

【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31年1月10日(2019.1.10)

【公表番号】特表2017-538711(P2017-538711A)

【公表日】平成29年12月28日(2017.12.28)

【年通号数】公開・登録公報2017-050

【出願番号】特願2017-531306(P2017-531306)

【国際特許分類】

C 07 D 271/06 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 K 38/16 (2006.01)
A 61 K 31/4985 (2006.01)
A 61 K 31/195 (2006.01)
A 61 K 31/155 (2006.01)
A 61 K 31/351 (2006.01)
A 61 K 31/381 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 3/00 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 K 31/4245 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
C 07 D 417/04 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 31/4725 (2006.01)
C 07 D 263/32 (2006.01)
A 61 K 31/421 (2006.01)
C 07 D 277/30 (2006.01)
A 61 K 31/426 (2006.01)
C 07 D 285/12 (2006.01)
A 61 K 31/433 (2006.01)
C 07 D 285/08 (2006.01)
C 07 D 239/26 (2006.01)
A 61 K 31/505 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
C 07 D 239/28 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
C 07 D 241/08 (2006.01)
A 61 K 31/495 (2006.01)
C 07 D 211/58 (2006.01)
A 61 K 31/445 (2006.01)
C 07 D 211/22 (2006.01)
C 07 D 207/08 (2006.01)
A 61 K 31/402 (2006.01)

C 0 7 D 295/155 (2006.01)
 C 0 7 D 213/55 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4418 (2006.01)
 C 0 7 D 241/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4965 (2006.01)
 C 0 7 D 237/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/50 (2006.01)
 C 0 7 D 253/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/53 (2006.01)
 C 0 7 D 233/64 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4164 (2006.01)
 C 0 7 D 231/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/415 (2006.01)
 C 0 7 D 409/14 (2006.01)
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)
 C 0 7 D 215/20 (2006.01)
 A 6 1 K 31/47 (2006.01)
 C 0 7 D 217/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/472 (2006.01)
 C 0 7 D 239/74 (2006.01)
 A 6 1 K 31/517 (2006.01)
 A 6 1 K 31/551 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 C 0 7 D 487/10 (2006.01)
 C 0 7 D 333/38 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 C 0 7 D 487/08 (2006.01)
 C 0 7 D 309/10 (2006.01)
 C 0 7 K 14/72 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	271/06			
A 6 1 P	43/00	1	2	1
A 6 1 K	38/16			
A 6 1 K	31/4985			
A 6 1 K	31/195			
A 6 1 K	31/155			
A 6 1 K	31/351			
A 6 1 K	31/381			
A 6 1 P	43/00	1	1	1
A 6 1 P	3/10			
A 6 1 P	3/04			
A 6 1 P	25/00	1	0	1
A 6 1 P	3/00			
A 6 1 P	1/16			
A 6 1 K	31/4245			
A 6 1 K	31/454			
C 0 7 D	417/04			
A 6 1 K	31/4709			
A 6 1 K	31/4725			
C 0 7 D	263/32			

A 6 1 K	31/421	
C 0 7 D	277/30	
A 6 1 K	31/426	
C 0 7 D	285/12	A
A 6 1 K	31/433	
C 0 7 D	285/08	
C 0 7 D	239/26	
A 6 1 K	31/505	
C 0 7 D	413/12	
A 6 1 K	31/506	
C 0 7 D	239/28	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	409/12	
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	241/08	
A 6 1 K	31/495	
C 0 7 D	211/58	
A 6 1 K	31/445	
C 0 7 D	211/22	
C 0 7 D	207/08	
A 6 1 K	31/402	
C 0 7 D	295/155	
C 0 7 D	213/55	
A 6 1 K	31/4418	
C 0 7 D	241/12	
A 6 1 K	31/4965	
C 0 7 D	237/08	
A 6 1 K	31/50	
C 0 7 D	253/06	E
A 6 1 K	31/53	
C 0 7 D	233/64	1 0 1
A 6 1 K	31/4164	
C 0 7 D	231/12	A
A 6 1 K	31/415	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	215/20	
A 6 1 K	31/47	
C 0 7 D	217/14	
A 6 1 K	31/472	
C 0 7 D	239/74	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 K	31/5377	
C 0 7 D	487/10	
C 0 7 D	333/38	
A 6 1 K	31/496	
C 0 7 D	487/08	
C 0 7 D	309/10	C S P

C 0 7 K 14/72 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月22日(2018.11.22)

【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

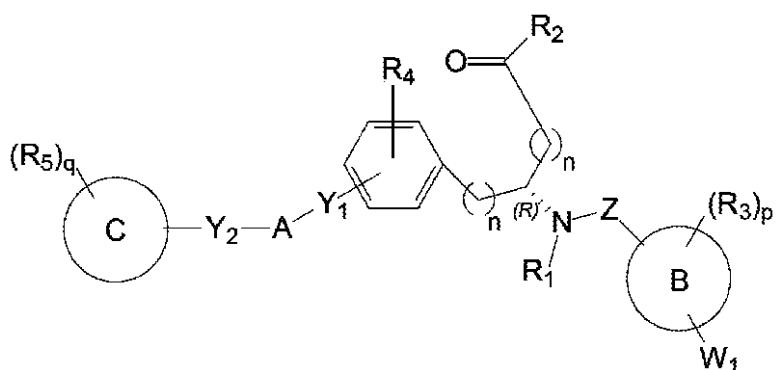
【補正方法】変更

【補正の内容】

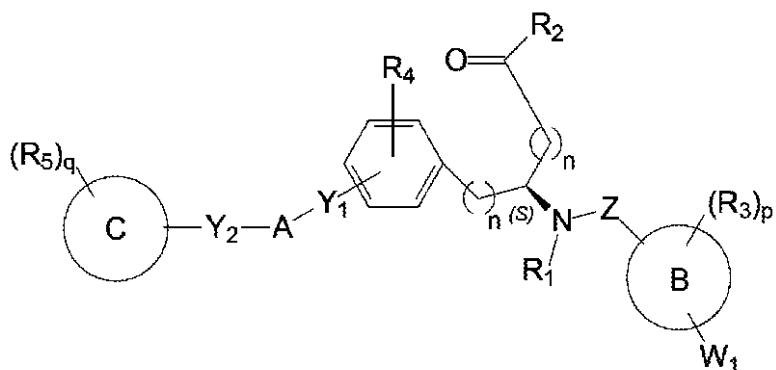
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I-RまたはI-Sあるいはその薬学的に受容可能な異性体、エナンチオマー、ラセミ体、塩、エステル、プロドラッグ、水和物または溶媒和物の構造を有する化合物：
【化487】



I-R



I-S

であって、式I-RおよびI-Sにおいて

Aは、1個、2個または3個のヘテロ原子を有する5員、6員または7員のヘテロシクリルであり、ここで各このようなヘテロ原子は独立して、O、N、およびSから選択され、そしてこのようなヘテロシクリルの任意の環原子は、1個またはそれより多くのR₄で必要に応じて置換され得；

Bは、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキルであり；

Cは、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルであり、そしてCがアリールである場合、AとCとは一緒にになって、Aの該5員、6員または7員のヘテロシクリルと、Cの該アリールとの間に、縮合二環式環系を形成し得；

Y_1 と Y_2 との両方が存在しないか、または Y_1 もしくは Y_2 のうちの一方が - NH - もしくは - O - であり、そして他方の Y_1 もしくは Y_2 が存在せず；

Z は、 - C(O) - または - S(O) ₂ - であり；

各 R_1 は独立して、H または $C_{1~4}$ アルキルであり；

R_2 は、 - OH、 - O - R₈、 - N(R₁) - SO₂ - R₇、 - NR_{4~1}R_{4~2}、 - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - COOR₈、 - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - CO - N(R₁) (R_{4~0})、 - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - N(R₁)C(O)O(R₈)、 - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - N(R₁) (R_{4~0})、 - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - CO - N(R₁) - ヘテロシクリル、または - N(R₁) - (CR_aR_b)_m - ヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルは、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得；

R_3 および R_4 の各々は独立して、H、ハロ、アルキル、R_{3~1} で（1回もしくは複数回）置換されたアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ペルハロアルキル、ハロアルコキシ、ペルハロアルコキシ、アリール、ヘテロシクリル、- OH、- OR₇、- CN、- NO₂、- NR₁R₇、- C(O)R₇、- C(O)NR₁R₇、- NR₁C(O)R₇、- SR₇、- S(O)R₇、- S(O)₂R₇、- OS(O)₂R₇、- S(O)₂NR₁R₇、- NR₁S(O)₂R₇、- (CR_aR_b)_mNR₁R₇、- (CR_aR_b)_mO(CR_aR_b)_mR₇、- (CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mR₇ または - (CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mCOOR₈ であるか；あるいは同じ炭素原子上の任意の2個の R_3 基または R_4 基は一緒になって、オキソを形成し；

各 $R_{3~1}$ は独立して、H、ハロ、ヒドロキシリル、- NR_{4~1}R_{4~2}、またはアルコキシであり；

各 $R_{4~0}$ は独立して、H、R₇、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るアルキルであるか、または $R_{4~0}$ と R_1 とは、これらが結合しているN原子と一緒にになって、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る3員～7員のヘテロシクリルを形成し；

$R_{4~1}$ および $R_{4~2}$ の各々は独立して、R_{4~0}、- (CHR_{4~0})_n - C(O)O - R_{4~0}、- (CHR_{4~0})_n - C(O) - R_{4~0}、- (CH₂)_n - N(R₁) (R₇)、アリールまたはヘテロアリールであり、該アリールまたはヘテロアリールの任意のものは、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るか；あるいは任意の2個の $R_{4~1}$ および $R_{4~2}$ は、これらが結合しているN原子と一緒にになって、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る3員～7員のヘテロシクリルを形成し；

W_1 は存在しないか、または - L₁ - (CR_aR_b)_m - L₁ - R₆ であり；

各 L_1 は独立して、式 I - R または I - S の構造の近位端から遠位端に向かって、存在しないか、- C(O)O - 、- S(O)₂ - 、- S(O) - 、- S - 、- N(R₁) - C(O) - N(R₁) - 、- (R₁) - C(O) - O - 、- C(O) - または - S(O)₂ - NR₁ - であり；

R_a および R_b の各々は独立して、H、ハロ、アルキル、アルコキシ、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル（該アルキル、アルコキシ、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルの任意のものは、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る）、- (CHR_{4~0})_mC(O)OR_{4~0}、- (CHR_{4~0})_mOR_{4~0}、- (CHR_{4~0})_mSR_{4~0}、- (CHR_{4~0})_mNR_{4~1}R_{4~2}、- (CHR_{4~0})_mC(O)NR_{4~1}R_{4~2}、- (CHR_{4~0})_mC(O) - N(R₁) (CHR_{4~0})_m - NR_{4~1}R_{4~2}、- (CHR_{4~0})_mC(O) - N(R₁) (CHR_{4~0})_mC(O)NR_{4~1}R_{4~2}、- (CHR_{4~0})_mC(O) - N(R₁) - (CHR_{4~0})_mC(O)OR_{4~0}、または - (CHR_{4~0})_m - S - S - R_{4~0} であるか；あるいは任意の2個の R_a および R_b は、これらが結合している炭素原子（単数もしくは複数）と一緒にになって、R₇ で（1回もしくは複数回）必要に応じて置換されたシクロアルキルまたはヘテロシクリルを形成するか；あるいは R_1 と、 R_a または R_b のうちのいずれか一方とは、これらが結合している原子（単数もしくは複数）と一緒にになって

、 R_7 で（1回もしくは複数回）必要に応じて置換されたヘテロシクリルを形成し；
 R_5 は、 R_7 、 - (CR_aR_b)_m - L_2 - (CR_aR_b)_m - R_7 、 または - (- L_3 - (CR_aR_b)_r -)_s - L_3 - R_7 であり、ここで任意の2個の隣接する - (CR_aR_b)_m 基または - (CR_aR_b)_r 基の炭素原子は一緒になって、二重結合 (- C (R_a) = (C (R_a) -) または三重結合 (- C (C -)) を形成し得；

R_6 は、 H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルであり、これらの任意のものは、 R_7 で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るか、または R_6 は、 - (CR_aR_b)_m - L_2 - (CR_aR_b)_m - R_7 であり；

各 R_7 は独立して、 R_{10} ；シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルから選択される環部分であって、このような環部分が、 R_{10} で必要に応じて1回または複数回置換されているものであるか；あるいは1個の炭素原子が2個の R_7 基を有する場合、このような2個の R_7 基は、一緒になってオキソもしくはチオキソを形成するか、または一緒になって、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルもしくはヘテロシクリルから選択される環部分を形成し、このような環部分は、 R_{10} で必要に応じて1回もしくは複数回置換されており；

各 R_{10} は独立して、 H、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ペルハロアルコキシ、ペルハロアルキル、 - (CR_aR_b)_m OH、 - (CR_aR_b)_m OR₈、 - (CR_aR_b)_m CN、 - (CR_aR_b)_m NH (C = NH) NH₂、 - (CR_aR_b)_m NR₁ R₈、 - (CR_aR_b)_m O (CR_aR_b)_m R₈、 - (CR_aR_b)_m NR₁ (CR_aR_b)_m R₈、 - (CR_aR_b)_m C (O) R₈、 - (CR_aR_b)_m C (O) OR₈、 - (CR_aR_b)_m C (O) NR₁ R₈、 - (CR_aR_b)_m NR₁ (CR_a R_b)_m C (O) OR₈、 - (CR_aR_b)_m NR₁ C (O) R₈、 - (CR_aR_b)_m C (O) NR₁ S (O)₂ R₈、 - (CR_aR_b)_m SR₈、 - (CR_aR_b)_m S (O) R₈、 - (CR_aR_b)_m S (O)₂ R₈、 - (CR_aR_b)_m S (O)₂ NR₁ R₈ または - (CR_aR_b)_m NR₁ S (O)₂ R₈ であり；

各 R_8 は独立して、 H、アルキル、ハロアルキル、アリール、 - (CR_aR_b)_m - L_2 - (CR_aR_b)_m - R_1 または - (- L_3 - (CR_aR_b)_r -)_s - L_3 - R_1 であり；

L_2 は独立して、式 I - R または I - S の構造の近位端から遠位端に向かって、存在しないか、 - O - 、 - OC (O) - 、 - NR₁ - 、 - C (O) NR₁ - 、 - N (R₁) - C (O) - 、 - S (O₂) - 、 - S (O) - 、 - S - 、 - C (O) - または - S (O₂) - N (R₁) - であり；

各 L_3 は独立して、存在しないか、 - O - 、または - N (R₁) - であり、

各 m は独立して、 0、1、2、3、4、5 または 6 であり；

各 n は独立して、 0 または 1 または 2 であり；

p は、 0、1、2 または 3 であり；

q は、 0、1、2 または 3 であり；

各 r は独立して、 2、3、または 4 であり；そして

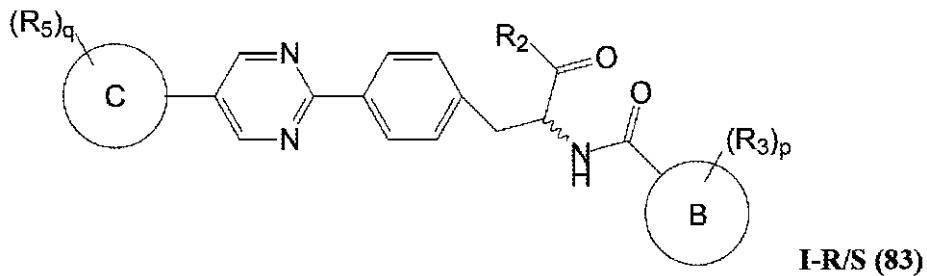
各 s は独立して、 1、2、3、または 4 である、

化合物。

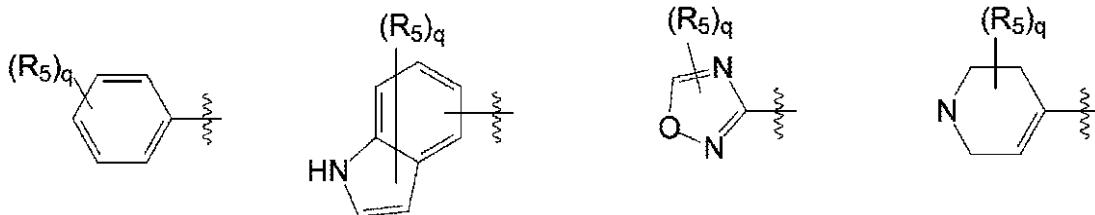
【請求項 2】

以下の構造：

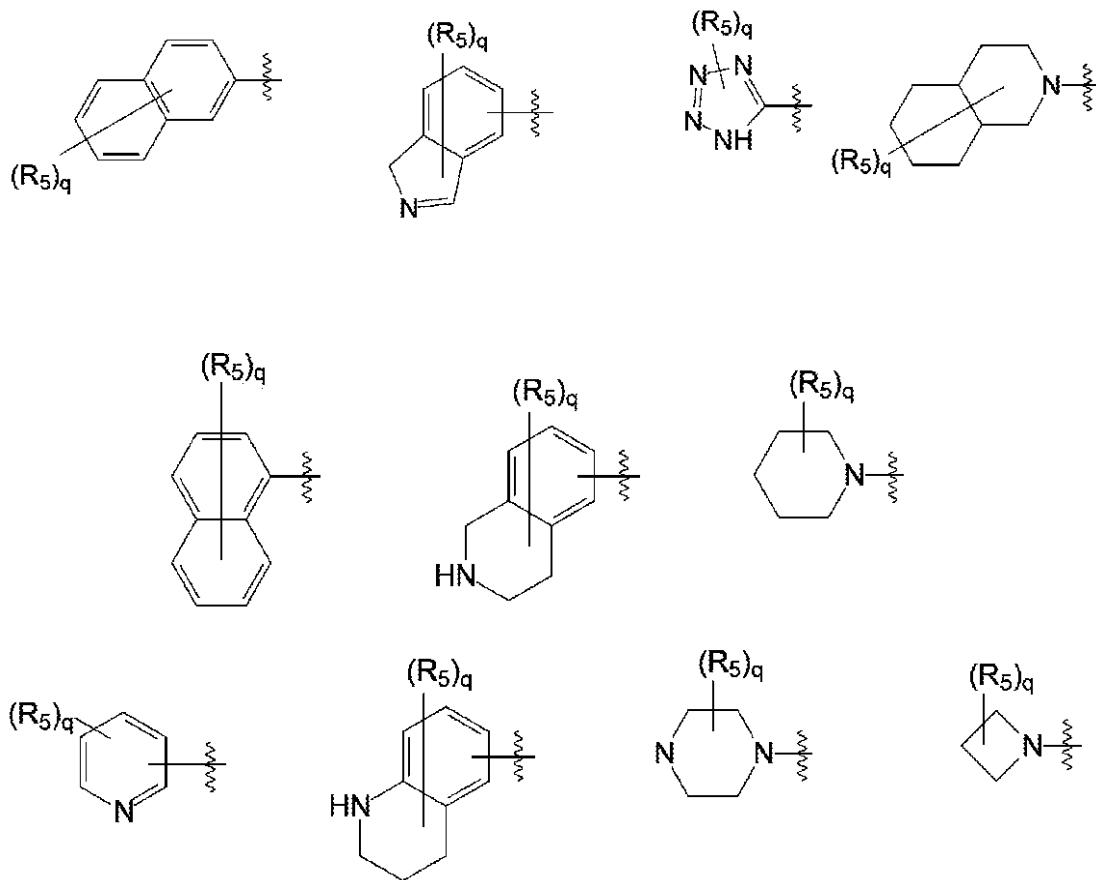
【化488】

を有する、請求項1に記載の化合物であって、C(R_5)_qは、以下：

【化489】



【化490】

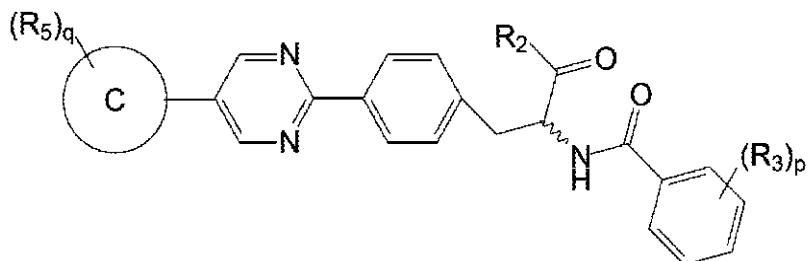


のうちの1つから選択される、化合物。

【請求項3】

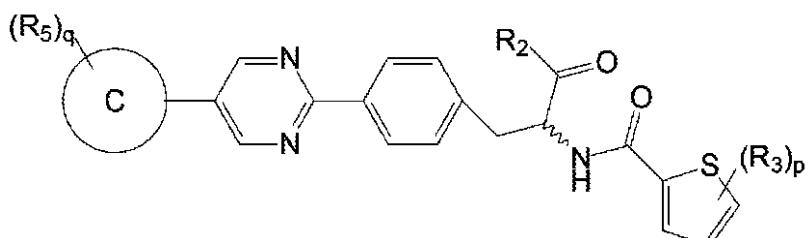
以下の構造：

【化491】



I-R/S (84)または

【化492】



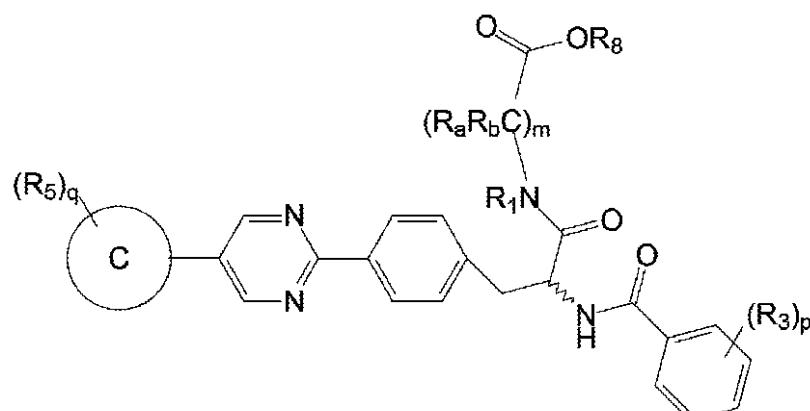
I-R/S (85)

