

【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(I)

【化1】

W-L-Z

(I)

[式中、

Wは-C(=O)R<sub>6</sub>、-C(OH)R<sub>6</sub>(R<sub>6</sub>)、-C(=O)OR<sub>6</sub>、-C(=O)NR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、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、R<sub>1</sub>、R<sub>1a</sub>、R<sub>1b</sub>、R<sub>1c</sub>およびR<sub>1d</sub>で置換されていてよく；

R<sub>1</sub>、R<sub>1a</sub>、R<sub>1b</sub>、R<sub>1c</sub>およびR<sub>1d</sub>は独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SOR<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、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<sub>7</sub>、R<sub>7a</sub>、R<sub>7b</sub>、およびR<sub>7c</sub>で置換されていてよい；あるいは、

いずれか2つのR<sub>1</sub>、R<sub>1a</sub>、R<sub>1b</sub>、R<sub>1c</sub>およびR<sub>1d</sub>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る；

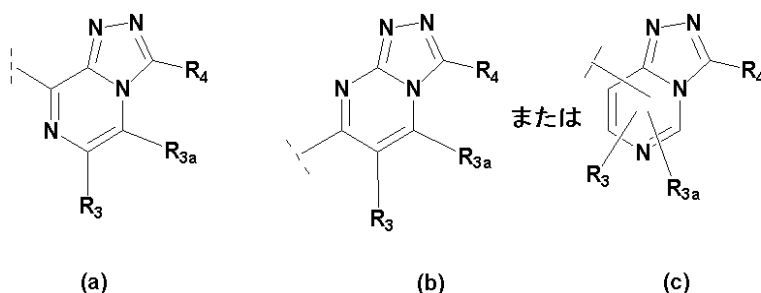
Lは結合、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、C(=O)、アルケニル、シクロアルキル、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>、OCR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、OCR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>O、CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>O、N(R<sub>5</sub>)CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>N(R<sub>5</sub>)、SCR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>S、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>SO、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>SO<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>OCR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>SCR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>SO<sub>2</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>CR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>、CO<sub>2</sub>CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CO、CONR<sub>6</sub>CR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>S、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>SO、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>CR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>SO<sub>2</sub>であるが、ただし、LがO、S、SO、SO<sub>2</sub>、C(=O)もしくはNR<sub>5</sub>である場合、Wはハロゲンまたは-OHでなく；

R<sub>2</sub>、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>およびR<sub>2c</sub>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R<sub>2</sub>、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>、およびR<sub>2c</sub>は、それらが結合している原子と一緒にあって、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る；

Zは以下の二環式ヘテロアリール基：

【化2】



から選択され;

$R_3$ は水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、アリーロキシ、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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、アリーロキシ、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;

いずれの $R_3$ および $R_{3a}$ は一緒になって、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;

$R_3$ または $R_{3a}$ の1つはW-Lと一緒に、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、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6COR_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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;

$R_4$ は、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6COR_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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;

$R_4$ は、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、 $COR_6$ 、 $CO_2R_6$ 、 $SO_2NR_6R_6$ 、または $SO_2R_6$ 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;

2つの $R_6$ は、それらが結合している原子と一緒に、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、アリーロキシ、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、-NO<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>H、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<sub>8</sub>、R<sub>8a</sub>、R<sub>8b</sub>、およびR<sub>8c</sub>で置換されていてよく；そして、

R<sub>8</sub>、R<sub>8a</sub>、R<sub>8b</sub>、およびR<sub>8c</sub>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、-NO<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>H、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R<sub>1</sub>、R<sub>1a</sub>、R<sub>1b</sub>、R<sub>1c</sub>およびR<sub>1d</sub>で適宜置換され得る、請求項 1 に記載の化合物。

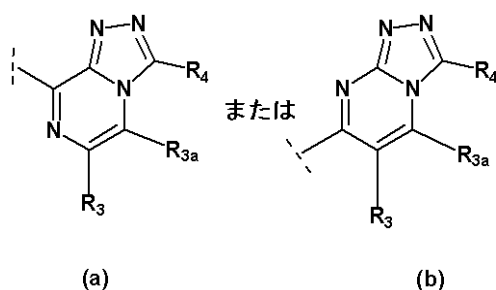
【請求項 3】

Wがフェニルまたはシクロプロピルであり、その両者がR<sub>1</sub>、R<sub>1a</sub>、R<sub>1b</sub>、R<sub>1c</sub>およびR<sub>1d</sub>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】

