

【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22年9月16日(2010.9.16)

【公表番号】特表2010-514681(P2010-514681A)

【公表日】平成22年5月6日(2010.5.6)

【年通号数】公開・登録公報2010-018

【出願番号】特願2009-543158(P2009-543158)

【国際特許分類】

C 07D 401/12 (2006.01)
 C 07D 403/12 (2006.01)
 A 61K 31/4035 (2006.01)
 A 61K 31/4709 (2006.01)
 C 07D 413/12 (2006.01)
 A 61K 31/517 (2006.01)
 C 07D 498/04 (2006.01)
 C 07D 413/14 (2006.01)
 A 61K 38/00 (2006.01)
 C 07D 417/14 (2006.01)
 A 61K 31/541 (2006.01)
 C 07D 453/06 (2006.01)
 A 61K 31/55 (2006.01)
 A 61P 43/00 (2006.01)
 A 61P 7/02 (2006.01)
 A 61P 9/10 (2006.01)
 A 61P 9/06 (2006.01)
 A 61P 9/08 (2006.01)
 A 61P 9/12 (2006.01)
 A 61P 3/06 (2006.01)
 A 61P 3/10 (2006.01)
 A 61P 11/00 (2006.01)
 A 61P 3/04 (2006.01)
 A 61P 35/00 (2006.01)
 A 61P 35/02 (2006.01)
 A 61K 38/55 (2006.01)
 C 07K 5/037 (2006.01)

【F I】

C 07D 401/12 C S P

C 07D 403/12

A 61K 31/4035

A 61K 31/4709

C 07D 413/12

A 61K 31/517

C 07D 498/04 1 1 6

C 07D 413/14

A 61K 37/02

C 07D 417/14

A 61K 31/541

C 07D 453/06

A 61K 31/55

A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 K	37/64	
C 0 7 K	5/037	

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月28日(2010.7.28)

【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

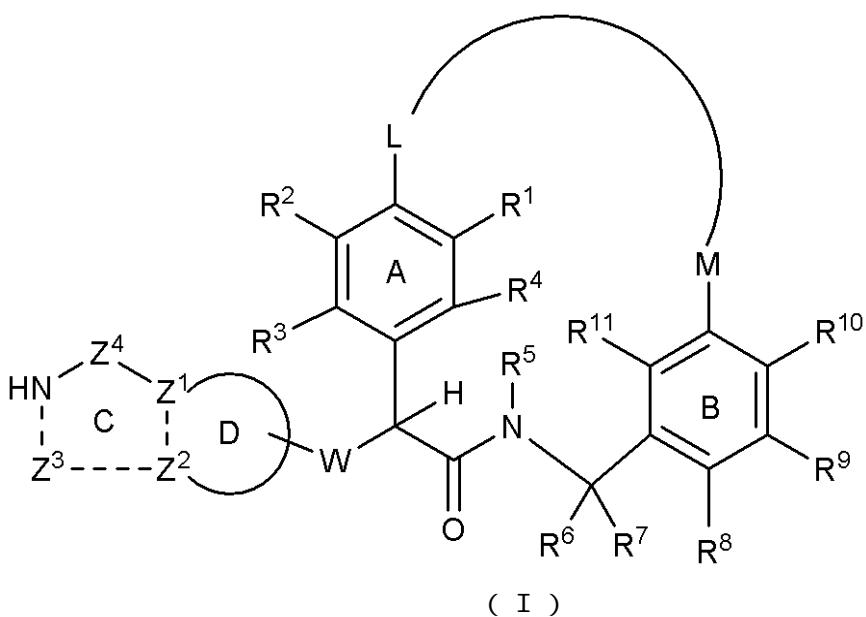
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ⅰ)：

【化1】



[式中、

環Aは、式(Ⅰ)の環A中のCR¹、CR²、CR³、またはCR⁴のうちの1つをNで置き換えることによって定義されるフェニルまたはピリジル異性体であり；

環Bは、式(Ⅰ)の環B中のCR⁸、CR⁹、CR¹⁰、またはCR¹¹のうちの1つをNで置き換えることによって定義されるフェニルまたはピリジル異性体であり；

Z^1 は、CまたはNであり；

Z^2 は、CまたはNであるが；

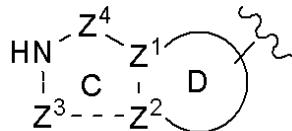
ただし、 Z^1 がNである場合、 Z^2 はCであるか；または Z^2 がNである場合、 Z^1 はCであり；

Z^3 の定義については、左から右に記載し、原子の結合は- NH - Z^3 - Z^2 - の順序であり；

Z^3 は、- CR¹⁸R¹⁸ -、- NR¹⁹ -、- O -、S(O)_p -、- C(=O) -、- C(=NH) -、- CR¹⁸=CR¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸=N -、- CR¹⁸R¹⁸NR¹⁹ -、- NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸ -、- C(O)CR¹⁸R¹⁸ -、- C(O)NR¹⁹ -、- CR¹⁸R¹⁸C(O) -、- C(O)C(O) -、- SO₂ -、- SO₂CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸SO₂ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸=CR¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸=CR¹⁸ -、- N=CR¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸ = N -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸O -、- NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸NR¹⁹ -、- C(O)CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸C(O) -、- CR¹⁸=CR¹⁸C(O) -、- C(O)CR¹⁸=CR¹⁸ -、- N=CR¹⁸C(O) -、- C(O)CR¹⁸=N -、- C(O)CR¹⁸R¹⁸O -、- NR¹⁹CR¹⁸C(O)CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸C(O)NR¹⁹ -、- NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸C(O) -、- C(O)CR¹⁸R¹⁸NR¹⁹ -、- C(O)NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸ -、- SO₂CR¹⁸R¹⁸CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸SO₂CR¹⁸R¹⁸ -、- CR¹⁸R¹⁸SO₂ -、- CR¹⁸=CR¹⁸SO₂ -、- SO₂CR¹⁸=CR¹⁸ -、- N=CR¹⁸SO₂ -、- CR¹⁸R¹⁸SO₂NR¹⁹ -、- NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸SO₂ -、- SO₂CR¹⁸R¹⁸NR¹⁹ -、- SO₂NR¹⁹CR¹⁸R¹⁸ -であるが；

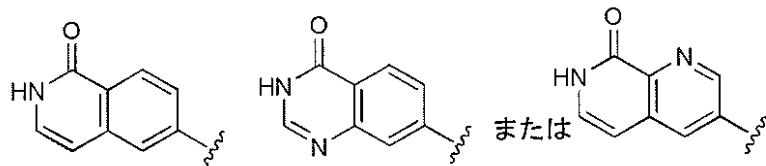
ただし、

【化2】



は、

【化3】



以外であり；

Z^4 は、C(O)、CR²⁰R²⁰またはSO₂であり；

環Cと縮合した2個の原子 Z^1 および Z^2 が含まれる環Dは、0～3個のR²¹で置換されたフェニル、または炭素原子、ならびにN、O、およびSからなる群から選択される1～4個のヘテロ原子からなる、5～6員のヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールは、0～3個のR²¹で置換されており；

LおよびMの定義については、左から右に記載し、原子の結合は(環A) - L - M - (環B)の順序であり；

Mは、- CONH -、- SO₂NH -、- NHCO -、または- NH₂SO₂ -であり；

Mが- CONH -である場合、Lは、- C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³) -、- XC(R¹²R¹³) -、- C(R¹²R¹³)Y -、- C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³) -、- XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³) -、- C(R¹²R¹³)XC(R¹²R¹³) -、- C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)Y -、- XC(R¹²R¹³)Y -、- C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³) -