を有する、請求項2に記載の化合物。

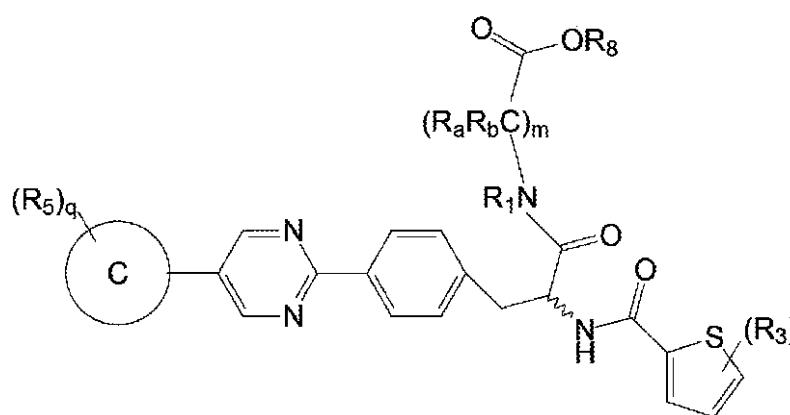
【請求項4】

以下の構造：

【化493】



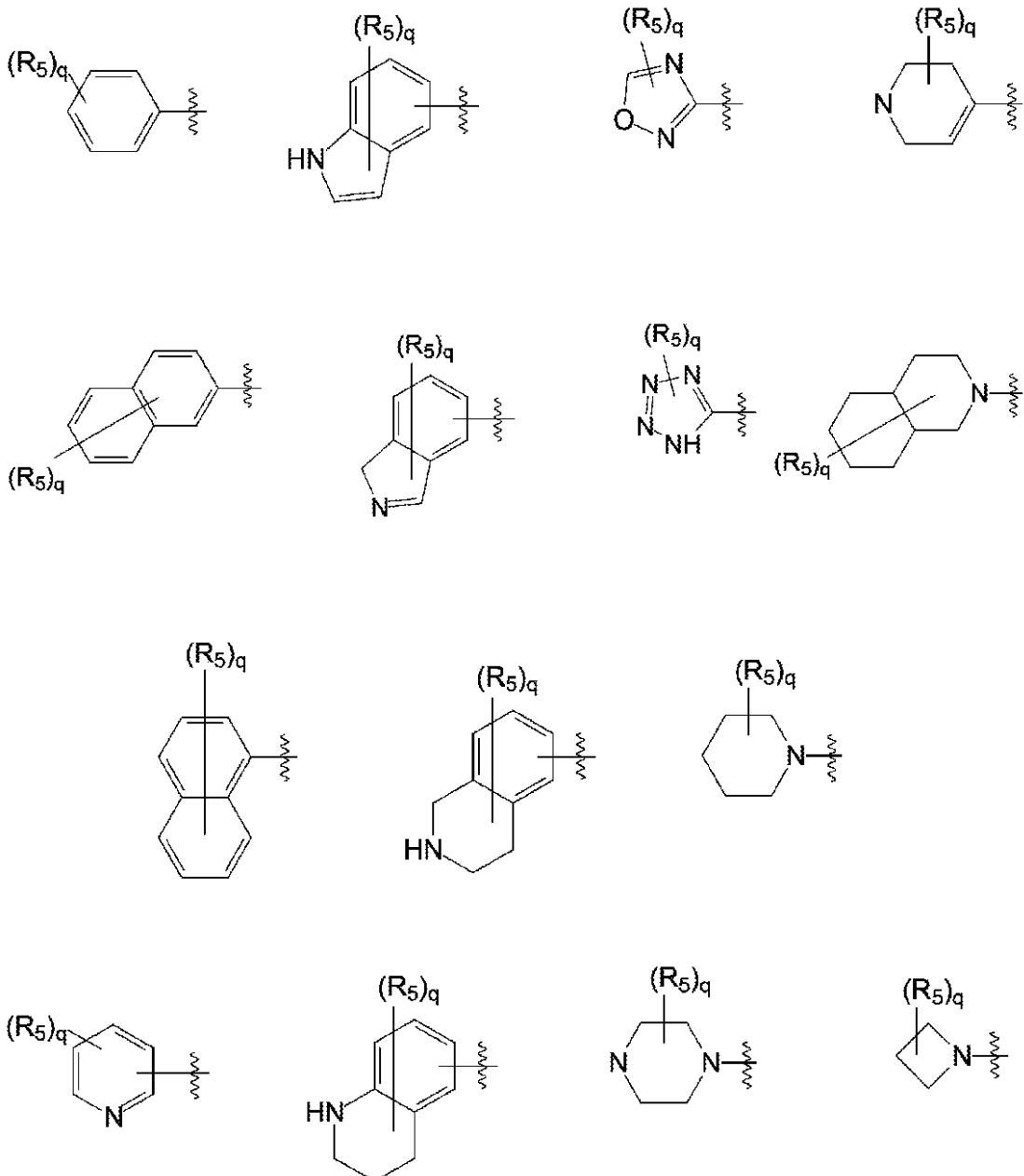
I-R/S (89)または



I-R/S (90)

を有する、請求項1に記載の化合物であつて、C (R5)qは、以下：

【化494】



のうちの1つから選択される、化合物。

【請求項5】

pが1であり、そしてR₃がアルキルである、請求項2～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

pが1であり、そしてR₃がtert-ブチルである、請求項2～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

qが1であり、そしてR₅がアルコキシである、請求項2～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

qが1であり、そしてR₅がC₄～₈アルコキシである、請求項2～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

q が 1 であり、そして R_5 が C_7 アルコキシである、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 0】

q が 1 であり、そして R_5 がアルキルである、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 1】

q が 1 であり、そして R_5 が $C_{1 \sim 4}$ アルキルである、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 2】

q が 1 であり、そして R_5 が、 R_{10} で置換されたシクロアルキルである、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

R_{10} がアルキルである、請求項 1 2 に記載の化合物。

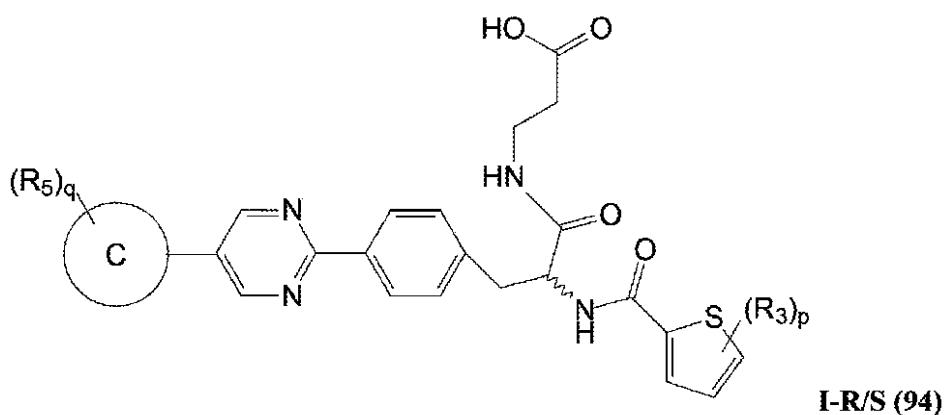
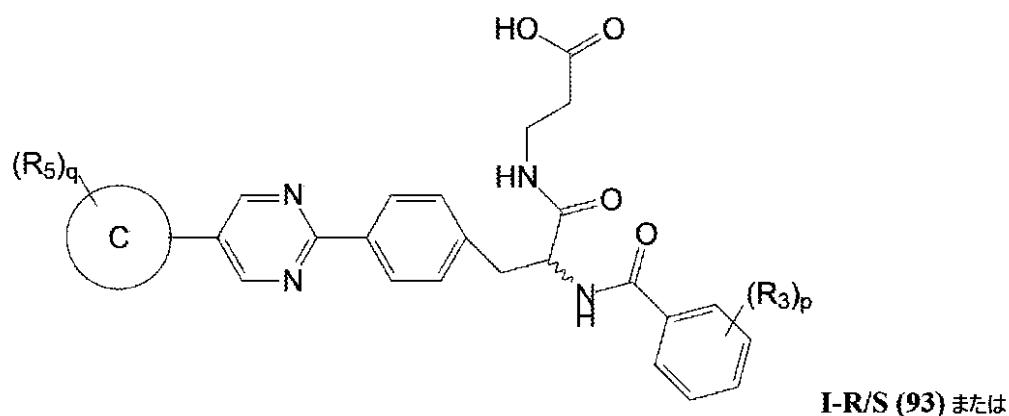
【請求項 1 4】

R_5 がシクロヘキシルであり、そして R_{10} が n - プロピルである、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

以下の構造：

【化 4 9 5】

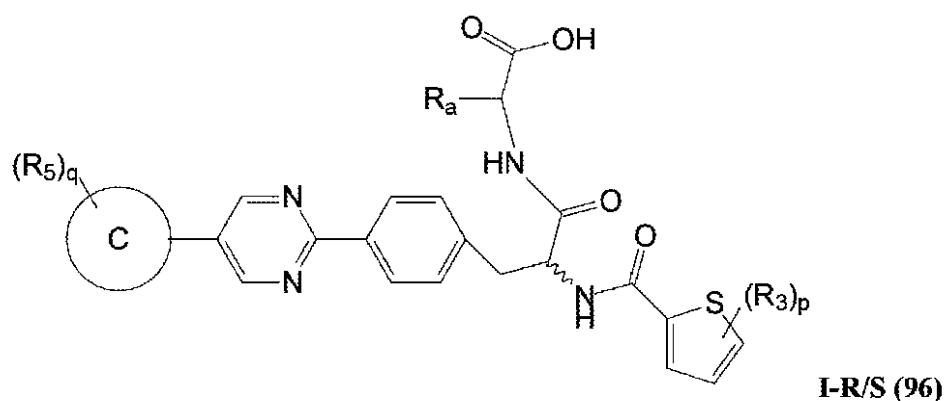
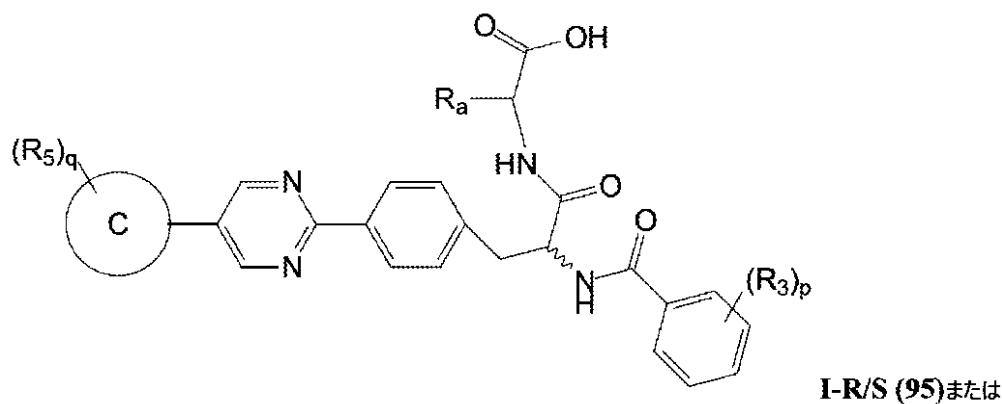


を有する、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

以下の構造：

【化496】

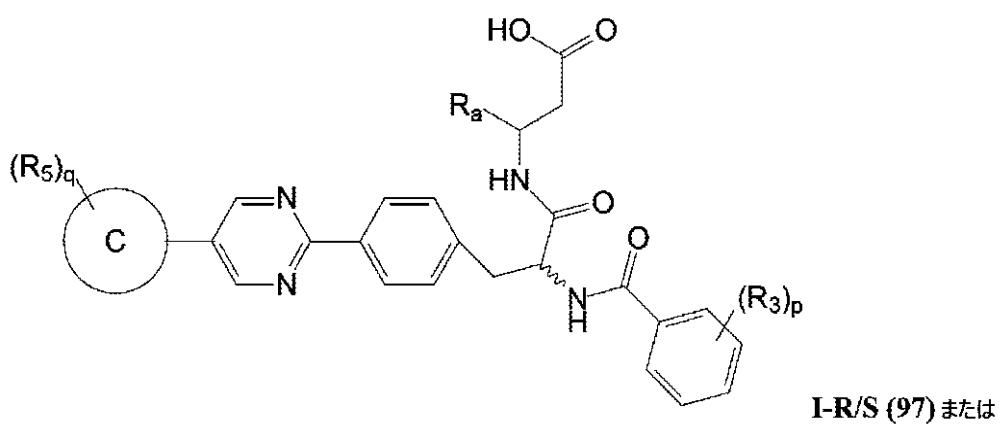


を有する、請求項4に記載の化合物。

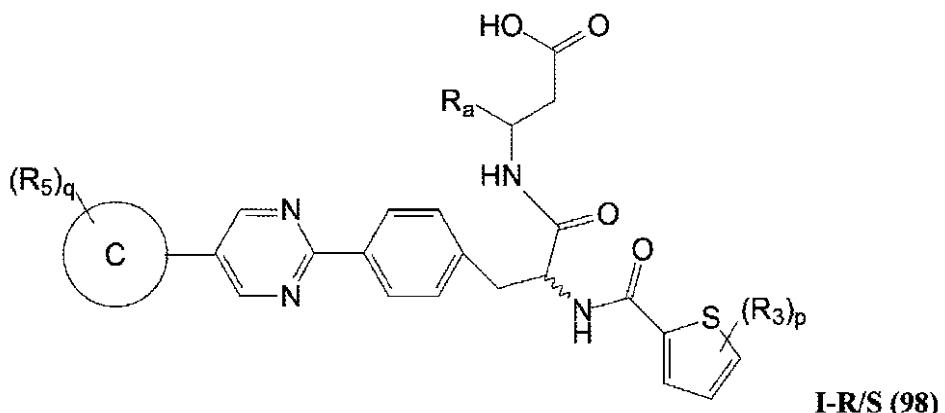
【請求項17】

以下の構造：

【化497】



【化498】



を有する、請求項4に記載の化合物。

【請求項18】

R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたアルキルである、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項19】

アルキルは、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、sec-ブチルおよびtert-ブチルから選択される直鎖または分枝鎖のアルキルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

アルキルは、イソプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルから選択されるシクロアルキルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項21】

R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたヘテロシクリル、または R_7 で必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキルである、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項22】

R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたアリール、または R_7 で必要に応じて置換されたアラルキルである、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項23】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mCOOR_{40}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項24】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mOR_{40}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項25】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mSR_{40}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項26】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mNR_{41}R_{42}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項27】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mC(O)NR_{41}R_{42}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項28】

R_a が $-(CH_{R_{40}})_mC(O)N(R_1)(CH_{R_{40}})_m-NR_{41}R_{42}$ である、請求項16～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 29】

R_a が $-\left(C H R_{4,0} \right)_m C(O)N(R_1)\left(C H R_{4,0} \right)_m - C(O)N R_{4,1} R_{4,2}$ である、請求項 16 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

R_a が $-\left(C H R_{4,0} \right)_m C(O)N(R_1)\left(C H R_{4,0} \right)_m - C(O)OR_{4,0}$ である、請求項 16 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

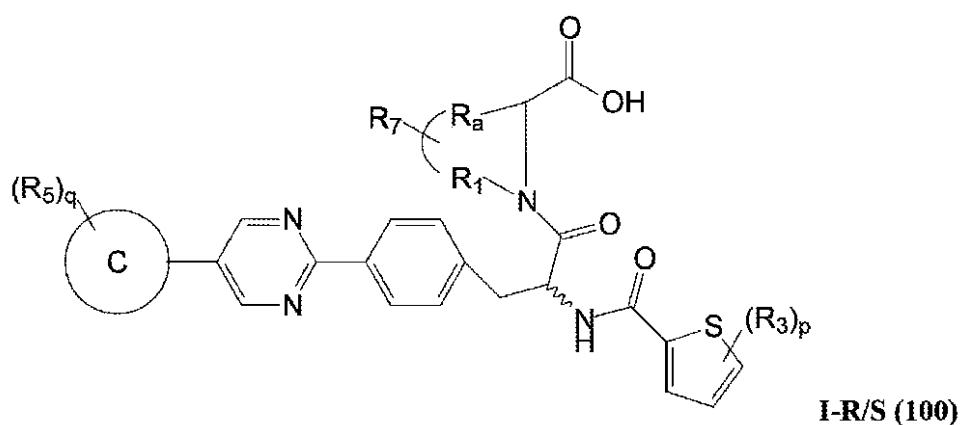
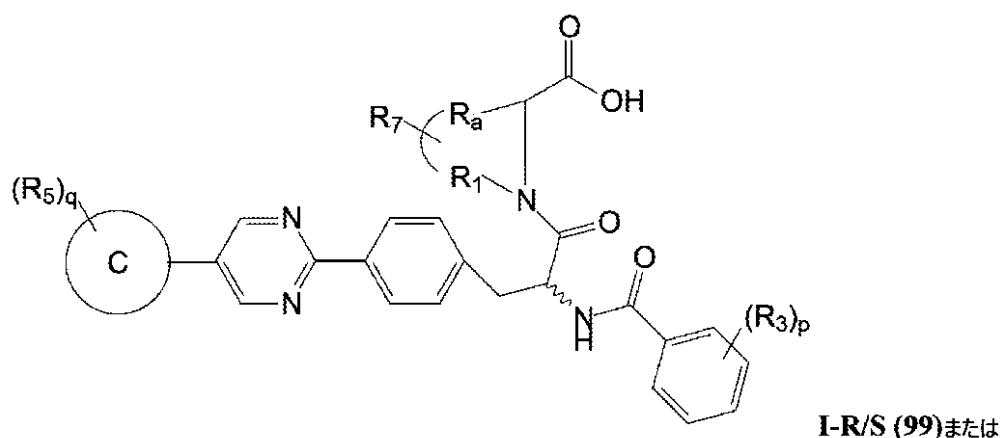
【請求項 31】

R_a が $-\left(C H R_{4,0} \right)_m - S - S - R_{4,0}$ である、請求項 16 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 32】