R<sub>4</sub>が、ハロゲン、-OH、-OR<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-OCOR<sub>6</sub>、-CN、-NR<sub>6</sub>COR<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-COR<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、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<sub>7</sub>、R<sub>7a</sub>、R<sub>7b</sub>、およびR<sub>7c</sub>で置換されていてよい；あるいは、

R<sub>4</sub>が、-OH、-OR<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-OCOR<sub>6</sub>、-CN、-NR<sub>6</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-COR<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、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 $R_5$ 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、 $COR_6$ 、 $CO_2R_6$ 、 $SO_2NR_6R_6$ 、または $SO_2R_6$ であり；

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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、

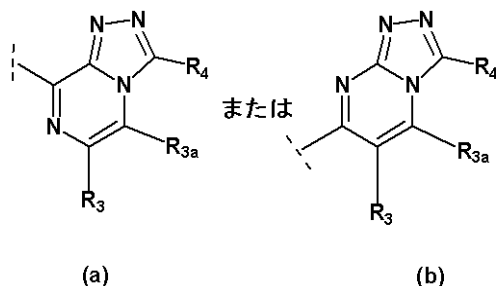
$R_8$ 、 $R_{8a}$ 、 $R_{8b}$ 、および $R_{8c}$ が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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】



から選択され；

$R_4$ が、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6COR_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、 $R_7$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$ 、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、 $COR_6$ 、 $CO_2R_6$ 、 $SO_2NR_6R_6$ 、または $SO_2R_6$ であり;

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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、 $R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ および $R_{1d}$ で置換されていてよく;

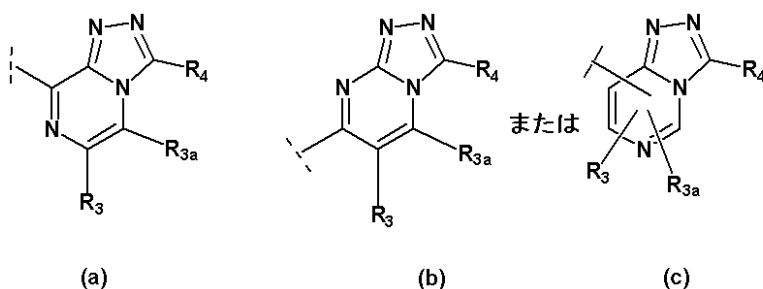
$R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ および $R_{1d}$ が独立して、水素、ハロゲン、-OH、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルケニル、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、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;

Lが、結合、O、S、 $SO_2$ 、 $C(=O)$ 、 $CR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_6$ 、 $SO_2NR_6$ 、 $OCR_2R_{2a}$ 、 $OCR_2R_{2a}CR_{2b}R_{2c}$ 、 $C$ 、 $R_2R_{2a}O$ 、 $CR_{2b}R_{2c}CR_2R_{2a}O$ 、 $SCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}S$ 、 $CR_2R_{2a}SO$ 、 $CR_2R_{2a}SO_2$ 、 $SO_2CR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}$ 、 $CR_2R_{2a}SCR_{2b}R_{2c}$ 、 $CR_2R_{2a}SO_2CR_{2b}R_{2c}$ 、 $SO_2NR_6CR_{2a}R_{2b}$ 、 $COCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}CO$ 、 $C$ 、 $ONR_6CR_{2a}R_{2b}$ 、 $CR_2R_{2a}CR_{2b}R_{2c}S$ 、 $CR_2R_{2a}CR_{2b}R_{2c}SO$ 、または $CR_2R_{2a}CR_{2b}R_{2c}SO_2$ 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 5】



から選択され;

$R_3$  が、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、アリーロキシ、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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、アリーロキシ、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、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6COR_6$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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;あるいは、

$R_4$  が、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-NR_6SO_2R_6$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-NR_6CO_2R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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 $R_6$ 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、アリーロキシ、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、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリーロキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリーロキシアリール、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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、アリーロキシ、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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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；