$R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) X C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) Y - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) Y - \sim - C(R^{12}R^{13}) X C(R^{12}R^{13}) Y - \sim -$ から選択され；

Mが- SO_2NH -である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) Y - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) Y - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) Y - \sim - C(R^{12}R^{13}) X C(R^{12}R^{13}) Y - \sim -$ から選択され；

Mが- $NHCO$ -である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim -$ から選択され；

Mが- $NHSO_2$ -である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - X C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim - C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) C(R^{12}R^{13}) - \sim -$ から選択され；

Wは、 NR^h 、OまたはSであり；

Xは、O、 $S(O)_p$ 、または NR^{16} であり；

Yは、Oまたは NR^{16a} であり；

R^1 は、H、F、C1、Br、I、0~1個のOHで置換された $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{1~4}$ フルオロアルキル、 $C_{2~4}$ アルケニル、 $C_{2~4}$ アルキニル、 $C_{1~4}$ アルコキシ、 $C_{1~4}$ アルキルチオ、または $C_{3~6}$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、F、C1、Br、I、 $-(CH_2)_sOR^a$ 、 $-(CH_2)_sSR^b$ 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_sOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 $-(CH_2)_sNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sS(O)_2R^b$ 、0~2個の R^e で置換された $C_{1~6}$ アルキル、 $C_{1~4}$ フルオロアルキル、0~2個の R^e で置換された $C_{2~4}$ アルケニル、0~2個の R^e で置換された $C_{2~4}$ アルキニル、0~2個の R^f で置換された $-(CH_2)_sC_{3~6}$ 炭素環、 $-(CH_2)_s-(5~6$ 員のヘテロ環)、 $-(CH_2)_s-NR^c$ 、 $-(5~6$ 員のヘテロ環)、または $-(CH_2)_s-O-(5~6$ 員のヘテロ環)であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびにN、 NR^c 、O、および $S(O)_p$ から選択される1~3個のヘテロ原子を含み、かつ0~2個の R^g で置換されており；

R^3 は、H、F、C1、Br、I、 $-(CH_2)_sOR^a$ 、 $-(CH_2)_sSR^b$ 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_sOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 $-(CH_2)_sNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sS(O)_2R^b$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^a$

、 - (CH₂)_sSO₂NHCOR^b、 - (CH₂)_sCONHSO₂R^b、 0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{1 ~ 6} アルキル、 C_{1 ~ 4} フルオロアルキル、 0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルケニル、 0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルキニル、 - O (CO₂R^a で置換されたベンジル)、 - (CH₂)_s テトラゾリル、 0 ~ 2 個の R^{f1} で置換された - (CH₂)_s - C_{3 ~ 6} 炭素環、 - (CH₂)_s - (5 ~ 6 員のヘテロ環)、 - (CH₂)_s - NR^c - (5 ~ 6 員のヘテロ環)、 または - (CH₂)_s - O - (5 ~ 6 員のヘテロ環) であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N、NR^c、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、かつ 0 ~ 2 個の R^{g1} で置換されているか；

あるいは、R² と R³ は、一体となって 5 ~ 7 員の炭素環、または炭素原子、ならびに N、NR^c、O、および S(O)_p から選択される 0 ~ 2 個のヘテロ原子を含むヘテロ環を形成してもよく；前記炭素環およびヘテロ環は、0 ~ 3 個の R^{g1} で置換されており；

R⁴ は、H、F、Cl、Br、I、または C_{1 ~ 4} アルキルであり；

R⁵ は、H、- (CH₂)_qOR^a、- (CH₂)_qSR^b、- (CH₂)_rCF₃、- (CH₂)_qO CF₃、- (CH₂)_qOCHF₂、- (CH₂)_qOCH₂F、- (CH₂)_qCN、- (CH₂)_qNO₂、- (CH₂)_qNR^cR^d、- (CH₂)_sC(O)R^a、- (CH₂)_sCO₂R^a、- (CH₂)_qNR^cC(O)R^a、- (CH₂)_sC(O)NR^cR^d、- (CH₂)_qNR^cC(O)OR^b、- (CH₂)_qO C(O)OR^b、- (CH₂)_qNR^cC(O)NR^cR^d、- (CH₂)_qO C(O)NR^cR^d、- (CH₂)_qSO₂NR^cR^d、- (CH₂)_qNR^cSO₂R^b、- (CH₂)_qNR^cSO₂CF₃、- (CH₂)_qSO₂CF₃、- (CH₂)_qS(O)₂R^b、- (CH₂)_qSO₂NHCOR^b、- (CH₂)_sCONHSO₂R^b、- O (CO₂R^a で置換されたベンジル)、- (CH₂)_s テトラゾリル、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{1 ~ 6} アルキル、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルケニル、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルキニル、0 ~ 2 個の R^{f1} で置換された - (CH₂)_s - C_{3 ~ 6} 炭素環、または - (CH₂)_s - 5 ~ 6 員のヘテロ環であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N、NR^c、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、かつ 0 ~ 2 個の R^{g1} で置換されており；

R⁶ は、H、- (CH₂)_rOR^a、- (CH₂)_rSR^b、- (CH₂)_sCF₃、- (CH₂)_rO CF₃、- (CH₂)_rOCHF₂、- (CH₂)_rOCH₂F、- (CH₂)_sCN、- (CH₂)_sNO₂、- (CH₂)_rNR^cR^d、- (CH₂)_sC(O)R^a、- (CH₂)_sCO₂R^a、- (CH₂)_rNR^cC(O)R^a、- (CH₂)_sC(O)NR^cR^d、- (CH₂)_rNR^cC(O)OR^b、- (CH₂)_rO C(O)OR^b、- (CH₂)_rNR^cC(O)NR^cR^d、- (CH₂)_rO C(O)NR^cR^d、- (CH₂)_rSO₂NR^cR^d、- (CH₂)_rNR^cSO₂R^b、- (CH₂)_rNR^cSO₂CF₃、- (CH₂)_rSO₂CF₃、- (CH₂)_rS(O)₂R^b、- (CH₂)_rSO₂NHCOR^b、- (CH₂)_sCONHSO₂R^b、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{1 ~ 6} アルキル、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルケニル、0 ~ 2 個の R^e で置換された C_{2 ~ 4} アルキニル、0 ~ 2 個の R^{f1} で置換された - (CH₂)_s - C_{3 ~ 6} 炭素環、または - (CH₂)_s - 5 ~ 6 員のヘテロ環であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N、NR^c、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、かつ 0 ~ 2 個の R^{g1} で置換されているか；

あるいは、R⁵ と R⁶ は、一緒になって、0 ~ 1 個の R^{f1} で置換されていてもよい 2 ~ 5 員のアルキレン鎖を形成することができ；

R⁷ は、H または C_{1 ~ 6} アルキルであるか；

あるいは、R⁶ と R⁷ は、一緒になって、3 ~ 7 員の炭素環またはヘテロ環を形成することができ；前記炭素環は 0 ~ 2 個の R^{f1} で置換されていてもよく；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N、NR^c、O、および S(O)_p から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、かつ 0 ~ 2 個の R^{g1} で置換されており；