以下の構造：

【化 4 9 9】

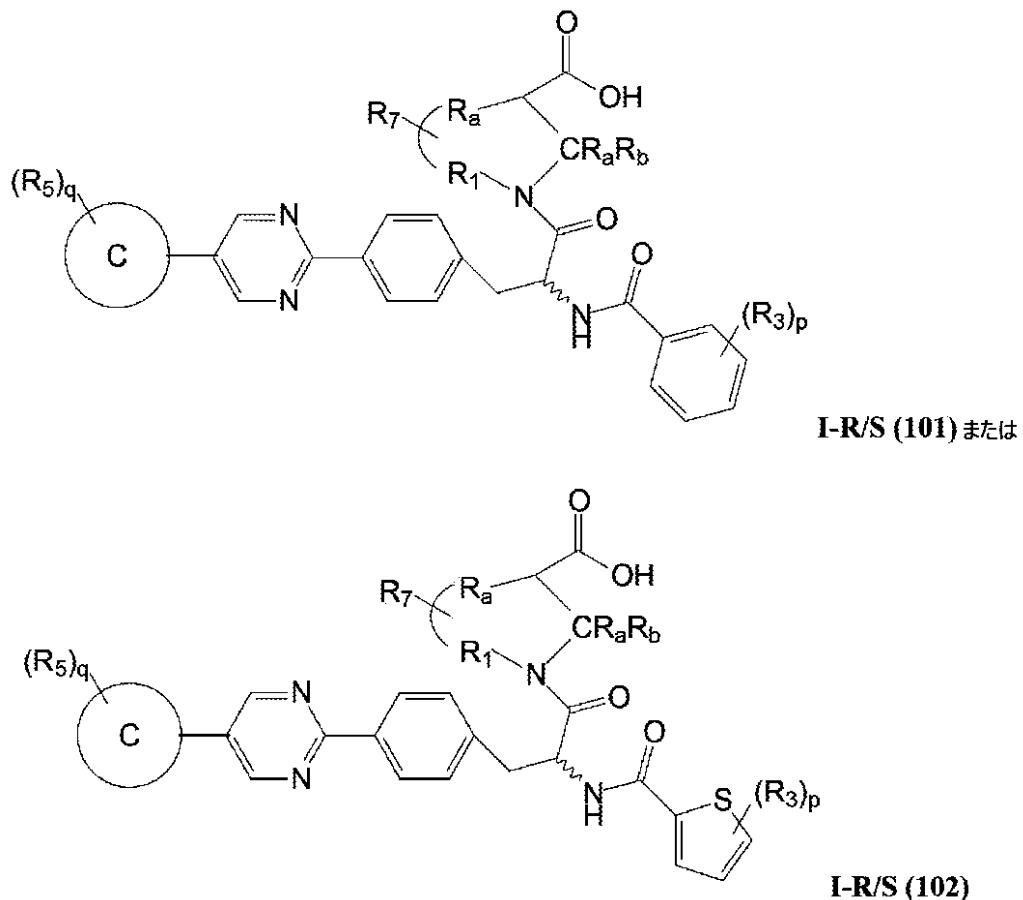


を有する、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 33】

以下の構造：

【化 5 0 0】

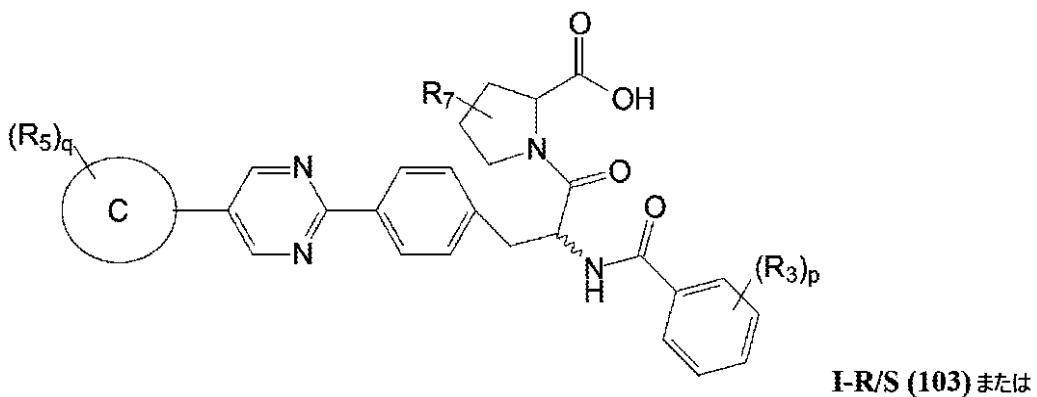


を有する、請求項 4 に記載の化合物。

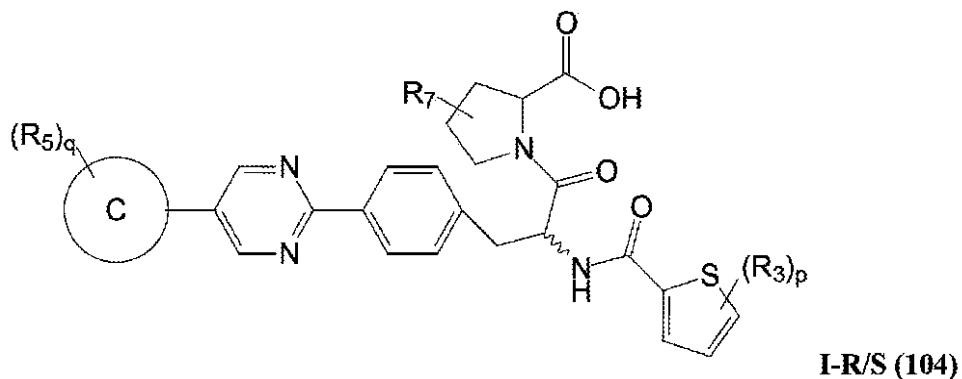
【請求項 3 4】

以下の構造：

【化 5 0 1】



【化 5 0 2】

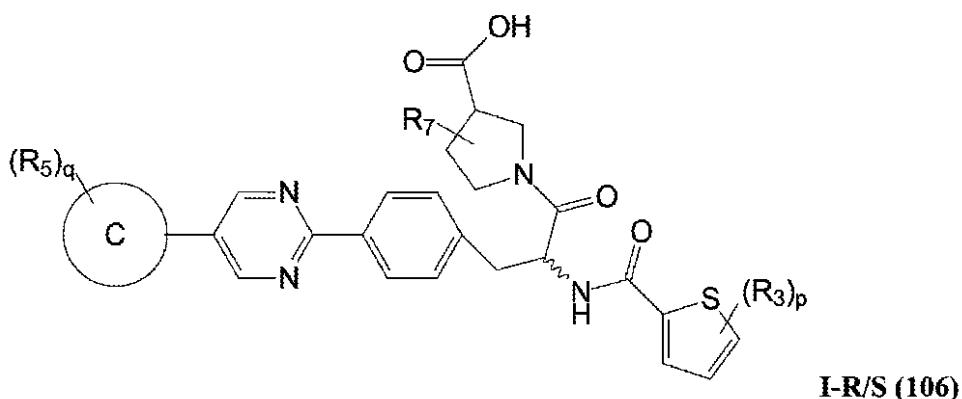
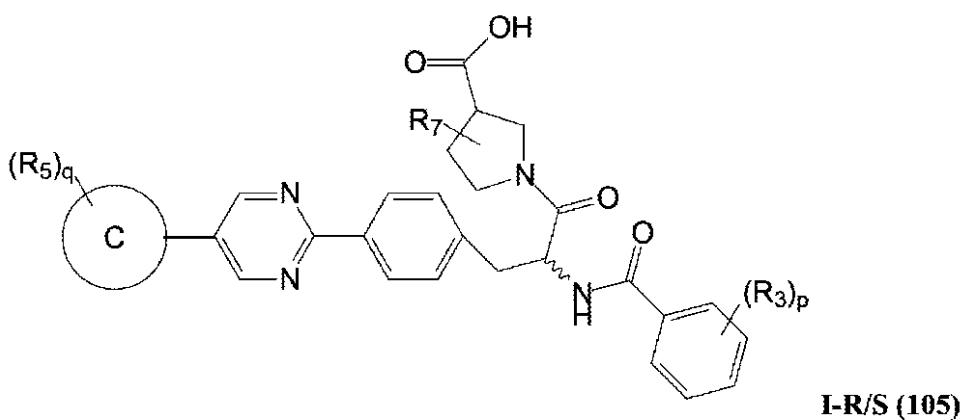


を有する、請求項 3 2 に記載の化合物。

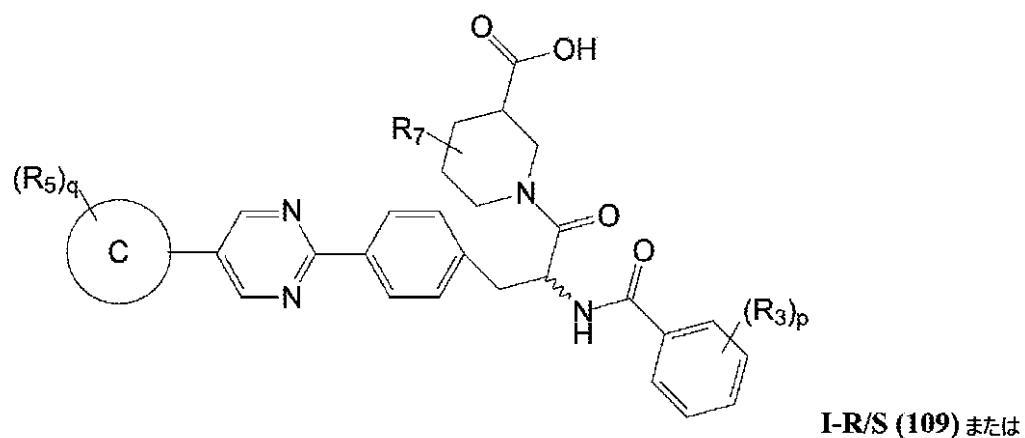
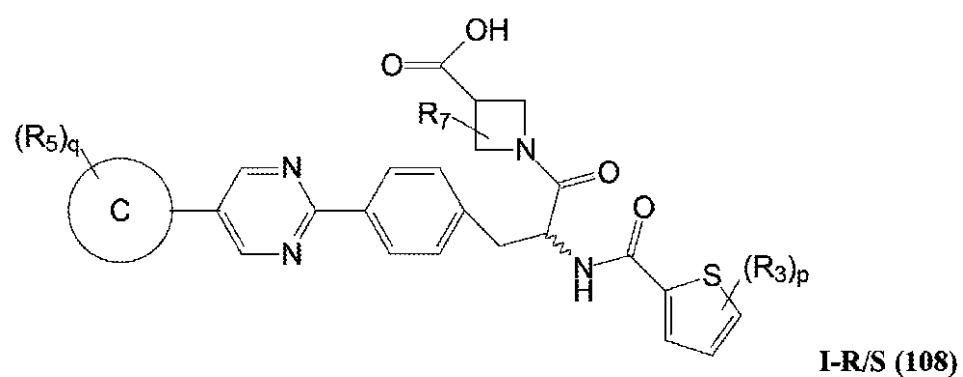
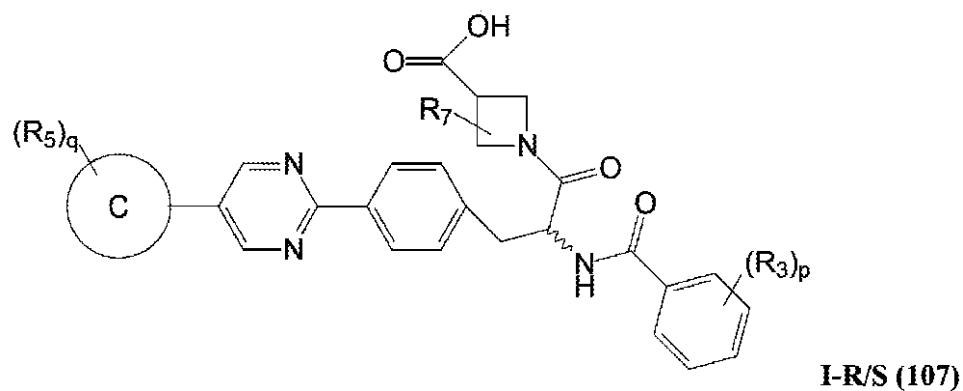
【請求項 3 5】

以下の構造：

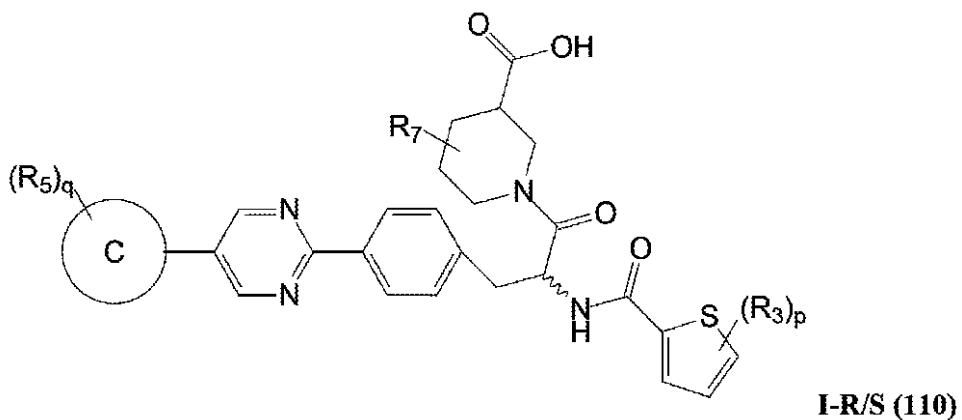
【化 5 0 3】



【化 5 0 4】



【化 5 0 5】



を有する、請求項 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

R_3 がアルキルであり、そして p が 1 である、請求項 3 2 ~ 3 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 7】

R_3 が *tert*-ブチルである、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

R_5 が、 R_{10} で置換されたシクロアルキルであり、そして q が 1 である、請求項 3 2 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 9】

R_{10} がアルキルである、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

R_5 がシクロヘキシルであり、そして R_{10} が *n*-プロピルである、請求項 3 8 に記載の化合物。

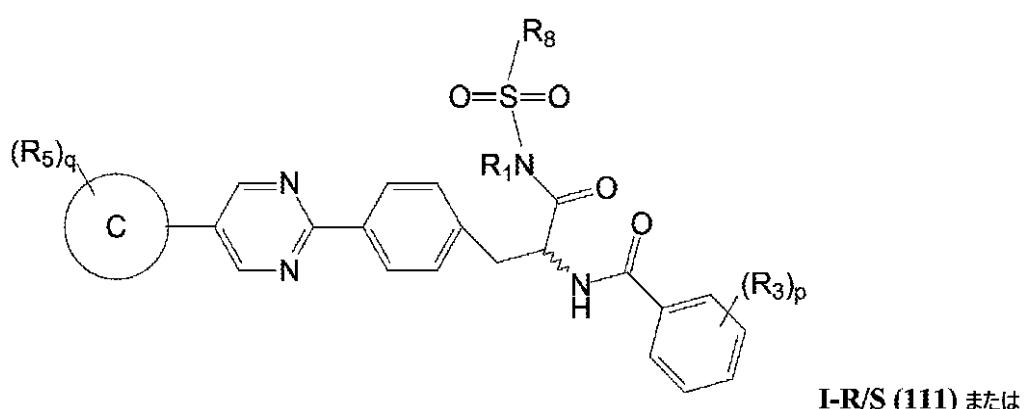
【請求項 4 1】

R_7 が水素である、請求項 3 2 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

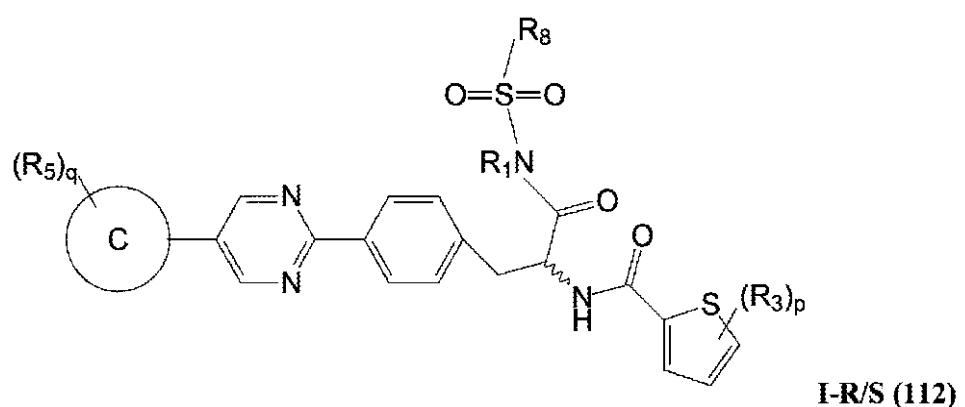
【請求項 4 2】

以下の構造：

【化 5 0 6】



【化 5 0 7】



を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

R_1 が水素である、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

R_3 がアルキルであり、そして p が 1 である、請求項 4 2 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 5】

R_3 が *t e r t* - ブチルである、請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

R_5 が、 R_{10} で置換されたシクロアルキルであり、そして q が 1 である、請求項 4 2 ~ 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4 7】

R_{10} がアルキルである、請求項 4 6 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R_5 がシクロヘキシルであり、そして R_{10} が *n* - プロピルである、請求項 4 6 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R_8 がアルキルである、請求項 4 2 ~ 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

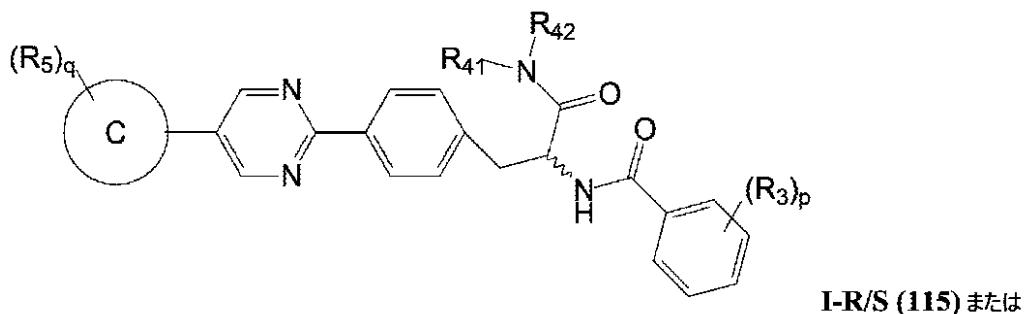
【請求項 5 0】

R_8 がメチルである、請求項 4 9 に記載の化合物。

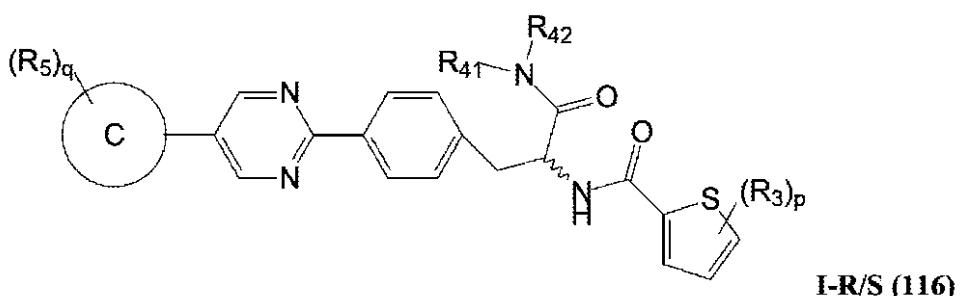
【請求項 5 1】

以下の構造：

【化 5 0 8】



【化 5 0 9】



を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

R_{41} および R_{42} は独立して、 R_{40} 、 $- (C H R_{40})_n - C(O)O R_{40}$ 、 $- (C H R_{40})_n - C(O)R_{40}$ 、 $- (C H_2)_n N(R_1)(R_7)$ 、 R_7 で必要に応じて置換されたアリール、または R_7 で必要に応じて置換されたヘテロアリールである、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 3】

R_{41} が水素であり、そして R_{42} が、 R_7 で必要に応じて置換されたアルキルである、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

R_{41} が水素であり、そして R_{42} が $- (C H R_{40})_n C(O)O R_{40}$ である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

$R_{4\ 1}$ が水素であり、そして $R_{4\ 2}$ が $- (C H R_{4\ 0})_n C (O) R_{4\ 0}$ である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 6】

$R_{4\ 1}$ が水素であり、そして $R_{4\ 2}$ が $- (C H_2)_n N (R_1) (R_7)$ である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 7】

$R_{4\ 1}$ が水素であり、そして $R_{4\ 2}$ が、 R_7 で必要に応じて置換されたアリールである、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

$R_{4\ 1}$ が水素であり、そして $R_{4\ 2}$ が、 R_7 で必要に応じて置換されたヘテロアリールである、請求項 5 1 に記載の化合物。

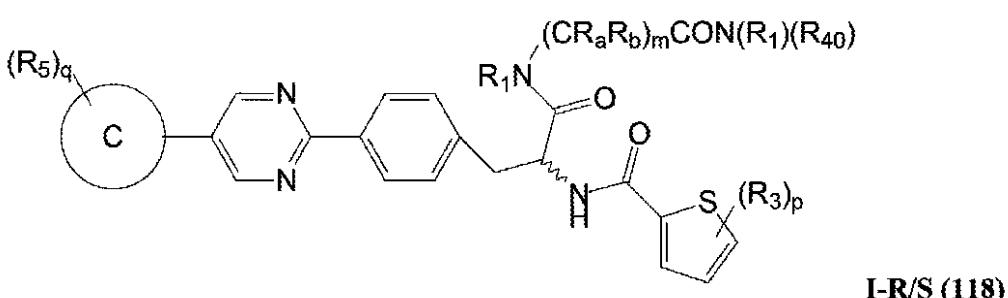
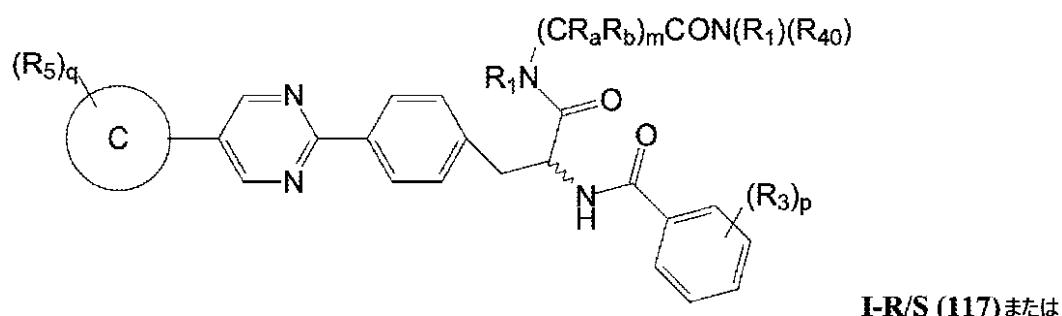
【請求項 5 9】

$R_{4\ 1}$ と $R_{4\ 2}$ とは、これらが結合しているN原子と一緒にになって、 R_7 で必要に応じて置換された3員～7員のヘテロシクリルを形成する、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

