

【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 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4035 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

C 0 7 D 453/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 38/55 (2006.01)

C 0 7 K 5/037 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/4035

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/517

C 0 7 D 498/04 1 1 6

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 37/02

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/541

C 0 7 D 453/06

A 6 1 K 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

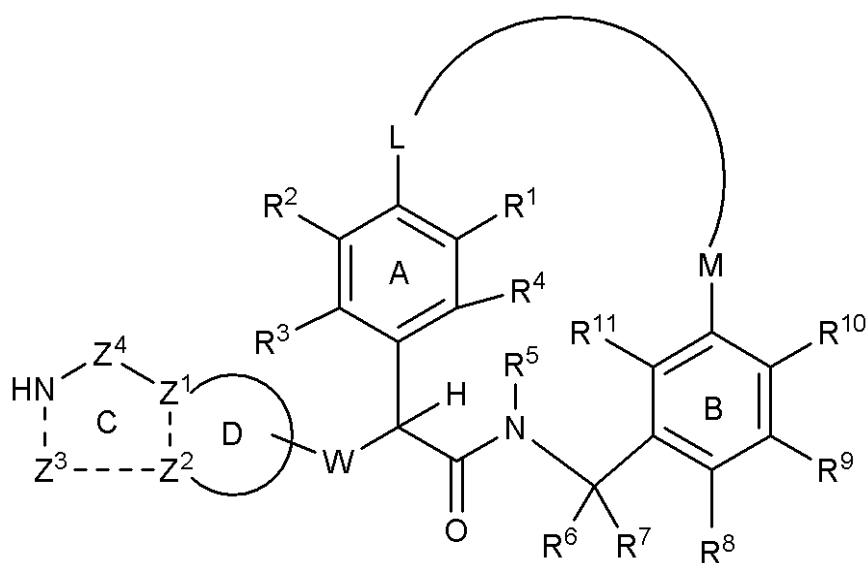
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

【式中、

環 A は、式 (I) の環 A 中の CR^1 、 CR^2 、 CR^3 、または CR^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 は、式 (I) の環 B 中の CR^8 、 CR^9 、 CR^{10} 、または CR^{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；

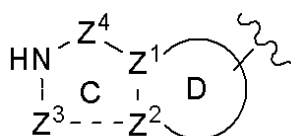
ただし、 Z^1 がNである場合、 Z^2 はCであるか；または Z^2 がNである場合、 Z^1 はCであり；

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、 $-CR^{18}R^{18}-$ 、 $-NR^{19}-$ 、 $-O-$ 、 $S(O)_p-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-CR^{18}=CR^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}=N-$ 、 $-CR^{18}R^{18}NR^{19}-$ 、 $-NR^{19}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-C(O)CR^{18}R^{18}-$ 、 $-C(O)NR^{19}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}C(O)-$ 、 $-C(O)C(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}SO_2-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}=CR^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}=CR^{18}-$ 、 $-N=CR^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}=N-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}O-$ 、 $-NR^{19}CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}NR^{19}-$ 、 $-C(O)CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}C(O)CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}C(O)-$ 、 $-CR^{18}=CR^{18}C(O)-$ 、 $-C(O)CR^{18}=CR^{18}-$ 、 $-N=CR^{18}C(O)-$ 、 $-C(O)CR^{18}=N-$ 、 $-C(O)CR^{18}R^{18}O-$ 、 $-NR^{19}C(O)CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}C(O)NR^{19}-$ 、 $-NR^{19}CR^{18}R^{18}C(O)-$ 、 $-C(O)CR^{18}R^{18}NR^{19}-$ 、 $-C(O)NR^{19}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-SO_2CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}SO_2CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}CR^{18}R^{18}SO_2-$ 、 $-CR^{18}=CR^{18}SO_2-$ 、 $-SO_2CR^{18}=CR^{18}-$ 、 $-N=CR^{18}SO_2-$ 、 $-SO_2CR^{18}=N-$ 、 $-SO_2CR^{18}R^{18}O-$ 、 $-NR^{19}SO_2CR^{18}R^{18}-$ 、 $-CR^{18}R^{18}SO_2NR^{19}-$ 、 $-NR^{19}CR^{18}R^{18}SO_2-$ 、 $-SO_2CR^{18}R^{18}NR^{19}-$ 、または $-SO_2NR^{19}CR^{18}R^{18}-$ であるが；

