

【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】令和2年8月20日(2020.8.20)

【公表番号】特表2019-522673(P2019-522673A)

【公表日】令和1年8月15日(2019.8.15)

【年通号数】公開・登録公報2019-033

【出願番号】特願2019-502161(P2019-502161)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/20 (2006.01)

C 0 7 C 231/02 (2006.01)

C 0 7 D 295/13 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 237/20

C 0 7 C 231/02

C 0 7 D 295/13

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/165

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和2年7月7日(2020.7.7)

【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

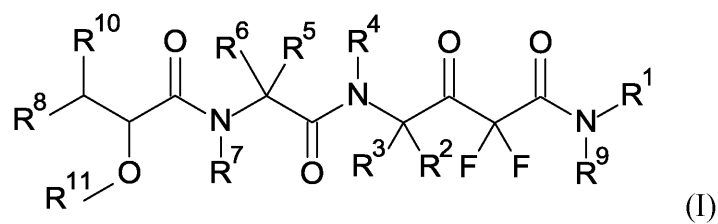
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



[ 式中、

R<sup>1</sup> は、

i) C<sub>1</sub> - 6 - アルキル、

ii) R<sup>2 4</sup>、R<sup>2 5</sup> 及び R<sup>2 6</sup> で置換された C<sub>3</sub> - 8 - シクロアルキル、

iii) 八口 - C<sub>1</sub> - 6 - アルキル、

i v)  $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{1-6}$  - アルキル、

v)  $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  で置換されたアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル、並びに

v i)  $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-6}$  - アルキルから選択され；

$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  及び  $R^{23}$  は、独立して、

i) H、

i i)  $C_{1-6}$  - アルキル、及び

i i i)  $C_{3-8}$  - シクロアルキル

から選択され；

$R^5$  は、

i)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたアリール、

i i)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル、

i i i)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたヘテロアリール、並びに

i v)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル

から選択され；

$R^8$  は、

i) H、

i) ヒドロキシ、

i i) H、 $C_{1-6}$  - アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルキル、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルから選択される1個又は2個の置換基により窒素原子上で置換されたアミノ -  $C_{1-6}$  - アルキル、ここで、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルは、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換され、

i i i) H、 $C_{1-6}$  - アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルキル、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルから選択される1個又は2個の置換基により窒素原子上で置換されたアミノカルボニル、ここで、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルは、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換され、

i v) H、 $C_{1-6}$  - アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$  - アルキル、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルから選択される1個又は2個の置換基により窒素原子上で置換されたアミノカルボニル -  $C_{1-6}$  - アルキル、ここで、アリールカルボニル及びヘテロアリールカルボニルは、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換され、

v) カルボキシ、

v i) カルボキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

v i i)  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

v i i i)  $C_{1-6}$  - ハロアルコキシ、

i x)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、

x)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル -  $C_{1-6}$  - アルキル、

x i)  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

x i i)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたアリール、

x i i i)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル、

x i v)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたアリール -  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

x v)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロアリール、

x v i)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル

、並びに

x v i i)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

x v i i i)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロシクロアルキル、

x i x)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{1-6}$  - ア

ルキル、並びに

xx)  $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{1-6}$  - アルコキシから選択され；

$R^{11}$  は、

i)  $R^{21}$  及び  $R^{22}$  により窒素原子上で置換されたアミノ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

ii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換された  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

iii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換された  $C_{3-8}$  - シクロアルキル -  $C_{1-6}$  - アルキル、

iiii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換された  $C_{3-8}$  - シクロアルキル (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

v)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール、

vi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル、

vii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

viii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール - ヘテロシクロアルキル、

ix)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

x)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール (ハ口) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリール (ハ口) - ヘテロシクロアルキル、

xii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリールオキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xiii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリールオキシ -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xiiii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリールオキシ - ヘテロシクロアルキル、

xv)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリールオキシ (ハ口) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xvi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたアリールオキシ (ハ口) - ヘテロシクロアルキル、

xvii) アリールオキシ (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xviii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロシクロアルキル、

xix)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xx)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロシクロアルキル (ハ口) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロシクロアルキル (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xxiii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリール、

xxiv)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xxv)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリール -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxvi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリール (ハ口) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxvii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリール (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xxviii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリールオキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xxix)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリールオキシ -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxx)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリールオキシ (ハ口) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

xxxi)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリールオキシ (ハ口) -  $C_{1-6}$  - アルキル、