R⁸ は、H、F、Cl、Br、CN、CH₂F、CHF₂、- (CH₂)_sCF₃、- (CH₂)_sCN、- (CH₂)_sNO₂、C_{1 ~ 6} アルキル、C_{2 ~ 6} アルケニル、C_{2 ~ 6} アルキニル、- (CH₂)_n - ORⁱ、- (CH₂)_n - SR^j、- (CH₂)_n - NR^cR^d、- (CH₂)_sC(O)R^a、- (CH₂)_sCO₂R^a、- (CH₂)_sNR^cC(O)R^a、- (CH₂)_sC

$\text{O NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{SO}_2 \text{R}^j$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{NR}^c \text{C}$
 $(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{OC}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{NR}^c \text{C}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{OC}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{NR}^c \text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{NR}^c \text{SO}_2 \text{R}^j$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{NR}^c \text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n \text{C}$
 $\text{O}_2 \text{R}^a$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{SO}_2 \text{NHCO} \text{R}^b$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{CONHSO}_2 \text{R}^j$ 、 $-\text{O}(\text{CO}_2 \text{R}^a \text{で置換されたベンジル})$ 、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{テトラゾリル}$ 、 $0 \sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ フルオロアルキル、 $0 \sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2 \sim 4}$ アルケニル
、 $0 \sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $0 \sim 3$ 個の R^{f1} で置換された $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{-C}_{3 \sim 6}$ 炭素環；炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-\text{(CH}_2\text{)}_n \text{-5 \sim 10 個のヘテロ環}$ であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0 \sim 3$ 個の R^{g1} で置換されているか、または炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-\text{O-5 \sim 10 個のヘテロ環}$ であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0 \sim 3$ 個の R^{g1} で置換されており；

R^9 、 R^{10} 、および R^{11} は、各々独立して、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、または $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルコキシであり；

R^{12} および R^{13} は、各々独立して、 F 、 Cl 、 OR^a 、 SR^b 、 CF_3 、 OCF_3 、 OCH_2F 、 CN 、 NO_2 、 $-\text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{CO}_2 \text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c \text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c \text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{NR}^c \text{C}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O}) \text{OR}^a$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c \text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c \text{SO}_2 \text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^c \text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^b$ 、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2 \sim 4}$ アルケニル、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $0 \sim 2$ 個の R^{f1} で置換された $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{-C}_{3 \sim 6}$ 炭素環、 $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{-} (5 \sim 6 \text{ 個のヘテロ環})$ 、 $-\text{NR}^c \text{-} (5 \sim 6 \text{ 個のヘテロ環})$ 、または $-\text{O-} (5 \sim 6 \text{ 個のヘテロ環})$ であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^{g1} で置換されているか；

あるいは、同一の炭素または 2 つの隣接炭素と結合した任意の 2 つの R^{12} または R^{13} は、一緒にになって、 $3 \sim 7$ 個の炭素環、または炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $0 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含むヘテロ環を形成してもよく、前記炭素環またはヘテロ環は、 $0 \sim 3$ 個の R^g で置換されているか；

あるいは、同一の炭素原子上の 2 つの R^{12} または R^{13} はオキソで置き換えることができ；

L 中の隣接炭素原子上の 2 つの R^{12} または R^{13} は、2 つの炭素原子間の二重結合で置き換えられてもよいか、または、 L 中の隣接炭素原子上の 4 つの R^{12} または R^{13} は、2 つの炭素原子間の三重結合で置き換えられてもよく；

R^{16} は、各々独立して、 H 、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 $-\text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{CH}_2 \text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^b$ 、または $-\text{(CH}_2\text{)}_s \text{-} (5 \sim 6 \text{ 個のヘテロ環})$ であり；前記アルキルまたはシクロアルキルは、 $0 \sim 2$ 個の R^e で適宜置換されており、前記フェニルおよびベンジルは、 $0 \sim 2$ 個の R^f で適宜置換されており、前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されており；

R^{16a} は、各々独立して、 H 、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 $-\text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{CH}_2 \text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{SO}_2 \text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^b$ 、または $5 \sim 6 \text{ 個のヘテロ環}$ であり；前記アルキルまたはシクロアルキルは、 $0 \sim 2$ 個の R^e で適宜置換されており、前記フェニルおよびベンジルは、 $0 \sim 2$ 個の R^f で適宜置換されており、前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されており；

R^{17} は、各々独立して、HまたはMeであり；

R^{18} は、各々独立して、H、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 OCF_3 、 $OCHF_2$ 、 OC
 H_2F 、CN、 $C_{1~4}$ アルコキシ、 $C_{1~4}$ ハロアルキル、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{2~4}$ アルケニル、 $C_{2~4}$ アルキニル、または $C_{3~6}$ シクロアルキルであり；

R^{19} は、各々独立して、H、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{2~4}$ アルケニル、または $C_{2~4}$ アルキニルであり；

R^{20} は、各々独立して、H、 CF_3 、0~2個の R^e で置換された $C_{1~6}$ アルキル、 $C_{1~4}$ ハロアルキル、0~2個の R^e で置換された $C_{2~4}$ アルケニル、0~2個の R^e で置換された $C_{2~4}$ アルキニル、または- $(CH_2)_s$ - $(5~6$ 員のヘテロ環)であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびにN、NR^c、O、およびS(O)_pから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、かつ0~2個の R^{g1} で置換されており；

R^{21} は、各々独立して、F、Cl、Br、I、CN、OH、 CF_3 、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{1~4}$ ハロアルキル、 $C_{1~4}$ アルコキシ、または $C_{3~6}$ シクロアルキルであり；

R^a は、各々独立して、H、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、フルオロアルキル、フェニル、またはベンジルであり；前記アルキルおよびシクロアルキルは、0~2個の R^e で適宜置換されており、前記フェニルおよびベンジルは、0~2個の R^f で適宜置換されており；

R^b は、各々独立して、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、フルオロアルキル、フェニル、またはベンジルであり；前記アルキルおよびシクロアルキルは、0~2個の R^e で適宜置換されており、前記フェニルおよびベンジルは、0~2個の R^f で適宜置換されており；

R^c および R^d は、各々独立して、H、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、フルオロアルキル、フェニル、またはベンジルであるか；

あるいは、 R^c と R^d は、同一の窒素原子と結合している場合、一体となって炭素原子、ならびにN、O、およびS(O)_pから選択される0~2個の追加のヘテロ原子を含む4~7員のヘテロ環を形成し；前記ヘテロ環は、0~2個の R^g で置換されており；

R^e は、各々独立して、F、 CF_3 、OH、または $C_{1~3}$ アルコキシであり；

R^f は、各々独立して、F、Cl、Br、 CF_3 、OH、 $C_{1~3}$ アルキル、または $C_{1~3}$ アルコキシであり；

R^{f1} は、各々独立して、 R^f 、- CO_2R^a 、- $C(O)NR^cR^d$ 、- $CONHSO_2R^b$ 、または- $CH_2CONHSO_2R^b$ であり；

R^g は、各々独立して、=O、F、Cl、Br、 CF_3 、OH、 $C_{1~3}$ アルキル、 $C_{1~3}$ フルオロアルキル、 $C_{1~3}$ アルコキシまたは $C_{1~3}$ フルオロアルコキシであり；

R^{g1} は、各々独立して、 R^g 、- CO_2R^a 、- $C(O)NR^cR^d$ 、- $CONHSO_2R^b$ 、または- $CH_2CONHSO_2R^b$ であり；

R^h は、各々独立して、Hまたは $C_{1~3}$ アルキルであり；

R^i は、各々独立して、H、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、フェニル、またはベンジルであり；前記アルキルおよびシクロアルキルは、0~2個の R^k および0~5個のFで適宜置換されており；前記フェニルおよびベンジルは、0~2個の R^f で適宜置換されており；