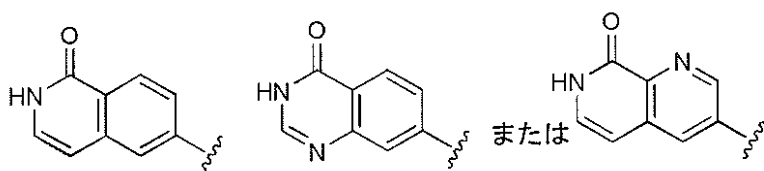
ただし、

【化2】



は、

【化3】



以外であり；

Z^4 は、 $C(O)$ 、 $CR^{20}R^{20}$ または SO_2 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 R^{21} 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 R^{21} 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、 $-CONH-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-NHCO-$ 、または $-NHSO_2-$ であり；

Mが $-CONH-$ である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})Y-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})XC(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})Y-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})Y-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})$

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

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

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

M が $-NH SO_2-$ である場合、L は、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 、および $-C(R^{12}R^{13})XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13}) -$ 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、Cl、Br、I、0 ~ 1 個の OH で置換された $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ フルオロアルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、または $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり；

R^2 は、H、F、Cl、Br、I、 $-(CH_2)_sOR^a$ 、 $-(CH_2)_sSR^b$ 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_sOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 $-(CH_2)_sNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sS(O)_2R^b$ 、0 ~ 2 個の R^e で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ フルオロアルキル、0 ~ 2 個の R^e で置換された $C_2 \sim 4$ アルケニル、0 ~ 2 個の R^e で置換された $C_2 \sim 4$ アルキニル、0 ~ 2 個の R^f で置換された $-(CH_2)_sC_3 \sim 6$ 炭素環、 $-(CH_2)_s-(5 \sim 6$ 員のヘテロ環)、 $-(CH_2)_s-NR^c-(5 \sim 6$ 員のヘテロ環)、または $-(CH_2)_s-O-(5 \sim 6$ 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、 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、Cl、Br、I、 $-(CH_2)_sOR^a$ 、 $-(CH_2)_sSR^b$ 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCF_3$ 、 $-(CH_2)_sOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_sOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 $-(CH_2)_sNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_sNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_sS(O)_2R^b$ 、 $-O(CH_2)_nCO_2R^a$

、 $-(CH_2)_sSO_2NHCOR^b$ 、 $-(CH_2)_sCONHSO_2R^b$ 、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、 $-O(CO_2R^a$ で置換されたベンジル)、 $-(CH_2)_s$ テトラゾリル、0～2個の R^{f1} で置換された $-(CH_2)_s-C_{3-6}$ 炭素環、 $-(CH_2)_s-(5\sim6$ 員のヘテロ環)、 $-(CH_2)_s-NR^c-(5\sim6$ 員のヘテロ環)、または $-(CH_2)_s-O-(5\sim6$ 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、 R^2 と R^3 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；

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

R^5 は、H、 $-(CH_2)_qOR^a$ 、 $-(CH_2)_qSR^b$ 、 $-(CH_2)_rCF_3$ 、 $-(CH_2)_qOCF_3$ 、 $-(CH_2)_qOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_qOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_qCN$ 、 $-(CH_2)_qNO_2$ 、 $-(CH_2)_qNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_qNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_qNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_qOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_qNR^cC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_qOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_qSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_qNR^cSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_qNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_qNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_qSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_qS(O)_2R^b$ 、 $-(CH_2)_qSO_2NHCOR^b$ 、 $-(CH_2)_sCONHSO_2R^b$ 、 $-O(CO_2R^a$ で置換されたベンジル)、 $-(CH_2)_s$ 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 $-(CH_2)_s-C_{3-6}$ 炭素環、または $-(CH_2)_s-5\sim6$ 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^6 は、H、 $-(CH_2)_rOR^a$ 、 $-(CH_2)_rSR^b$ 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_rOCF_3$ 、 $-(CH_2)_rOCHF_2$ 、 $-(CH_2)_rOCH_2F$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 $-(CH_2)_rNR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_rNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_rNR^cC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_rOC(O)OR^b$ 、 $-(CH_2)_rNR^cC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_rOC(O)NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_rSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_rNR^cSO_2NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_rNR^cSO_2R^b$ 、 $-(CH_2)_rNR^cSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_rSO_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_rS(O)_2R^b$ 、 $-(CH_2)_rSO_2NHCOR^b$ 、 $-(CH_2)_sCONHSO_2R^b$ 、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^{f1} で置換された $-(CH_2)_s-C_{3-6}$ 炭素環、または $-(CH_2)_s-5\sim6$ 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、 R^5 と R^6 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；

