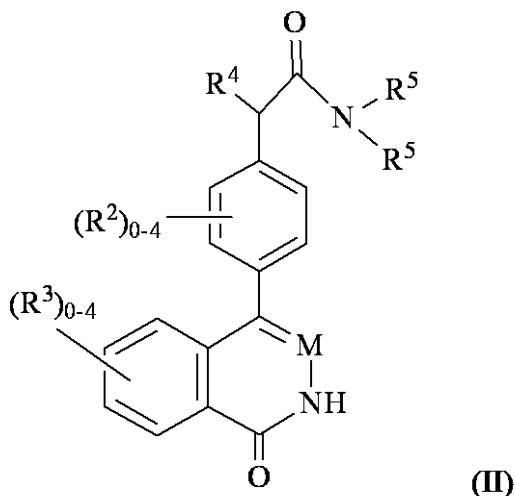
pが、各々独立して、0、1、および2から選択される、

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CR^{1~0}から選択され；

R⁵は、各々独立して、H、C_{1~4}アルキル、-(CR⁶R⁶)_n-C_{3~10}炭素環および-(CR⁶R⁶)_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、C_{1~4}アルキル、C_{1~4}アルコキシ、CN、OH、CF₃、-(CH₂)_n-CO₂H、-(CH₂)_n-CO₂(C_{1~4}アルキル)、-(CH₂)_n-NR⁸R⁸、-NHCO(C_{1~4}アルキル)、-NHCO₂F₃、-NHCO₂(C_{1~4}アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₂O(C_{1~4}アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₃O(C_{1~4}アルキル)、-NHCO₂(CH₂)₂OH、-NHCO₂(CH₂)₂NH₂、-NHCO₂(CH₂)₂N(C_{1~4}アルキル)₂、-NHCO₂CH₂CO₂H、-CH₂NHCO₂(C_{1~4}アルキル)、-NHCO(O)NR⁸R⁸、-NH₂SO₂(C_{1~4}アルキル)、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C_{1~4}アルキル)、-SO₂N(C_{1~4}アルキル)₂、-SO₂NH(CH₂)₂OH、-SO₂NH(CH₂)₂O(C_{1~4}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、アルコキシリル、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、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、-(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、C_{1~4}アルキル、C_{1~4}アルコキシ、CH₂OH、CO₂H、CO₂(C_{1~4}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、-(CR^{1~0}R^{1~0})_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；

R¹ は、HおよびC₁～₄アルキルから選択され；

R^a は、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 は、それらが結合している窒素原子と共に一緒にになって、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、C₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシ、OCF₃、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 は、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、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；