R^j は、各々独立して、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、フェニル、またはベンジルであり；前記アルキルおよびシクロアルキルは、0~2個の R^k および0~5個のFで適宜置換されており、前記フェニルおよびベンジルは、0~2個の R^f で適宜置換されており；

R^k は、各々独立して、 CF_3 、OH、または $C_{1~3}$ アルコキシであり；

n は、各々、0、1、2、3、および4から選択され；

p は、各々、0、1、および2から選択され；

q は、各々、2または3から選択され；

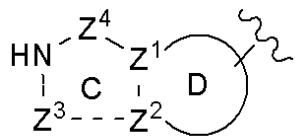
r は、各々、1、2、または3から選択され；並びに

s は、各々、0、1、および2から選択される】

の化合物またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物。

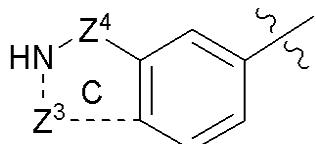
【請求項 2】

【化 4】



が、

【化 5】

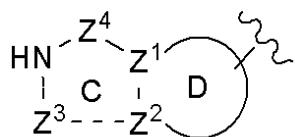


であり；

フェニル環が0～3個のR²¹で置換されている、
請求項1に記載の化合物。

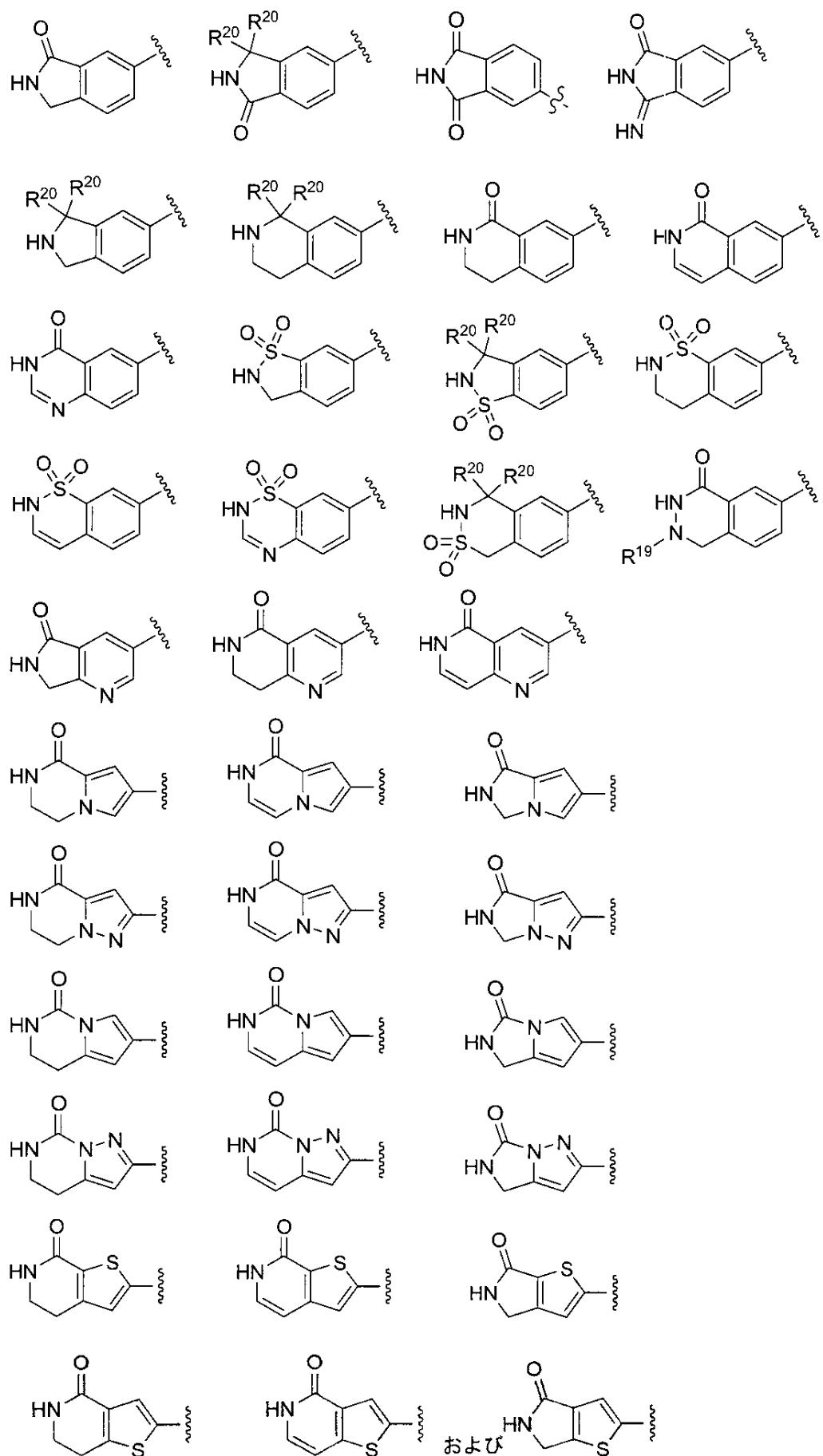
【請求項 3】

【化 6】



が、以下から選択され：

【化 7】



環 C が、0 ~ 2 個の R¹⁸ で置換されており；環 D が、0 ~ 2 個の R²¹ で置換されており

;

Mが、-CONH-、-SO₂NH-、-NHC(O)-、または-NHSO₂-であり；

Mが-CONH-である場合、Lは、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)Y-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)Y-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)Y-、および-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)Y-から選択され；

Mが-SO₂NH-である場合、Lは、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、および-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-から選択され；

Mが-NHC(O)-である場合、Lは、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、および-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-から選択され；

Mが-NHSO₂-である場合、Lは、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-、および-XC(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)-から選択され；

Xが、O、S、またはNR¹⁶であり；

Wが、NHまたはOであり；

R²が、H、F、Cl、Br、I、OR^a、SR^b、CF₃、OCF₃、OCHF₂、OCH₂F、CN、NO₂、-NR^cR^d、-C(O)R^a、-CO₂R^a、-NR^cC(O)R^a、-C(O)NR^cR^d、-NR^cC(O)OR^b、-NR^cC(O)NR^cR^d、-OC(O)N^cR^d、-SO₂NR^cR^d、-NR^cSO₂NR^cR^d、-NR^cSO₂R^b、-NR^cSO₂CF₃、-SO₂CF₃、-S(O)₂R^b、0~2個のR^eで置換されたC_{1~6}アルキル、0~2個のR^eで置換されたC_{2~4}アルケニル、0~2個のR^eで置換されたC_{2~4}アルキニル、0~2個のR^fで置換されたC_{3~6}炭素環、-(CH₂)_s-(5~6員のヘテロ環)、-NR^c-(5~6員のヘテロ環)、または-O-(5~6員のヘテロ環)であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびにN、NR^c、O、およびS(O)_pから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、かつ0~2個のR^gで置換されており；

R³が、H、F、Cl、Br、I、OR^a、SR^b、CF₃、OCF₃、OCHF₂、OCH₂F、CN、NO₂、-NR^cR^d、-C(O)R^a、-CO₂R^a、-NR^cC(O)R^a、-C(O)NR^cR^d、-NR^cC(O)OR^b、-NR^cC(O)NR^cR^d、-OC(O)N^cR^d、-SO₂NR^cR^d、-NR^cSO₂NR^cR^d、-NR^cSO₂R^b、-NR^cSO₂CF₃、-SO₂CF₃、-S(O)₂R^b、-O(CH₂)_nCO₂R^a、-SO₂NHCOR^b、-CONHSO₂R^b、0~2個のR^eで置換されたC_{1~6}アルキル、0~2個のR^eで置換されたC_{2~4}アルケニル、0~2個のR^eで置換されたC_{2~4}アルキニル、-O(CO₂R^aで置換されたベンジル)、またはテトラゾリルであるか；