$x x v i i i$ )  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリアルオキシ -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、  
 $x x i x$ )  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリアルオキシ (ハロ) -  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、並びに  
 $x x x$ )  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたヘテロアリアルオキシ (ハロ) -  $C_{1-6}$  - アルキル

から選択され；

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{19}$ 、 $R^{20}$ 、 $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  は、独立して、

i) H、

i) シアノ、

ii) ハロゲン、

iii) オキシ、

iv)  $C_{1-6}$  - アルキル、

v) 独立して、H、 $C_{1-6}$  - アルキル、 $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、アリアルカルボニル及びヘテロアリアルカルボニルから選択される2個の置換基により窒素原子上で置換されたアミノ、

vi) 独立して、H、 $C_{1-6}$  - アルキル、 $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、アリアルカルボニル及びヘテロアリアルカルボニルから選択される2個の置換基により窒素原子上で置換されたアミノ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

vii)  $C_{1-6}$  - アルキル、

viii) ハロ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

ix)  $C_{3-8}$  - シクロアルキル、

x)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xi) カルボキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

xii)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル -  $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル -  $C_{1-6}$  アルキル、

xiii) カルボキシ -  $C_{1-6}$  - アルキルアミノカルボニル -  $C_{1-6}$  アルキル、

xiv)  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

xv) ハロ -  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

xvi)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル -  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

xvii) カルボキシ -  $C_{1-6}$  - アルコキシ、

xviii)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル -  $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル -  $C_{1-6}$  アルコキシ、並びに

ix) カルボキシ -  $C_{1-6}$  アルキルアミノカルボニル -  $C_{1-6}$  アルコキシ；

xx) ヘテロシクロアルキル

から選択され；

$R^{21}$  及び  $R^{22}$  は、独立して、

i) H、

ii)  $C_{1-6}$  - アルコキシカルボニル、

iii) カルボキシ -  $C_{1-6}$  - アルキル、

iv) アリアルカルボニル、及び

v) ヘテロアリアルカルボニル

から選択される]

で示される化合物、又は薬学的に許容し得る塩。

【請求項2】

$R^1$  が、

i)  $C_{1-6}$  - アルキル、並びに

ii)  $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  で置換されたヘテロシクロアルキル -  $C_{1-6}$  - アルキル

から選択され；

$R^2$  が、 $C_{1-6}$ -アルキルであり；

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^9$  及び  $R^{10}$  が、H であり；

$R^5$  が、

i)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたフェニル、並びに

ii)  $R^{12}$ 、 $R^{13}$  及び  $R^{14}$  で置換されたフェニル- $C_{1-6}$ -アルキル

から選択され；

$R^8$  が、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$  及び  $R^{17}$  で置換されたフェニルであり；

$R^{11}$  が、

iii)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたフェニル、並びに

iv)  $R^{18}$ 、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  で置換されたピリジニル

から選択され；

$R^{12}$  が、

i) H、及び

ii)  $C_{1-6}$ -アルコキシ

から選択され；

$R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{17}$  及び  $R^{20}$  が H であり；

$R^{15}$  が、

i) H、

ii) シアノ、及び

iii) ハロゲン

から選択され；

$R^{16}$  が、

i) H、及び

ii) ハロゲン

から選択され；

$R^{18}$  が、

i) ハロゲン、及び

ii) シアノ

から選択され；

$R^{19}$  が、

i) H、

ii) シアノ、

iii)  $C_{1-6}$ -アルキル、及び

iv) ハロゲン

から選択される、請求項 1 記載の化合物、又は薬学的に許容し得る塩。

【請求項 3】

$R^1$  が、

i)  $C_{1-6}$ -アルキル、並びに

ii)  $R^{24}$ 、 $R^{25}$  及び  $R^{26}$  で置換されたヘテロシクロアルキル- $C_{1-6}$ -アルキル

から選択される、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 4】

$R^1$  が、ハロ- $C_{1-6}$ -アルキルである、請求項 1 ~ 2 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 5】

$R^1$  が、トリフルオロエチルである、請求項 1、2 及び 4 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 6】

$R^2$  が、 $C_{1-6}$ -アルキルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 7】

R<sup>2</sup> が、イソプロピルである、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 8】