nは、各々独立して、0、1、2、3、および4から選択され；

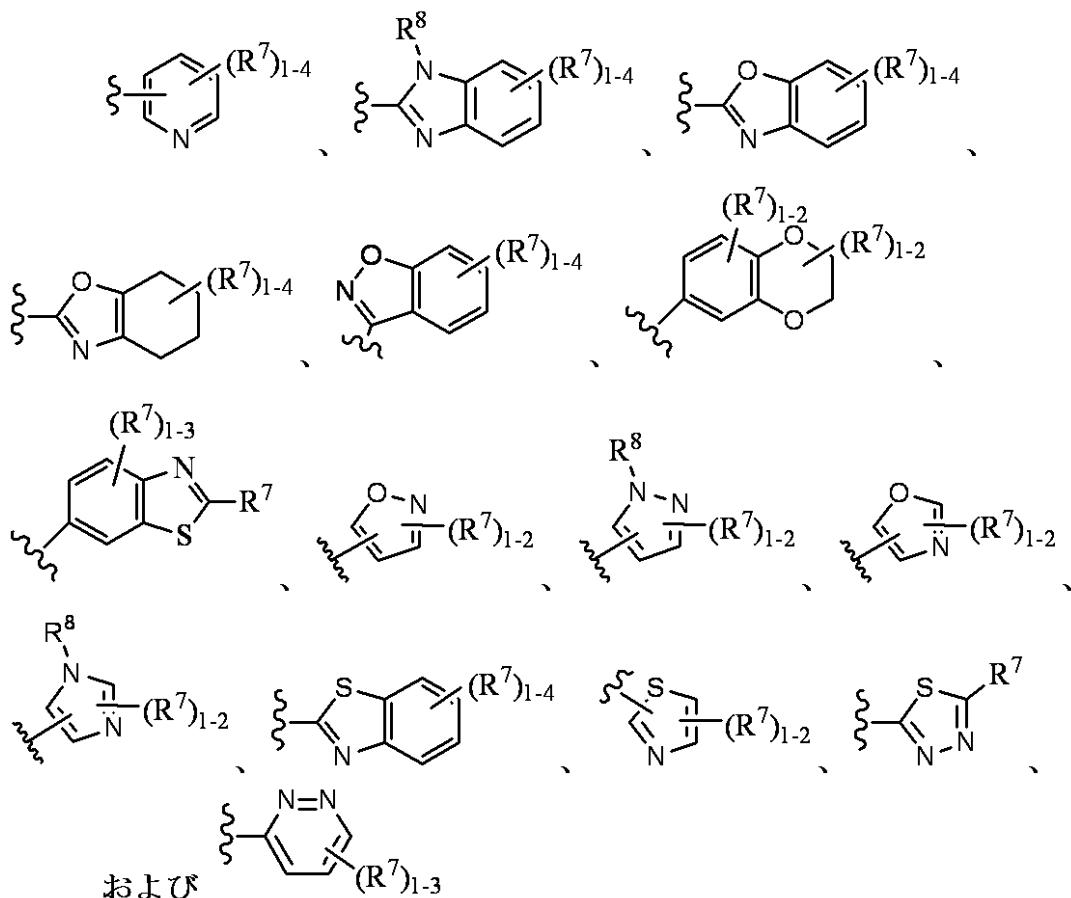
pは、各々独立して、0、1、および2から選択される]

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】

R⁵ が、H、C₁～₄アルキル、-(CH₂)_n-C₃～₁₀炭素環、-(CH₂)_n-アリール、-(CH₂)_n-4～10員ヘテロ環(

【化4】

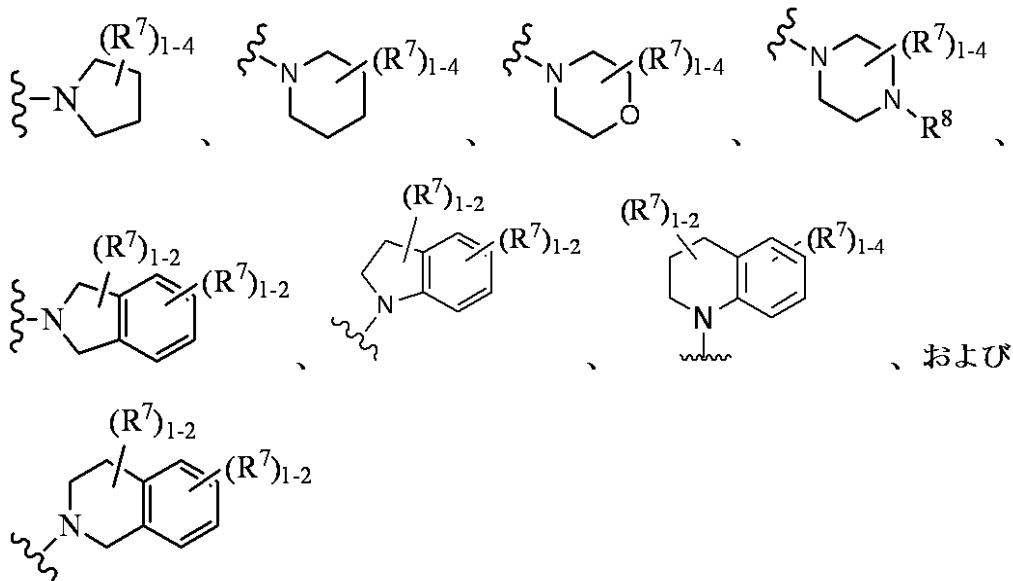


から選択される)から選択され; 前記アルキル、シクロアルキル、アリールは、1~4つのR⁷により置換されている、請求項3記載の化合物。

【請求項5】

R⁵およびR⁵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;