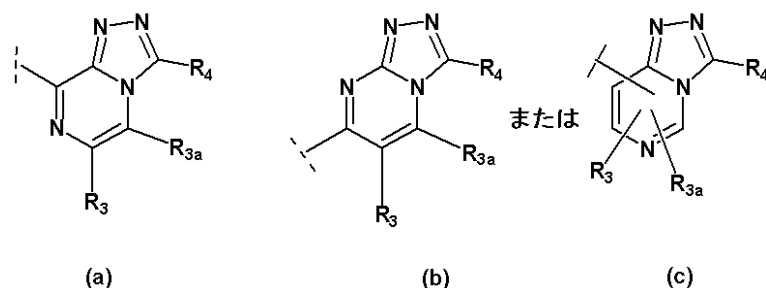
$R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ および $R_{1d}$ が独立して、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたは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、 $SO_2$ 、 $C(=O)$ 、 $CR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_6$ 、 $CR_2R_{2a}CR_{2b}R_{2c}$ 、 $OCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}O$ 、 $SCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}S$ 、 $CR_2R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}$ 、 $CR_2R_{2a}SCR_{2b}R_{2c}$ 、 $CR_2R_{2a}SO_2CR_{2b}R_{2c}$ または $SO_2NR_6CR_{2a}R_{2b}$ 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；

Z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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-SOR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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

、アリアルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリアルチオ、アリアルスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリアルアミノ、ヘテロアリアルアミノ、アリアル、ヘテロアリア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、アリアル、ヘテロアリア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、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、アリアル、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリアルから選択される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、アリアル、ヘテロアリア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；あるいは、

$R_4$ が、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-OCOR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、アリアル、アミノ、ヘテロシクリルまたはヘテロアリアルから選択される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、アリアル、ヘテロアリア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、アリアルまたはヘテロアリアルであり、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、アリアル、アリアルオキシ、アリアルアリアル、アリアルアルキル、アリアルアルキルオキシ、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、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルオキシ、ヘテロアリアルアルキル、ヘテロアリアルアルコキシ、アリアルオキシアルキル、アルキルチオ、アリアルアルキルチオ、アリアルオキシアリアル、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリアルカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、アリアル、アリアルオキシ、アリアルアリアル、アリアルアルキル、アリアルアルキルオキシ、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、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルオキシ、ヘテロアリアルアルキル、ヘテロアリアルアルコキシ、アリアルオキシアルキル、アルキルチオ、アリアルアルキルチオ、アリアルオキシアリアル、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリア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、アリアル、アリアルオキシ、アリアルアリアル、アリアルアルキル、アリアルアルキルオキシ、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、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルオキシ、ヘテロアリアルアルキル、ヘテロアリアルアルコキシ、アリアルオキシアルキル、アルキルチオ、アリアルアルキルチオ、アリアルオキシアリアル、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリアルカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、アリアルまたはシクロアルキルであり、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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2NR_6R_6$ 、 $-OCONR_6R_6$ 、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、アリアルオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリアルチオ、アリアルスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリアルアミノ、ヘテロアリアル

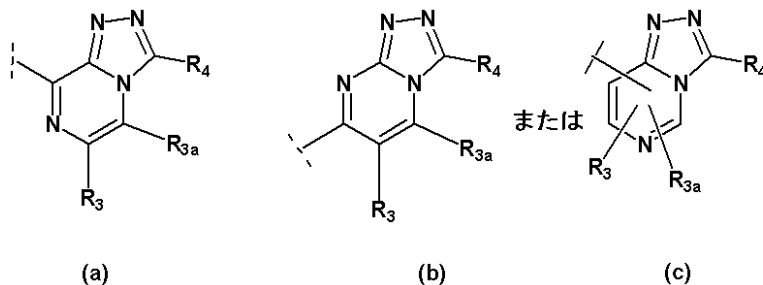
アミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 $R_7$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$ 、および $R_{7c}$ で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、 $SO_2$ 、 $C(=O)$ 、 $CR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_6$ 、 $OCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}O$ 、 $SO_2NR_6CR_{2a}R_2$ または $CR_2R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}$ 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；

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、-NO<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、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、-NO<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、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、-OR<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-OCOR<sub>6</sub>、-CN、-COR<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、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；あるいは、

$R_4$ が、-OH、-OR<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-OCOR<sub>6</sub>、-CN、-COR<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-OCONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、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<sub>6</sub>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、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、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、 $\text{R}_8$ 、 $\text{R}_{8a}$ 、 $\text{R}_{8b}$ 、および $\text{R}_{8c}$ で置換されていてよく；そして、

$\text{R}_8$ 、 $\text{R}_{8a}$ 、 $\text{R}_{8b}$ 、および $\text{R}_{8c}$ 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、 $-\text{OH}$ 、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、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、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、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_{1a}$ 、 $\text{R}_{1b}$ 、 $\text{R}_{1c}$ および $\text{R}_{1d}$ で置換されていてよく；

