

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載
 【部門区分】第3部門第2区分
 【発行日】令和7年5月1日(2025.5.1)

【国際公開番号】WO2022/223025
 【公表番号】特表2024-514338(P2024-514338A)
 【公表日】令和6年4月1日(2024.4.1)
 【年通号数】公開公報(特許)2024-059
 【出願番号】特願2023-564007(P2023-564007)
 【国際特許分類】

10

- C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 4 4 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 7 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 7 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)
- A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

20

【 F I 】

- C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 C S P
- C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 3
- C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1
- C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1
- C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 6
- C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 Z
- C 0 7 D 4 9 8 / 0 4 1 1 1
- C 0 7 D 4 1 3 / 1 4
- A 6 1 K 3 1 / 4 4 4
- A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 6
- A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 9
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 7
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9
- A 6 1 K 3 1 / 5 1 7
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3
- A 6 1 K 3 1 / 5 3 8

30

40

50

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】令和7年4月22日(2025.4.22)

【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

10

【補正方法】変更

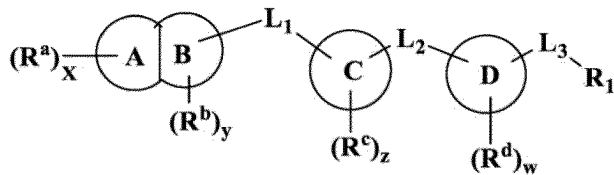
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)

【化1】



20

(I)

(式中、環A、環B、環C及び環Dは、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、

R_1 は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)NR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{22}(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-OC(R_{11}R_{22})_n(CH_2)_{n1}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}S(O)_mR_{33}$ からなる群から選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは各々場合により更に置換されていてもよく、

30

R_{11} 、 R_{22} 及び R_{33} は、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、重水素化アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、シアノで置換されたアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、重水素化アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、シアノで置換されたアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

40

L_1 、 L_2 及び L_3 は、結合、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、 $-(CH_2)_n-$ 、 $-(CH_2)_nC(O)(CR_{aa}R_{bb})_{n1}-$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{aa}(CH_2)_{n1}-$ 、 $-(CH_2)_n(CR_{aa}R_{bb})_{n2}-$ 、 $-(CR_{aa}R_{bb})_nO(CH_2)_{n1}-$ 、 $-(CH_2)_nO(CR_{aa}R_{bb})_{n1}-$ 、 $-(CR_{aa}R_{bb})_n3S(CH_2)_{n4}-$ 、 $-(CH_2)_nS(CR_{aa}R_{bb})_{n3}-$ 、 $-(CR_{aa}R_{bb})_{n3}(CH_2)_nNR_{cc}-$ 、 $-(CH_2)_nNR_{aa}(CR_{bb}R_{cc})_n-$ 、 $-(CH_2)_nNR_{aa}C(O)-$ 、 $-(CH_2)_nP(O)_pR_{aa}-$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_m-$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mNR_{aa}-$ 及び $-(CH_2)_nNR_{aa}S(O)_m-$ からなる群から各々独立して選択され、

50

ールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

R_{c1} 、 R_{c2} 及び R_{c3} は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

各 R^d は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)OR_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)NR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{d2}(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-OC(R_{d1}R_{d2})_n(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{d2}S(O)_mR_{d3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

R_{d1} 、 R_{d2} 及び R_{d3} は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

w 、 x 、 y 及び z は、各々独立して、1、2、3又は4であり、

各 m は、独立して0、1又は2であり、

各 n は、独立して0、1、2、3又は4であり、

各 p は、独立して0又は1であり、

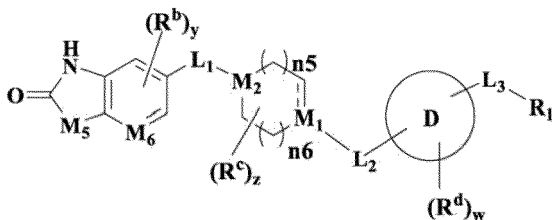
n_1 、 n_2 、 n_3 及び n_4 は、各々独立して、0、1、2、3又は4である)

の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

式(III)

【化2】



(III)

(式中、

【化3】

≡

は単結合又は二重結合であり、

L_1 は、結合、 $-(CH_2)_nC(O)(CR_{aa}R_{bb})_{n1}-$ 、 $-(CH_2)_n(CR_{aa}R_{bb})_{n2}-$ 又は $-(CR_{aa}R_{bb})_{n3}-$

10

20

30

40

50

) n O(CH $_2$) n_1 -であり、

L $_2$ は、結合又は-(CH $_2$) n (CR $_{aa}$ R $_{bb}$) n_2 -であり、

L $_3$ は、結合、-(CH $_2$) n C(O)(CR $_{aa}$ R $_{bb}$) n_1 -、-(CH $_2$) n C(O)NR $_{aa}$ (CH $_2$) n_1 -、-(CH $_2$) n (CR $_{aa}$ R $_{bb}$) n_2 -、-(CR $_{aa}$ R $_{bb}$) n O(CH $_2$) n_1 -及び-(CH $_2$) n NR $_{aa}$ (CR $_{bb}$ R $_{cc}$) n -からなる群から選択され、