R⁷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、-NHC(O)(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、-NHSO₂(C₁-4アルキル)、-SO₂NH₂、-SO₂NH(C₁-4アルキル)、-SO₂N(C₁-4アルキル)₂、-SO₂NH(CH₂)₂O₂H、-SO₂NH(C₁-4アルキル)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、-NHC(O)-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、OCF₃、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、

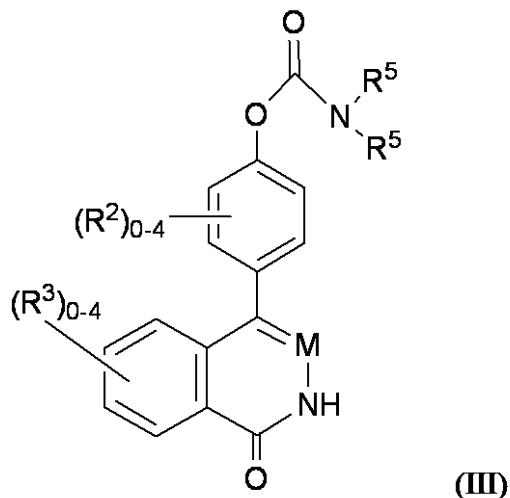
R^dが、各々独立して、=O、ハロゲン、-OH、C₁-4アルキル、NH₂、NH(C₁-4アルキル)、N(C₁-4アルキル)₂、C₁-4アルコキシおよび-NHCO(C₁-4アルキル)、O、およびS(O)_pからなる群から選択される1~4個のヘテロ原子を含む)から選択される。

請求項 3 記載の化合物。

【請求項 6】

式 (I I I) :

【化 6】



[式中、

M は、 N および C R^{1-0} から選択され；

R^5 は、各々独立して、 H 、 C_{1-4} アルキル、 $-(\text{C R}^6 \text{R}^6)_n-\text{C}_{3-10}$ 炭素環および $-(\text{C R}^6 \text{R}^6)_n-4 \sim 10$ 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 、 $=\text{O}$ 、 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)、 $- (\text{CH}_2)_n-\text{NR}^8 \text{R}^8$ 、 $- \text{NHC(O)(C}_{1-4}\text{アルキル)}$ 、 $- \text{NHCOCF}_3$ 、 $- \text{NHC(O)}_2$ (C_{1-4} アルキル)、 $- \text{NHC(O)}_2 (\text{CH}_2)_2\text{O}$ (C_{1-4} アルキル)、 $- \text{NHC(O)}_2 (\text{CH}_2)_3\text{O}$ (C_{1-4} アルキル)、 $- \text{NHC(O)}_2 (\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 $- \text{NHC(O)}_2 (\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ 、 $- \text{NHC(O)}_2 (\text{CH}_2)_2\text{N(C}_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 $- \text{NHC(O)}_2 \text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $- \text{CH}_2\text{NHC(O)}_2 (\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $- \text{NHC(O)NR}^8 \text{R}^8$ 、 $- \text{NHSO}_2 (\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $- \text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $- \text{SO}_2\text{NH} (\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $- \text{SO}_2\text{N} (\text{C}_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 $- \text{SO}_2\text{NH} (\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 $- \text{SO}_2\text{NH} (\text{CH}_2)_2\text{O}$ (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、 $- \text{NHC(O)-}$ 炭素環、 $- \text{NHC(O)-}$ 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 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、アルコキシリル、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、 $- (\text{CH}_2)_n-\text{C(O)NR}^a \text{R}^a$ 、 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、 $\text{SO}_2\text{NR}^a \text{R}^a$ 、 $- (\text{CH}_2)_n-$ 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 、 $\text{CO}_2 (\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ 、 CON