R^7 は、Hまたは C_{1-6} アルキルであるか；

あるいは、 R^6 と R^7 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；

R^8 は、H、F、Cl、Br、CN、 CH_2F 、 CHF_2 、 $-(CH_2)_sCF_3$ 、 $-(CH_2)_sCN$ 、 $-(CH_2)_sNO_2$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 $-(CH_2)_n-OR^i$ 、 $-(CH_2)_n-SR^j$ 、 $-(CH_2)_n-NR^cR^d$ 、 $-(CH_2)_sC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sCO_2R^a$ 、 $-(CH_2)_sNR^cC(O)R^a$ 、 $-(CH_2)_sC$

ONR^cR^d 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{OC}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{OC}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{NHCO}\text{R}^b$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{CONHSO}_2\text{R}^j$ 、 $-\text{O}(\text{CO}_2\text{R}^a)$ で置換されたベンジル)、 $-(\text{CH}_2)_s$ テトラゾリル、0～3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、0～3個の R^e で置換された C_{2-4} アルケニル、0～3個の R^e で置換された C_{2-4} アルキニル、0～3個の R^{f1} で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_{3-6}$ 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1～4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、0～3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1～4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、0～3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、 C_{1-4} アルキル、または C_{1-4} 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 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、CN、 NO_2 、 $-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^b$ 、0～2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 $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_{3-6}$ 炭素環、 $-(\text{CH}_2)_s-(5\sim 6\text{員のヘテロ環})$ 、 $-\text{NR}^c-(5\sim 6\text{員のヘテロ環})$ 、または $-\text{O}-(5\sim 6\text{員のヘテロ環})$ 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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、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、一緒になって、3～7員の炭素環、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0～3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、0～3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いてもよい、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いてもよく；

R^{16} は、各々独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} 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 $-(\text{CH}_2)_s-(5\sim 6\text{員のヘテロ環})$ であり；前記アルキルまたはシクロアルキルは、0～2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、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1～3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^{16a} は、各々独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} 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5～6員のヘテロ環であり；前記アルキルまたはシクロアルキルは、0～2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、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1～3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^{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 、 $OCHF_2$ 、 CH_2F 、CN、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、または $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり；

R^{19} は、各々独立して、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、または $C_2 \sim 4$ 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 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、0～2個の R^e で置換された $C_2 \sim 4$ アルケニル、0～2個の R^e で置換された $C_2 \sim 4$ アルキニル、または $-(CH_2)_5-$ （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 、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、または $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり；

R^a は、各々独立して、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ 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、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ 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、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 3$ アルコキシであり；

R^f は、各々独立して、F、Cl、Br、 CF_3 、OH、 $C_1 \sim 3$ アルキル、または $C_1 \sim 3$ 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、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 3$ フルオロアルキル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシまたは $C_1 \sim 3$ 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 $C_1 \sim 3$ アルキルであり；

R^i は、各々独立して、H、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ 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、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 3$ 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；