あるいは、R²とR³が、一体となって5~7員の炭素環、または炭素原子、ならびにN、NR^c、O、およびS(O)_pから選択される0~2個のヘテロ原子を含むヘテロ環を形成してもよく；前記炭素環およびヘテロ環は、0~3個のR^gで置換されており；

R⁵が、H、-CH₂CH₂OR^a、-CH₂CH₂CH₂CH₂OR^a、-CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂NHCOR^b、-CH₂CH₂

$\text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C H}_2 \text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C O N H S O}_2 \text{R}^b$ 、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^f で置換された $-(\text{C H}_2)_s - \text{C}_{3 \sim 6}$ 炭素環、または $-(\text{C H}_2)_s - 5 \sim 6$ 員のヘテロ環であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 N R^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されており；

R^6 が、 H 、 $-\text{C H}_2 \text{O R}^a$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C H}_2 \text{O R}^a$ 、 C N 、 $-\text{C O}_2 \text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C O}_2 \text{R}^a$ 、 $-\text{C H}_2 \text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C O N H S O}_2 \text{R}^b$ 、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^f で置換された $-(\text{C H}_2)_s - \text{C}_{3 \sim 6}$ 炭素環、または $-(\text{C H}_2)_s - 5 \sim 6$ 員のヘテロ環であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 N R^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されているか；

あるいは、 R^5 と R^6 が、一緒になって、 $0 \sim 1$ 個の R^f で置換されていてもよい $2 \sim 5$ 員のアルキレン鎖を形成することができ；

R^7 が、 H または $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキルであるか；

あるいは、 R^6 と R^7 が、一緒になって、 $3 \sim 7$ 員の炭素環またはヘテロ環を形成することができ；前記炭素環は $0 \sim 2$ 個の R^f で置換されていてもよく；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 N R^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されており；

R^9 が、 H 、 F 、 $\text{C}1$ 、 Br 、 I 、 $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキル、または $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルコキシであり；

R^{10} および R^{11} が、各々独立して、 H 、 F 、 $\text{C}1$ 、 Br 、 I 、または $\text{C}_{1 \sim 4}$ アルキルであり；

R^{12} および R^{13} が、各々独立して、 F 、 $\text{C}1$ 、 O R^a 、 S R^b 、 C F_3 、 O C F_3 、 O C H F_2 、 $\text{O C H}_2 \text{F}$ 、 C N 、 NO_2 、 $-\text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{C O}_2 \text{R}^a$ 、 $-\text{N R}^c \text{C}(\text{O}) \text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{N R}^c \text{C}(\text{O}) \text{O R}^b$ 、 $-\text{N R}^c \text{C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{O C}(\text{O}) \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{S O}_2 \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{N R}^c \text{S O}_2 \text{N R}^c \text{R}^d$ 、 $-\text{N R}^c \text{S O}_2 \text{R}^b$ 、 $-\text{N R}^c \text{S O}_2 \text{C F}_3$ 、 $-\text{S O}_2 \text{C F}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^b$ 、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキル、 $0 \sim 2$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2 \sim 4}$ アルキニル、 $0 \sim 2$ 個の R^f で置換された $-(\text{C H}_2)_s - \text{C}_{3 \sim 6}$ 炭素環、 $-(\text{C H}_2)_s - (5 \sim 6$ 員のヘテロ環)、 $-\text{N R}^c - (5 \sim 6$ 員のヘテロ環)、または $-\text{O} - (5 \sim 6$ 員のヘテロ環) であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびに N 、 N R^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含み、かつ $0 \sim 2$ 個の R^g で置換されているか；

あるいは、同一の炭素または 2 つの隣接炭素と結合した任意の 2 つの R^{12} または R^{13} が、一体となって $5 \sim 7$ 員の炭素環、または炭素原子、ならびに N 、 N R^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $0 \sim 3$ 個のヘテロ原子を含むヘテロ環を形成してもよく、前記炭素環またはヘテロ環は、 $0 \sim 3$ 個の R^g で置換されており；並びに

L 中の隣接炭素原子上の 2 つの R^{12} または R^{13} は、2 つの炭素原子間の二重結合で置き換えられてもよい、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

環 A が、式 (I) の環 A 中の C R^1 、 C R^2 、 C R^3 、または C R^4 のうちの 1 つを N で置き換えることによって定義されるフェニルまたはピリジル異性体であり；

環 B が、式 (I) の環 B 中の C R^8 、 C R^9 、 C R^{10} 、または C R^{11} のうちの 1 つを N で置き換えることによって定義されるフェニルまたはピリジル異性体であるが；

ただし、環 A がピリジルである場合、環 B はピリジルではなく；

M が、 $-\text{C O N H} -$ 、 $-\text{S O}_2 \text{N H} -$ 、 $-\text{N H C O} -$ 、または $-\text{N H S O}_2 -$ であり；

M が $-\text{C O N H} -$ である場合、 L は、 $-\text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) -$ 、 $-\text{X C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) -$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{Y} -$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) -$ 、 $-\text{X C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) -$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) \text{X C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13}) -$ 、 $-\text{X C}(\text{R}^{12} \text{R}^{13})$ ；

$R^{12}R^{13})Y$ - 、および - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) Y - から選択され ;
 Mが - $S O_2 N H$ - である場合、Lは、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、および - C ($R^{12}R^{13}$) X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - から選択され ;

Mが - $N H C O$ - である場合、Lは、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、および - C ($R^{12}R^{13}$) X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - から選択され ;

Mが - $N H S O_2$ - である場合、Lは、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、および - C ($R^{12}R^{13}$) X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - から選択され ;

Wが、N H または O であり ; 並びに

R^4 が、H または F である、

請求項 1、請求項 2 または請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

環 A が、フェニルであり ;

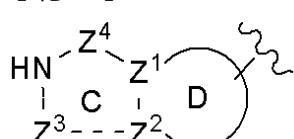
環 B が、フェニルであり ;

Mが、- CONH - または - $N H S O_2$ - であり ;

Mが - CONH - である場合、Lは、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - X C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) Y - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) X C ($R^{12}R^{13}$) - 、および - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) Y - から選択され ;