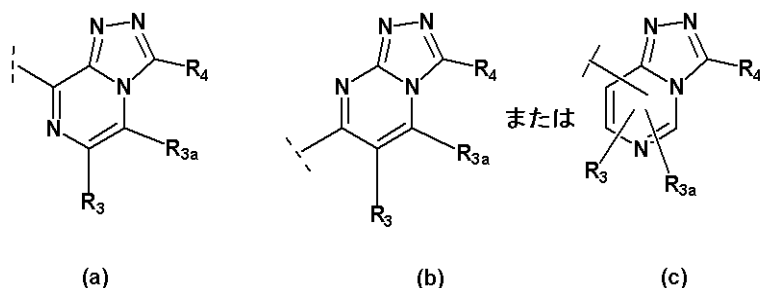
$\text{R}_1$ 、 $\text{R}_{1a}$ 、 $\text{R}_{1b}$ 、 $\text{R}_{1c}$ および $\text{R}_{1d}$ が独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、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、 $\text{R}_7$ 、 $\text{R}_{7a}$ 、 $\text{R}_{7b}$ 、および $\text{R}_{7c}$ で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、 $\text{SO}_2$ 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CR}_2\text{R}_{2a}$ 、 $\text{CR}_2\text{R}_6$ 、 $\text{OCR}_2\text{R}_{2a}$ 、 $\text{CR}_2\text{R}_{2a}\text{O}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_6\text{CR}_{2a}\text{R}_2$ または $\text{CR}_2\text{R}_{2a}\text{OCR}_{2b}\text{R}_{2c}$ であり；

$\text{R}_2$ 、 $\text{R}_{2a}$ 、 $\text{R}_{2b}$ および $\text{R}_{2c}$ が独立して、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、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 8】



から選択され；

$\text{R}_3$ が、水素、ハロゲン、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_6$ 、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、 $\text{R}_7$ 、 $\text{R}_{7a}$ 、 $\text{R}_{7b}$ 、および $\text{R}_{7c}$ で置換されていてよく；

$R_{3a}$ が、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CO_2R_6$ 、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、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリーロチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリーロアミノ、ヘテロアリーロアミノ、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、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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；あるいは、

$R_4$ が、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、アリーロキシ、アリーロアリール、アリーロアルキル、アリーロアルキルオキシ、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、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリーロアルキル、ヘテロアリーロアルコキシ、アリーロオキシアルキル、アルキルチオ、アリーロアルキルチオ、アリーロオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリーロカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、アリーロキシ、アリーロアリール、アリーロアルキル、アリーロアルキルオキシ、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、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリーロアルキル、ヘテロアリーロアルコキシ、アリーロオキシアルキル、アルキルチオ、アリーロアルキルチオ、アリーロオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリーロ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、アリーロキシ、アリーロアリール、アリーロアルキル、アリーロアルキルオキシ、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、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリーロアルキル、ヘテロアリーロアルコキシ、アリーロオキシアルキル、アルキルチオ、アリーロアルキルチオ、アリーロオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリーロカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、 $R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ 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、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、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、アリーロキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリーロチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノ

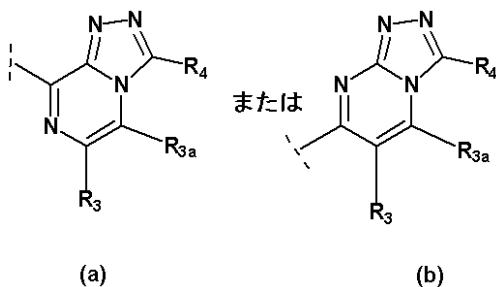
アルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 $R_7$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$ 、および $R_{7c}$ で置換されていてよく；

$L$ が、結合、O、S、SO、 $SO_2$ 、 $C(=O)$ 、 $CR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_6$ 、 $OCR_2R_{2a}$ 、 $CR_2R_{2a}O$ 、 $SO_2NR_6CR_{2a}R_{2b}$ または $CR_2R_{2a}OCR_{2b}R_{2c}$ 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；

$Z$ が、以下の二環式ヘテロアリール基：

【化 9】



から選択され；

$R_3$ が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO<sub>2</sub>、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、-NO<sub>2</sub>、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、-OR<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-CN、-COR<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-CONR<sub>6</sub>R<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、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、 $R_7$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$ 、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、-NO<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>H、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、-NO<sub>2</sub>、-CN、-CO<sub>2</sub>H、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 1 2】

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、 $R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ および $R_{1d}$ で置換されていてよく；