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>9</sup> 及び R<sup>10</sup> が、H である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 9】

R<sup>5</sup> が、

i) R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup> 及び R<sup>14</sup> で置換されたフェニル、並びに

ii) R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup> 及び R<sup>14</sup> で置換されたフェニル - C<sub>1-6</sub> - アルキル

から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 10】

R<sup>5</sup> が、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup> 及び R<sup>14</sup> で置換されたフェニルである、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 11】

R<sup>5</sup> が、1つの C<sub>1-6</sub> - アルコキシで置換されたフェニルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 12】

R<sup>8</sup> が、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup> 及び R<sup>17</sup> で置換されたフェニルである、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 13】

R<sup>11</sup> が、

i) R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup> 及び R<sup>20</sup> で置換されたフェニル、並びに

ii) R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup> 及び R<sup>20</sup> で置換されたピリジニル

から選択される、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 14】

R<sup>11</sup> が、R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup> 及び R<sup>20</sup> で置換されたフェニルである、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 15】

R<sup>12</sup> が、

i) H、及び

ii) C<sub>1-6</sub> - アルコキシ

から選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 16】

R<sup>12</sup> が、C<sub>1-6</sub> - アルコキシである、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 17】

R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>17</sup> 及び R<sup>20</sup> が、H である、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 18】

R<sup>15</sup> が、

i) H、

ii) シアノ、及び

iii) ハロゲン

から選択される、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 19】

R<sup>15</sup> が、ハロゲンである、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 20】

R<sup>16</sup> が、

i) H、及び

ii) ハロゲン

から選択される、請求項 1 ~ 19 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 21】

R<sup>16</sup> が、H である、請求項 1 ~ 20 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 22】

R<sup>18</sup> が、

i) ハロゲン、及び

ii) シアノ

から選択される、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 23】

R<sup>19</sup> が、

i) H、

ii) シアノ、

iii) C<sub>1-6</sub>-アルキル、及び

iv) ハロゲン

から選択される、請求項 1 ~ 22 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 24】

R<sup>9</sup> が、

i) シアノ、及び

ii) ハロゲン

から選択される、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 25】

(S)-4-((S)-2-((R)-2-(3,5-ジクロロフェノキシ)-3-フェニルプロパンアミド)-3-フェニルプロパンアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-2-(3,5-ジクロロフェノキシ)-3-フェニルプロパンアミド)-2-フェニルアセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-N-(2-モルホリノエチル)-3-オキソヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-2-(3,5-ジクロロフェノキシ)-3-フェニルプロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-3-(3-クロロフェニル)-2-(3,5-ジクロロフェノキシ)プロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-2-(3-クロロ-5-メチルフェノキシ)-3-(3-クロロフェニル)プロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-2-(3-クロロフェノキシ)-3-(3,4-ジクロロフェニル)プロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-3-(3-クロロフェニル)-2-(3,5-ジシアノフェノキシ)プロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S)-4-((S)-2-((R)-3-(3-クロロフェニル)-2-((5-クロロピリジン-3-イル)オキシ)プロパンアミド)-2-(4-メトキシフェニル)アセトアミド)-2,2-ジフルオロ-5-メチル-3-オキソ-N-(2,2,2-トリ

フルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3 - クロロフェノキシ) - 3 - (3, 5 - ジクロロフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((S) - 3 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (3, 5 - ジクロロフェノキシ)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((S) - 3 - (3 - クロロフェニル) - 2 - (3, 5 - ジクロロフェノキシ)プロパンアミド) - 2 - フェニルアセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3 - クロロ - 5 - シアノフェノキシ) - 3 - (3 - クロロフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3 - クロロ - 5 - シアノフェノキシ) - 3 - (3 - クロロフェニル)プロパンアミド) - 2 - フェニルアセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(4S) - 4 - ((2S) - 2 - (2 - (3 - クロロ - 5 - シアノフェノキシ) - 3 - (3 - シアノフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3, 5 - ジシアノフェノキシ) - 3 - (3 - フルオロフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3 - シアノフェノキシ) - 3 - (3 - フルオロフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド;

(S) - 4 - ((S) - 2 - ((R) - 2 - (3 - クロロフェノキシ) - 3 - (3 - フルオロフェニル)プロパンアミド) - 2 - (4 - メトキシフェニル)アセトアミド) - 2, 2 - ジフルオロ - 5 - メチル - 3 - オキソ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)ヘキサナムド