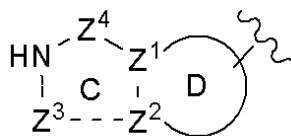
rは、各々、1、2、または3から選択され；並びに

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。

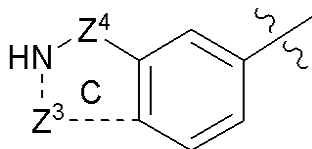
【請求項 2】

【化 4】



が、

【化 5】

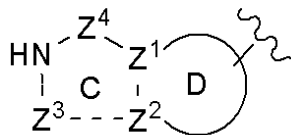


であり；

フェニル環が 0 ~ 3 個の R^{21} で置換されている、
請求項 1 に記載の化合物。

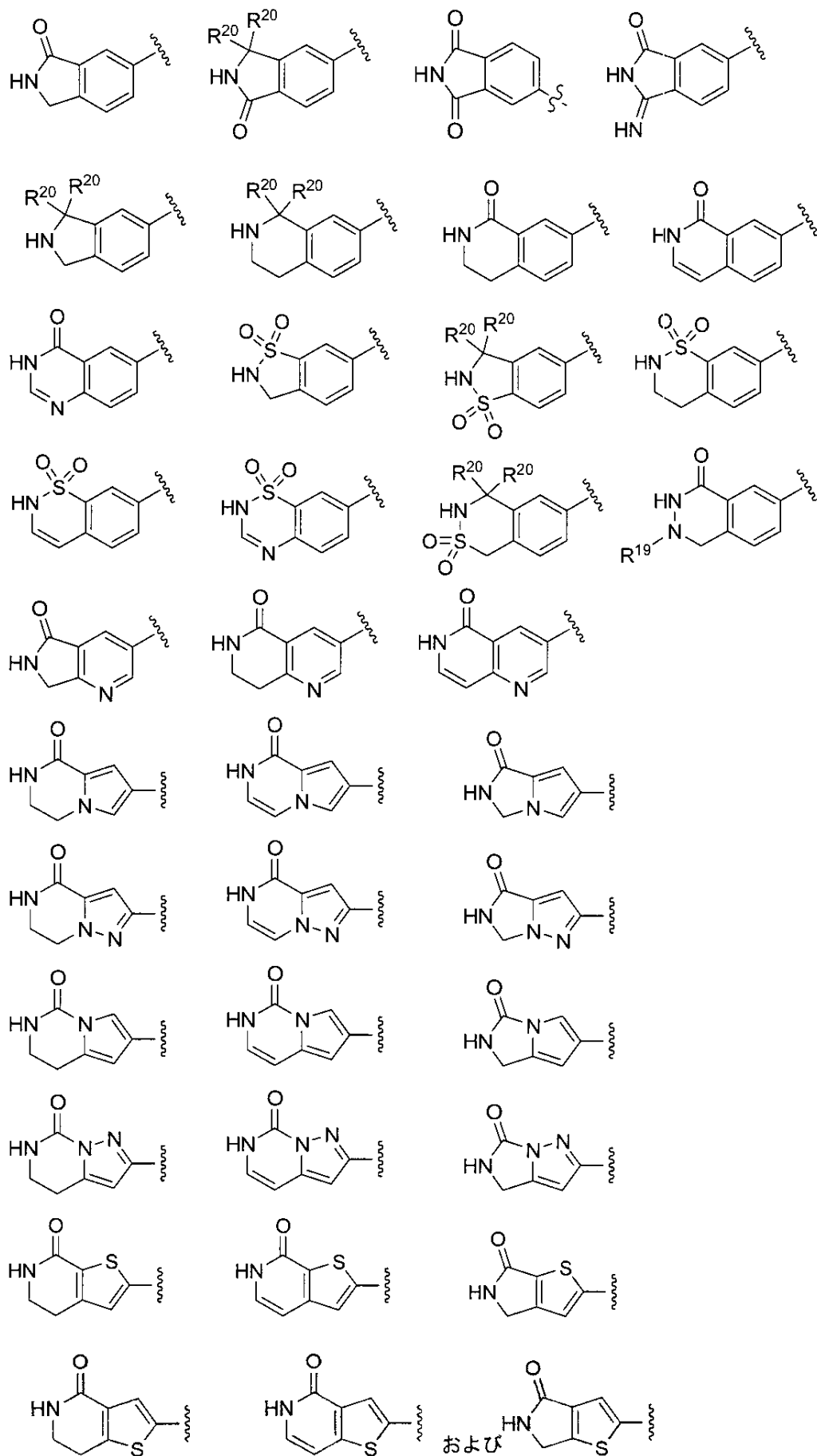
【請求項 3】

【化 6】



が、以下から選択され：

【化 7】



環 C が、0 ~ 2 個の R^{18} で置換されており；環 D が、0 ~ 2 個の R^{21} で置換されており

;

Mが、 $-\text{CONH}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}-$ 、 $-\text{NHCO}-$ 、または $-\text{NHSO}_2-$ であり；

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

Mが $-\text{SO}_2\text{NH}-$ である場合、Lは、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、および $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ から選択され；

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

Mが $-\text{NHSO}_2-$ である場合、Lは、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、および $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ から選択され；

Xが、O、S、または NR^{16} であり；

Wが、NHまたはOであり；

R^2 が、H、F、Cl、Br、I、 OR^a 、 SR^b 、 CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、CN、 NO_2 、 $-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^b$ 、0～2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、 $-(\text{CH}_2)_s-$ （5～6員のヘテロ環）、 $-\text{NR}^c-$ （5～6員のヘテロ環）、または $-\text{O}-$ （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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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 が、H、F、Cl、Br、I、 OR^a 、 SR^b 、 CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、CN、 NO_2 、 $-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^b$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCO}\text{R}^b$ 、 $-\text{CONH}\text{SO}_2\text{R}^b$ 、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、 $-\text{O}(\text{CO}_2\text{R}^a)$ 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、 R^2 と R^3 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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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；

R^5 が、H、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2$

NR^cR^d 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{CONHSO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONHSO}_2\text{R}^b$ 、0～2個の R^e で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～2個の R^f で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_3\sim 6$ 炭素環、または $-(\text{CH}_2)_s-5\sim 6$ 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 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ 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^6 が、 H 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}^a$ 、 CN 、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CONHSO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CH}_2\text{CONHSO}_2\text{R}^b$ 、0～2個の R^e で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～2個の R^f で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_3\sim 6$ 炭素環、または $-(\text{CH}_2)_s-5\sim 6$ 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 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ 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 で置換されているか；