構造：

【化 5 1 0】

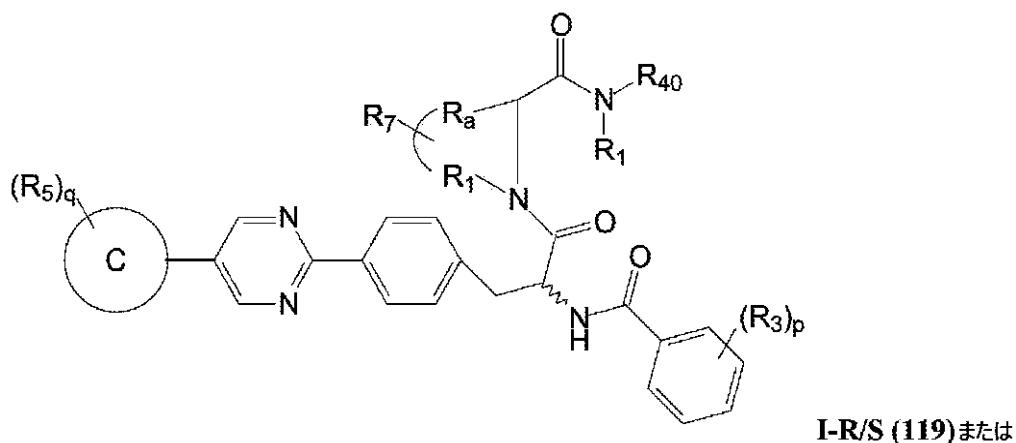


を有する、請求項 1 に記載の化合物。

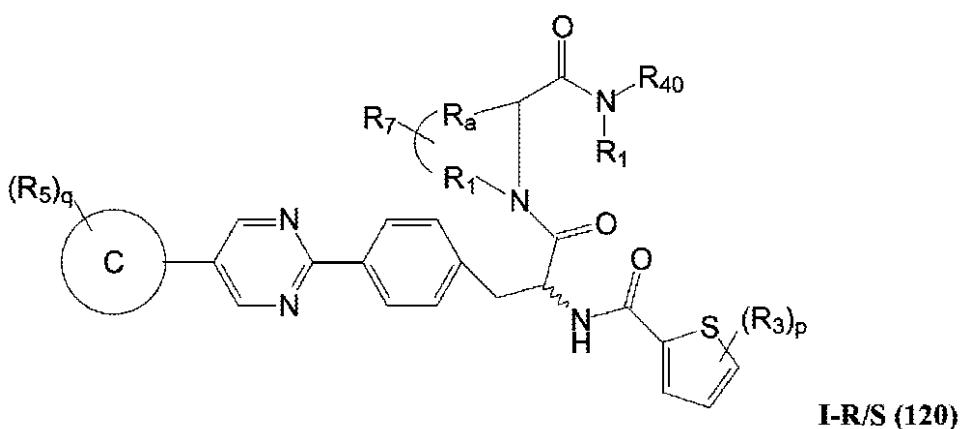
【請求項 6 1】

以下の構造：

【化 5 1 1】



【化 5 1 2】

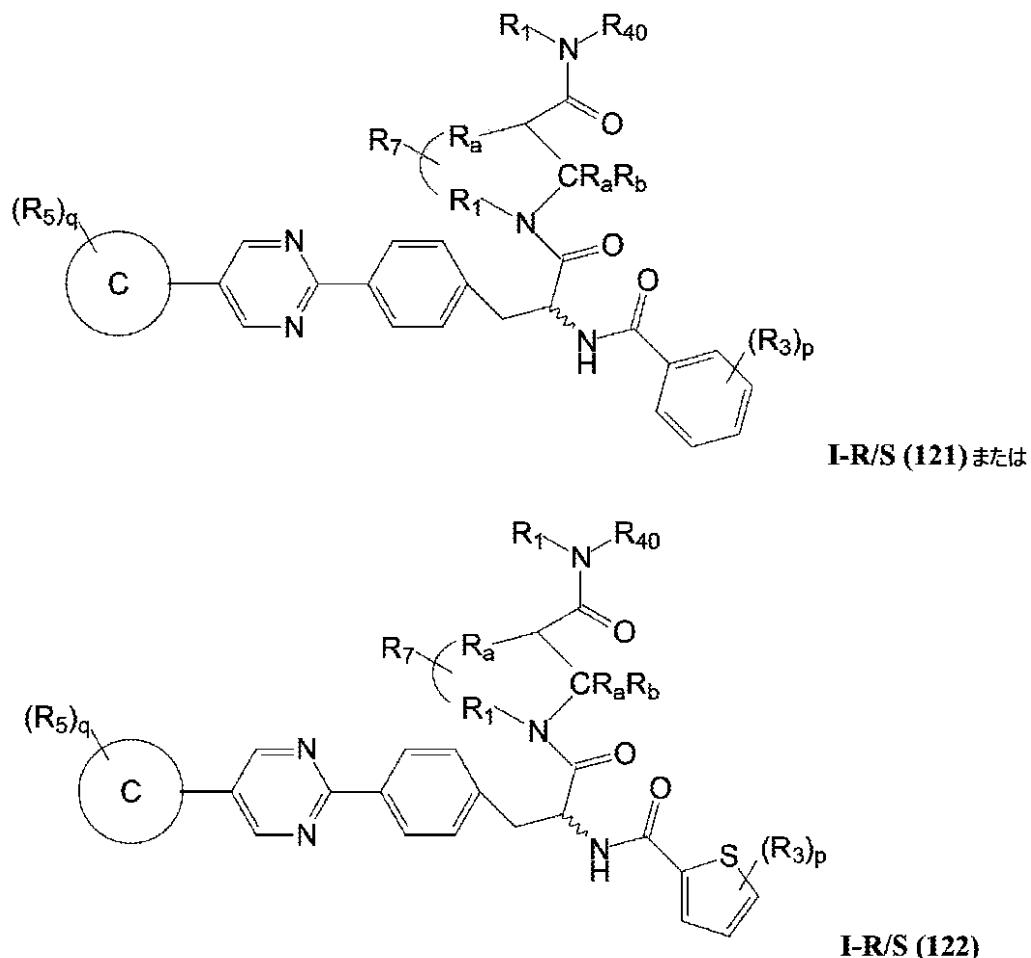


を有する、請求項 6 0 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

以下の構造：

【化 5 1 3】

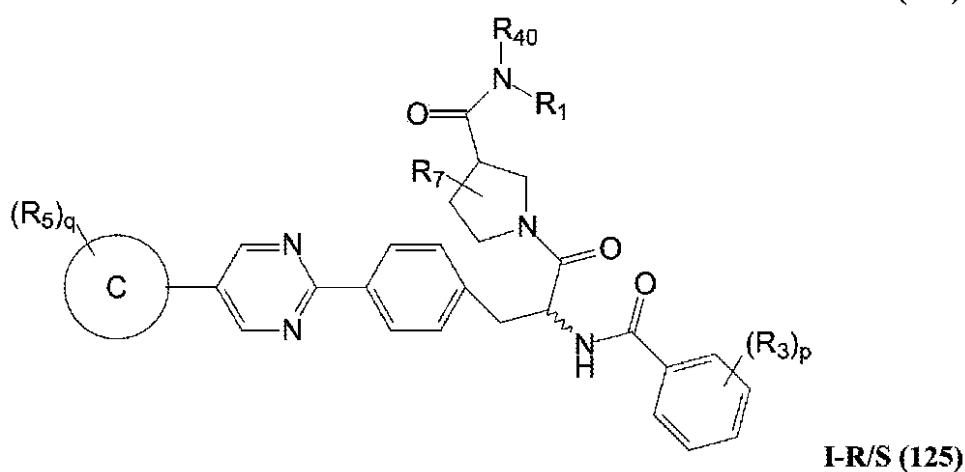
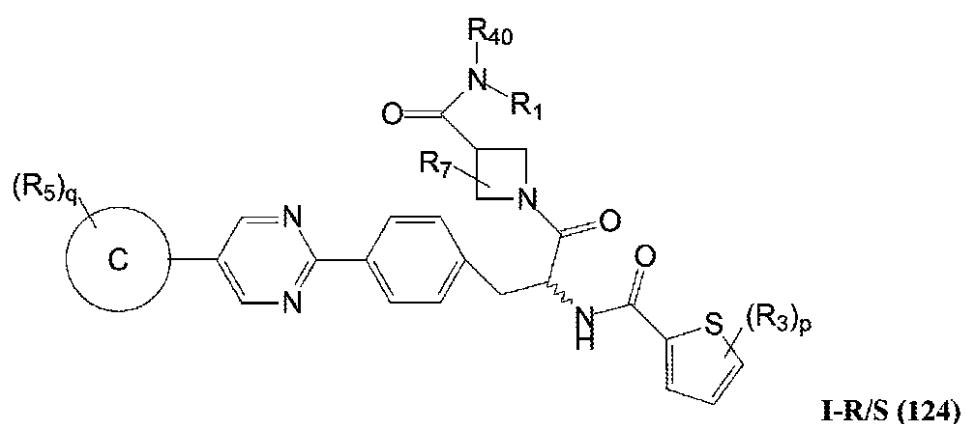
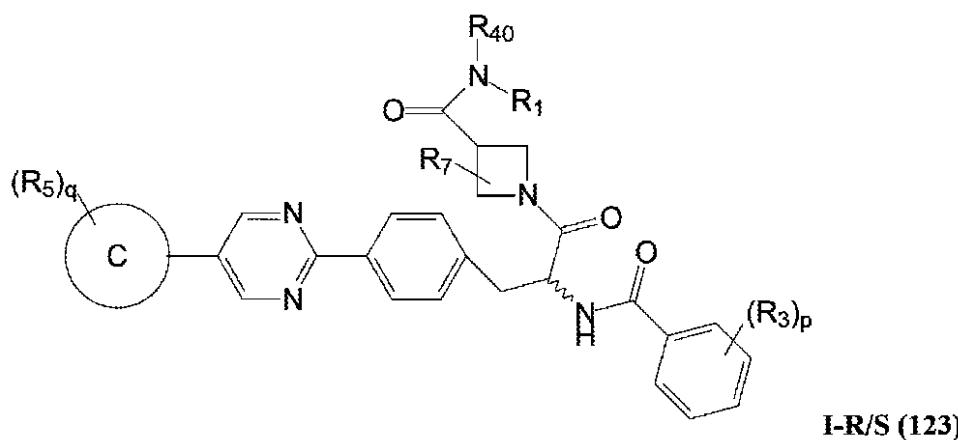


を有する、請求項 6 0 に記載の化合物。

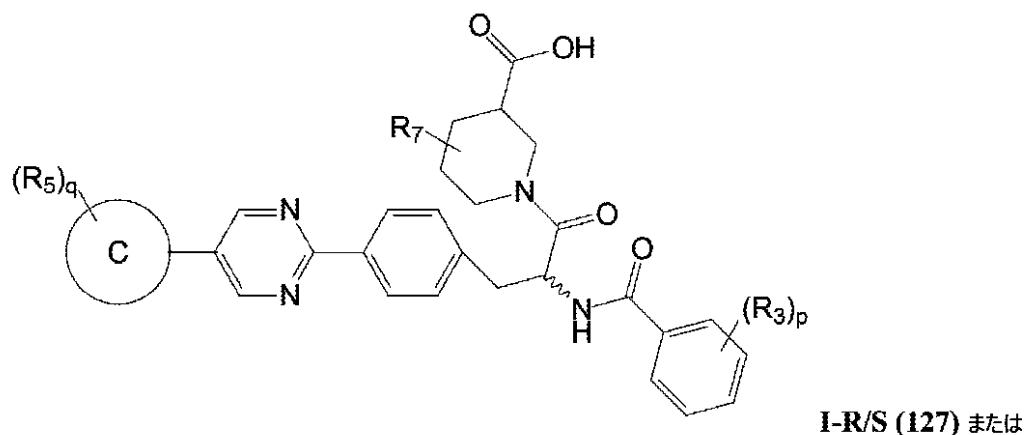
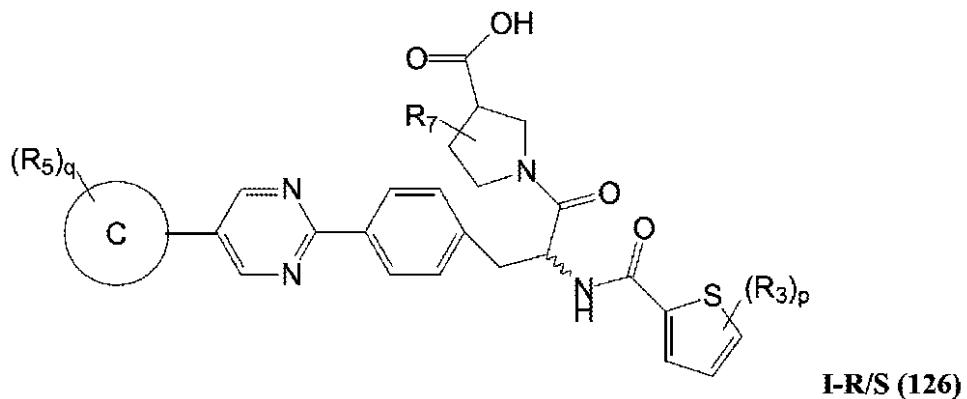
【請求項 6 3】

以下の構造：

【化 5 1 4】



【化 5 1 5】

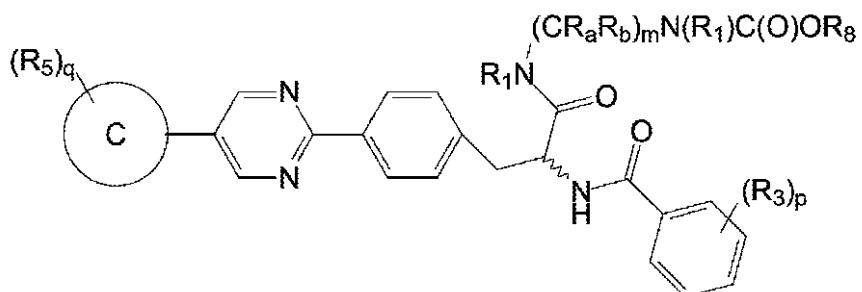


を有する、請求項 6 2 に記載の化合物。

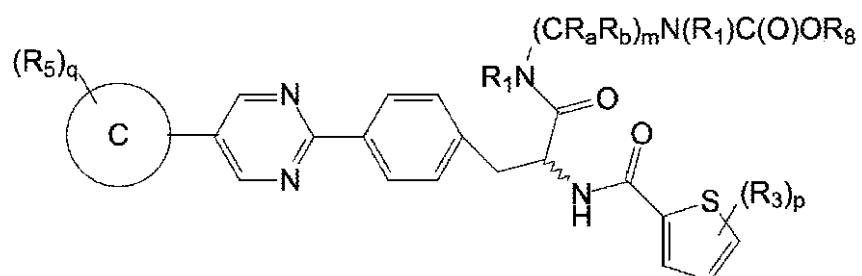
【請求項 6 4】

構造

【化 5 1 6】



I-R/S (129) または



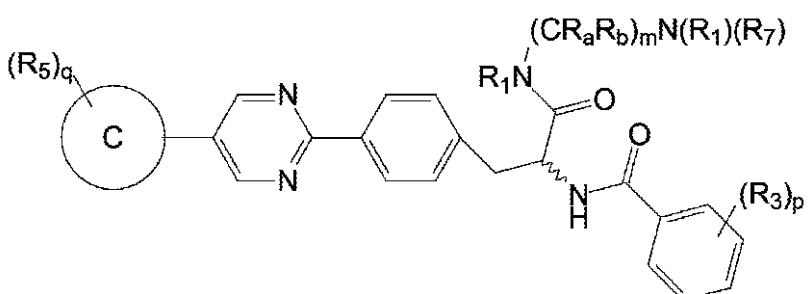
I-R/S (130)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

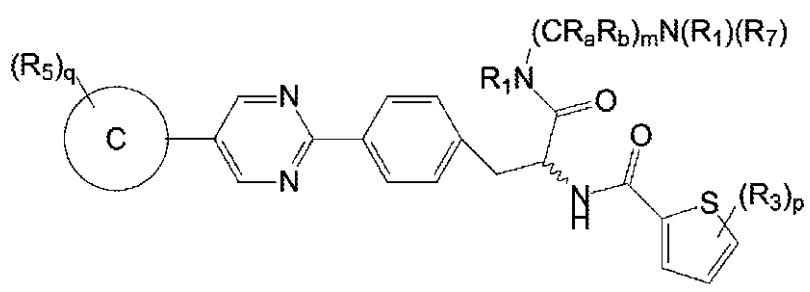
【請求項 6 5】

構造：

【化 5 1 7】



I-R/S (131) または



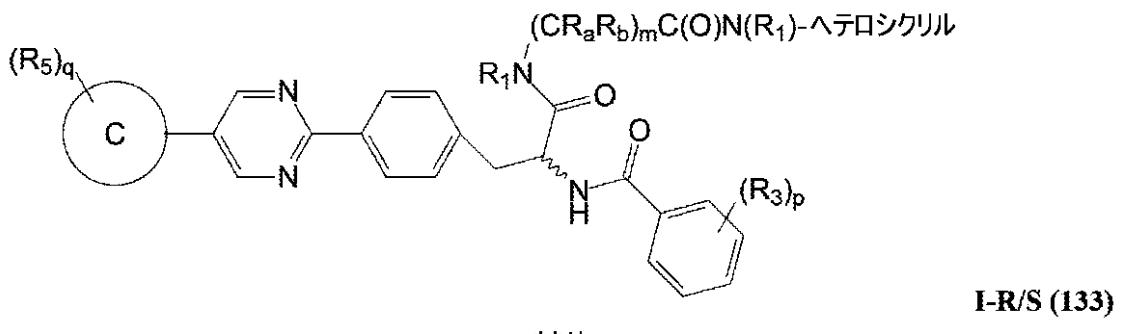
I-R/S (132)

を有する、請求項 1 に記載の化合物。

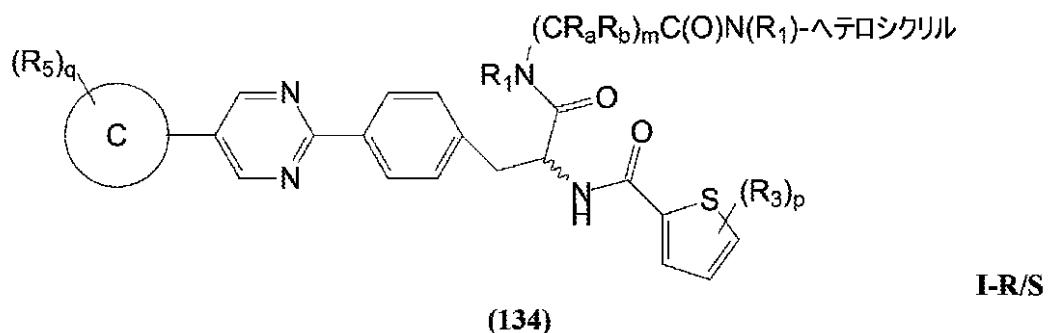
【請求項 6 6】

構造：

【化 5 1 8】



または

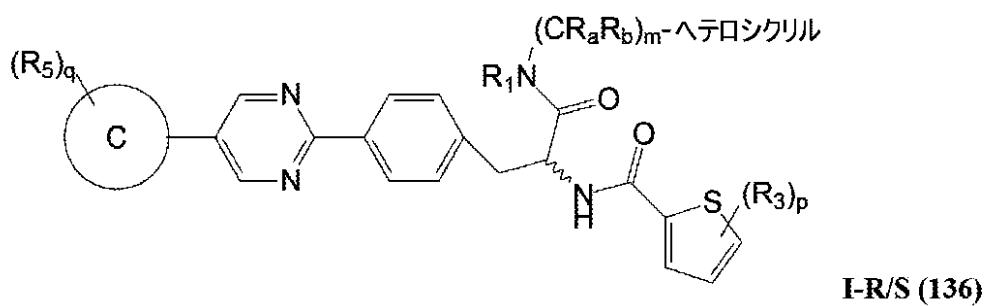
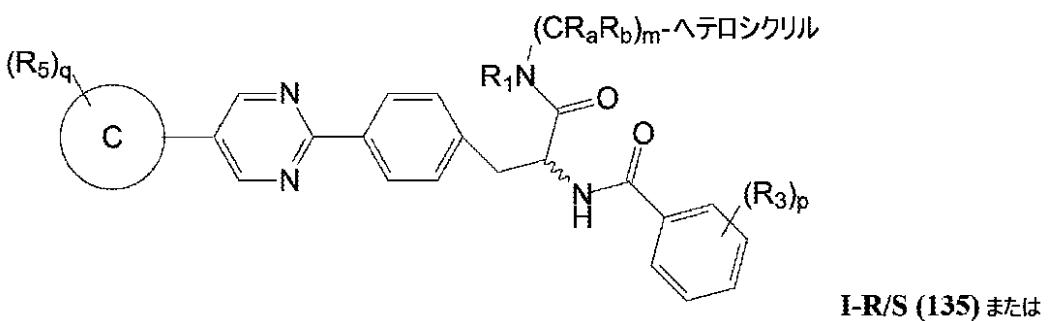


を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6 7】

構造：

【化 5 1 9】

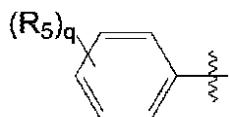


を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6 8】

 $C (R_5)_q$ が：

【化520】

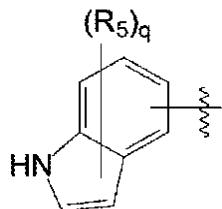


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項69】

$C(R_5)_q$ が：

【化521】

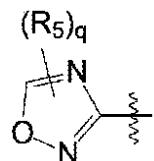


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項70】

$C(R_5)_q$ が：

【化522】

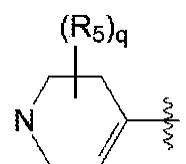


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項71】

$C(R_5)_q$ が：

【化523】

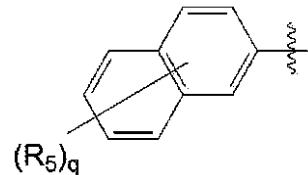


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項72】

$C(R_5)_q$ が：

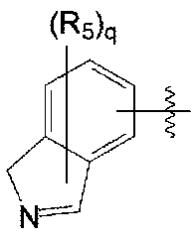
【化524】



である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項73】

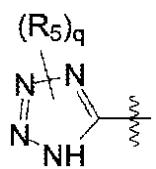
$C(R_5)_q$ が：
【化 5 2 5】



である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 4】

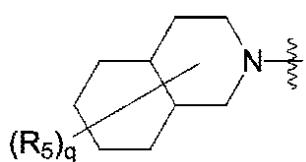
$C(R_5)_q$ が：
【化 5 2 6】



である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 5】

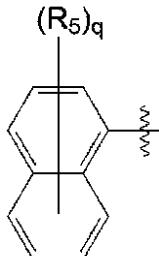
$C(R_5)_q$ が：
【化 5 2 7】



である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 6】

$C(R_5)_q$ が：
【化 5 2 8】

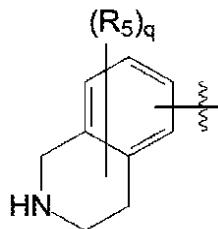


である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 7】

$C(R_5)_q$ が：

【化529】

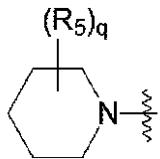


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項78】

C (R₅)_q が：

【化530】

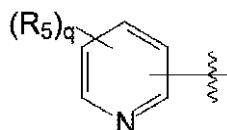


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項79】

C (R₅)_q が：

【化531】

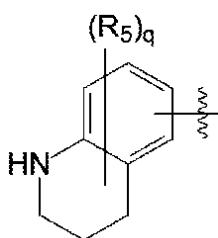


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項80】

C (R₅)_q が：

【化532】

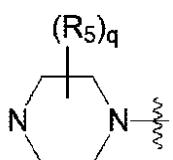


である、請求項1～67のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項81】

C (R₅)_q が：

【化533】

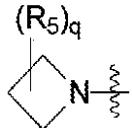


である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 2】

C (R₅)_q が：

【化 5 3 4】



である、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 3】

前記化合物が、表 1 の化合物 1 ~ 1 5 5 3 のうちのいずれか 1 つ、あるいはその薬学的に受容可能な異性体、エナンチオマー、ラセミ体、塩、エステル、プロドラッグ、水和物または溶媒和物の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8 4】

請求項 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を、少なくとも 1 種の薬学的に受容可能なキャリア、希釈剤または賦形剤と一緒に含有する、薬学的組成物。

【請求項 8 5】

請求項 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物および第二の医薬を含有する、薬学的組み合わせ物。

【請求項 8 6】

前記第二の医薬が、グルカゴンレセプター、G I P レセプター、G L P - 2 レセプター、または P T H レセプター、またはグルカゴン様ペプチド 1 (G L P - 1) レセプターに対するアゴニスト、アンタゴニスト、またはモジュレーターである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 8 7】

前記第二の医薬が、エクセナチド、リラグルチド、タスボグルチド、アルビグルチド、またはリキシセナチドである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 8 8】

前記第二の医薬が D P P I V 阻害剤である、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 8 9】

前記第二の医薬がシタグリブチンである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 9 0】

前記第二の医薬が、ビグアナイド、スルホニル尿素、メグリチニド、チアゾリジンジオン、- グルコシダーゼ阻害剤、S G L T 2 阻害剤、胆汁酸吸着剤、および / またはドバミン - 2 アゴニストである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 9 1】

前記第二の医薬がメトホルミンである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 9 2】

前記第二の医薬が、ダパグリフロジン、エンパグリフロジンまたはカナグリフロジンである、請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

