

【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23年5月19日(2011.5.19)

【公表番号】特表2010-524953(P2010-524953A)

【公表日】平成22年7月22日(2010.7.22)

【年通号数】公開・登録公報2010-029

【出願番号】特願2010-504198(P2010-504198)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 31/00	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 1/18	(2006.01)
A 61 P 19/00	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
C 07 D 495/14	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 K 31/5025	(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04	1 4 5
A 61 P 3/10	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/06	
A 61 P 9/12	
A 61 P 25/28	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 27/02	
A 61 P 13/12	
A 61 P 17/02	
A 61 P 9/10	
A 61 P 31/00	
A 61 P 9/00	
A 61 P 1/18	
A 61 P 19/00	
A 61 K 31/4985	
C 07 D 495/14	C S P D
A 61 K 31/519	
A 61 K 31/5025	

【手続補正書】

【提出日】平成23年4月1日(2011.4.1)

【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(1)

【化1】

W-L-Z

(I)

[式中、

Wは-C(=O)R₆、-C(OH)R₆(R₆)、-C(=O)OR₆、-C(=O)NR₆R₆、ハロゲン、-OH、アルキル、アルケニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該アルキル、アルケニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}は独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよい；あるいは、

いずれか2つのR₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}は一緒になって、縮合シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル環またはスピロヘテロシクリル環を形成することができ；

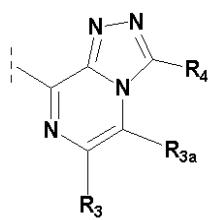
Lは結合、O、S、SO、SO₂、C(=O)、アルケニル、シクロアルキル、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、CR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}、SO₂NR₆、OCR₂R_{2a}、OCR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}、CR₂R_{2a}O、CR₂bR_{2c}CR₂R_{2a}O、N(R₅)CR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}N(R₅)、SCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}S、CR₂R_{2a}SO、CR₂R_{2a}SO₂、SOCR₂R_{2a}、SO₂CR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}OOCR₂bR_{2c}、CR₂R_{2a}SCR₂bR_{2c}、CR₂R_{2a}SO₂CR₂bR_{2c}、SO₂NR₆CR₂aR_{2b}、COCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}CO、CONR₆CR₂aR_{2b}、CR₂R_{2a}CR₂bR_{2c}S、CR₂R_{2a}CR₂bR_{2c}SO、CR₂R_{2a}CR₂bR_{2c}SO₂であるが、ただし、LがO、S、SO、SO₂、C(=O)もしくはNR₅である場合、Wはハロゲンまたは-OHでなく；

R₂、R_{2a}、R_{2b}およびR_{2c}は独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリール、またはハロアルキルであるか；あるいは、

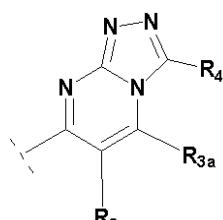
いずれか2つのR₂、R_{2a}、R_{2b}、およびR_{2c}は、それらが結合している原子と一緒にになって、シクロアルキル、ハロゲン置換シクロアルキルまたはヘテロシクリル環を形成することができ；

Zは以下の二環式ヘテロアリール基：

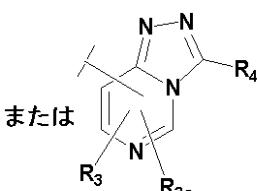
【化2】



(a)



(b)



(c)

から選択され；

R_3 は水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_{3a} は水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよいか；

いずれの R_3 および R_{3a} は一緒にになって、縮合シクロアルキルまたはアリール環を形成することができ、それらは適宜、 R_1 、 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} および R_{1d} で置換されていてよいか；あるいは、

R_3 または R_{3a} の1つはW-Lと一緒にになって、縮合シクロアルキルまたはアリール環を形成することができ、それらは適宜、 R_1 、 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} および R_{1d} で置換されていてよく；

R_4 は、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆COR₆、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよいか；

R_4 は、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆COR₆、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るヘテロシクリルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよいか；あるいは、

R_4 は、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

各 R_5 は独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、COR₆、CO₂R₆、SO₂NR₆R₆、またはSO₂R₆であり；