R $_{aa}$ 、R $_{bb}$ 及びR $_{cc}$ は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル及びアルキニルからなる群から各々独立して選択されるか、

又は、R $_{aa}$ 、R $_{bb}$ 及びR $_{cc}$ のいずれか2つは結合してシクロアルキルを形成し、

M $_1$ はN、C又はCR $_2$ であり、

M $_2$ はN又はCR $_3$ であり、

M $_5$ は-CR $_6$ R $_7$ -、-CR $_6$ R $_7$ -CR $_8$ R $_9$ -、-CR $_6$ =CR $_8$ -、-CR $_6$ R $_7$ -NR $_8$ -、-NR $_8$ -C(=O)-、-CR $_6$ R $_7$ -O-又は-CR $_6$ =N-であり、

M $_6$ はN又はCR $_{10}$ であり、

R $_1$ は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、-(CH $_2$) n R $_{11}$ 、-(CH $_2$) n OR $_{11}$ 、-(CH $_2$) n C(O)R $_{11}$ 、-(CH $_2$) n C(O)OR $_{11}$ 、-(CH $_2$) n S(O) m R $_{11}$ 、-(CH $_2$) n NR $_{22}$ R $_{33}$ 、-(CH $_2$) n NR $_{22}$ C(O)OR $_{33}$ 、-(CH $_2$) n NR $_{22}$ C(O)(CH $_2$) n_1 R $_{33}$ 、-(CH $_2$) n NR $_{22}$ C(O)NR $_{22}$ R $_{33}$ 、-(CH $_2$) n C(O)NR $_{22}$ (CH $_2$) n_1 R $_{33}$ 、-OC(R $_{11}$ R $_{22}$) n (CH $_2$) n_1 R $_{33}$ 及び-(CH $_2$) n NR $_{22}$ S(O) m R $_{33}$ からなる群から選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは各々場合により更に置換されていてもよく、

R $_{11}$ 、R $_{22}$ 及びR $_{33}$ は、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、重水素化アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、シアノで置換されたアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、重水素化アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、シアノで置換されたアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

R $_2$ 及びR $_3$ は同一であるか又は異なり、場合によりアルキル、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、R $_2$ 及びR $_3$ は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、アルキル又はシクロアルキルであり、

R $_6$ 、R $_7$ 、R $_8$ 、R $_9$ 及びR $_{10}$ は同一であるか若しくは異なり、場合によりアルキル、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールにより置換されている水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、R $_6$ 、R $_7$ 、R $_8$ 及びR $_9$ は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルキニル若しくはシクロアルキルであるか、

又は、R $_6$ 、R $_7$ は、隣接する炭素原子と一緒に結合してシクロアルキルを形成し、シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ若しくは複数の置換基と置換されるか、

又は、R $_6$ 、R $_8$ は、隣接する炭素原子と一緒に結合してシクロアルキルを形成し

10

20

30

40

50

、シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ若しくは複数の置換基と置換され、

各 R^b は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)OR_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)NR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{b2}(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-OC(R_{b1}R_{b2})_n(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{b2}S(O)_mR_{b3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

10

R_{b1} 、 R_{b2} 及び R_{b3} は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

20

各 R^c は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{c2}R_{c3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{c2}C(O)OR_{c3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{c2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{c3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{c2}C(O)NR_{c2}R_{c3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{c2}(CH_2)_{n1}R_{c3}$ 、 $-OC(R_{c1}R_{c2})_n(CH_2)_{n1}R_{c3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{c2}S(O)_mR_{c3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

30

R_{c1} 、 R_{c2} 及び R_{c3} は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

各 R^d は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)OR_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)NR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{d2}(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-OC(R_{d1}R_{d2})_n(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{d2}S(O)_mR_{d3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテロアリールは、各々場合により更に置換されていてもよく、

40

R_{d1} 、 R_{d2} 及び R_{d3} は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール及びヘテ

50

ロアリアルからなる群から各々独立して選択され、アミノ、アルキル、重水素化アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリアル及びヘテロアリアルは、各々場合により更に置換されていてもよく、

w、y及びzは、各々独立して1、2、3又は4であり、

各mは、独立して0、1又は2であり、

各nは、独立して0、1、2、3又は4であり、

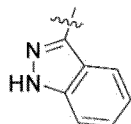
n₁及びn₂は、各々独立して、0、1、2、3又は4であり、

n₅及びn₆は、各々独立して、0、1又は2であり、

M₁がNであり、M₂がNである場合、環Dは単環ではなく、環Dが

10

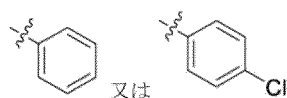
【化4】



である場合、R₁は水素ではなく、

M₂がNであり、M₁がCHであり、環Dが

【化5】



20

である場合、R₁は水素ではなく、

M₁がNであり、M₂がCHであり、環Dが

【化6】



30

である場合、R₁は水素ではなく、

【化7】



が二重結合であり、M₁がCであり、M₂がNであり、環Dがフェニルである場合、R₁は水素ではない)