【請求項 9 3】

グルカゴン様ペプチド 1 レセプターの活性化、増強、調節またはアゴニズムのための、請求項 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、または請求項 8 4 に記載の薬学的組成物、または請求項 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物を含む組成物であって、該組成物は該レセプターと接触させられることを特徴とする、組成物。

【請求項 9 4】

グルカゴン様ペプチド 1 レセプターを増強するための、請求項 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物であって、該組成物は該レセプターと、G L P - 1 (7 - 3 6)、G L P - 1 (9 - 3 6) および / またはオキシントモジュリンの存在下で接触させ

られることを特徴とする、組成物。

【請求項 9 5】

グルカゴン様ペプチド 1 レセプターの活性化、増強、調節またはアゴニズムが医学的に必要である患者における異常状態の処置のための、請求項 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物であって、該組成物は、有利な効果を該患者に与えるために十分な頻度および持続時間で、該患者に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 9 6】

前記異常状態は、I 型糖尿病、II 型糖尿病、妊娠糖尿病、肥満症、食欲亢進、満腹感不足、代謝異常、非アルコール性脂肪肝疾患または非アルコール性脂肪性肝炎である、請求項 9 5 に記載の組成物。

【請求項 9 7】

前記異常状態が II 型糖尿病である、請求項 9 5 に記載の組成物。

【請求項 9 8】

前記異常状態が非アルコール性脂肪肝疾患または非アルコール性脂肪性肝炎である、請求項 9 5 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】1 1 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【1 1 1 3】

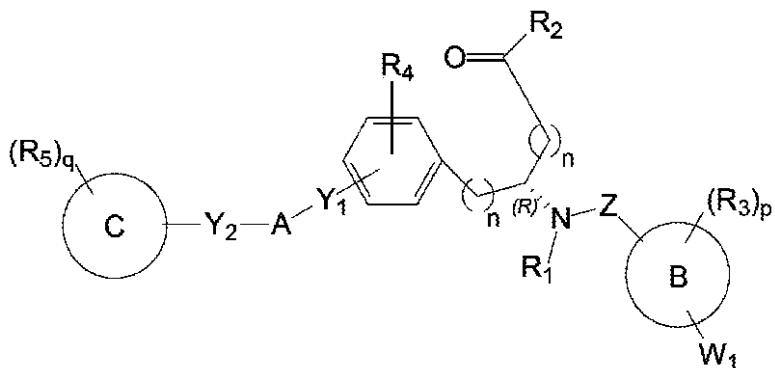
上記のことから、本発明の具体的な実施形態が説明の目的で本明細書中に記載されたが、本発明の趣旨および範囲から逸脱することなく、種々の改変がなされ得ることが理解される。従って、本発明は、添付の特許請求の範囲による以外には、限定されない。

一 実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

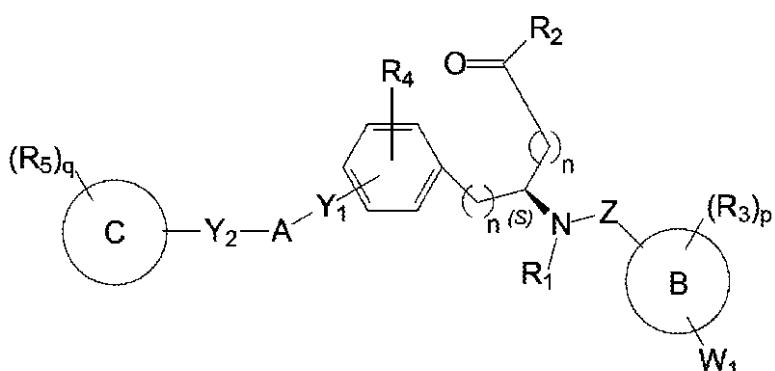
(項目 1)

式 I - R または I - S あるいはその薬学的に受容可能な異性体、エナンチオマー、ラセミ体、塩、エステル、プロドラッグ、水和物または溶媒和物の構造を有する化合物：

【化487】



I-R



I-S

であって、式 I - R および I - S において

A は、1 個、2 個または 3 個のヘテロ原子を有する 5 員、6 員または 7 員のヘテロシクリルであり、ここで各このようなヘテロ原子は独立して、O、N、およびSから選択され、そしてこのようなヘテロシクリルの任意の環原子は、1 個またはそれより多くの R₄ で必要に応じて置換され得；

B は、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、またはヘテロシクリルアルキルであり；

C は、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルであり、そして C がアリールである場合、A と C とは一緒にになって、A の該 5 員、6 員または 7 員のヘテロシクリルと、C の該アリールとの間に、縮合二環式環系を形成し得；

Y₁ と Y₂ との両方が存在しないか、または Y₁ もしくは Y₂ のうちの一方が - NH - もしくは - O - であり、そして他方の Y₁ もしくは Y₂ が存在せず；

Z は、- C (O) - または - S (O) ₂ - であり；

各 R₁ は独立して、H または C_{1~4} アルキルであり；

R₂ は、- OH、- O - R₈、- N (R₁) - SO₂ - R₇、- NR₄₁R₄₂、- N (R₁) - (CR_aR_b)_m - COOR₈、- N (R₁) - (CR_aR_b)_m - CO - N (R₁) (R₄₀)、- N (R₁) - (CR_aR_b)_m - N (R₁) C (O) O (R₈)、- N (R₁) - (CR_aR_b)_m - N (R₁) (R₄₀)、- N (R₁) - (CR_aR_b)_m - CO - N (R₁) - ヘテロシクリル、または - N (R₁) - (CR_aR_b)_m - ヘテロシクリルであり、該ヘテロシクリルは、R₇ で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得；

R₃ および R₄ の各々は独立して、H、ハロ、アルキル、R₃₁ で（1回もしくは複数回）置換されたアルキル、アルコキシ、ハロアルキル、ペルハロアルキル、ハロアルコキ

シ、ペルハロアルコキシ、アリール、ヘテロシクリル、-O H、-OR₇、-CN、-NO₂、-NR₁R₇、-C(O)R₇、-C(O)NR₁R₇、-NR₁C(O)R₇、-SR₇、-S(O)R₇、-S(O)₂R₇、-OS(O)₂R₇、-S(O)₂NR₁R₇、-NR₁S(O)₂R₇、-(CR_aR_b)_mNR₁R₇、-(CR_aR_b)_mO(CR_aR_b)_mR₇、-(CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mR₇または-(CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mCOOR₈であるか；あるいは同じ炭素原子上の任意の2個のR₃基またはR₄基は一緒になって、オキソを形成し；

各R₃基は独立して、H、ハロ、ヒドロキシリ、-NR₄₁R₄₂、またはアルコキシであり；

各R₄基は独立して、H、R₇、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るアルキルであるか、またはR₄基とR₁とは、これらが結合しているN原子と一緒にになって、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る3員～7員のヘテロシクリルを形成し；

R₄₁およびR₄₂の各々は独立して、R₄基、-(CHR₄基)-C(O)O-R₄基、-(CHR₄基)_n-C(O)-R₄基、-(CH₂)_n-N(R₁)(R₇)、アリールまたはヘテロアリールであり、該アリールまたはヘテロアリールの任意のものは、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るか；あるいは任意の2個のR₄₁およびR₄₂は、これらが結合しているN原子と一緒にになって、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る3員～7員のヘテロシクリルを形成し；

W₁は存在しないか、または-L₁-(CR_aR_b)_m-L₁-R₆であり；

各L₁は独立して、式I-RまたはI-Sの構造の近位端から遠位端に向かって、存在しないか、-C(O)O-、-S(O₂)-、-S(O)-、-S-、-N(R₁)-C(O)-N(R₁)-、-(R₁)-C(O)-O-、-C(O)-または-S(O₂)-NR₁-であり；

R_aおよびR_bの各々は独立して、H、ハロ、アルキル、アルコキシ、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル（該アルキル、アルコキシ、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルの任意のものは、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得る）、-(CHR₄基)_mC(O)OR₄基、-(CHR₄基)_mOR₄基、-(CHR₄基)_mSR₄基、-(CHR₄基)_mN(R₄₁)R₄₂、-(CHR₄基)_mC(O)NR₄₁R₄₂、-(CHR₄基)_mC(O)N(R₁)(CHR₄基)_m-NR₄₁R₄₂、-(CHR₄基)_mC(O)-N(R₁)(CHR₄基)_mC(O)NR₄₁R₄₂、-(CHR₄基)_mC(O)N(R₁)-(CHR₄基)_mC(O)OR₄基、または-(CHR₄基)_m-S-S-R₄基であるか；あるいは任意の2個のR_aおよびR_bは、これらが結合している炭素原子（単数もしくは複数）と一緒にになって、R₇で（1回もしくは複数回）必要に応じて置換されたシクロアルキルまたはヘテロシクリルを形成するか；あるいはR₁と、R_aまたはR_bのうちのいずれか一方とは、これらが結合している原子（単数もしくは複数）と一緒にになって、R₇で（1回もしくは複数回）必要に応じて置換されたヘテロシクリルを形成し；

R₅は、R₇、-(CR_aR_b)_m-L₂-(CR_aR_b)_m-R₇、または-(-L₃-(CR_aR_b)_r-)S-L₃-R₇であり、ここで任意の2個の隣接する-(CR_aR_b)_m基または-(CR_aR_b)_r基の炭素原子は一緒にになって、二重結合(-C(R_a)-)または三重結合(-C(C(R_a))-)を形成し得；

R₆は、H、アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロシクロアルキルであり、これらの任意のものは、R₇で必要に応じて（1回もしくは複数回）置換され得るか、またはR₆は、-(CR_aR_b)_m-L₂-(CR_aR_b)_m-R₇であり；

各R₇は独立して、R₁～；シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルから選択される環部分であって、このような環部分が、R₁～で必要に応じて1回または複数回置換されているものであるか；あるいは1個の炭素原子が2個のR₇基を有する場合、このような2個のR₇基は、一緒にになってオキソもし

くはチオキソを形成するか、または一緒にあって、シクロアルキル、アリール、ヘテロシリルもしくはヘテロシクリルから選択される環部分を形成し、このような環部分は、R₁₀で必要に応じて1回もしくは複数回置換されており；

各R₁₀は独立して、H、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ペルハロアルコキシ、ペルハロアルキル、-(CR_aR_b)_mOH、-(CR_aR_b)_mOR₈、-(CR_aR_b)_mCN、-(CR_aR_b)_mNH(C=NH)NH₂、-(CR_aR_b)_mNR₁R₈、-(CR_aR_b)_mO(CR_aR_b)_mR₈、-(CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mR₈、-(CR_aR_b)_mC(O)R₈、-(CR_aR_b)_mC(O)OR₈、-(CR_aR_b)_mNR₁(CR_aR_b)_mC(O)OR₈、-(CR_aR_b)_mNR₁C(O)R₈、-(CR_aR_b)_mC(O)NR₁S(O)₂R₈、-(CR_aR_b)_mSR₈、-(CR_aR_b)_mS(O)₂R₈、-(CR_aR_b)_mS(O)₂NR₁R₈または-(CR_aR_b)_mNR₁S(O)₂R₈であり；

各R₈は独立して、H、アルキル、ハロアルキル、アリール、-(CR_aR_b)_m-L₂-(CR_aR_b)_m-R₁または-(L₃-(CR_aR_b)_r-)_s-L₃-R₁であり；

L₂は独立して、式I-RまたはI-Sの構造の近位端から遠位端に向かって、存在しないか、-O-、-OC(O)-、-NR₁-、-C(O)NR₁-、-N(R₁)-C(O)-、-S(O₂)-、-S(O)-、-S-、-C(O)-または-S(O₂)-N(R₁)-であり；

各L₃は独立して、存在しないか、-O-、または-N(R₁)-であり、

各mは独立して、0、1、2、3、4、5または6であり；

各nは独立して、0または1または2であり；

pは、0、1、2または3であり；

qは、0、1、2または3であり；

各rは独立して、2、3、または4であり；そして

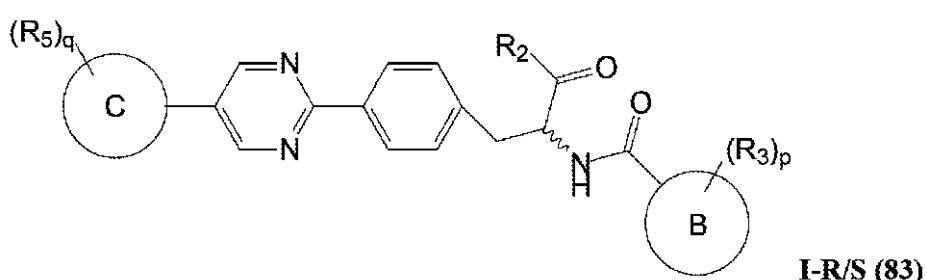
各sは独立して、1、2、3、または4である、

化合物。

(項目2)

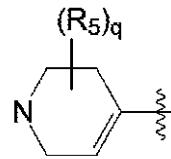
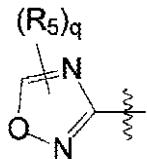
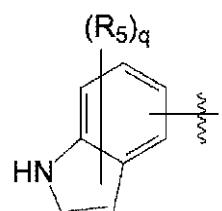
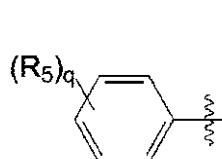
以下の構造：

【化488】

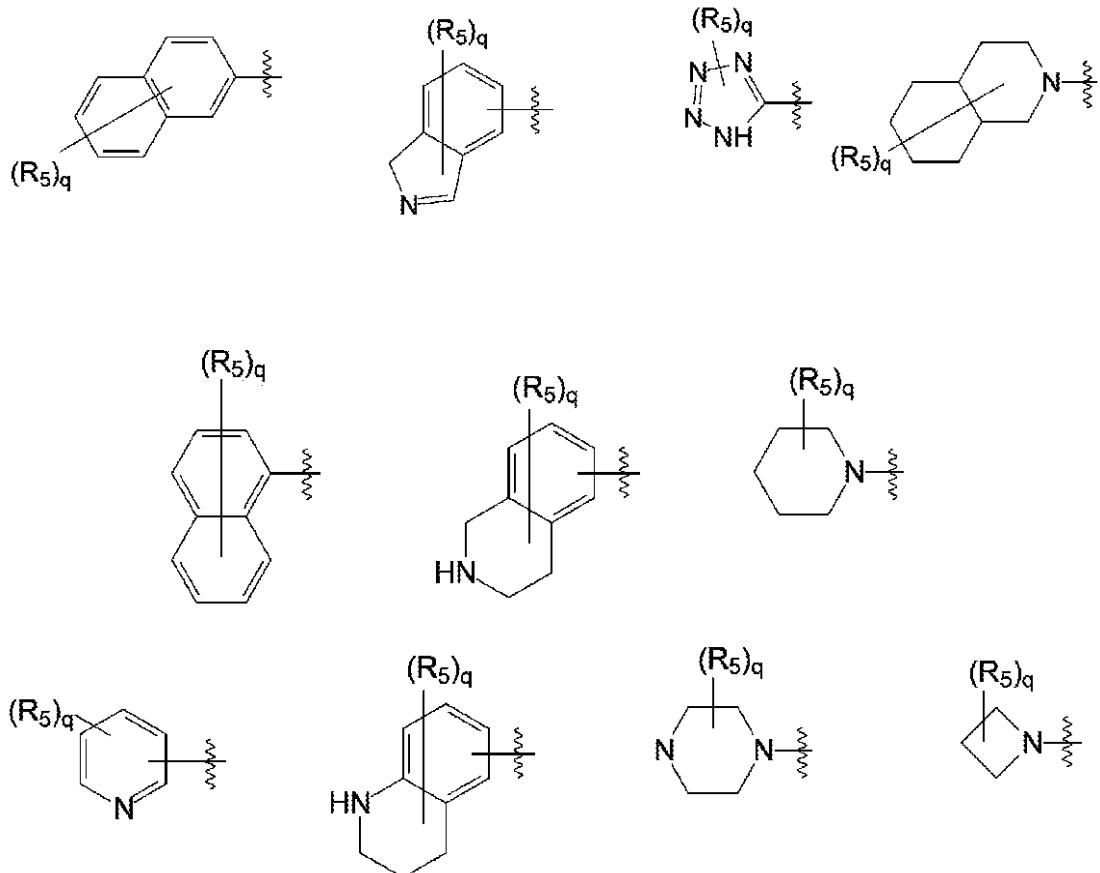


を有する、項目1に記載の化合物であって、C(R₅)_qは、以下：

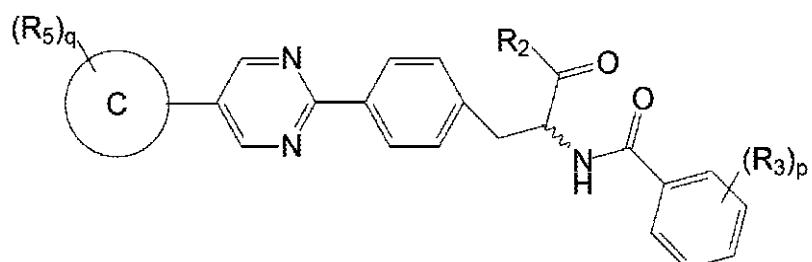
【化489】



【化490】

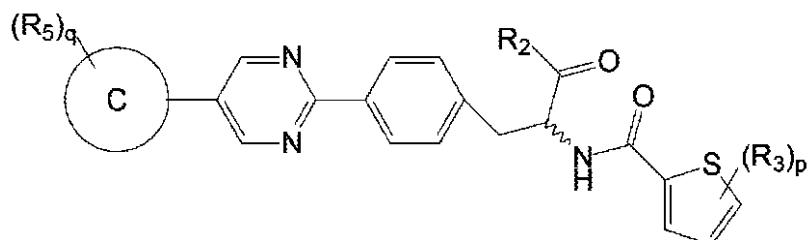
のうちの 1 つから選択される、化合物。(項目 3)以下の構造 :

【化491】



I R/S (84) または

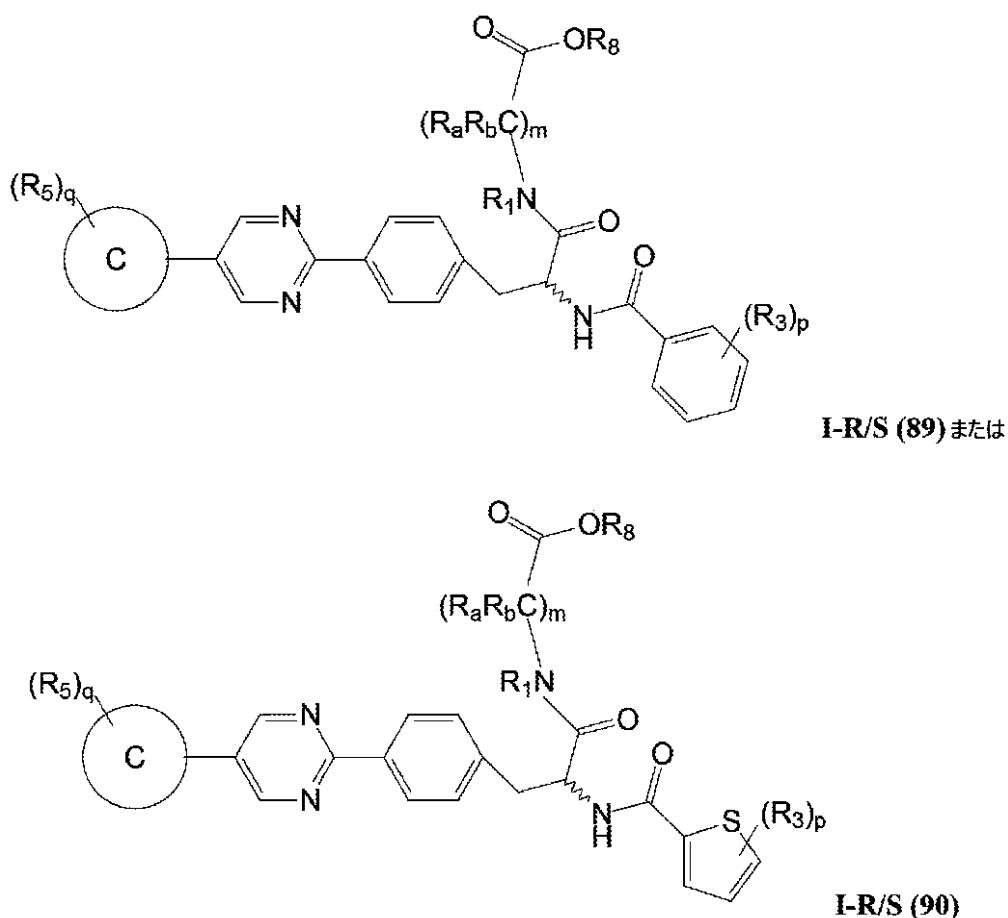
【化492】



I-R/S (85)