各 R_6 は独立して、H、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよいか；あるいは、

2つの R_6 は、それらが結合している原子と一緒にになって、3-から7-員シクロアルキルまたはヘテロシクリル環を形成してよく、それらは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} および R_{7c} で置換されていてよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} は各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキ

ルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}は各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである】

の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマーまたは塩。

【請求項2】

Wがアルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、その全てがR₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で適宜置換され得る、請求項1に記載の化合物。

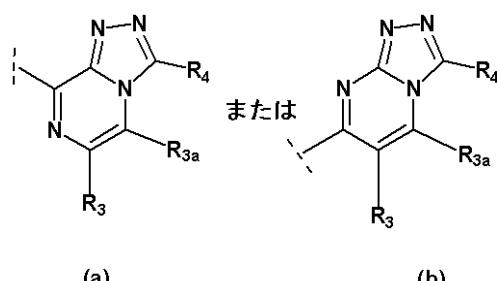
【請求項3】

Wがフェニルまたはシクロプロピルであり、その両者がR₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で適宜置換され得る、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

Zが以下の二環式ヘテロアリール基：

【化3】



から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R₄が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆COR₆、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよい；あるいは、

R₄が、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、

スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

各R₅が独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、COR₆、CO₂R₆、SO₂NR₆R₆、またはSO₂R₆であり；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

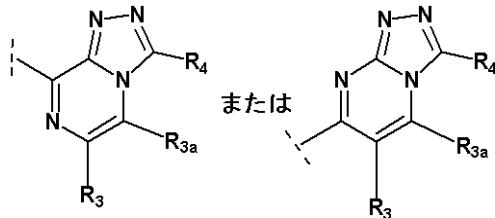
R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

Zが、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化4】



(a)

(b)

から選択され；

R₄が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆COR₆、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およ

びR_{7c}で置換されていてよく；

各R₅が独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、COR₆、CO₂R₆、SO₂NR₆R₆、またはSO₂R₆であり；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

Wが、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、その全てが適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

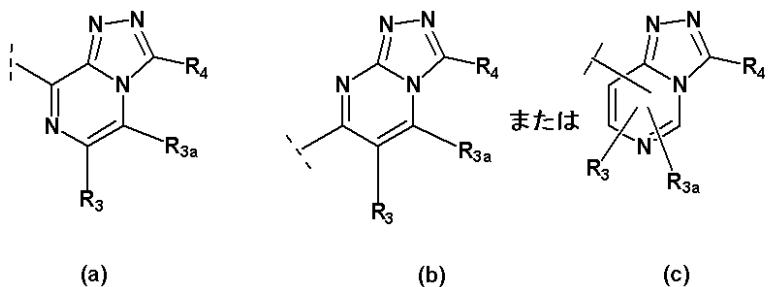
R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO₂、C(=O)、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、SO₂NR₆、OCR₂R_{2a}、OCR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}、C₂R_{2a}O、CR_{2b}R_{2c}CR₂R_{2a}O、SCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}S、CR₂R_{2a}SO、CR₂R_{2a}SO₂、SO₂CR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}、CR₂R_{2a}SCR_{2b}R_{2c}、CR₂R_{2a}SO₂CR_{2b}R_{2c}、SO₂NR₆CR_{2a}R_{2b}、COCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}CO、C₂NR₆CR_{2a}R_{2b}、CR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}S、CR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}SO₂、またはCR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}SO₂であり；

R₂、R_{2a}、R_{2b}およびR_{2c}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

Zが、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化 5】



から選択され；

R_3 が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_{3a} が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-NR₆SO₂R₆、-NR₆CO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_4 が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆COR₆、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCOCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよいか；あるいは、

R_4 が、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-NR₆SO₂R₆、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-NR₆CO₂R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

各 R_5 が独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロアルキル、 COR_6 または CO_2R_6 であり；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリ

ールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、 R_8 、 R_{8a} 、 R_{8b} 、および R_{8c} で置換されていてよく；そして、

R_8 、 R_{8a} 、 R_{8b} 、および R_{8c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項8】