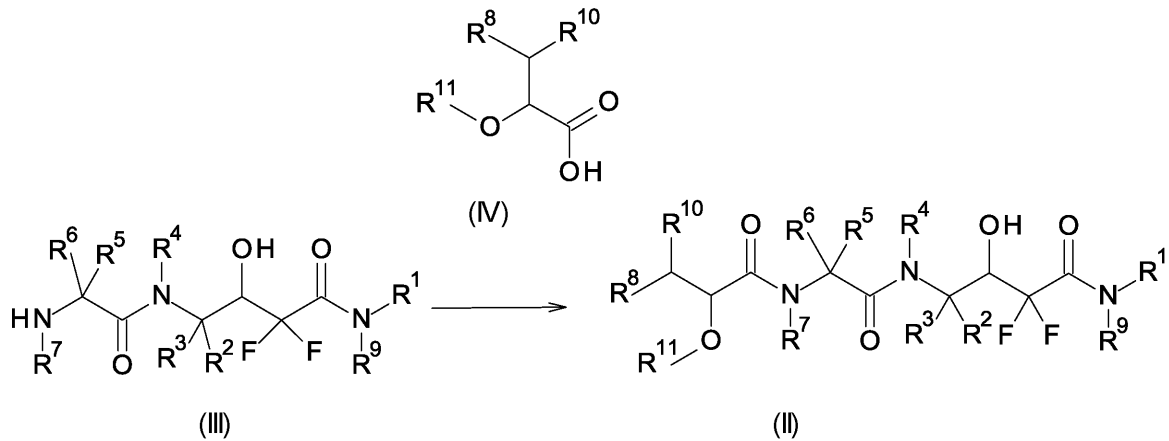
及びそれらの薬学的に許容し得る塩

から選択される、請求項 1 ~ 24 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 26】

i) 式 (III) で示される化合物を式 (IV) で示される化合物と反応させること、

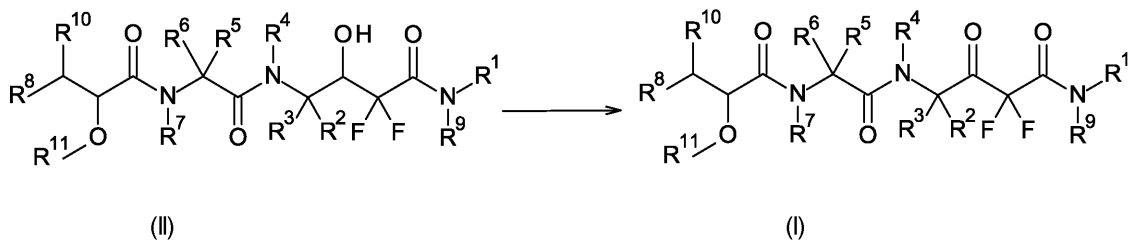
## 【化2】



次いで、

i i) 酸化条件において式 (II) で示される化合物を反応させること

## 【化3】



[ 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$  及び  $R^{11}$  は、請求項 1 ~ 28 のいずれかに記載のとおりである ]

を含む、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物を調製するためのプロセス。

## 【請求項 27】

治療活性物質として使用するための、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 28】

請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物及び治療上不活性な担体を含む医薬組成物。

## 【請求項 29】

ウェット型又はドライ型の加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症及びポリープ状脈絡膜血管症を処置又は予防するための、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物の使用。

## 【請求項 30】

ウェット型又はドライ型の加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症及びポリープ状脈絡膜血管症を処置又は予防するための、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物。

## 【請求項 31】

ウェット型又はドライ型の加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症及びポリープ状脈絡膜血管症を処置又は予防するための医薬を調製するための、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物の使用。

## 【請求項 32】

腎臓疾患、肝臓疾患、炎症性疾患からなる群より選択される腎臓の状態、ウェット型又はドライ型の加齢黄斑変性症、地図状萎縮、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症及びポリープ状脈絡膜血管症の状態を処置又は予防するための方法であって、有効量の請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物を含む医薬組成物を投与することを含む、方法に用いられる

医薬組成物。

【請求項 33】

請求項 26 に記載のプロセスにより製造される場合の、請求項 1 ~ 25 のいずれか一項記載の化合物。