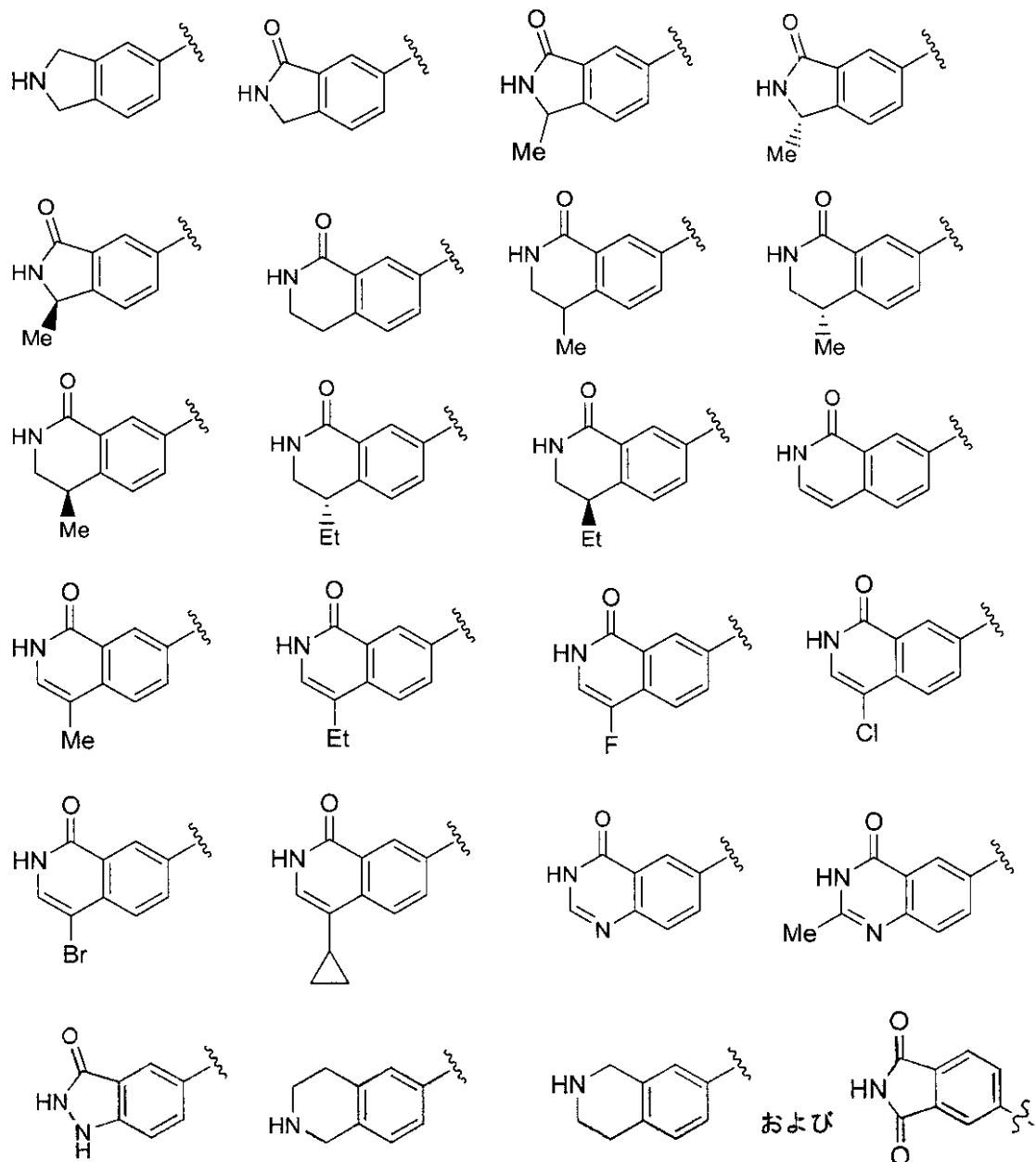
Mが - $N H S O_2$ - である場合、Lは、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、 - C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - 、および - X C ($R^{12}R^{13}$) C ($R^{12}R^{13}$) - から選択され ;

【化 8】



が、以下から選択され :

【化9】



[式中、環Dは、0～1個のFで適宜置換されている]；

Wが、NHであり；

R¹が、H、C₁～₆アルキル、メチル、エチル、1-ヒドロキシエチル、プロピル、イソプロピル、ビニル、アリル、2-プロペニル、エチニル、1-プロピニル、メトキシ、エトキシ、シクロプロピル、シクロブチル、またはシクロペンチルであり；

R²が、H、F、C₁～₆アルキル、0～2個のR[°]で置換されたC₁～₆アルキル、0～2個のR[°]で置換されたC₂～₄アルケニル、0～2個のR[°]で置換されたC₂～₄アルキニル、または-O-（5～6員のヘテロ環）であり；前記ヘテロ環は、炭素原子、ならびにN、NR^c、O、およびS(O)_pから選択される1～3個のヘテロ原子を含み、かつ0～2個のR^gで置換されており；

R³が、H、F、C₁～₆アルキル、OR^a、-O(CH₂)_nCO₂R^a、0～2個のR[°]で置換されたC₁～₆アルキル、0～2個のR[°]で置換されたC₂～₄アルケニル、0～2個のR[°]で置換されたC₂～₄アルキニル、または-O(CO₂R^aで置換されたベンジル）であり；

R⁴が、Hであり；R⁵が、H、C₁～₄アルキル、-CH₂CH₂OR^a、-CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、-CH₂

CO_2R^a 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}\text{O}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NRC}\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、または $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ であり；

R^6 が、 H 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 CN 、 $\text{C}_{1\sim 4}$ アルキル、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、または $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ であり；

R^7 が、 H であり；

R^8 が、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 CH_2F 、 CHF_2 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{2\sim 6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2\sim 6}$ アルキニル、 $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}^i$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{SR}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{CONR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{O}(\text{CO}_2\text{R}^a)$ で置換されたベンジル)、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ フルオロアルキル、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2\sim 4}$ アルケニル、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2\sim 4}$ アルキニル、 $0\sim 3$ 個の R^{f1} で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_{3\sim 6}$ 炭素環；炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1\sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-(\text{CH}_2)_n-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0\sim 3$ 個の R^{g1} で置換されているか、または炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1\sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-\text{O}-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0\sim 3$ 個の R^{g1} で置換されており；並びに

R^9 、 R^{10} および R^{11} が、各々独立して、 H 、 F 、または Cl である、
請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

環Aが、フェニルであり；

環Bが、フェニルであり；

Mが、 $-\text{CONH}-$ であり；

Lが、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{X}\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、および $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ から選択され；

Wが、 NH であり；

R^1 が、 H 、 Cl 、 Br 、メチル、エチル、ビニル、 2-プロペニル 、アリル、エチニル、 1-プロピニル 、メトキシ、エトキシ、またはシクロプロピルであり；

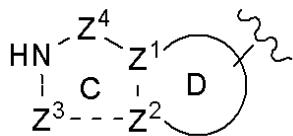
R^8 が、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}^i$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{SR}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 CONR^cR^d 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{O}(\text{CO}_2\text{R}^a)$ で置換されたベンジル)、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ フルオロアルキル、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2\sim 4}$ アルケニル、 $0\sim 3$ 個の R^e で置換された $\text{C}_{2\sim 4}$ アルキニル、 $0\sim 3$ 個の R^{f1} で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_{3\sim 6}$ 炭素環；炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1\sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-(\text{CH}_2)_n-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0\sim 3$ 個の R^{g1} で置換されているか、または炭素原子、ならびに N 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ から選択される $1\sim 4$ 個のヘテロ原子を含む $-\text{O}-5\sim 10$ 員のヘテロ環であり、前記フェニルおよびヘテロ環は、 $0\sim 3$ 個の R^{g1} で置換されている、