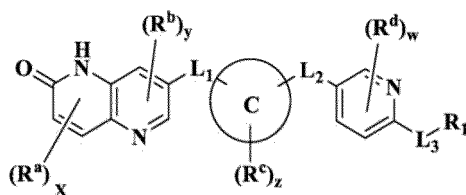
に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

40

式(II)

【化8】



(II)

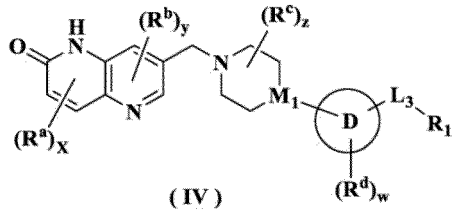
50

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

式(IV)

【化9】



10

(式中、 M_1 はN又は CR^a である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

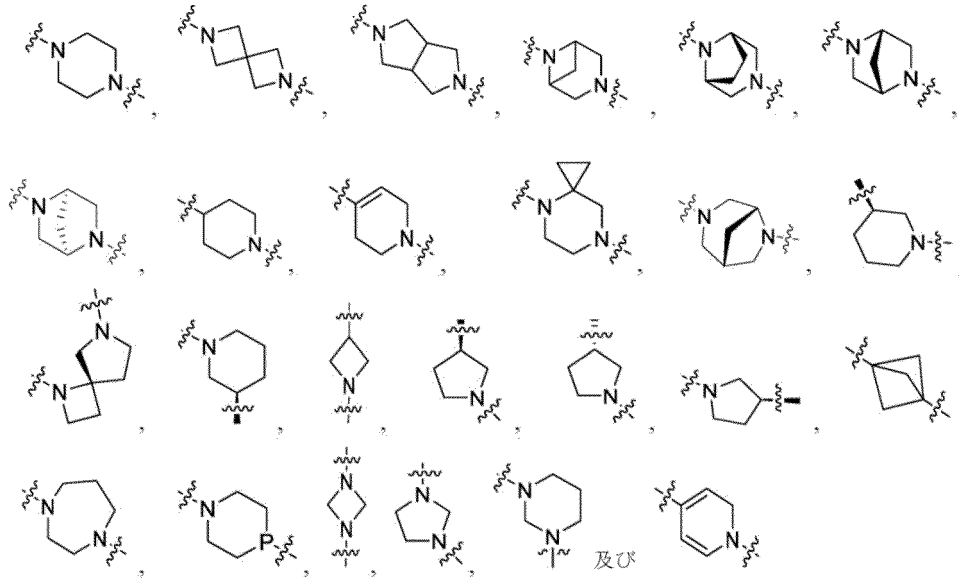
【請求項5】

環Cが3～10員のヘテロシクリルであり、より好ましくは、環Cが4～8員のヘテロシクリルであり、3～10員のヘテロシクリル及び4～8員のヘテロシクリル中のヘテロ原子が、窒素、酸素及び硫黄からなる群から各々独立して選択され、ヘテロ原子の数が独立して1、2又は3であり、好ましくは、3～10員のヘテロシクリル及び4～8員のヘテロシクリルの環が、各々独立して、単環、架橋環、スピロ環又は縮合環であり、