Wが、アルキル、アリール、シクロアルキルまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、 R_1 、 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} および R_{1d} で置換されていてよく；

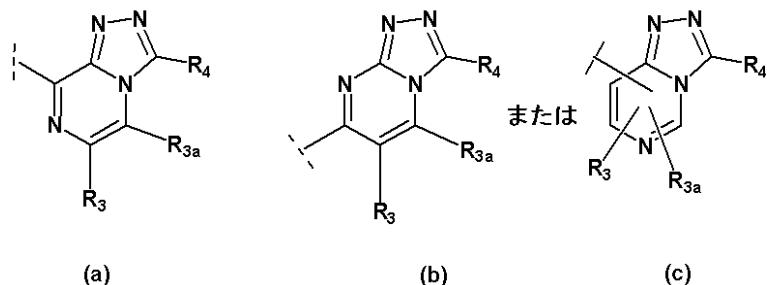
R_1 、 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} および R_{1d} が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、SO₂、C(=O)、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、CR₂R_{2a}CR_{2b}R_{2c}、OCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}O、SCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}S、CR₂R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}、CR₂R_{2a}SCR_{2b}R_{2c}、CR₂R_{2a}SO₂CR_{2b}R_{2c}またはSO₂NR₆CR_{2a}R_{2b}であり；

R_2 、 R_{2a} 、 R_{2b} および R_{2c} が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

乙が、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化 6】



から選択され:

R_3 が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_{3a} が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-SOR₆、-SO₂R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ

、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₄が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；あるいは、

R₄が、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

Wが、アルキル、アリールまたはシクロアルキルであり、その全てが適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリール

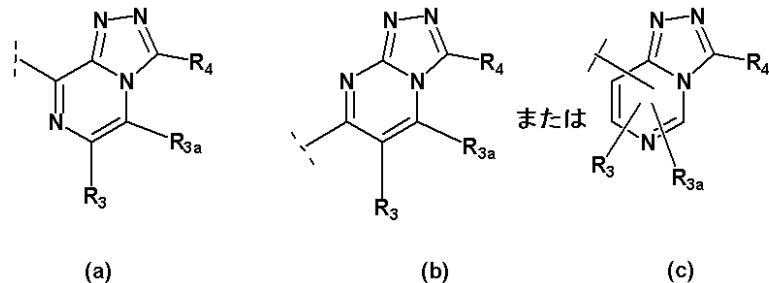
アミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、 SO_2 、 SO_2 、C(=O)、 CR_2R_{2a} 、 CR_2R_6 、 OCR_2R_{2a} 、 $CR_2R_{2a}O$ 、 $SO_2NR_6CR_2aR_2$
 b または $CR_2R_{2a}OCR_2bR_{2c}$ であり；

R_2 、 R_{2a} 、 R_{2b} および R_{2c} が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

Zが、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化7】



から選択され；

R_3 が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_{3a} が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂NR₆R₆、-OCONR₆R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_4 が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよいか；あるいは、

R_4 が、-OH、-OR₆、-SR₆、-OCOR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-OCONR₆R₆、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

各 R_6 が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリ

ールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R_8 、 R_{8a} 、 R_{8b} 、および R_{8c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

Wが、アルキル、アリールまたはシクロアルキルであり、その全てが適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

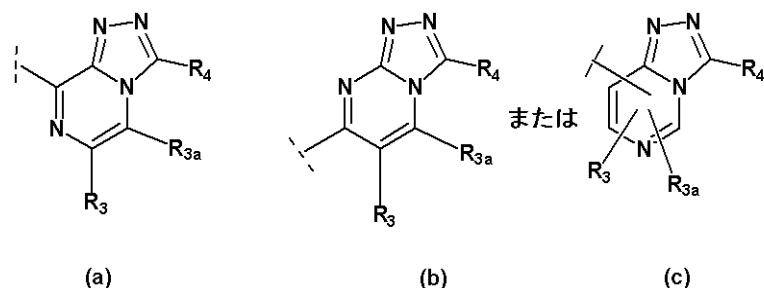
R_1 、 R_{1a} 、 R_{1b} 、 R_{1c} および R_{1d} が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、SO₂、C(=O)、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、OCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}O、SO₂NR₆CR_{2a}R_{2b}またはCR₂R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}であり；