H_2 、 $- (CH_2)_n NR^a R^a$ 、 $- (CH_2)_n CONR^a R^a$ 、 $- O (CH_2)_n$ へテロ環、 $- O (CH_2)_{(2-4)} NR^a R^a$ 、 $- (CR^{10} R^{10})_n - 4 \sim 10$ 員へ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；

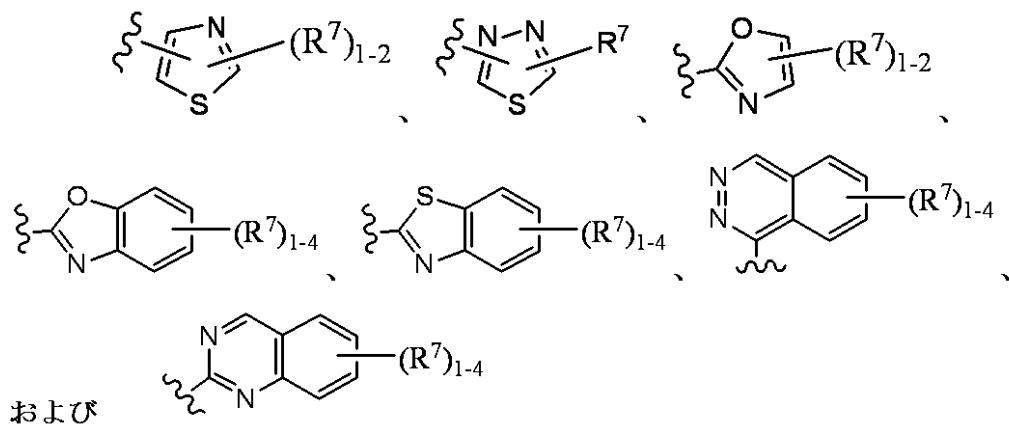
R^7 が、各々独立して、 H 、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 CN 、 OH 、 $- (CH_2)_n$ -炭素環および $- (CH_2)_n$ -ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシル、炭素環およびヘテロ環は、0~4つの R^9 で置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

L が、 $-NR^6-$ であり；かつ

R^1 が、

【化7】



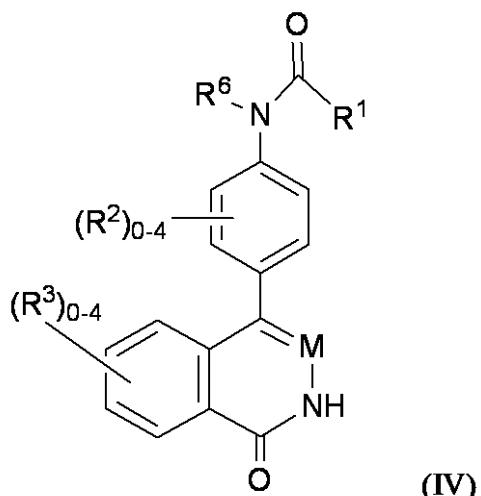
から選択される、

請求項7記載の化合物。

【請求項9】

式(I V)：

【化8】



[式中、

R¹は、NR⁵R⁵、C₃₋₁₀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R⁷で置換されており；

R⁵は、各々独立して、H、C₁₋₄アルキル、-(CR⁶R⁶)_n-C₃₋₁₀炭素環および-(CR⁶R⁶)_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；

R⁶は、各々独立して、HおよびC₁₋₄アルキルから選択され；

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、-NHC(O)(C₁₋₄アルキル)、-NHCOCF₃、-NHC(O)₂(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₂O(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₃O(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O)₂(CH₂)₂OH、-NHC(O)₂(CH₂)₂NH₂、-NHC(O)₂(CH₂)₂N(C₁₋₄アルキル)₂、-NHC(O)₂CH₂CO₂H、-CH₂NHC(O)₂(C₁₋₄アルキル)、-NHC(O)NR⁸R⁸、-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、-NHC(O)-炭素環、-NHC(O)-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、アルコキシリ、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、C₂₋₄アルケニル、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、アルケニル、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、-(CR¹⁰R¹⁰)_n-4~10員ヘテロ環から選択され、前記アルキル、アルコキシリ、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；