20

環Cが、更に好ましくは

【化10】



30

からなる群から選択されることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項6】

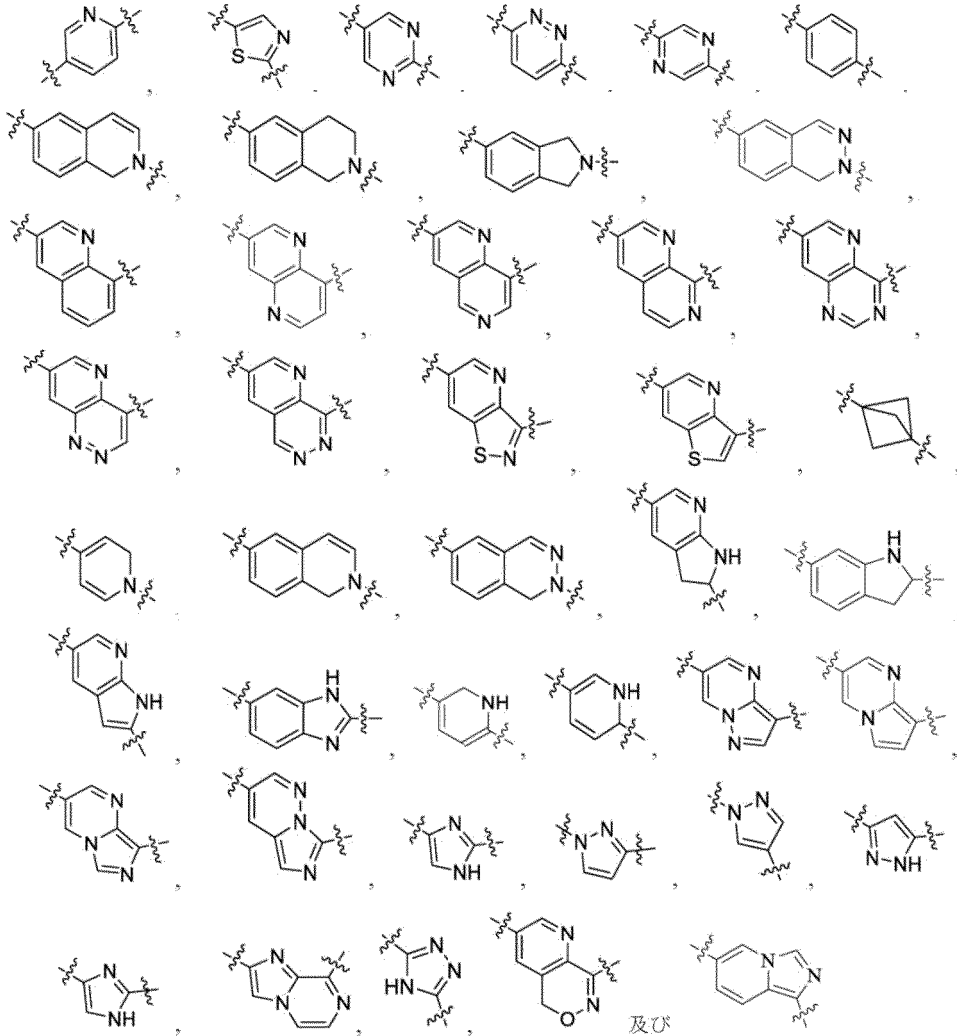
環Dが、6～10員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール又は5～10員のヘテロアリールであり、好ましくは、環Dが、5員のヘテロ芳香環、6員のヘテロ芳香環、ベンゼン環、6員のヘテロ芳香環と縮合した5員のヘテロ芳香環、6員のヘテロ芳香環と縮合した6員のヘテロ芳香環、6員の複素環と縮合した6員のヘテロ芳香環、5員の複素環と縮合した6員のヘテロ芳香環、5員の複素環と縮合したベンゼン環、6員のヘテロ芳香環と縮合したベンゼン環、6員の複素環と縮合したベンゼン環であり、3～14員のヘテロシクリル、6～10員のヘテロシクリル、5～10員のヘテロアリール及び5～14員のヘテロアリール中の

40

ヘテロ原子が、窒素、酸素及び硫黄からなる群から各々独立して選択され、ヘテロ原子の数が独立して1、2又は3であり、

環Dが、更に好ましくは

【化11】



10

20

30

からなる群から選択されることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項7】

R_1 が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 重水素化アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-12} シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 C_{6-12} アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)NR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{22}(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-OC(R_{11}R_{22})_n(CH_2)_{n1}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}S(O)_mR_{33}$ からなる群から選択され、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 重水素化アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-12} シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 C_{6-12} アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、オキソ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{6-12} アリール、5~12員のヘテロアリール及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換

40

50

されていてもよく、

好ましくは、 R_1 が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)NR_{22}R_{33}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{22}(CH_2)_{n1}R_{33}$ 、 $-OC(R_{11}R_{22})_n(CH_2)_{n1}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}S(O)_mR_{33}$ からなる群から選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

R_{11} 、 R_{22} 及び R_{33} が、各々場合により重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び $C_3\sim 12$ シクロアルキルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基と置換されている、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_1\sim 6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、シアノで置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-O(CH_2)_{n1}R_{66}$ 、 $-OC(R_{44}R_{55})_{m1}(CH_2)_{n1}R_{66}$ 、 $-NR_{44}(CH_2)_{n1}R_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}-$ 、 $-(CH_2)_{n1}R_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}OR_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}SR_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}C(O)R_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}C(O)OR_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}S(O)_{m1}R_{66}$ 、 $-(CH_2)_{n1}NR_{44}R_{55}$ 、 $-(CH_2)_{n1}C(O)NR_{44}R_{55}$ 、 $-(CH_2)_{n1}NR_{44}C(O)R_{66}$ 及び $-(CH_2)_{n1}NR_{44}S(O)_{m1}R_{66}$ からなる群から各々独立して選択され、

R_{44} 、 R_{55} 及び R_{66} が、各々場合により重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び $C_3\sim 12$ シクロアルキルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基と置換されている、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_1\sim 6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、シアノで置換された $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、

より好ましくは、 R_1 が、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよい、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールからなる群から選択され、

更に好ましくは、 R_1 は、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよい、水素、重水素、シアノ、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択され、

より更に好ましくは、 R_1 が、水素、 $-CH_3$ 、 $-CD_3$ 、 $-CH_2CN$ 、エチル、メトキシ、シアノ、シクロプロピル、

10

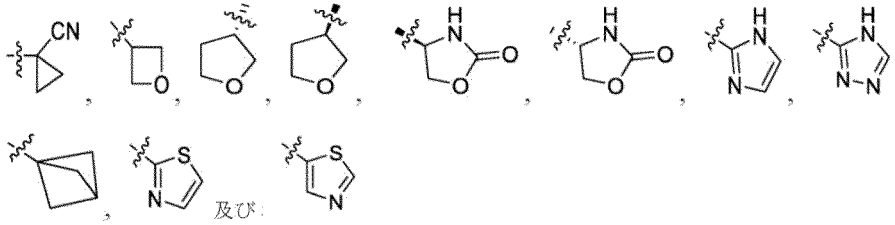
20

30

40

50

【化 1 2】



からなる群から選択されることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 8】

各 R^a が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)OR_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)NR_{a2}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{a2}(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 、 $-OC(R_{a1}R_{a2})_n(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{a2}S(O)_mR_{a3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