あるいは、 R^5 と R^6 が、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；

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、3～7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 $\text{S}(\text{O})_p$ 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^9 が、 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^{10} および R^{11} が、各々独立して、 H 、 F 、 Cl 、 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 、 Cl 、 OR^a 、 SR^b 、 CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 CN 、 NO_2 、 $-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{OR}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^b$ 、0～2個の R^e で置換された $\text{C}_1\sim 6$ アルキル、0～2個の R^e で置換された $\text{C}_2\sim 4$ アルケニル、0～2個の R^e で置換された $\text{C}_2\sim 4$ アルキニル、0～2個の R^f で置換された $-(\text{CH}_2)_s-\text{C}_3\sim 6$ 炭素環、 $-(\text{CH}_2)_s-(5\sim 6$ 員のヘテロ環)、 $-\text{NR}^c-(5\sim 6$ 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 、 NR^c 、 O 、および $\text{S}(\text{O})_p$ 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、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5～7員の炭素環、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0～3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、0～3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いてもよい、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 CR^1 、 CR^2 、 CR^3 、または CR^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 CR^8 、 CR^9 、 CR^{10} 、または CR^{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、 $-\text{CONH}-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}-$ 、 $-\text{NHCO}-$ 、または $-\text{NHSO}_2-$ であり；

M が $-\text{CONH}-$ である場合、 L は、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})$

$R^{12}R^{13})Y-$ 、および $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})Y-$ から選択され；

Mが $-SO_2NH-$ である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、および $-C(R^{12}R^{13})XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ から選択され；

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

Mが $-NH SO_2-$ である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、および $-C(R^{12}R^{13})XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ から選択され；

Wが、NH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；

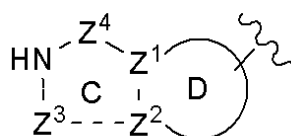
環Bが、フェニルであり；

Mが、 $-CONH-$ または $-NH SO_2-$ であり；

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

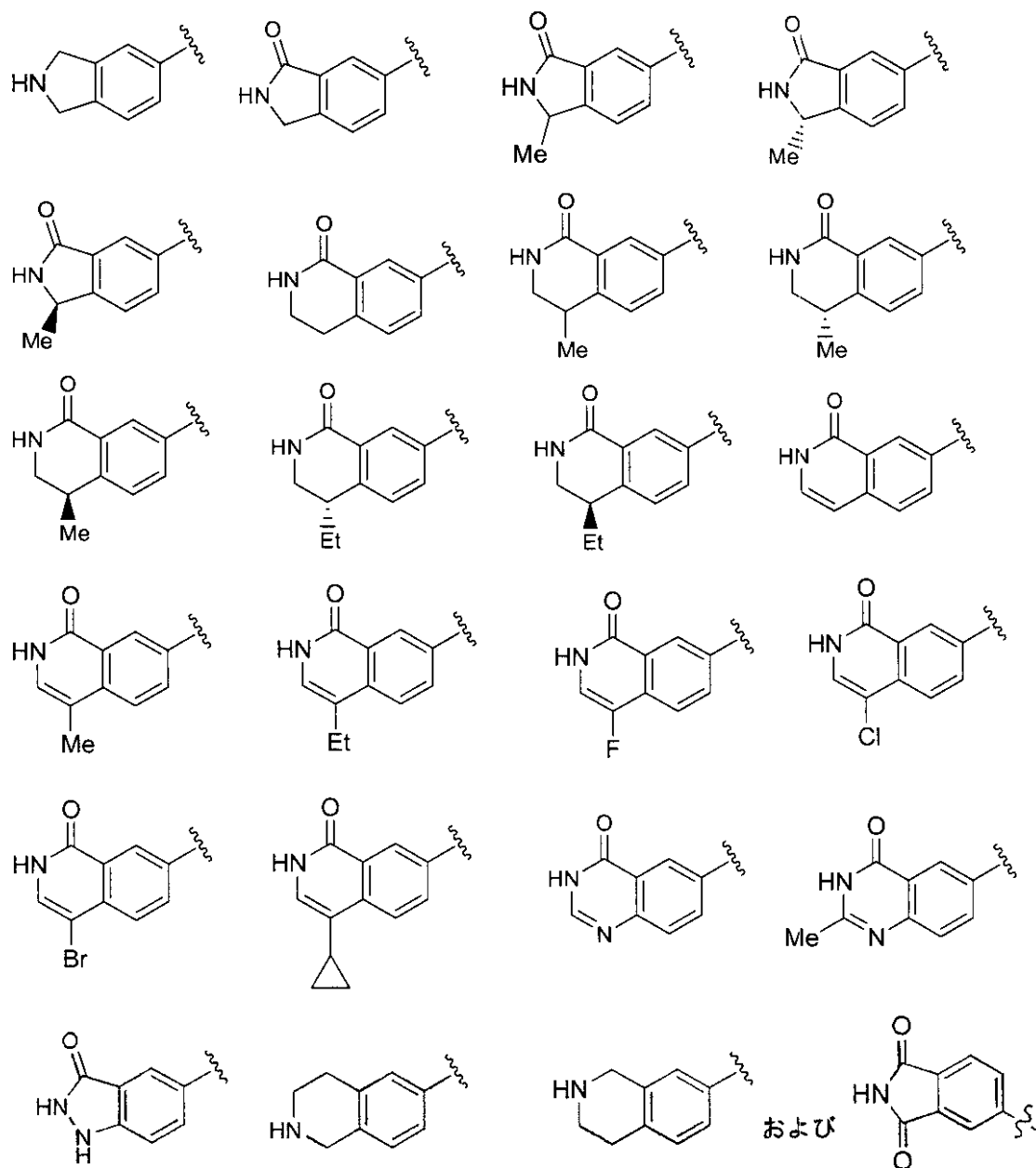
Mが $-NH SO_2-$ である場合、Lは、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、 $-C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ 、および $-XC(R^{12}R^{13})C(R^{12}R^{13})-$ から選択され；