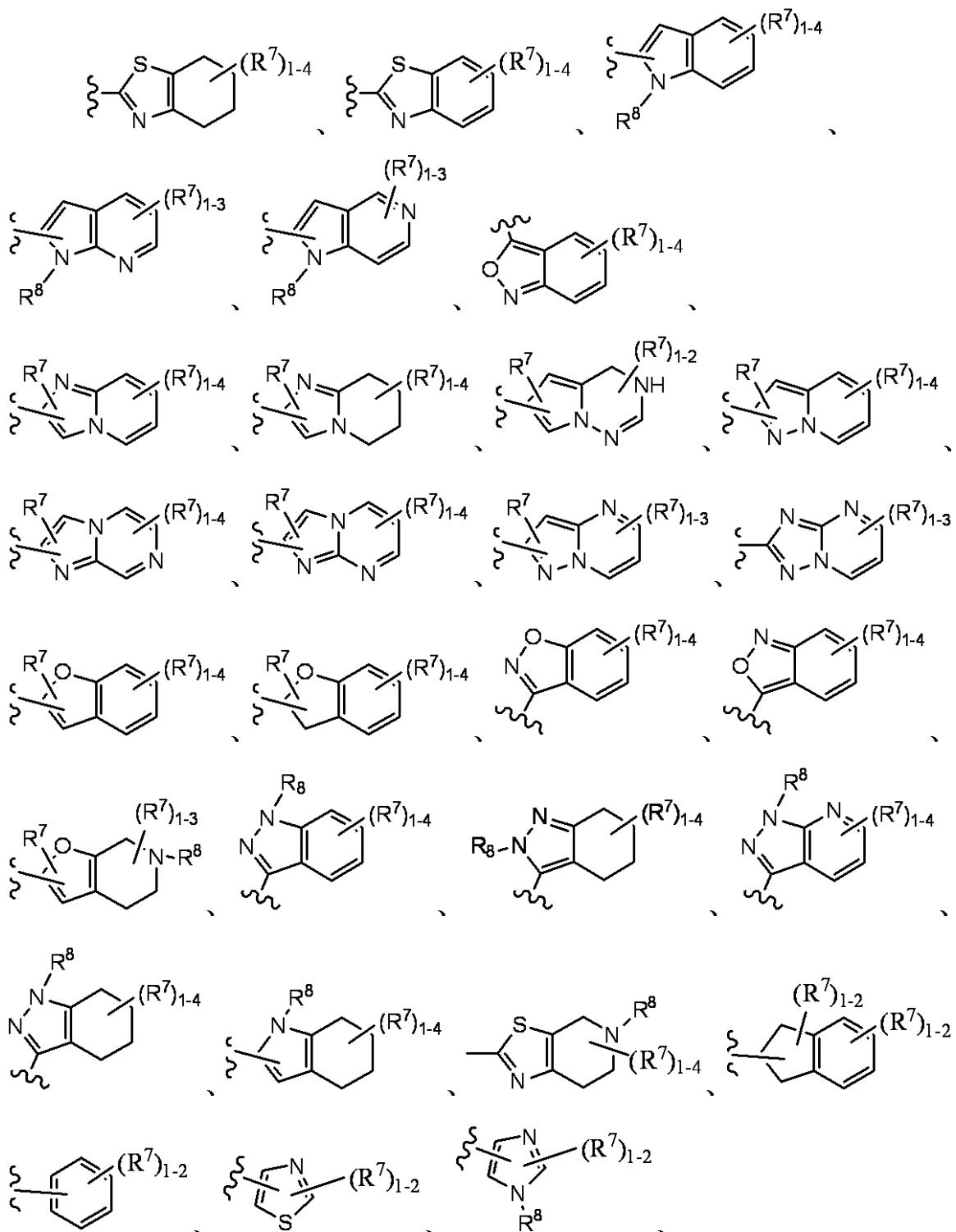
pは、各々独立して、0、1、および2から選択される]