20

好ましくは、各 R^a が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール、5~10員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{a1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)OR_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{a2}C(O)NR_{a2}R_{a3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{a2}(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 、 $-OC(R_{a1}R_{a2})_n(CH_2)_{n1}R_{a3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{a2}S(O)_mR_{a3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール及び5~10員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

30

40

R_{a1} 、 R_{a2} 及び R_{a3} が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

50

より好ましくは、各 R^a が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル及び $C_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され、

x が好ましくは1、2又は3である

ことを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項9】

各 R^b が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)OR_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)NR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{b2}(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-OC(R_{b1}R_{b2})_n(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{b2}S(O)_mR_{b3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

好ましくは、各 R^b が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール、5~10員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{b1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)OR_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{b2}C(O)NR_{b2}R_{b3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{b2}(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 、 $-OC(R_{b1}R_{b2})_n(CH_2)_{n1}R_{b3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{b2}S(O)_mR_{b3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール及び5~10員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

R_{b1} 、 R_{b2} 及び R_{b3} が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

より好ましくは、各 R^b が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル及び $C_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され、

更に好ましくは、各 R^b は、水素、F、 $-CF_3$ 、シアノ、メチル及びシクロプロピルからなる群から独立して選択され、

10

20

30

40

50

yが、好ましくは1である

ことを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項10】

各R^cが、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、C₁~6アルキル、C₁~6重水素化アルキル、C₁~6ハロアルキル、C₁~6ヒドロキシアルキル、C₁~6アルコキシ、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₃~12シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、C₆~12アリアル、5~12員のヘテロアリアル、-(CH₂)_nR_{c1}、-(CH₂)_nOR_{c1}、-(CH₂)_nC(O)R_{c1}、-(CH₂)_nC(O)OR_{c1}、-(CH₂)_nS(O)_mR_{c1}、-(CH₂)_nNR_{c2}R_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)OR_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)(CH₂)_{n1}R_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)NR_{c2}R_{c3}、-(CH₂)_nC(O)NR_{c2}(CH₂)_{n1}R_{c3}、-OC(R_{c1}R_{c2})_n(CH₂)_{n1}R_{c3}及び-(CH₂)_nNR_{c2}S(O)_mR_{c3}からなる群から独立して選択され、アミノ、C₁~6アルキル、C₁~6重水素化アルキル、C₁~6ハロアルキル、C₁~6ヒドロキシアルキル、C₁~6アルコキシ、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₃~12シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、C₆~12アリアル及び5~12員のヘテロアリアルが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、C₁~6アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

好ましくは、各R^cが、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、C₁~3アルキル、C₁~3重水素化アルキル、C₁~3ハロアルキル、C₁~3ヒドロキシアルキル、C₁~3アルコキシ、C₂~3アルケニル、C₂~3アルキニル、C₃~6シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、C₆~10アリアル、5~10員のヘテロアリアル、-(CH₂)_nR_{c1}、-(CH₂)_nOR_{c1}、-(CH₂)_nC(O)R_{c1}、-(CH₂)_nC(O)OR_{c1}、-(CH₂)_nS(O)_mR_{c1}、-(CH₂)_nNR_{c2}R_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)OR_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)(CH₂)_{n1}R_{c3}、-(CH₂)_nNR_{c2}C(O)NR_{c2}R_{c3}、-(CH₂)_nC(O)NR_{c2}(CH₂)_{n1}R_{c3}、-OC(R_{c1}R_{c2})_n(CH₂)_{n1}R_{c3}及び-(CH₂)_nNR_{c2}S(O)_mR_{c3}からなる群から独立して選択され、アミノ、C₁~3アルキル、C₁~3重水素化アルキル、C₁~3ハロアルキル、C₁~3ヒドロキシアルキル、C₁~3アルコキシ、C₂~3アルケニル、C₂~3アルキニル、C₃~6シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、C₆~10アリアル及び5~10員のヘテロアリアルが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、C₁~3アルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

R_{c1}、R_{c2}及びR_{c3}が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、C₁~6アルキル、C₁~6重水素化アルキル、C₁~6ハロアルキル、C₁~6ヒドロキシアルキル、C₁~6アルコキシ、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₃~12シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、C₆~12アリアル及び5~12員のヘテロアリアルからなる群から各々独立して選択され、アミノ、C₁~6アルキル、C₁~6重水素化アルキル、C₁~6ハロアルキル、C₁~6ヒドロキシアルキル、C₁~6アルコキシ、C₂~6アルケニル、C₂~6アルキニル、C₃~12シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、C₆~12アリアル及び5~12員のヘテロアリアルが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、C₁~6アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

より好ましくは、各R^cが、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、C₁~3アルキル、C₁~3ハロアルキル及びC₃~6シクロアルキルからなる群から独立して選択され、