R_2 、 R_{2a} 、 R_{2b} および R_{2c} が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

乙が、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化 8】



から選択され；

R_3 が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_{3a} が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、-CO₂R₆、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_4 が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよいか；あるいは、

R_4 が、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

Wが、アルキル、アリールまたはシクロアルキルであり、その全てが適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノ

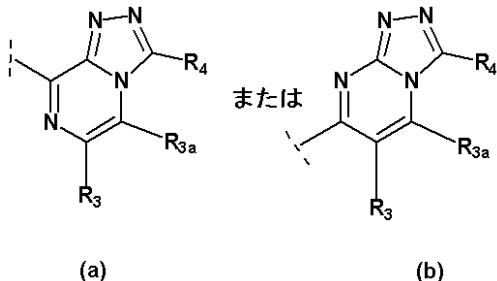
アルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、SO₂、C(=O)、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、OCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}O、SO₂NR₆CR_{2a}R₂_bまたはCR₂R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}であり；

R₂、R_{2a}、R_{2b}およびR_{2c}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

Zが、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化9】



から選択され；

R₃が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_{3a}が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₄が、ハロゲン、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CO₂H、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るシクロアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

各R₆が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロ

アリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}で置換されていてよく；そして、

R₈、R_{8a}、R_{8b}、およびR_{8c}が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアリル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

Wが、アルキル、アリールまたはシクロアルキルであり、その全てが適宜、R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}で置換されていてよく；

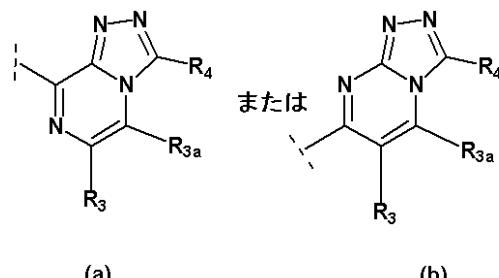
R₁、R_{1a}、R_{1b}、R_{1c}およびR_{1d}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、SO₂、C(=O)、CR₂R_{2a}、CR₂R₆、OCR₂R_{2a}、CR₂R_{2a}O、SO₂NR₆CR_{2a}R_{2b}またはCR₂R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}であり；

R₂、R_{2a}、R_{2b}およびR_{2c}が独立して、水素、ハロゲン、-OH、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはハロアルキルであり；

Zが、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化10】



から選択され；

R₃が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_{3a}が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO₂、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、R₇、R_{7a}、R_{7b}、およびR_{7c}で置換されていてよく；

R_4 が、-OH、-OR₆、-SR₆、-CN、-COR₆、-CO₂R₆、-CONR₆R₆、-SO₂R₆、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で適宜置換され得るアルキルであり、ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、スピロシクロアルキル、スピロヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

各 R_6 が独立して、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、その全てが適宜、 R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} で置換されていてよく；

R_7 、 R_{7a} 、 R_{7b} 、および R_{7c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールであり、ここで該アルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノまたはテトラゾリルは適宜、 R_8 、 R_{8a} 、 R_{8b} 、および R_{8c} で置換されていてよく；そして、