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。

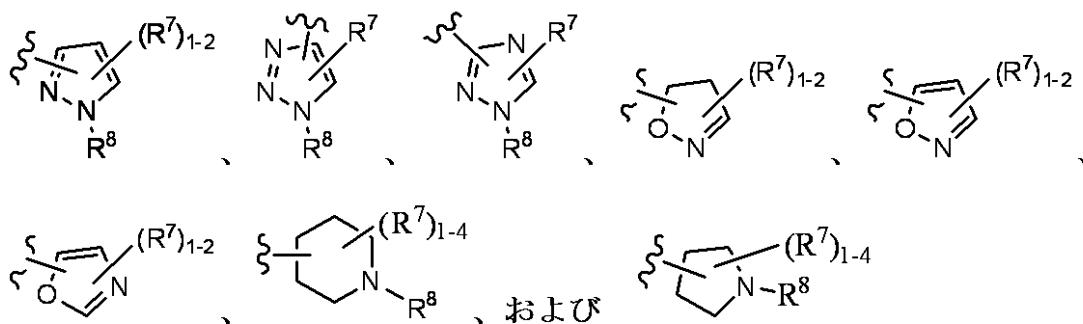
【請求項10】

R¹が、

【化9】



【化10】



[式中、

R^7 は、各々独立して、H、=O、 NO_2 、ハロゲン、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、 CN 、 OH 、 CF_3 、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2$ ($C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-(CH_2)_n-NR^8R^8$ 、 $-NHCO(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-NHCOOCF_3$ 、 $-NHCO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_2O(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_3O(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-NHCO_2(CH_2)_2OH$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2NH_2$ 、 $-NHCO_2(CH_2)_2N(C_{1\sim4}$ アルキル) $_2$ 、 $-NHCO_2CH_2CO_2H$ 、 $-CH_2NHCO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-NHCO(NR^8R^8)$ 、 $-NHSO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-SO_2N(C_{1\sim4}$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2OH$ 、 $-SO_2NH(CH_2)_2O(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-(CH_2)_n-CO NR^8R^8$ 、 $-O(CH_2)_n$ -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、アルコキシリル、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、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C(O)C_{1\sim4}$ 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 、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、 CH_2OH 、 CO_2H 、 $CO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $CONH_2$ 、 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ ヘテロ環、 $-O(CH_2)_{(2\sim4)}NR^aR^a$ 、 $-(CR^{10}R^{10})_n$ -4~10員ヘテロ環から選択される、前記アルキル、アルコキシリル、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、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $-(CH_2)_nOH$ 、 $CO(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $COCF_3$ 、 $CO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CONH-C_{1\sim4}$ アルキレン- $CO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $C_{1\sim4}$ アルキレン- $CO_2(C_{1\sim4}$ 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、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、 O 、 CF_3 、 NH_2 、 NO_2 、 $N(C_{1\sim4}$ アルキル) $_2$ 、 $CO(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $CO(C_{1\sim4}$ ハロアルキル)、 $CO_2(C_{1\sim4}$ アルキル)、 $CONH_2$ 、 $-CONH(C$

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；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)、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、CF₃、 $-(CH_2)_n-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2(C_{1-4}$ 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) $_2$ 、 $-NHSO_2(C_{1-4}$ 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)、 $-CONH_2$ 、 $-CONH(C_{1-4}$ 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、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、アルコキシリル、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、NO₂、CHF₂、CF₃、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、CH₂OH、CO₂H、CO₂(C_{1-4} アルキル)、CONH₂、 $-(CH_2)_nNR^aR^a$ 、 $-(CH_2)_nCONR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_n$ 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、アルコキシリル、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 1 4】

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 ~ 1 1 のいずれか 1 項記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 1 5】

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 1 4 記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

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 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

平滑筋関連疾患が、縁内障、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 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

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 1 5 記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

R h o キナーゼ活性を阻害するための、請求項 1 ~ 1 1 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。