更に好ましくは、各R^cが、水素、重水素、F、塩素、ヒドロキシ、メチル、メトキシ、オキソ及びシアノからなる群から独立して選択され、

zが好ましくは1又は2である

ことを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 1】

各 R^d が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール、5~12員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)OR_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)NR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{d2}(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-OC(R_{d1}R_{d2})_n(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{d2}S(O)_mR_{d3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

10

好ましくは、各 R^d が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール、5~10員のヘテロアリール、 $-(CH_2)_nR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{d1}$ 、 $-(CH_2)_nS(O)_mR_{c1}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)OR_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{d2}C(O)NR_{d2}R_{d3}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR_{d2}(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 、 $-OC(R_{d1}R_{d2})_n(CH_2)_{n1}R_{d3}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{d2}S(O)_mR_{d3}$ からなる群から独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル、 $C_1\sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_2\sim 3$ アルケニル、 $C_2\sim 3$ アルキニル、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、3~6員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 10$ アリール及び5~10員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル及び3~6員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

20

R_{d1} 、 R_{d2} 及び R_{d3} が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5~12員のヘテロアリールが、各々場合によりヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、 $C_1\sim 6$ アルキル及び3~12員のヘテロシクリルからなる群から選択される1つ又は複数の置換基により更に置換されていてもよく、

30

より好ましくは、各 R^d が、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 3$ アルコキシ、 $C_1\sim 3$ ハロアルキル及び $C_3\sim 6$ シクロアルキルからなる群から独立して選択され、

40

更に好ましくは、各 R^d が、水素、重水素、シクロプロピル、イソプロピル、シアノ、F、Cl、メチル、 $-CD_3$ 、 $-NHCH_3$ 、 $-NHCD_3$ 、メトキシ及びオキソからなる群から独立して選択され、

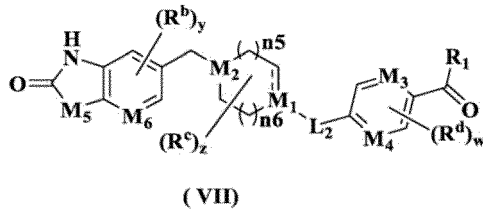
wが、好ましくは1又は2、及びより好ましくは1であることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 2】

式(VII)

50

【化 1 3】



(式中、

L_2 は結合又はOであり、

10

【化 1 4】

は単結合又は二重結合であり、

M_1 はC又は CR_2 であり、

M_2 はN又は CR_3 であり、

M_3 はN又は CR_4 であり、

M_4 はN又は CR_5 であり、

M_5 は $-CR_6R_7-$ 、 $-CR_6R_7-CR_8R_9-$ 、 $-CR_6=CR_8-$ 、 $-CR_6R_7-NR_8-$ 、 $-NR_8-C(=O)-$ 、
 $-CR_6R_7-O-$ 又は $-CR_6=N-$ であり、

20

M_6 はN又は CR_{10} であり、

R_1 は、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、
 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ からなる群から選択され、

R_{11} 、 R_{22} 及び R_{33} は、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、
 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、
 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_1\sim 6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、
 $3\sim 12$ 員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び $5\sim 12$ 員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、

30

R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は同一であるか又は異なり、場合により $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 6$ アルキル、
 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、
 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアルキル、 $3\sim 12$ 員のヘテロシクリル、
 $C_6\sim 12$ アリール及び $5\sim 12$ 員のヘテロアリールにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、
ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、
 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、 $C_1\sim 3$ アルキル又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルであり、

R^b は、場合により $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ及び
 $C_3\sim 6$ シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、
チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から選択され、

40

R^c は、場合により $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ及び
 $C_3\sim 6$ シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、
チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から選択され、

R^d は、場合により $C_1\sim 3$ アルキル、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ及び
 $C_3\sim 6$ シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、
チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から選択され、

R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 及び R_{10} は同一であるか若しくは異なり、場合により $C_1\sim 3$ アルキル、
 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、
 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 12$ シクロアル

50

キル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6\sim 12$ アリール及び5～12員のヘテロアリールにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、 R_6 、 R_7 、 R_8 及び R_9 は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1\sim 3$ アルキル若しくは $C_3\sim 6$ シクロアルキルであるか、

又は、 R_6 、 R_7 は、隣接する炭素原子と一緒になって結合して $C_3\sim 6$ シクロアルキルを形成し、 $C_3\sim 6$ シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ若しくは複数の置換基と置換されるか、

又は、 R_6 、 R_8 は、隣接する炭素原子と一緒になって結合して $C_3\sim 6$ シクロアルキルを形成し、 $C_3\sim 6$ シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ又は複数の置換基と置換され、

n_5 及び n_6 は、各々独立して、0、1又は2であり、

w は1又は2であり、

y は1又は2であり、

z は1又は2であり、

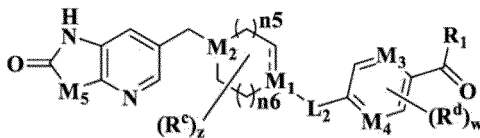
n は0、1、2又は3である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項13】

式(VI)

【化15】



(VI)