請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

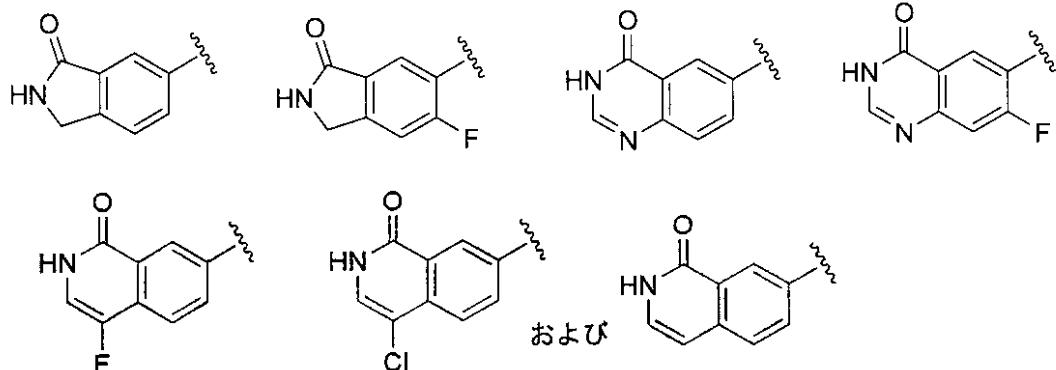
Lが、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{NR}^{16}\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{NR}^{16}$ または $-\text{OC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ から選択され；

【化10】



が、以下から選択され：

【化11】



;

Yが、OまたはNMeであり；

R¹が、H、C1、Br、メチル、エチル、ビニル、2-プロペニル、エチニル、メトキシ、またはエトキシであり；

R³が、H、F、C1、Me、OCH₂CO₂Hであり；

R⁵が、H、C_{1~4}アルキル、-CH₂CH₂OR^a、-CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂C_O₂R^a、-CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂NHC_O₂R^b、-CH₂NR^cR^d、-CH₂C(O)NR^cR^d、または-CH₂CH₂C(O)NR^cR^dであり；

R⁶が、H、C_{1~4}アルキル、-CO₂R^a、-C(O)NR^cR^d、-CH₂CO₂R^a、または-CH₂C(O)NR^cR^dであり；

R¹²およびR¹³が、各々独立して、H、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、t-ブチル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、シクロプロポキシ、OH、CH₂OH、OCH₂OME、またはNHCO₂Bnであるが、ただし、L中のR¹²およびR¹³の2つ以下はH以外であり；並びに

R¹⁶が、H、C_{1~4}アルキル、-C(O)R^a、-C(O)NR^cR^d、-C(O)OR^b、-CH₂C(O)OR^b、または-S(O)₂R^bである、

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

Lが、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)CH₂-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)O-、-C(R¹²R¹³)NR¹⁶C(R¹²R¹³)-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)NH-、-C(R¹²R¹³)C(R¹²R¹³)NMe-、-C(R¹²R¹³)NHCH₂-、-C(R¹²R¹³)CH₂-、-CH₂NMe-、または-OCH₂-であり；

R¹が、H、C1、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R²が、H、C1、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R³が、HまたはFであり；

R⁵が、H、C_{1~4}アルキル、-CH₂CH₂OR^a、-CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂C_O₂R^a、-CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、-CH₂CH₂NHC_O₂R^b、-CH₂CH₂NR^cR^d、-CH₂C(O)NR^cR^d、または-CH₂CH₂C(O)NR^cR^dであり；

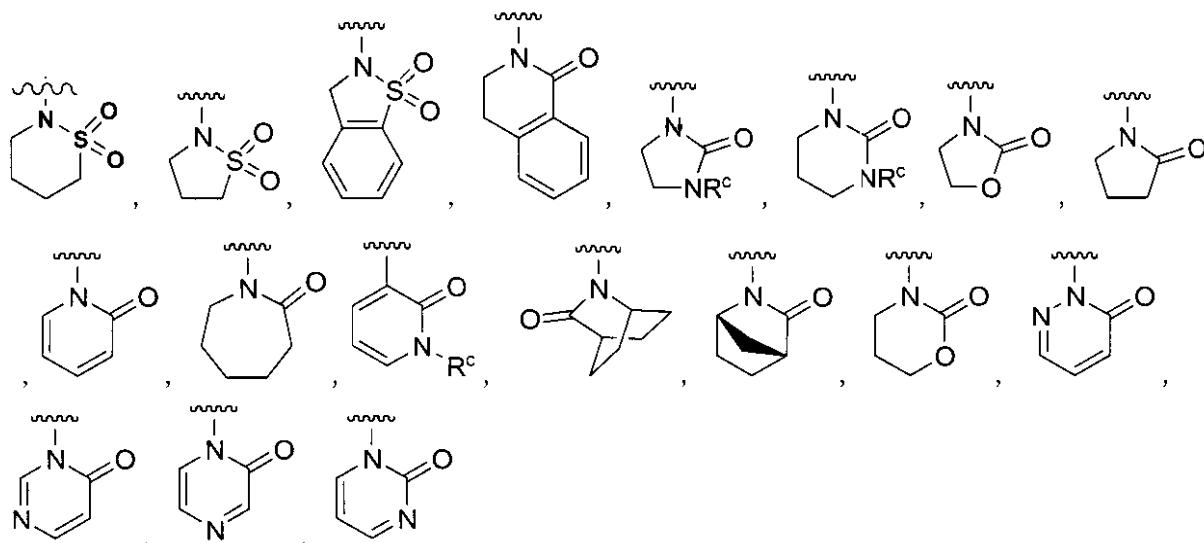
R⁶が、H、メチル、エチル、-CO₂Hまたは-CH₂CO₂Hであり；

R⁷が、Hであり；並びに

R⁸が、H、F、C1、Br、CN、0~3個のReで置換されたC_{1~6}アルキル、Oⁱ、-CH₂ORⁱ、-CONR^cR^d、-SO₂R^j、-SO₂NR^cR^d、フェニル、O-フ

エニル、以下から選択される 5 ~ 10 品のヘテロ環：モルホリニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピリジル、ジヒドロイソキノリニル。

【化 1 2】



、または以下から選択される 0 - 5 ~ 10 品のヘテロ環：イミダゾリル、オキサジアゾリル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリジニル、ピロリル、テトラヒドロフラニル、チアジアゾリル、チアゾリル、チオフェニル、もしくはトリアゾリルであり、前記フェニルおよびヘテロ環は、0 ~ 2 個の R⁹で置換されており；並びに

R⁹、R¹⁰およびR¹¹が、各々独立して、H、F、またはC1である、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

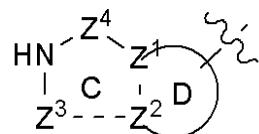
環 A が、フェニルであり；

環 B が、フェニルであり；

Mが、 ---CONH--- であり：

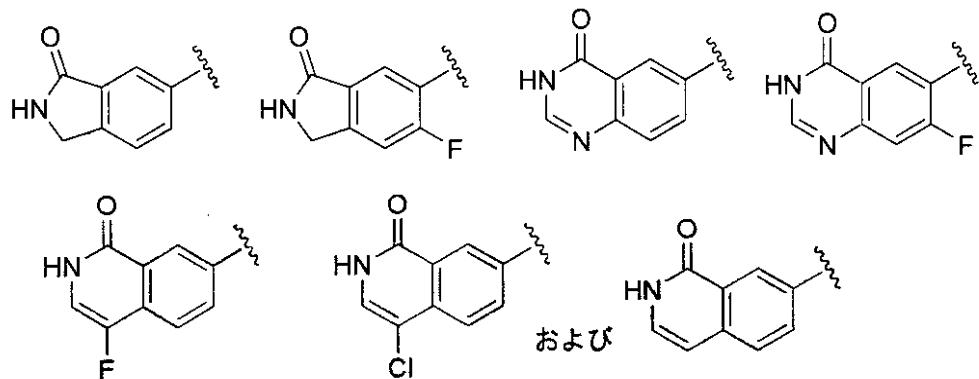
Lが、-CH₂CH₂CH₂-、-CH(Me)CH₂CH₂-、-CH₂CH₂O-、-CHFCH₂O-、-CH(Me)CH₂O-、-CH(Et)CH₂O-、-、-CH(OH)CH₂O-、-CH(OMe)CH₂O-、-CH(OEt)CH₂O-、-CH(CH₂OH)CH₂O-、-CH(OCH₂OMe)CH₂O-、-CH(NHCO₂Bn)CH₂O-、-CH(Me)CH₂NH-、-CH(Me)CH₂N(Me)-、-CH₂N(Me)-、-CH₂NHCH₂-、-CH₂N(Me)CH₂-、-CH₂N(Et)CH₂-、-CH₂N(Pr)CH₂-、-CH₂N(i-Pr)CH₂-、-CH₂N(COMe)CH₂-、-CH₂N(COEt)CH₂-、-CH₂N(CO(i-Pr))CH₂-、-CH₂N(CO₂Me)CH₂-、-CH₂N(CH₂CO₂H)CH₂-、-CH(Me)NHCH₂-、-CH(Me)N(COMe)CH₂-、-CH(Me)N(CO₂Me)CH₂-、または-CH(Me)N(CO₂Bn)CH₂-であり；