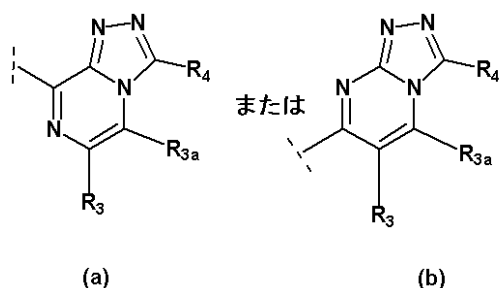
$R_1$ 、 $R_{1a}$ 、 $R_{1b}$ 、 $R_{1c}$ および $R_{1d}$ が独立して、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO<sub>2</sub>、テトラゾリル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アリールスルホニル、アルキルアミノ、アミノアルキル、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり、ここで該テトラゾリル、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは適宜、 $R_7$ 、 $R_{7a}$ 、 $R_{7b}$ 、および $R_{7c}$ で置換されていてよく；

Lが、結合、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、C(=O)、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、OCR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>、CR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>O、SO<sub>2</sub>NR<sub>6</sub>CR<sub>2a</sub>R<sub>2b</sub>またはCR<sub>2</sub>R<sub>2a</sub>OCR<sub>2b</sub>R<sub>2c</sub>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 1 0】



から選択され；

$R_3$ が、水素、ハロゲン、-OH、-CN、-NO<sub>2</sub>、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、-NO<sub>2</sub>、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、 $-OH$ 、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-CN$ 、 $-COR_6$ 、 $-CO_2R_6$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CONR_6R_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、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、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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、

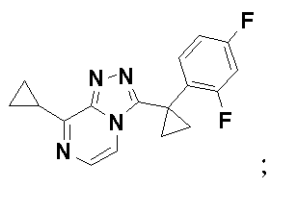
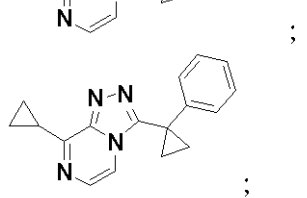
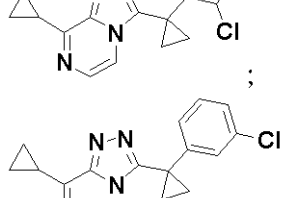
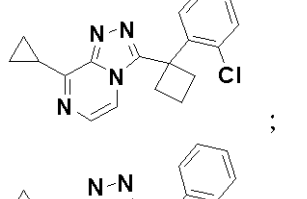
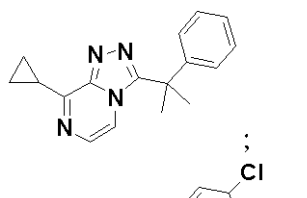
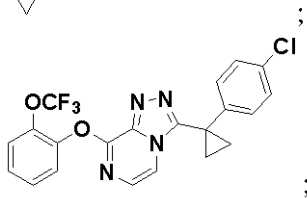
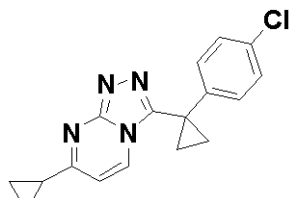
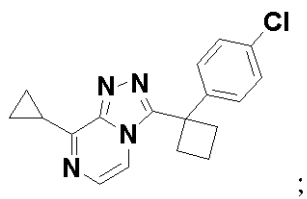
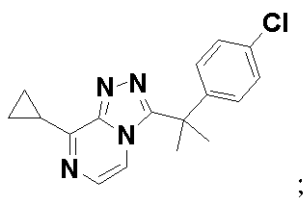
$R_8$ 、 $R_{8a}$ 、 $R_{8b}$ 、および  $R_{8c}$  が各々独立して、ハロ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、アリールオキシ、アリールアリール、アリールアルキル、アリールアルキルオキシ、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルキルオキシ、アミノ、 $-OH$ 、ヒドロキシアルキル、アシル、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルコキシ、アリールオキシアルキル、アルキルチオ、アリールアルキルチオ、アリールオキシアリール、アルキルアミド、アルカノイルアミノ、アリールカルボニルアミノ、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、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。