(式中、

L_2 は結合又はOであり、

【化16】

は単結合又は二重結合であり、

M_1 はC又は CR_2 であり、

M_2 はN又は CR_3 であり、

M_3 はN又は CR_4 であり、

M_4 はN又は CR_5 であり、

M_5 は $-CR_6R_7-$ 、 $-CR_6R_7-CR_8R_9-$ 、 $-CR_6=CR_8-$ 、 $-CR_6R_7-NR_8-$ 、 $-NR_8-C(=O)-$ 、 $-CR_6R_7-O-$ 又は $-CR_6=N-$ であり、

R_1 は、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ からなる群から選択され、

R_{11} 、 R_{22} 及び R_{33} は、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_1\sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1\sim 6$ ハロアルキル、 $C_1\sim 6$ アルコキシ、 $C_1\sim 6$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim 6$ ヒドロキシアルキ

ル、 $C_3 \sim 12$ シクロアルキル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 12$ アリール及び5～12員のヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、

R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は同一であるか又は異なり、場合により $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ シクロアルキル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 12$ アリール及び5～12員のヘテロアリールにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$ アルキル又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり、

R^c は、場合により $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ及び $C_3 \sim 6$ シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から選択され、

R^d は、場合により $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ及び $C_3 \sim 6$ シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から選択され、

R_6 、 R_7 、 R_8 及び R_9 は同一であるか若しくは異なり、場合により $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ シクロアルキル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 12$ アリール及び5～12員のヘテロアリールにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、 R_6 、 R_7 、 R_8 及び R_9 は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$ アルキル若しくは $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであるか、

又は、 R_6 、 R_7 は、隣接する炭素原子と一緒になって結合して $C_3 \sim 6$ シクロアルキルを形成し、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ若しくは複数の置換基と置換されるか、

又は、 R_6 、 R_8 は、隣接する炭素原子と一緒になって結合して $C_3 \sim 6$ シクロアルキルを形成し、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキルは、場合により、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ及びアミノからなる群から選択される1つ又は複数の置換基と置換され、

n_5 及び n_6 は、各々独立して、0、1又は2であり、

w は1又は2であり、

z は1又は2であり、

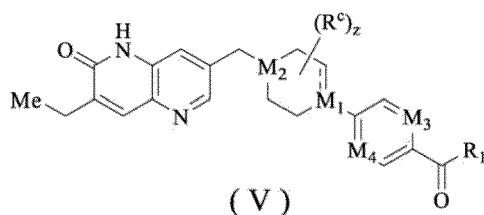
n は0、1、2又は3である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項14】

式(V)

【化17】



(式中、

【化18】

//

は単結合又は二重結合であり、

M_1 はC又は CR_2 であり、

M_2 はN又は CR_3 であり、

M_3 はN又は CR_4 であり、

M_4 はN又は CR_5 であり、

R_1 は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $-(CH_2)_nR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nOR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R_{11}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)OR_{11}$ 、 $-(CH_2)_nNR_{22}R_{33}$ 及び $-(CH_2)_nNR_{22}C(O)OR_{33}$ からなる群から選択され、

R_{11} 、 R_{22} 及び R_{33} は、水素、重水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_3 \sim 12$ シクロアルキル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 12$ アリーール及び5～12員のヘテロアリーールからなる群から各々独立して選択され、

R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は同一であるか又は異なり、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ 重水素化アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 12$ シクロアルキル、3～12員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 12$ アリーール及び5～12員のヘテロアリーールからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、 R_2 、 R_3 、 R_4 及び R_5 は、各々独立して、水素、重水素、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$ アルキル又は $C_3 \sim 6$ シクロアルキルであり、

R^c は、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル及び $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群から選択され、

z は1又は2であり、

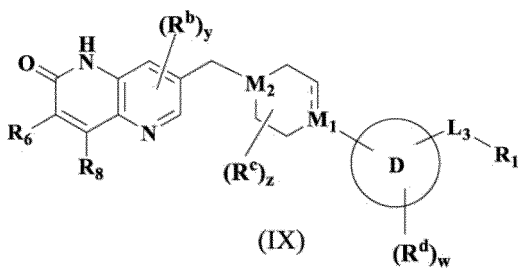
n は0、1、2又は3である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項15】

式(IX)

【化19】



(式中、環Dは9～10員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 10$ アリーール又は9～10員のヘテロアリーールであり、好ましくは6員のヘテロ芳香環と縮合した6員のヘテロ芳香環、6員の複素環と縮合した6員のヘテロ芳香環、又は5員の複素環と縮合した6員のヘテロ芳香環であり、及びより好ましくは、