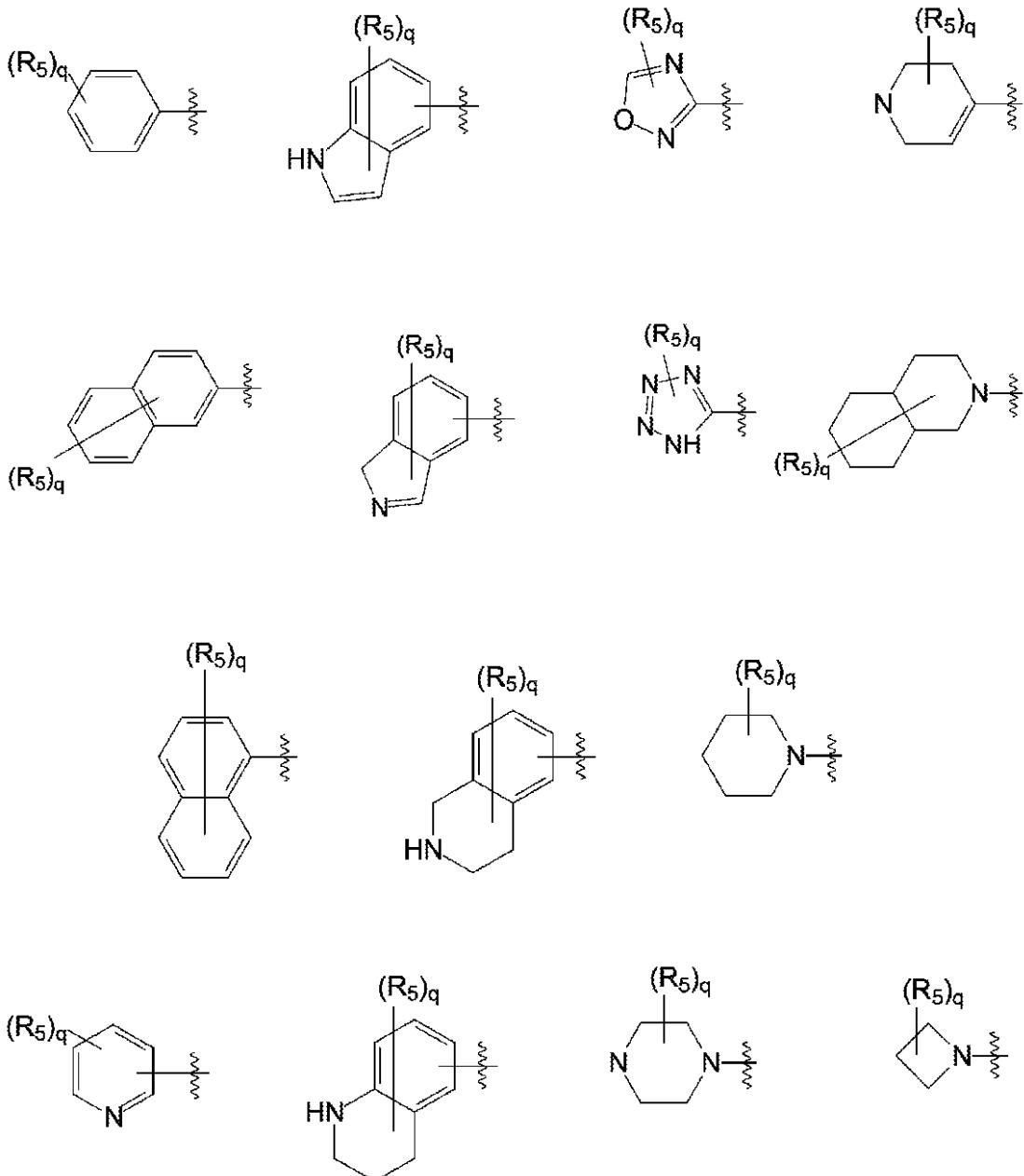
を有する、項目 2 に記載の化合物。(項目 4)

以下の構造：
【化 4 9 3】



を有する、項目 1 に記載の化合物であって、C (R₅)_q は、以下：

【化494】

のうちの1つから選択される、化合物。(項目5)pが1であり、そしてR₃がアルキルである、項目2～4のいずれか1項に記載の化合物。(項目6)pが1であり、そしてR₃がtert-ブチルである、項目2～4のいずれか1項に記載の化合物。(項目7)qが1であり、そしてR₅がアルコキシである、項目2～4のいずれか1項に記載の化合物。(項目8)qが1であり、そしてR₅がC₄～₈アルコキシである、項目2～4のいずれか1項に記載の化合物。(項目9)

q が 1 であり、そして R₅ が C₇ アルコキシである、項目 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

q が 1 であり、そして R₅ がアルキルである、項目 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 11)

q が 1 であり、そして R₅ が C_{1 ~ 4} アルキルである、項目 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 12)

q が 1 であり、そして R₅ が、R_{1 ~ 0} で置換されたシクロアルキルである、項目 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 13)

R_{1 ~ 0} がアルキルである、項目 12 に記載の化合物。

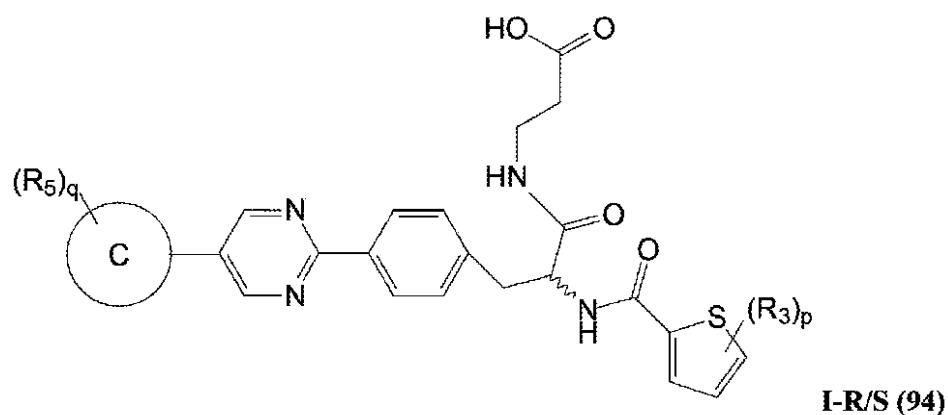
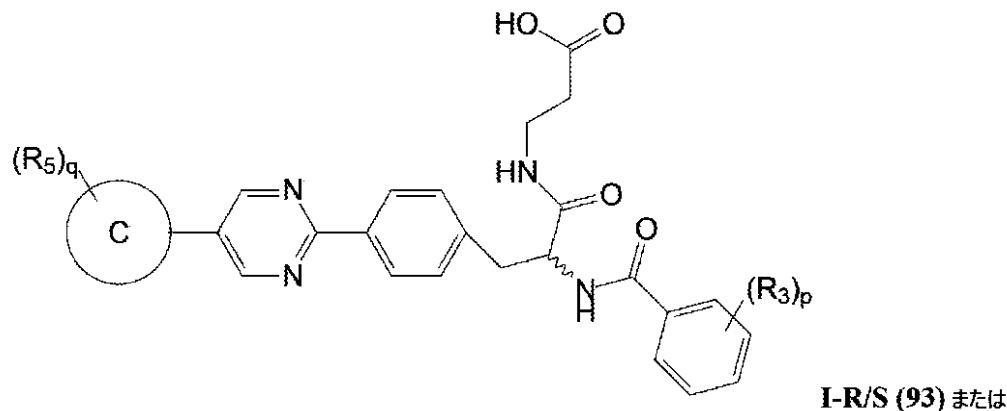
(項目 14)

R₅ がシクロヘキシルであり、そして R_{1 ~ 0} が n - プロピルである、項目 12 に記載の化合物。

(項目 15)

以下の構造 :

【化 495】

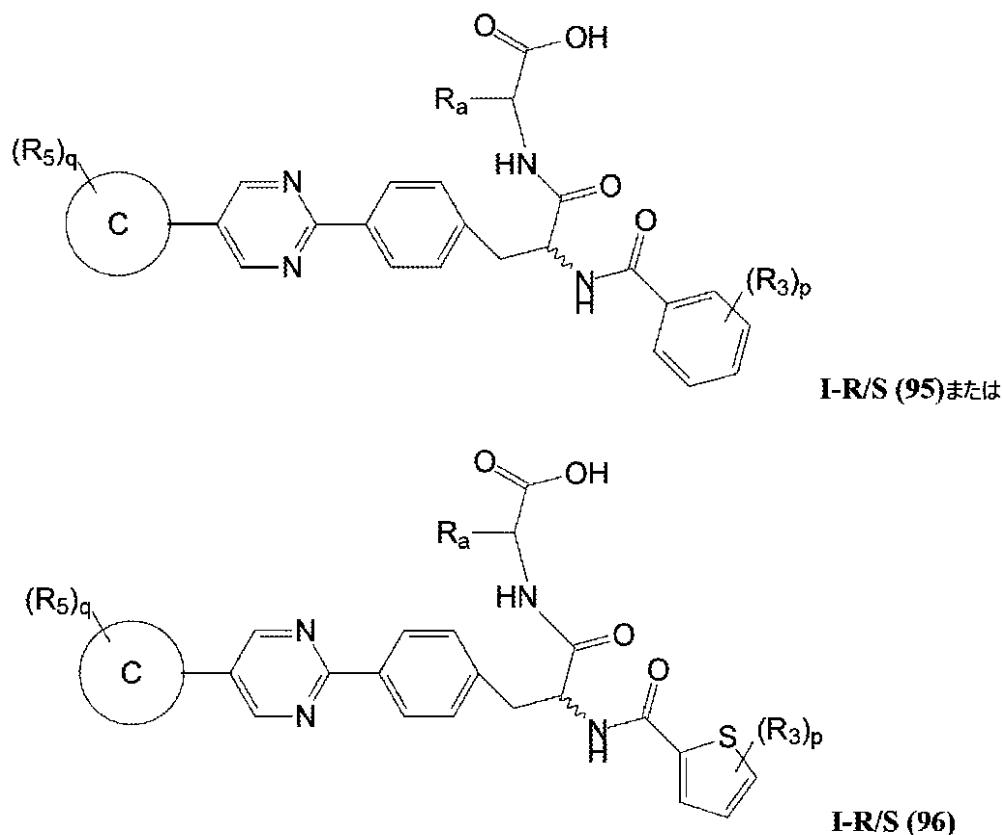


を有する、項目 4 に記載の化合物。

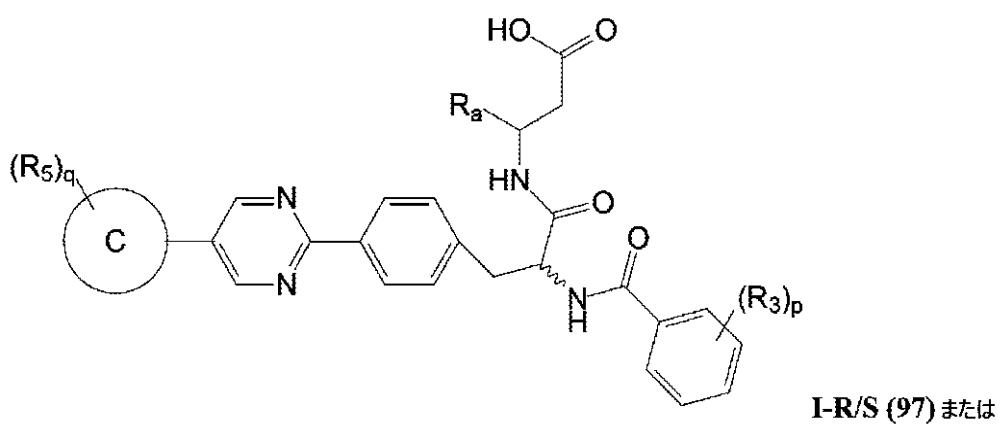
(項目 16)

以下の構造 :

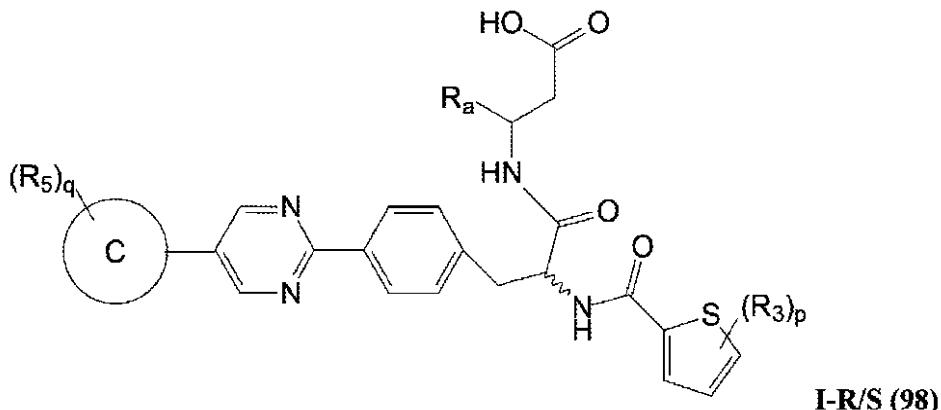
【化496】

を有する、項目4に記載の化合物。(項目17)以下の構造：

【化497】



【化498】

を有する、項目4に記載の化合物。(項目18) R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたアルキルである、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目19)アルキルは、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、sec-ブチルおよびtert-ブチルから選択される直鎖または分枝鎖のアルキルである、項目18に記載の化合物。(項目20)アルキルは、イソプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルから選択されるシクロアルキルである、項目18に記載の化合物。(項目21) R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたヘテロシクリル、または R_7 で必要に応じて置換されたヘテロシクリルアルキルである、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目22) R_a は、 R_7 で必要に応じて置換されたアリール、または R_7 で必要に応じて置換されたアラルキルである、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目23) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mC(O)OR_{40}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目24) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mOR_{40}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目25) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mSR_{40}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目26) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mNR_{41}R_{42}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目27) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mC(O)NR_{41}R_{42}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。(項目28) R_a が $-\left(CH_{R_{40}}\right)_mC(O)N(R_1)\left(CH_{R_{40}}\right)_m-NR_{41}R_{42}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目29)

R_a が $-(CH_2R_{40})_mC(=O)N(R_1)(CH_2R_{40})_m-C(=O)NR_{41}R_{42}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目30)

R_a が $-(CH_2R_{40})_mC(=O)N(R_1)(CH_2R_{40})_m-C(=O)OR_{40}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。

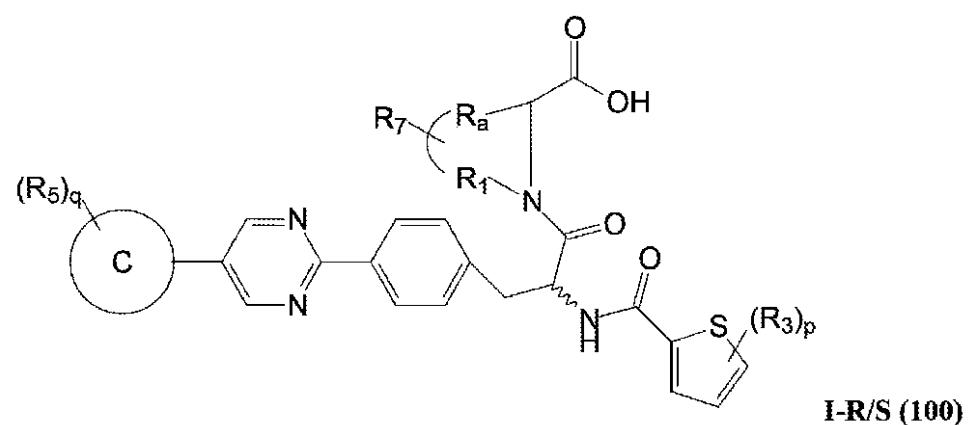
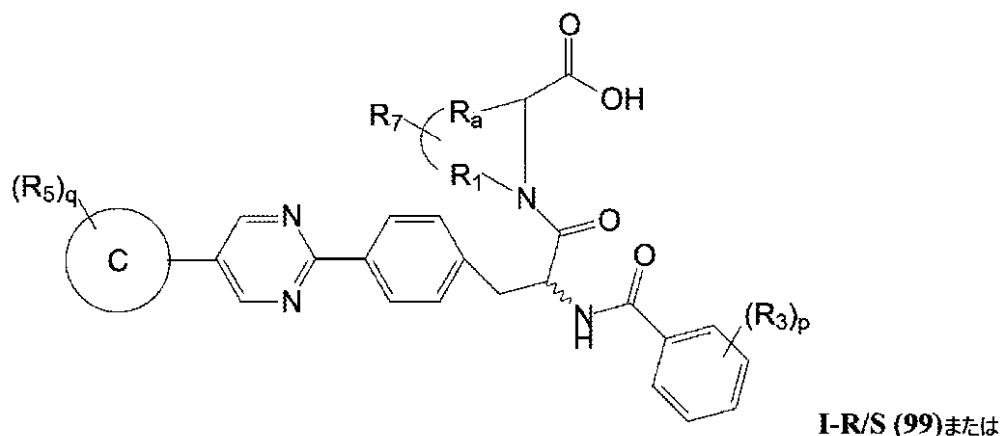
(項目31)

R_a が $-(CH_2R_{40})_m-S-S-R_{40}$ である、項目16～17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目32)

以下の構造：

【化499】

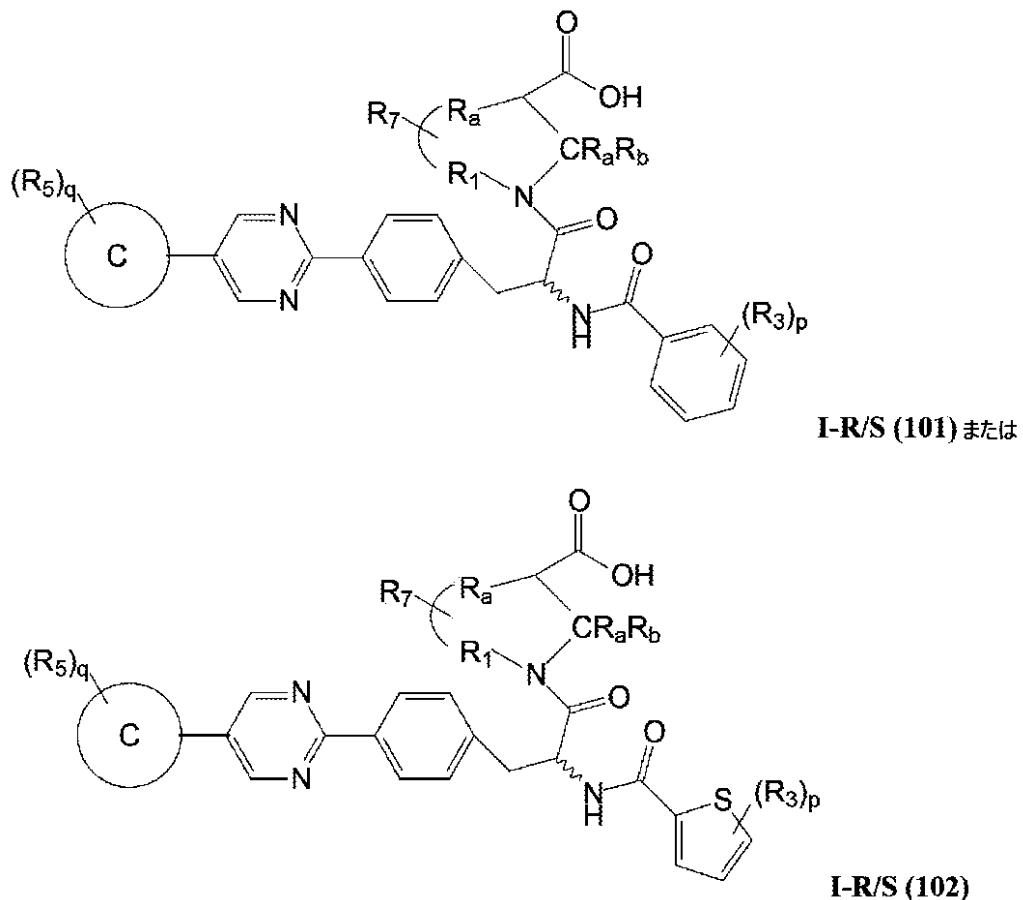


を有する、項目4に記載の化合物。

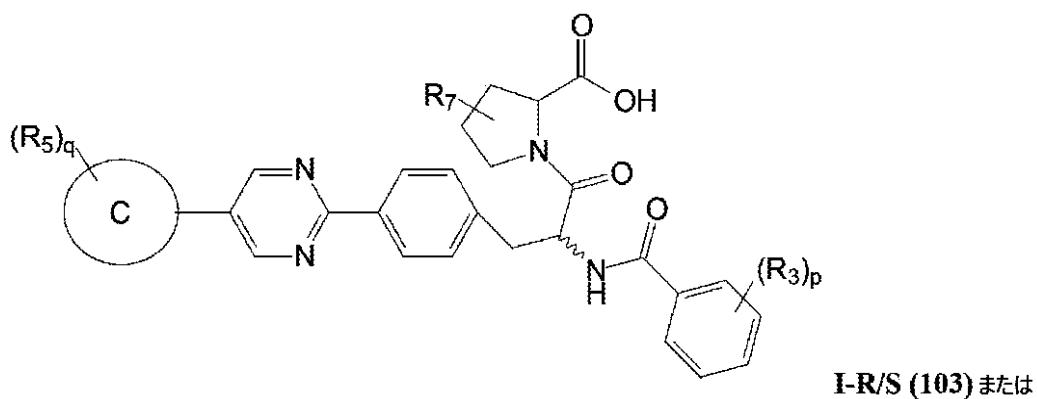
(項目33)

以下の構造：

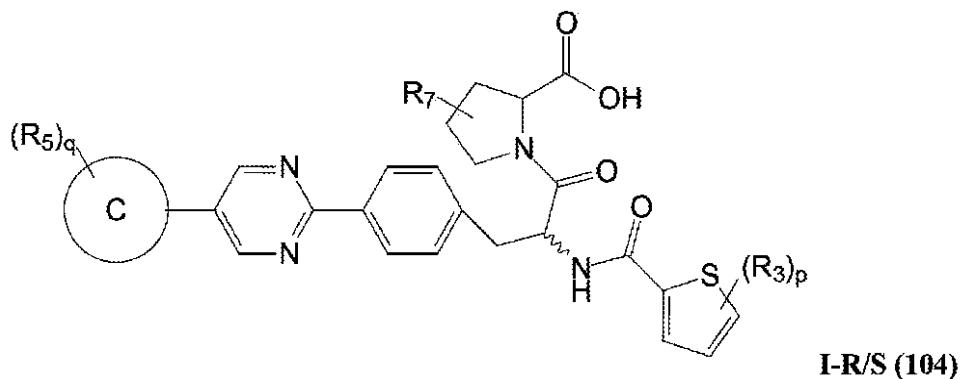
【化 5 0 0】

を有する、項目 4 に記載の化合物。(項目 3 4)以下の構造：

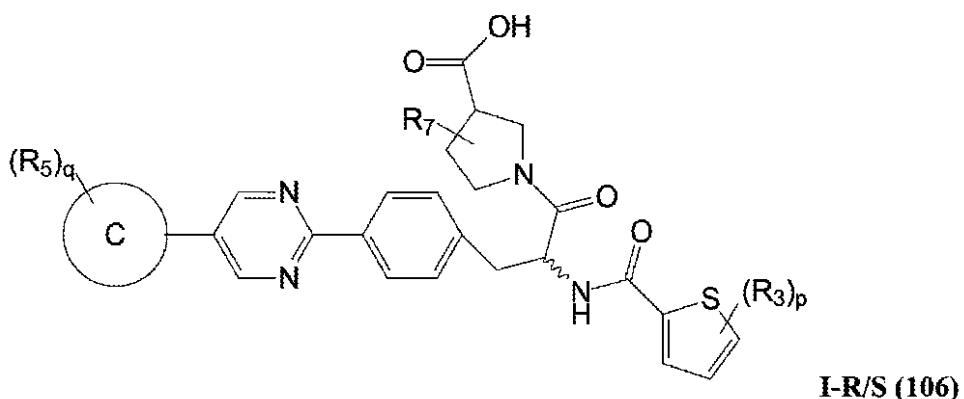
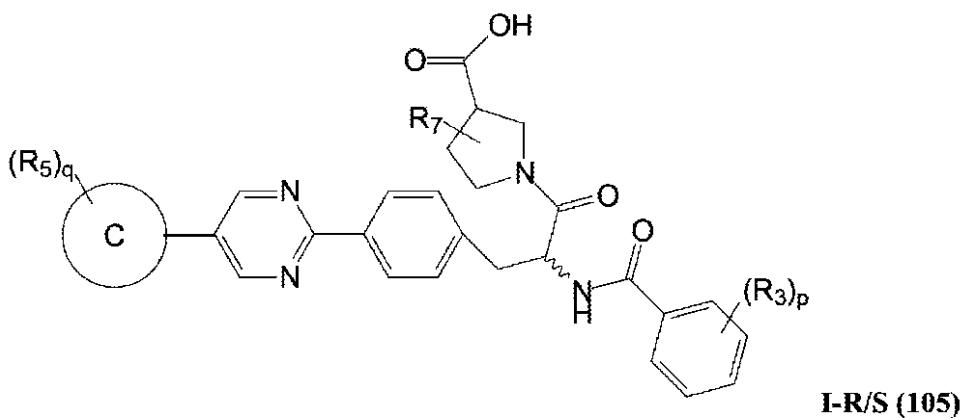
【化 5 0 1】