【化 1 3】



が、以下から選択され：

【化14】



R¹が、H、C1、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R²が、H、C1、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R³が、HまたはFであり；

R⁴が、Hであり；

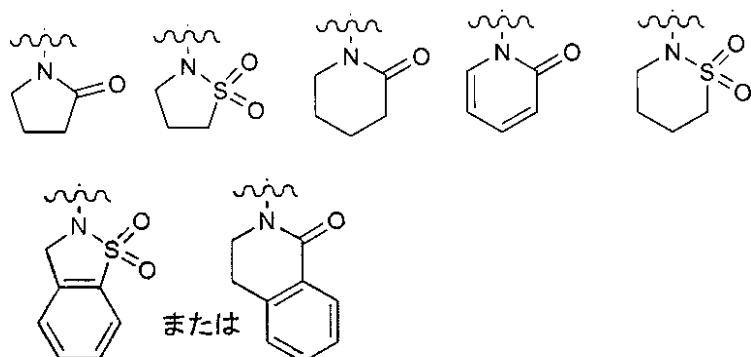
R⁵が、H、メチル、エチル、プロピル、-CH₂CO₂H、-CH₂CH₂CO₂H、-CH₂CH₂CO₂Et、-CH₂CH₂CH₂CO₂H、-CH₂CH₂NHCO₂Me、-CH₂CH₂NHCO₂(t-Bu)、-CH₂CH₂OH、-CH₂CH₂OMe、-CH₂CH₂NH₂、-CH₂CH₂CONH₂、または-CH₂CH₂CONHMeであり；

R⁶が、H、メチル、エチル、-CO₂Hまたは-CH₂CO₂Hであり；

R⁷が、Hであり；

R⁸が、H、F、C1、Br、CN、OH、-CH₂OH、-CH₂OMe、-OCF₂H、-OCF₃、-OCF₂CF₂H、CO₂H、-SO₂Et、-SO₂(i-Pr)、-SO₂-シクロプロピル、フェニル、2-OCF₃-フェニル、3-CO₂H-フェニル、3-CO₂Me-フェニル、2,6-ジF-フェニル、2-F-5-CO₂H-フェニル、1H-ピラゾール-1-イル、1-Me-1H-ピラゾール-4-イル、1-Me-1H-ピラゾール-5-イル、1-Et-1H-ピラゾール-5-イル、オキサゾール-2-イル、3,5-ジMe-イソオキサゾール-4-イル、2-チアゾリル、1H-イミダゾール-1-イル、1-Me-1H-イミダゾール-2-イル、1,2-ジメチル-1H-イミダゾール-5-イル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、

【化15】



であり；並びに

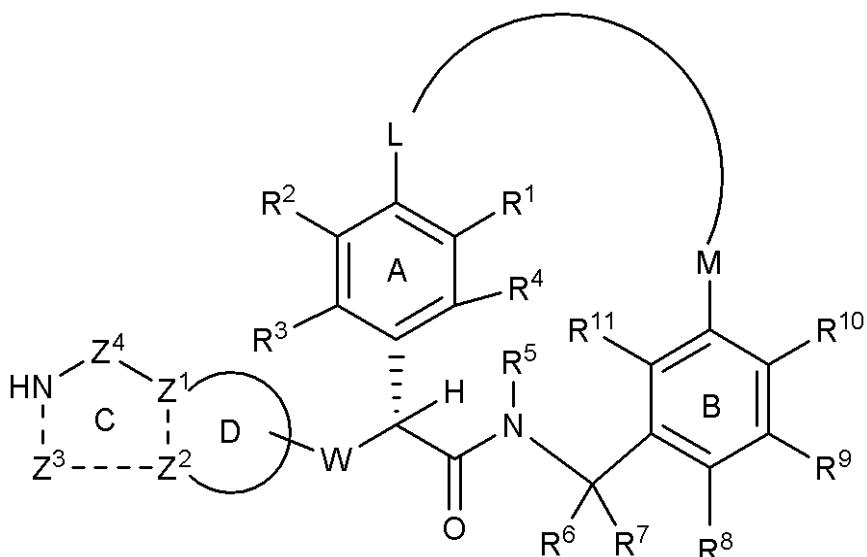
R⁹、R¹⁰、およびR¹¹が、Hである、

請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

式(Ia)：

【化16】



(I a)

を有する化合物またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物である、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

1つもしくは複数の例示した実施例またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

医薬上許容される担体および請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物を含む医薬組成物。

【請求項13】

請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物を含む、血栓塞栓性障害の治療剤。

【請求項14】

血栓塞栓性障害が、動脈心血管血栓塞栓性障害、静脈心血管血栓塞栓性障害、および心室または末梢循環内の血栓塞栓性障害からなる群から選択される、請求項13に記載の治療剤。

【請求項15】

血栓塞栓性障害が、不安定狭心症、急性冠血管症候群、心房細動、心筋梗塞、一過性虚血性発作、脳卒中、アテローム性動脈硬化症、末梢動脈閉塞性疾患、静脈血栓症、深部静脈血栓症、血栓性静脈炎、動脈塞栓症、冠動脈血栓症、大脳動脈血栓症、大脳塞栓症、腎臓塞栓症、肺塞栓症、および血液が血栓症を促進する人工表面に露出される医療用移植片、装置、または手順から生じる血栓症から選択される、請求項13に記載の治療剤。

【請求項16】

請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物、またはその立体異性体、互変異性体、医薬上許容される塩、もしくは溶媒和物を含む、血栓塞栓性障害の一次予防剤。

【請求項17】

血栓塞栓性障害が、動脈心血管血栓塞栓性障害、静脈心血管血栓塞栓性障害、および心室または末梢循環内の血栓塞栓性障害からなる群から選択される、請求項16に記載の予防剤。

【請求項18】

血栓塞栓性障害が、不安定狭心症、急性冠血管症候群、心房細動、心筋梗塞、虚血性突然死、一過性虚血性発作、脳卒中、アテローム性動脈硬化症、末梢動脈閉塞性疾患、静脈血栓症、深部静脈血栓症、血栓性静脈炎、動脈塞栓症、冠動脈血栓症、大脳動脈血栓症、

大脳塞栓症、腎臓塞栓症、肺塞栓症、および血液が血栓症を促進する人工表面に露出される医療用移植片、装置、または手順から生じる血栓症から選択される、請求項 1 6 に記載の予防剤。