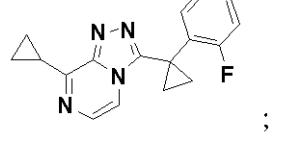
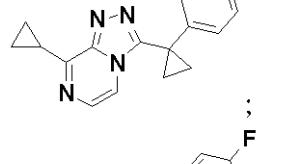
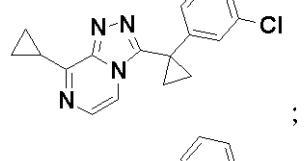
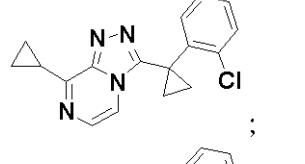
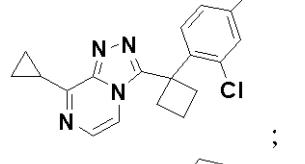
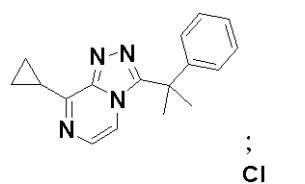
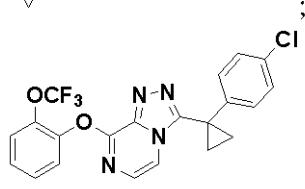
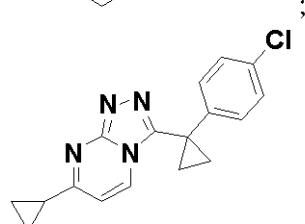
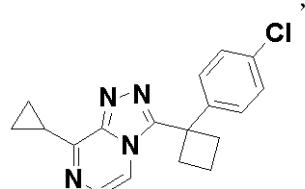
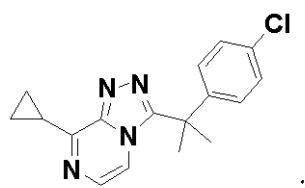
R_8 、 R_{8a} 、 R_{8b} 、および R_{8c} が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、-OH、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、-NO₂、-CN、-CO₂H、テトラゾリルまたはチオールである、