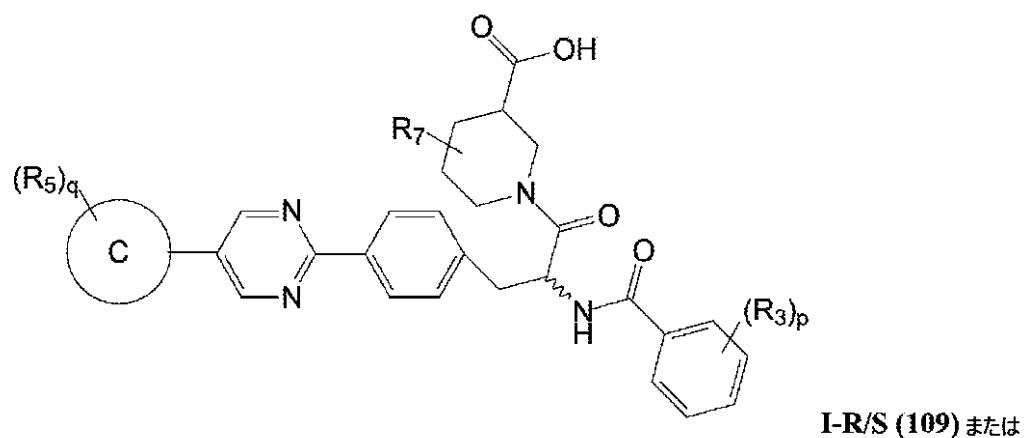
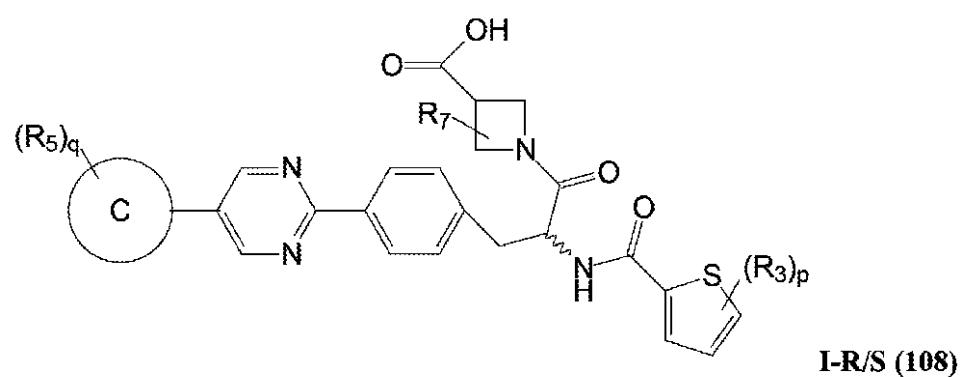
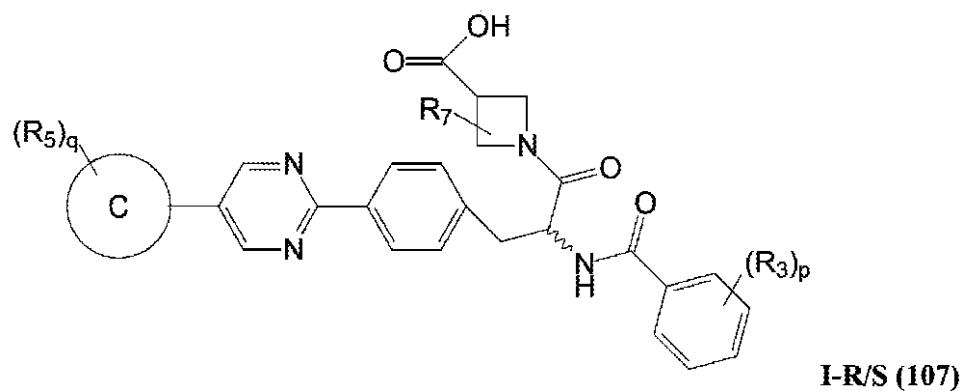
【化 5 0 2】

を有する、項目 3 2 に記載の化合物。(項目 3 5)以下の構造 :

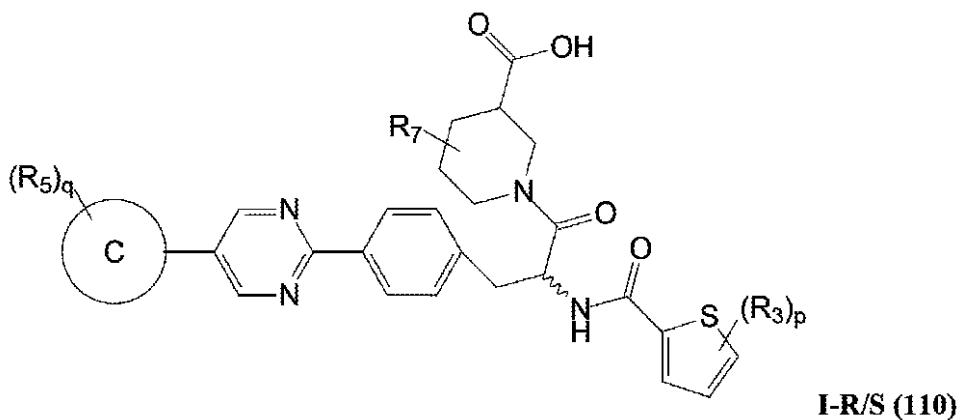
【化 5 0 3】



【化 5 0 4】



【化 5 0 5】



を有する、項目 3 3 に記載の化合物。

(項目 3 6)

R₃ がアルキルであり、そして p が 1 である、項目 3 2 ~ 3 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 7)

R₃ が t e r t - ブチルである、項目 3 6 に記載の化合物。

(項目 3 8)

R₅ が、R₁₀ で置換されたシクロアルキルであり、そして q が 1 である、項目 3 2 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 9)

R₁₀ がアルキルである、項目 3 8 に記載の化合物。

(項目 4 0)

R₅ がシクロヘキシルであり、そして R₁₀ が n - プロピルである、項目 3 8 に記載の化合物。

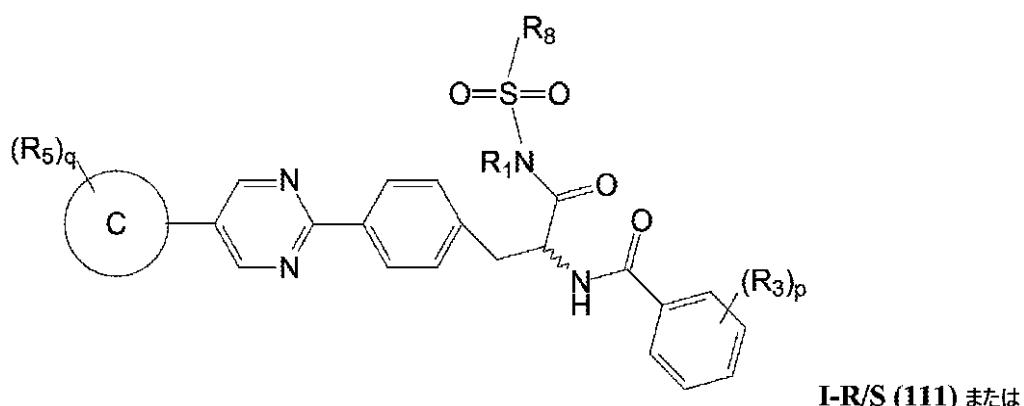
(項目 4 1)

R₇ が水素である、項目 3 2 ~ 4 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

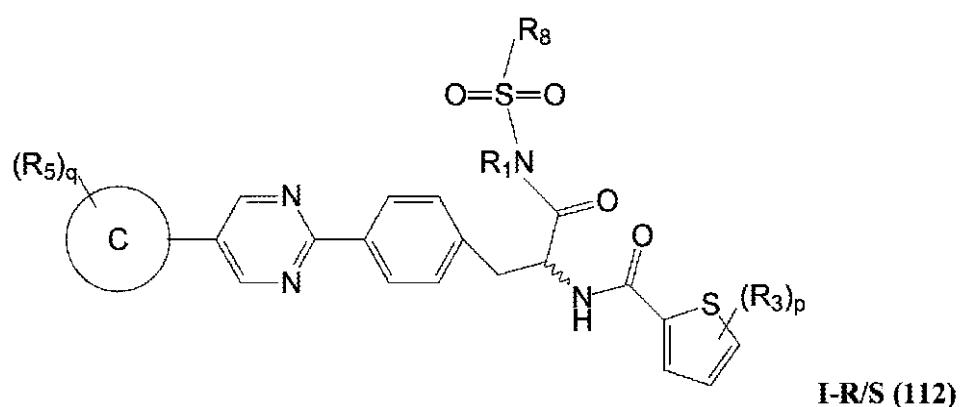
(項目 4 2)

以下の構造：

【化 5 0 6 】



【化 5 0 7 】



を有する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4 3)

R₁ が水素である、項目 4 2 に記載の化合物。

(項目 4 4)

R₃ がアルキルであり、そして p が 1 である、項目 4 2 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目45)

R₃ が t e r t - ブチルである、項目44に記載の化合物。

(項目46)

R₅ が、R₁₀ で置換されたシクロアルキルであり、そしてqが1である、項目42～45のいずれか1項に記載の化合物。

(項目47)

R₁₀ がアルキルである、項目46に記載の化合物。

(項目48)

R₅ がシクロヘキシルであり、そしてR₁₀ がn - プロピルである、項目46に記載の化合物。

(項目49)

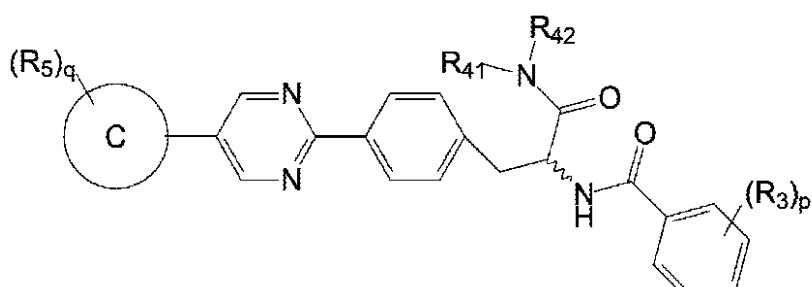
R₈ がアルキルである、項目42～48のいずれか1項に記載の化合物。

(項目50)

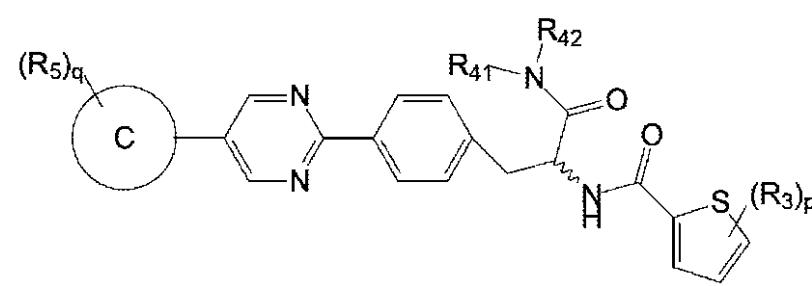
R₈ がメチルである、項目49に記載の化合物。

(項目51)

以下の構造：

【化508】

I-R/S (115) または

【化509】

I-R/S (116)

を有する、項目1に記載の化合物。(項目52)

R₄₁ および R₄₂ は独立して、R₄₀、- (C H R₄₀)_n - C (O) O R₄₀、- (C H R₄₀)_n - C (O) R₄₀、- (C H₂)_n N (R₁) (R₇)、R₇ で必要に応じて置換されたアリール、または R₇ で必要に応じて置換されたヘテロアリールである、項目51に記載の化合物。

(項目53)

R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が、R₇ で必要に応じて置換されたアルキルである、項目51に記載の化合物。

(項目54)

R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が - (C H R₄₀)_n C (O) O R₄₀ である、項目51に記載の化合物。

(項目 5 5)

R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が - (C H R₄₀)_n C (O) R₄₀ である、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 5 6)

R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が - (C H₂)_n N (R₁) (R₇) である、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 5 7)

R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が、R₇ で必要に応じて置換されたアリールである、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 5 8)

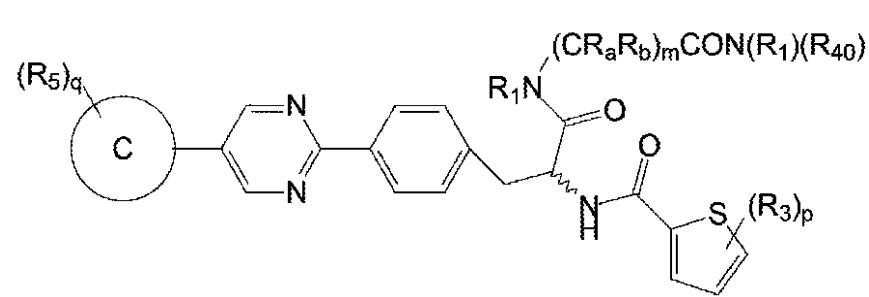
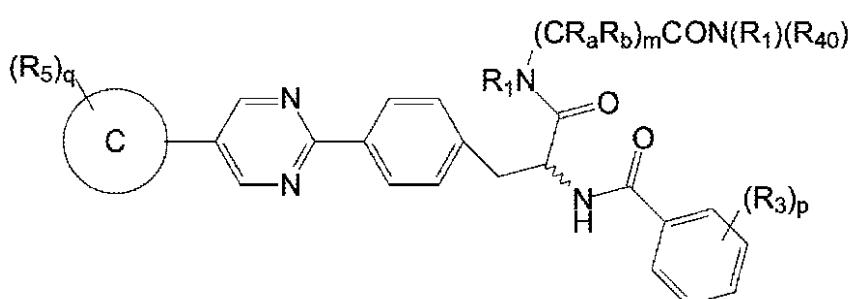
R₄₁ が水素であり、そして R₄₂ が、R₇ で必要に応じて置換されたヘテロアリールである、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 5 9)

R₄₁ と R₄₂ とは、これらが結合している N 原子と一緒にになって、R₇ で必要に応じて置換された 3 員～7 員のヘテロシクリルを形成する、項目 5 1 に記載の化合物。

(項目 6 0)

構造：

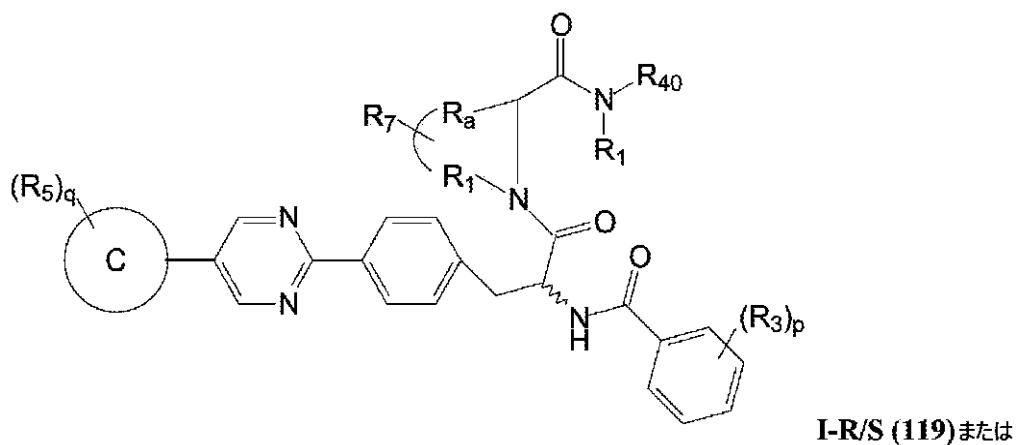
【化 5 1 0 】

を有する、項目 1 に記載の化合物。

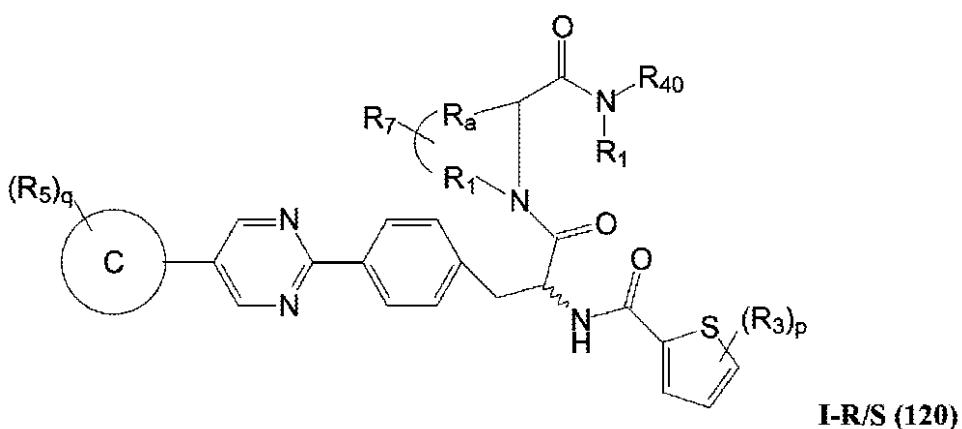
(項目 6 1)