【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、Cl、Br、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 - プロビニル、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、Cl、OR^a、0 ～ 2 個の R^e で置換された C₁ ～ 6 アルキル、0 ～ 2 個の R^e で置換された C₂ ～ 4 アルケニル、0 ～ 2 個の R^e 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、N R^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、OR^a、- O (CH₂)_n CO₂ R^a、0 ～ 2 個の R^e で置換された C₁ ～ 6 アルキル、0 ～ 2 個の R^e で置換された C₂ ～ 4 アルケニル、0 ～ 2 個の R^e で置換された C₂ ～ 4 アルキニル、または - O (CO₂ R^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、- CH₂CH₂CH₂OR^a、- CH₂

CO_2R^a 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^a$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCO}_2\text{R}^b$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NR}^c\text{R}^d$ 、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、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{XC}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、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；

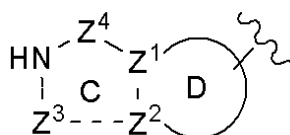
R^8 が、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{OR}^i$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{SR}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $\text{NR}^c\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 CONR^cR^d 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $-(\text{CH}_2)_s\text{SO}_2\text{NR}^c\text{R}^d$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{R}^j$ 、 $\text{NR}^c\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{O}(\text{CO}_2\text{R}^a$ 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】

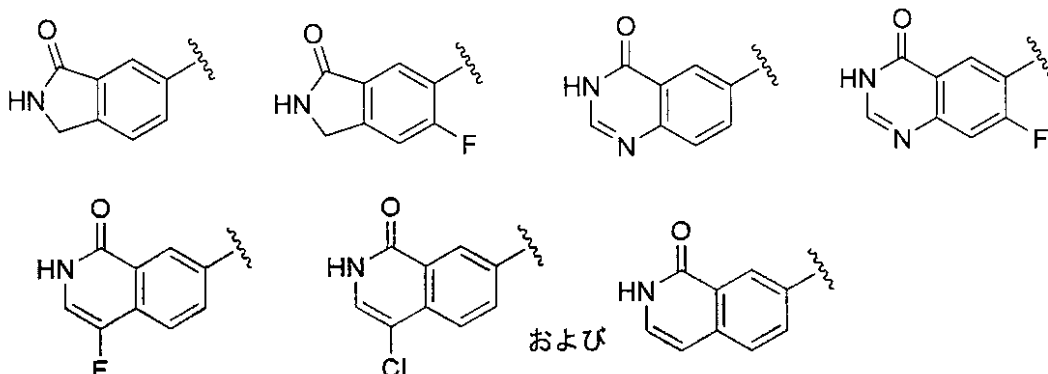
Lが、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{NR}^{16}\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{Y}-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12}\text{R}^{13})\text{NR}^{16}$ 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、Cl、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、Cl、Me、OCH₂CO₂H であり；

R⁵ が、H、C₁ - 4 アルキル、- CH₂CH₂OR^a、- CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂NHCO₂R^b、- CH₂NR^cR^d、- CH₂C(O)NR^cR^d、または - CH₂CH₂C(O)NR^cR^d であり；