請求項1に記載の化合物。

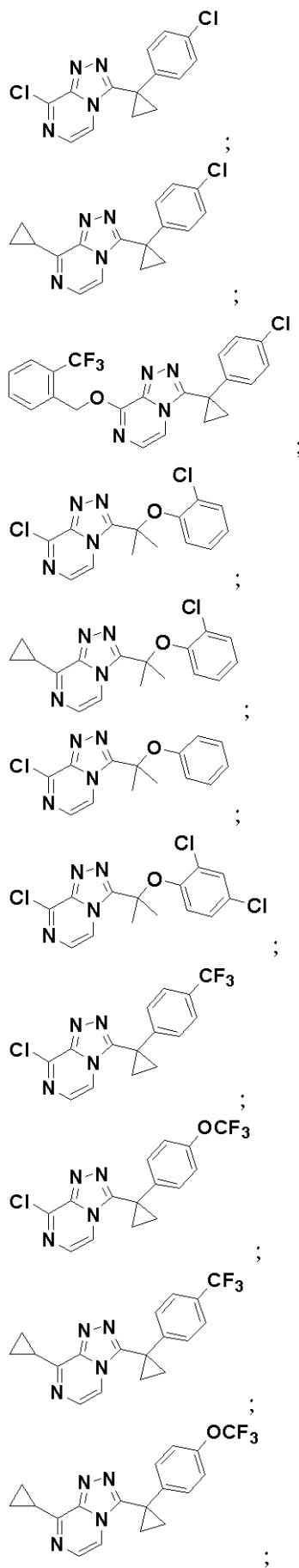
【請求項13】

式：

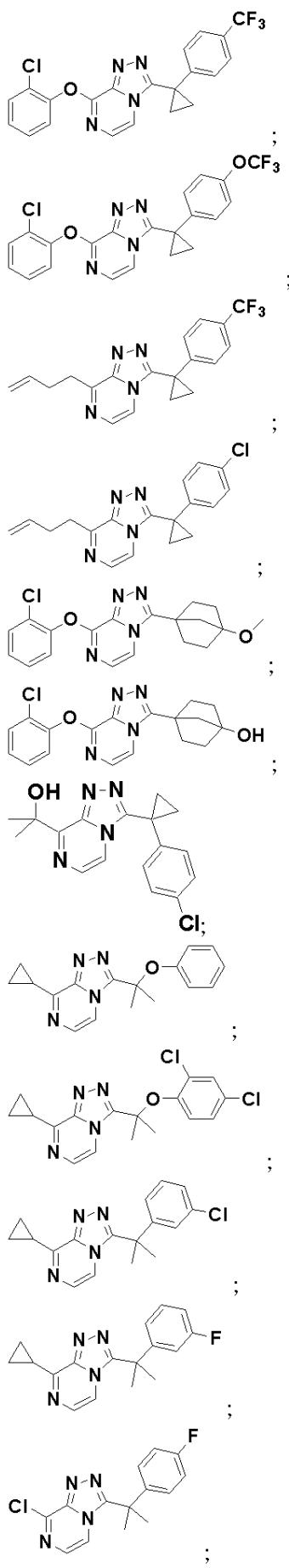
【化 11】



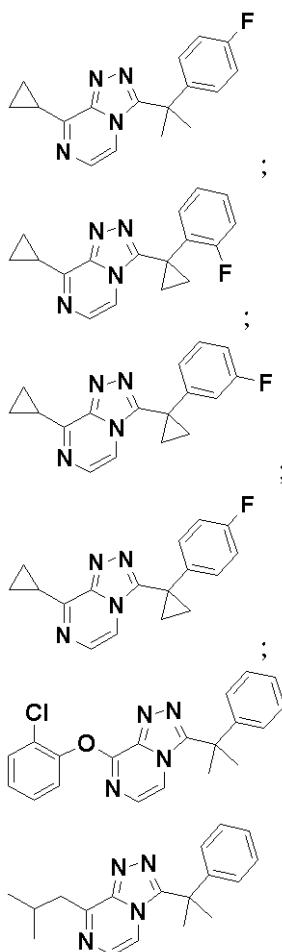
【化 1 2】



【化 1 3】



【化14】



からなる群から選択される化合物。

【請求項14】

少なくとも1つの請求項1から13のいずれか1つに記載の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマーまたは塩、および医薬的に許容される担体を含む、糖尿病、高血糖、肥満、異常脂質血症、高血圧、認知障害、メタボリックシンドロームまたは緑内障の治療、予防、または進行を遅延するための医薬組成物。

【請求項15】

他の11- -ヒドロキシステロイドヒドロゲナーゼI型阻害剤、抗糖尿病薬、抗高血糖薬、抗高インスリン血症薬、抗網膜症薬、抗ニューロパシー薬、抗腎障害薬、抗アテローム性動脈硬化薬、抗虚血薬、抗高血圧薬、抗肥満薬、抗脂質異常症薬、抗異常脂質血症薬、抗高脂血症薬、抗高トリグリセリド血症薬、抗高コレステロール血症薬、抗再狭窄薬、抗膵炎薬、脂質低下薬、食欲抑制薬、記憶増強薬、認知促進薬および抗炎症薬からなる群から選択される、1つ以上の他の治療薬をさらに含有する、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

糖尿病、高血糖、肥満、異常脂質血症、高血圧、認知障害、メタボリックシンドロームまたは緑内障の治療、予防、または進行を遅延するための医薬の製造における、請求項1から13のいずれか1つに記載の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマーまたは塩の使用。

【請求項17】

治療上有効な量の少なくとも1つの請求項1から13のいずれか1つに記載の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマーまたは塩、および1つ以上の他の治療薬の組み合わせを含む、糖尿病、高血糖、肥満、異常脂質血症、高血圧、認知障害、メタボリックシンドロームまたは緑内障の治療、予防、または進行を遅延するための剤。

【請求項 18】

該他の治療薬が、他の11- -ヒドロキシステロイドデヒドロゲナーゼI型阻害剤、抗糖尿病薬、抗高血糖薬、抗高インスリン血症薬、抗網膜症薬、抗ニューロパシー薬、抗腎障害薬、抗アテローム性動脈硬化薬、抗虚血薬、抗高血圧薬、抗肥満薬、抗脂質異常症薬、抗異常脂質血症薬、抗高脂血症薬、抗高トリグリセリド血症薬、抗高コレステロール血症薬、抗再狭窄薬、抗膀胱炎薬、脂質低下薬、食欲抑制薬、記憶増強薬、認知促進薬および抗炎症薬からなる群から選択される、請求項17に記載の剤。

【請求項 19】

請求項1から13のいずれか1つに記載の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマーまたは塩を、他の治療薬と同時に、別個に、または連続して投与することを特徴とする、請求項17に記載の剤。