以下の構造：

【化 5 1 1】



【化 5 1 2】

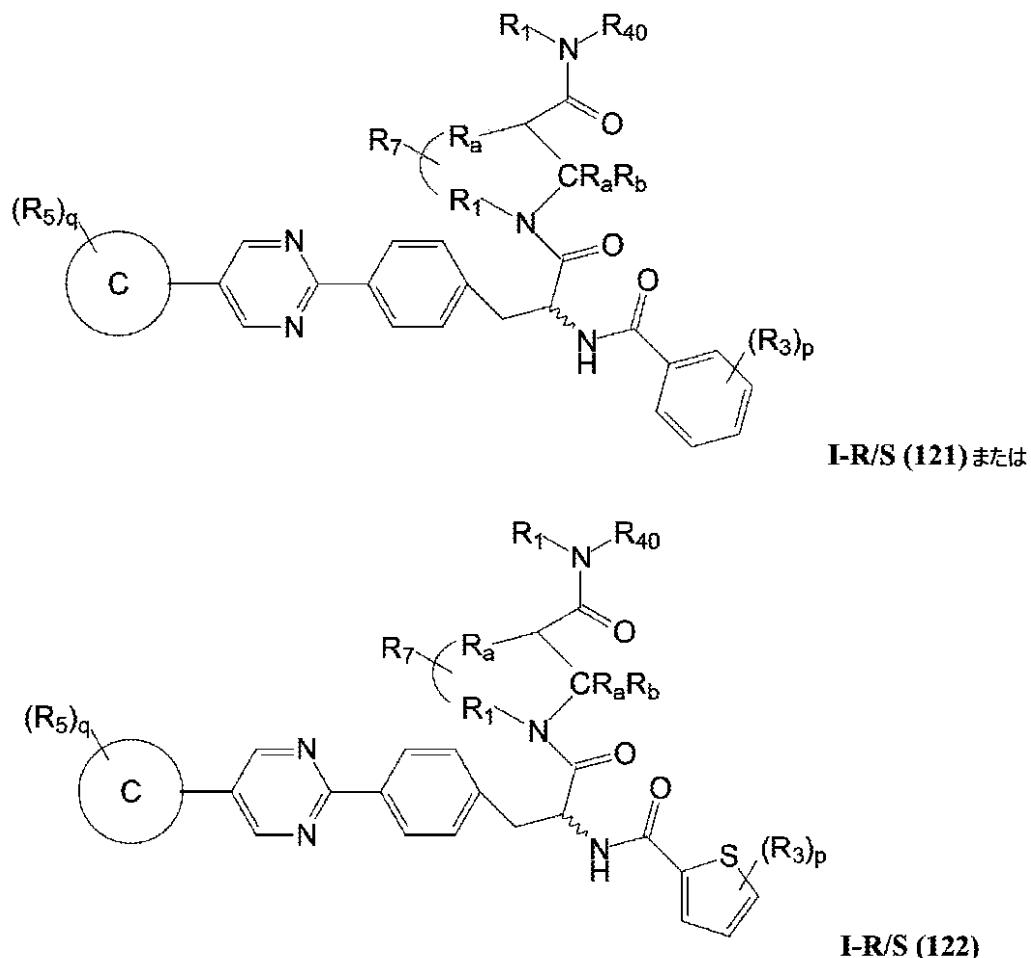


を有する、項目 6 0 に記載の化合物。

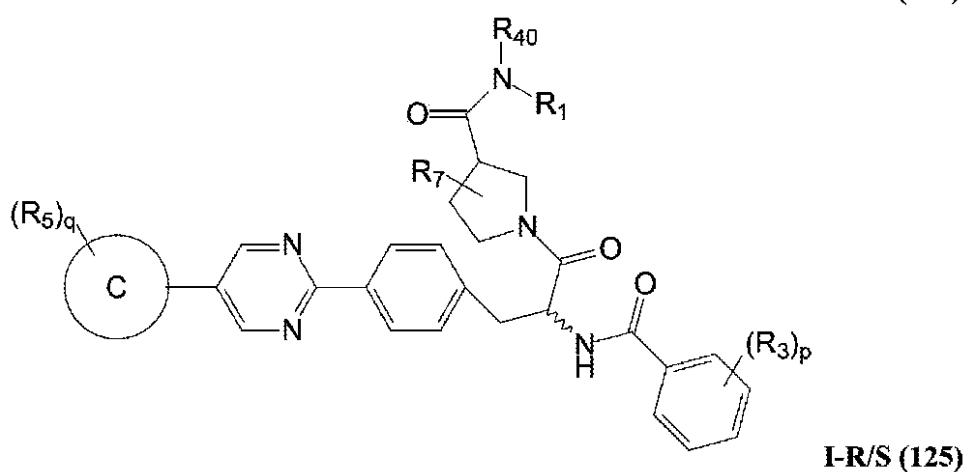
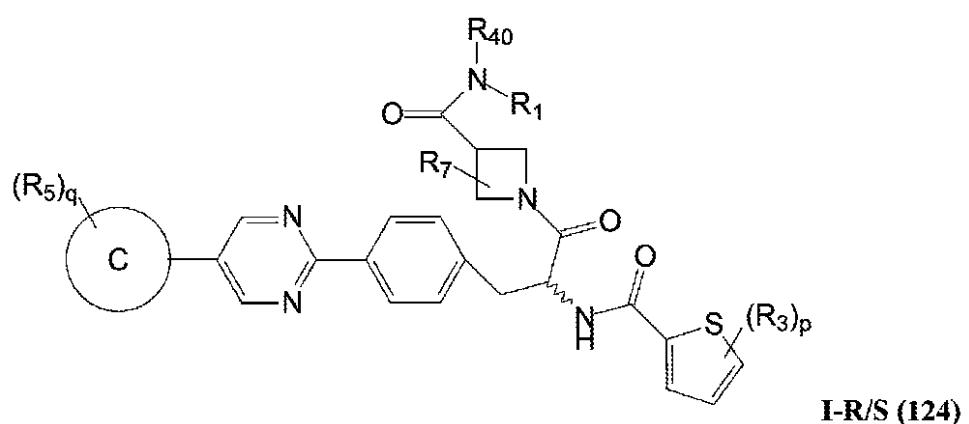
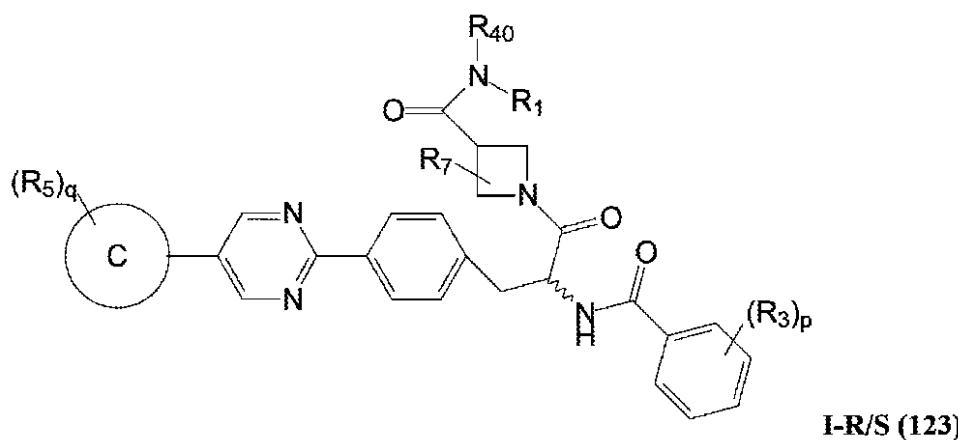
(項目 6 2)

以下の構造：

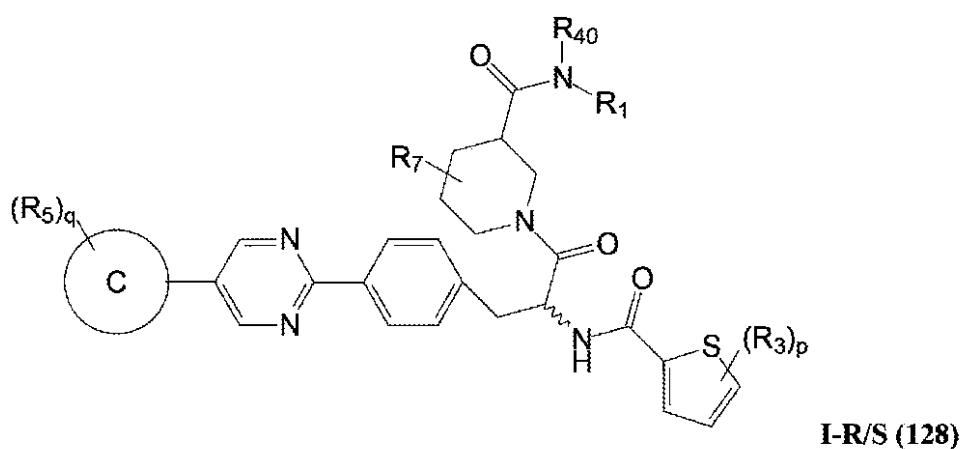
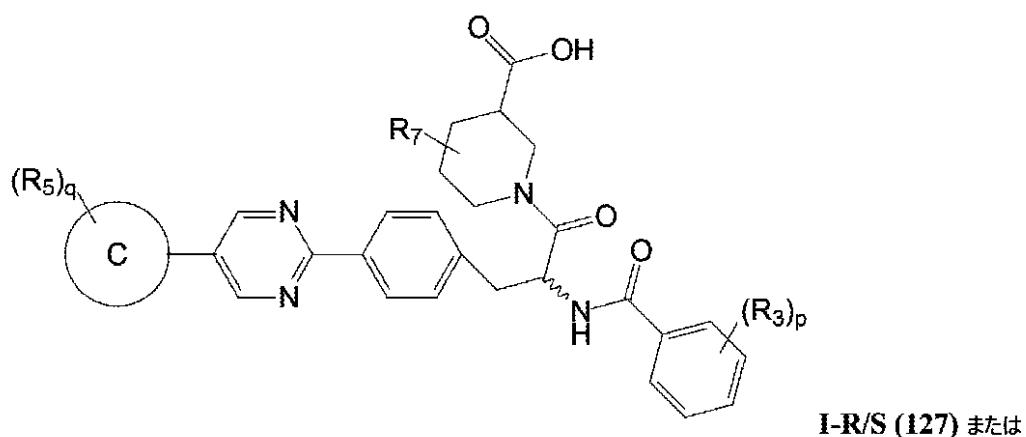
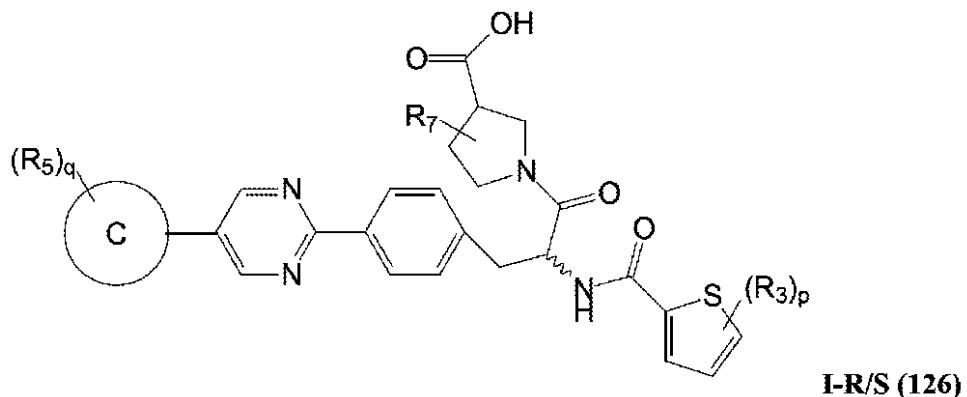
【化 5 1 3】

を有する、項目 6 0 に記載の化合物。(項目 6 3)以下の構造：

【化 5 1 4】



【化 5 1 5】

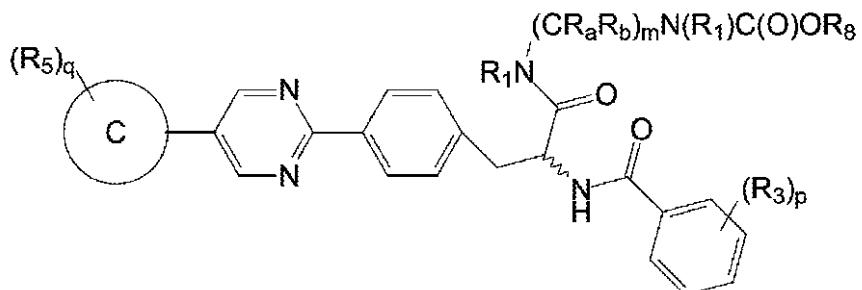
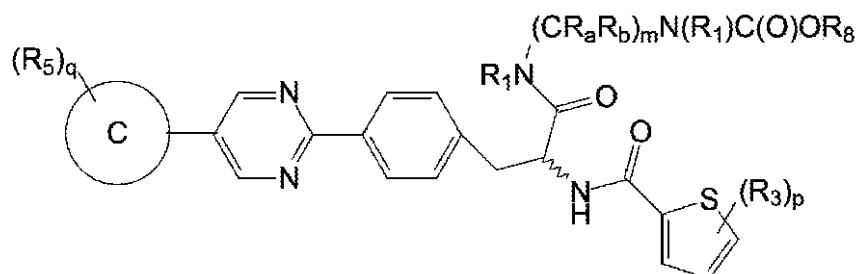


を有する、項目 6 2 に記載の化合物。

(項目 6 4)

構造

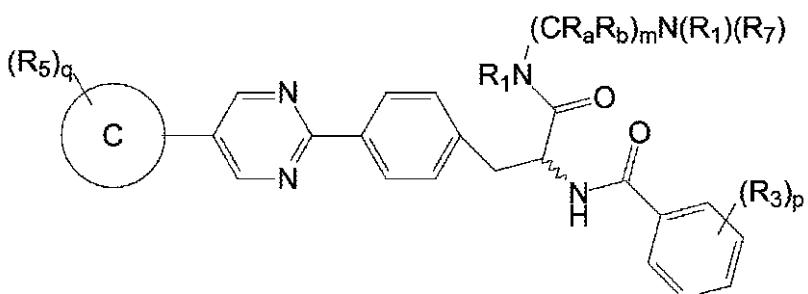
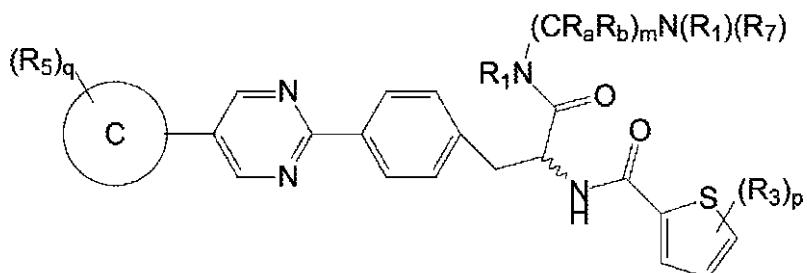
【化516】

I-R/S (129) または
I-R/S (130)

I-R/S (130)

を有する、項目1に記載の化合物。(項目65)構造：

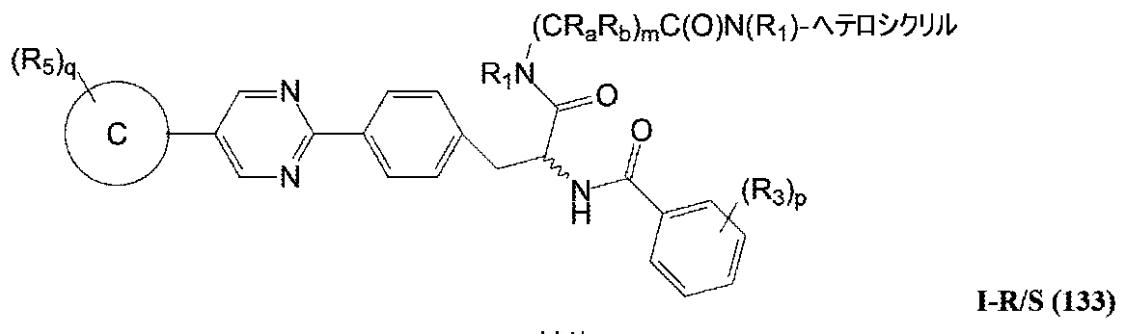
【化517】

I-R/S (131) または
I-R/S (132)

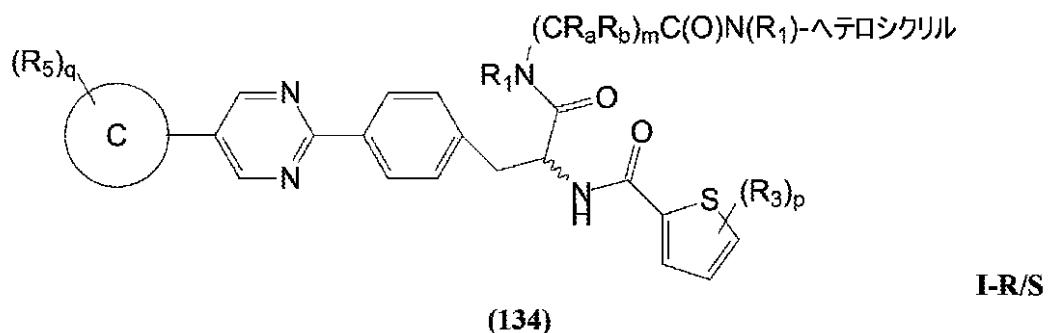
I-R/S (132)

を有する、項目1に記載の化合物。(項目66)構造：

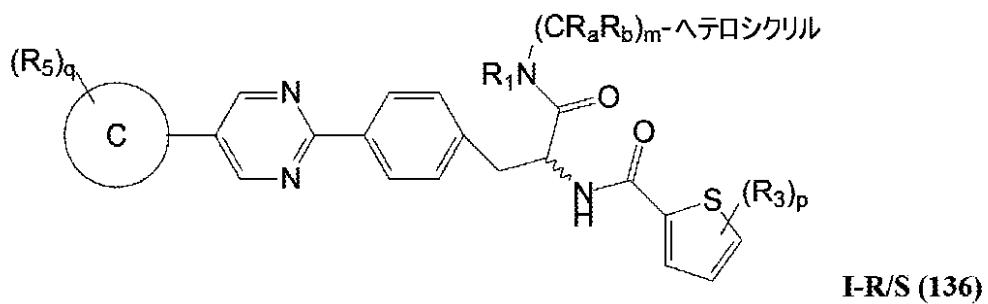
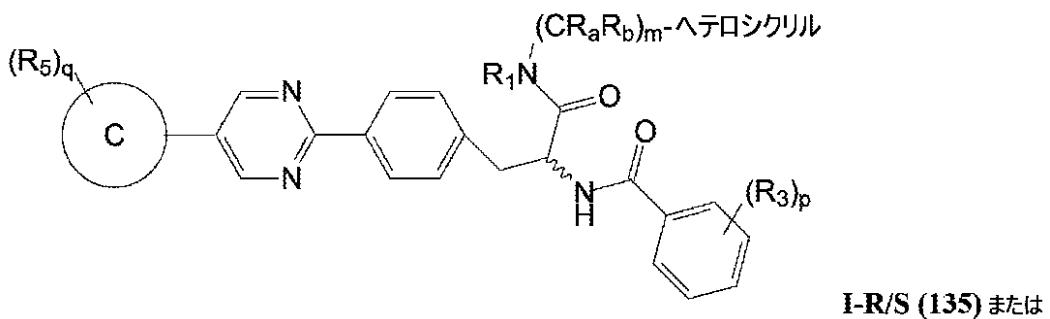
【化518】



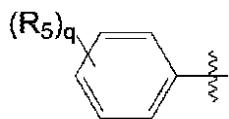
または

を有する、項目1に記載の化合物。(項目67)構造：

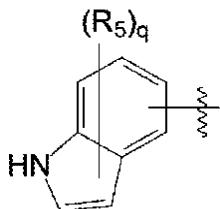
【化519】

を有する、項目1に記載の化合物。(項目68) $C(R_5)_q$ が：

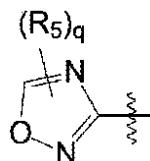
【化520】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目69)C(R₅)_qが：

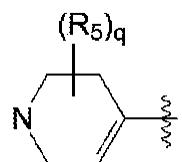
【化521】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目70)C(R₅)_qが：

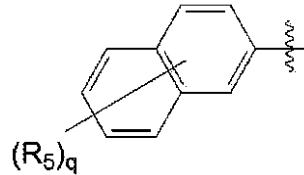
【化522】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目71)C(R₅)_qが：

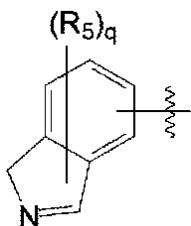
【化523】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目72)C(R₅)_qが：

【化524】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目73)

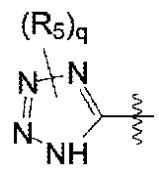
C (R₅)_q が :
【化 5 2 5】



である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 4)

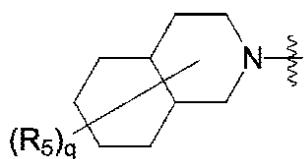
C (R₅)_q が :
【化 5 2 6】



である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 5)

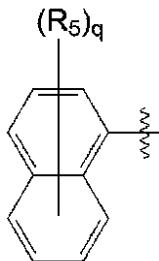
C (R₅)_q が :
【化 5 2 7】



である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 6)

C (R₅)_q が :
【化 5 2 8】

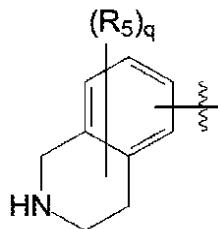


である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

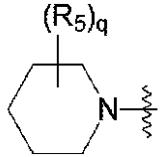
(項目 7 7)

C (R₅)_q が :

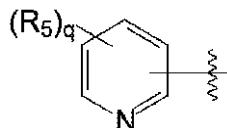
【化529】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目78)C (R₅)_q が：

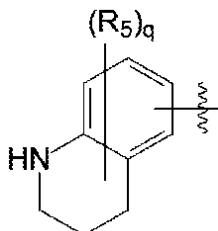
【化530】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目79)C (R₅)_q が：

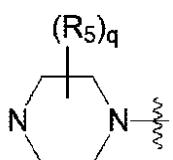
【化531】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目80)C (R₅)_q が：

【化532】

である、項目1～67のいずれか1項に記載の化合物。(項目81)C (R₅)_q が：

【化533】

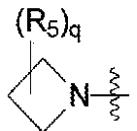


である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 2)

C (R₅)_q が :

【化 5 3 4】



である、項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 3)

前記化合物が、表 1 の化合物 1 ~ 1 5 5 3 のうちのいずれか 1 つ、あるいはその薬学的に受容可能な異性体、エナンチオマー、ラセミ体、塩、エステル、プロドラッグ、水和物または溶媒和物の構造を有する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8 4)

項目 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を、少なくとも 1 種の薬学的に受容可能なキャリア、希釈剤または賦形剤と一緒に含有する、薬学的組成物。

(項目 8 5)

項目 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物および第二の医薬を含有する、薬学的組み合わせ物。

(項目 8 6)

前記第二の医薬が、グルカゴンレセプター、G I P レセプター、G L P - 2 レセプター、または P T H レセプター、またはグルカゴン様ペプチド 1 (G L P - 1) レセプターに対するアゴニスト、アンタゴニスト、またはモジュレーターである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 8 7)

前記第二の医薬が、エクセナチド、リラグルチド、タスボグルチド、アルビグルチド、またはリキシセナチドである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 8 8)

前記第二の医薬が D P P I V 阻害剤である、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 8 9)

前記第二の医薬がシタグリップチンである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 9 0)

前記第二の医薬が、ビグアナイド、スルホニル尿素、メグリチニド、チアゾリジンジオン、- グルコシダーゼ阻害剤、S G L T 2 阻害剤、胆汁酸吸着剤、および / またはドパミン - 2 アゴニストである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 9 1)

前記第二の医薬がメトホルミンである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 9 2)

前記第二の医薬が、ダパグリフロジン、エンパグリフロジンまたはカナグリフロジンである、項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物。

(項目 9 3)

グルカゴン様ペプチド 1 レセプターの活性化、増強、調節またはアゴニズムの方法であって、該レセプターを、有効量の項目 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、または項目 8 4 に記載の薬学的組成物、または項目 8 5 に記載の薬学的組み合わせ物と接触させる工程を包含する、方法。

(項目 9 4)

グルカゴン様ペプチド 1 レセプターを増強する方法であって、該レセプターを、項目 1 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と、G L P - 1 (7 - 3 6)、G L P - 1 (9 - 3 6) および / またはオキシントモジュリンの存在下で接触させる工程を包含する、方法。

(項目95)

グルカゴン様ペプチド1レセプターの活性化、増強、調節またはアゴニズムが医学的に必要である患者における異常状態の処置の方法であって、有利な効果を該患者に与えるために十分な頻度および持続時間で、有効量の項目1～83のいずれか1項に記載の化合物を該患者に投与する工程を包含する、方法。

(項目96)

前記異常状態は、I型糖尿病、II型糖尿病、妊娠糖尿病、肥満症、食欲亢進、満腹感不足、代謝異常、非アルコール性脂肪肝疾患または非アルコール性脂肪性肝炎である、項目95に記載の方法。

(項目97)

前記異常状態がII型糖尿病である、項目95に記載の方法。

(項目98)

前記異常状態が非アルコール性脂肪肝疾患または非アルコール性脂肪性肝炎である、項目95に記載の方法。