R⁶ が、H、C₁ - 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、プロボキシ、イソプロボキシ、シクロプロボキシ、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、C₁ - 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、Cl、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R² が、H、Cl、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、C₁ - 4 アルキル、- CH₂CH₂OR^a、- CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂CH₂CO₂R^a、- CH₂CH₂NHCO₂R^b、- CH₂CH₂NR^cR^d、- CH₂C(O)NR^cR^d、または - CH₂CH₂C(O)NR^cR^d であり；

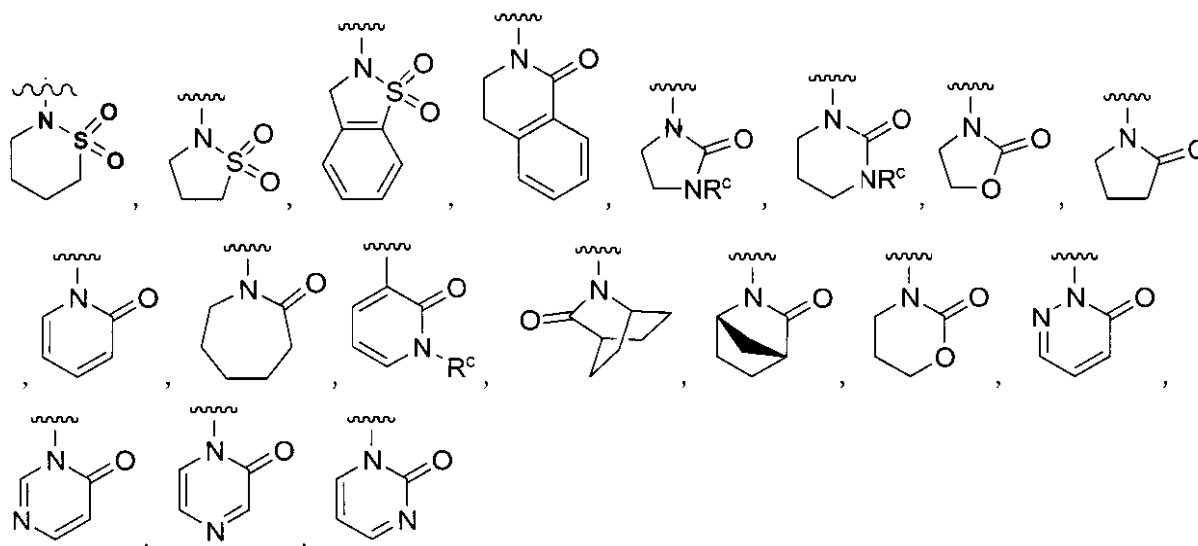
R⁶ が、H、メチル、エチル、- CO₂H または - CH₂CO₂H であり；

R⁷ が、H であり；並びに

R⁸ が、H、F、Cl、Br、CN、0 ~ 3 個の R^e で置換された C₁ - 6 アルキル、ORⁱ、- CH₂ORⁱ、- CONR^cR^d、- SO₂Rⁱ、- SO₂NR^cR^d、フェニル、O - フ

エニル、以下から選択される 5 ~ 10 員のヘテロ環：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 12】



、または以下から選択される 0 - 5 ~ 10 員のヘテロ環：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 Cl 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】

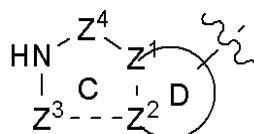
環 A が、フェニルであり；

環 B が、フェニルであり；

M が、- CONH - であり；

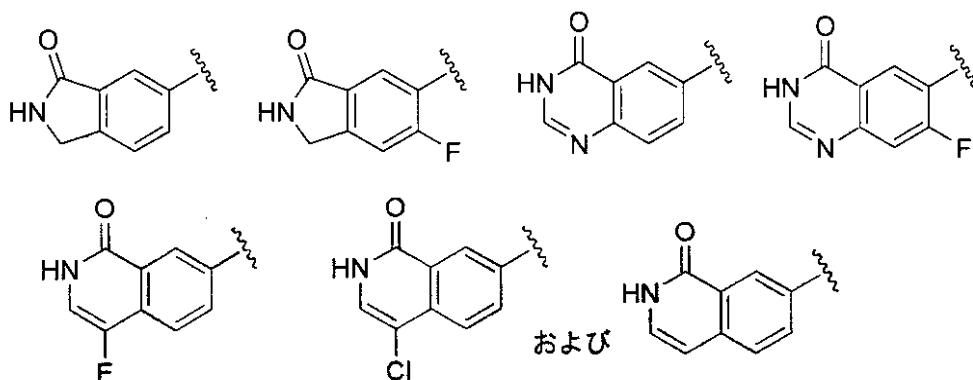
L が、- CH₂CH₂CH₂ -、- CH(Me)CH₂CH₂ -、- CH₂CH₂O -、- CHFCH₂O -、- CH(Me)CH₂O -、- CH(Et)CH₂O -、-、- CH(OH)CH₂O -、- CH(OMe)CH₂O -、- CH(OEt)CH₂O -、- CH(CH₂OH)CH₂O -、- CH(OCH₂OMe)CH₂O -、- CH(NHCO₂Bn)CH₂O -、- CH(Me)CH₂NH -、- CH(Me)CH₂N(Me) -、- CH₂N(Me) -、- CH₂NHCH₂ -、- CH₂N(Me)CH₂ -、- CH₂N(Et)CH₂ -、- CH₂N(Pr)CH₂ -、- 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 13】