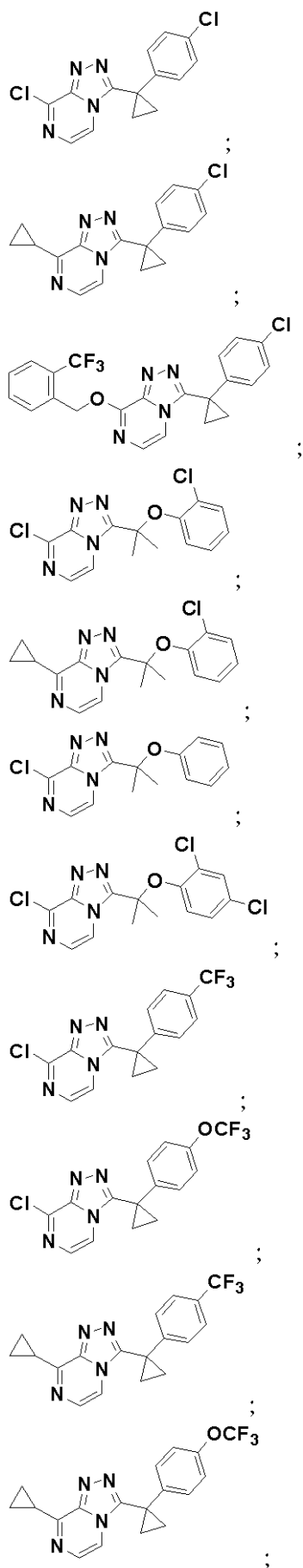
【請求項 13】

式：

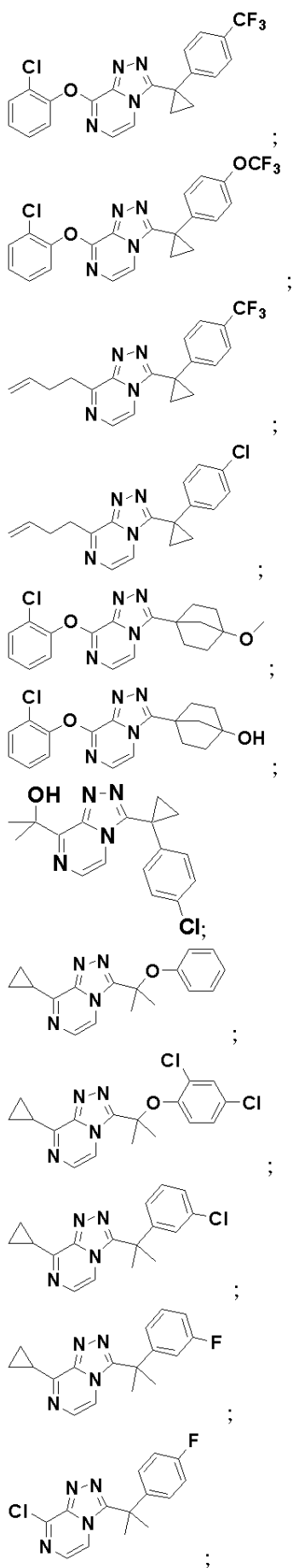
## 【化 1 1】



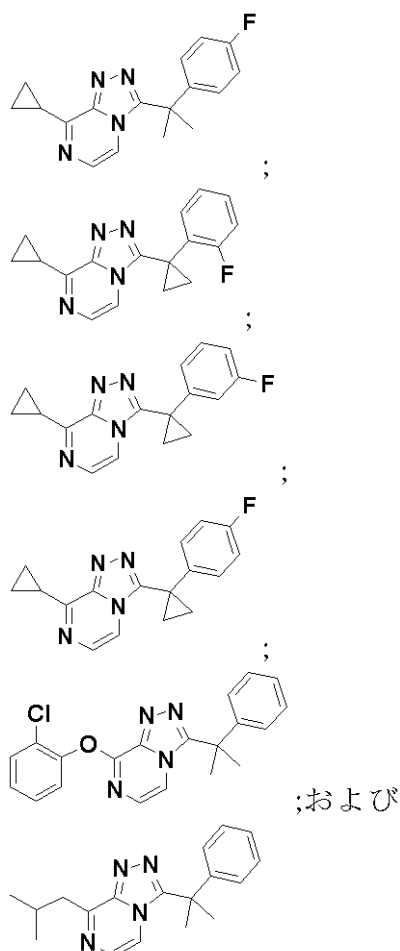
## 【化 1 2】



## 【化 1 3】



## 【化 1 4】



からなる群から選択される化合物。

## 【請求項 1 4】

少なくとも 1 つの請求項 1 から 1 3 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 1 5】

他の 11-β-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 1 4 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 6】

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 1 3 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 1 7】

治療上有効な量の少なくとも 1 つの請求項 1 から 1 3 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- $\beta$ -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、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。