が、以下から選択され：

【化 1 4】



;

R^1 が、H、Cl、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R^2 が、H、Cl、Br、メチル、エチル、メトキシ、またはエトキシであり；

R^3 が、HまたはFであり；

R^4 が、Hであり；

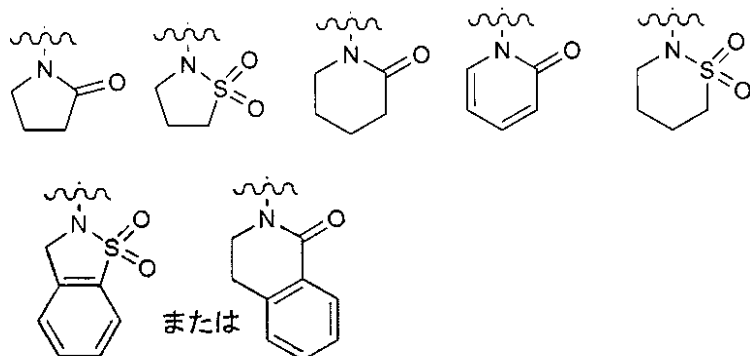
R^5 が、H、メチル、エチル、プロピル、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCO}_2\text{Me}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCO}_2(\text{t-Bu})$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONH}_2$ 、または $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CONHMe}$ であり；

R^6 が、H、メチル、エチル、 $-\text{CO}_2\text{H}$ または $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ であり；

R^7 が、Hであり；

R^8 が、H、F、Cl、Br、CN、OH、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 CO_2H 、 $-\text{SO}_2\text{Et}$ 、 $-\text{SO}_2(\text{i-Pr})$ 、 $-\text{SO}_2$ -シクロプロピル、フェニル、2- OCF_3 -フェニル、3- CO_2H -フェニル、3- CO_2Me -フェニル、2,6-ジF-フェニル、2-F-5- CO_2H -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 1 5】



であり；並びに

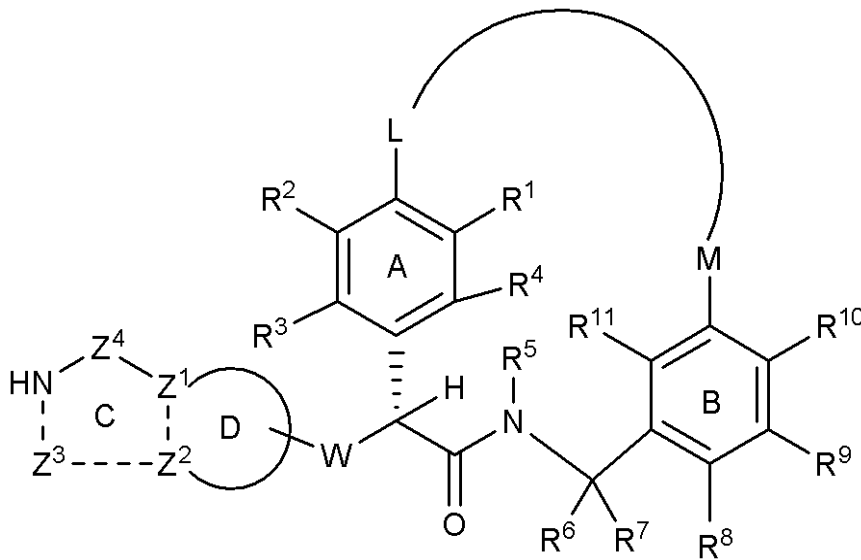
R^9 、 R^{10} 、および R^{11} が、Hである、

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 (I a)：

【化 1 6】



(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 16 に記載の予防剤。