10

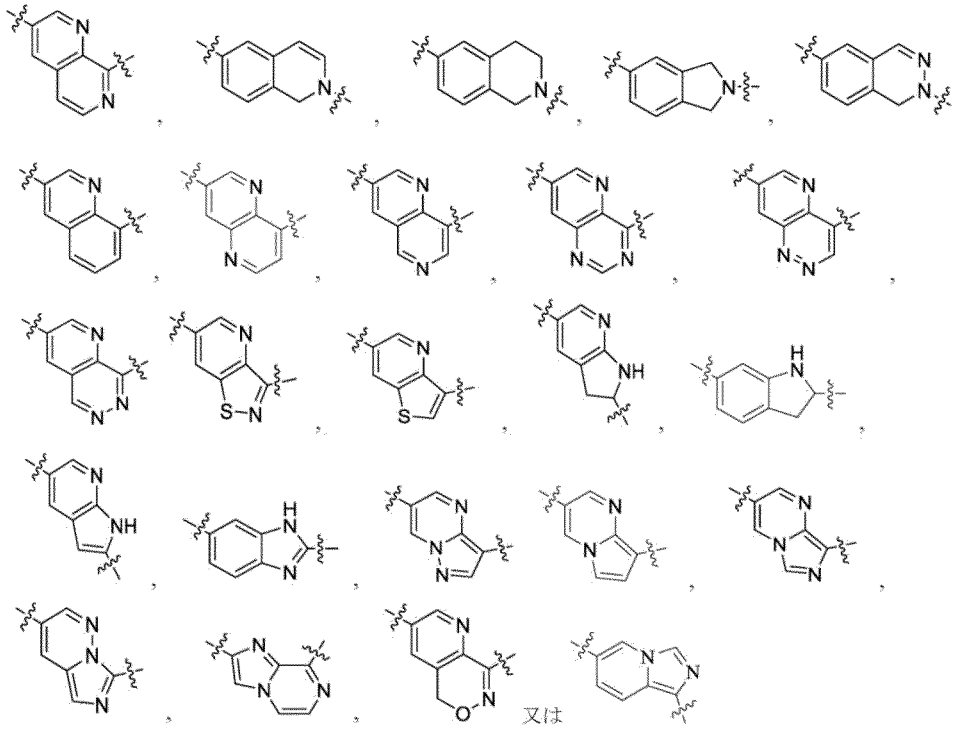
20

30

40

50

【化 2 0】



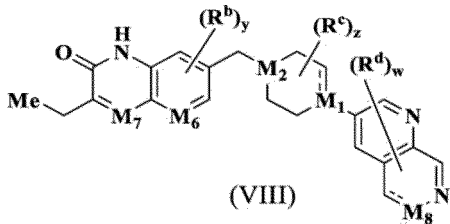
である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項2に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

式(VIII)

【化 2 1】



(式中、

【化 2 2】

≡

は単結合又は二重結合を表し、
 M_1 はN、C又は CR_2 であり、
 M_2 はN又は CR_3 であり、
 M_6 はN又は CR_{10} であり、
 M_7 は CR_{12} 又はNであり、
 M_8 は CR_{13} 又はOであり、好ましくは、

【化 2 3】

$\equiv M_8$

は

40

50

【化 2 4】

$$=CR_{13} \text{ 又は } -O$$

であり、

R_2 、 R_3 、 R_{10} 、 R_{12} 及び R_{13} は同一であるか又は異なり、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} 重水素化アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-12} シクロアルキル、3~12員のヘテロシクリル、 C_{6-12} アリール及び5~12員のヘテロアリールにより置換されている水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、好ましくは、 R_2 、 R_3 、 R_{10} 、 R_{12} 及び R_{13} は同一であるか又は異なり、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} 重水素化アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 C_{1-3} ヒドロキシアルキル及び C_{1-3} アルコキシにより置換されている水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、シアノ、アミノからなる群から各々独立して選択され、

各 R^b は、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ及び C_{3-6} シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、及び好ましくは、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル及び C_{1-3} アルコキシにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から独立して選択され、

各 R^c は、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ及び C_{3-6} シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、及び好ましくは、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル及び C_{1-3} アルコキシにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から独立して選択され、

各 R^d は、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ及び C_{3-6} シクロアルキルにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノ、及び好ましくは、場合により1つ又は複数の C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル及び C_{1-3} アルコキシにより置換されている、水素、重水素、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、チオール、オキソ、シアノ、アミノからなる群から独立して選択され、

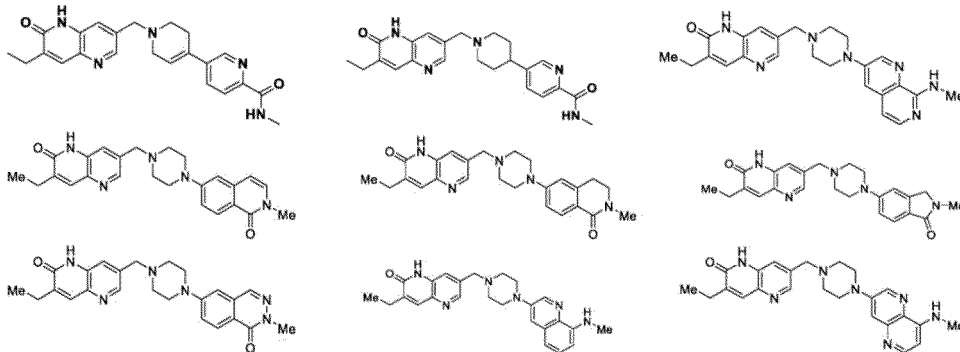
w 、 y 及び z は、各々独立して、1、2、3又は4である)

に更に示されるようなものであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 7】

特定の構造が以下

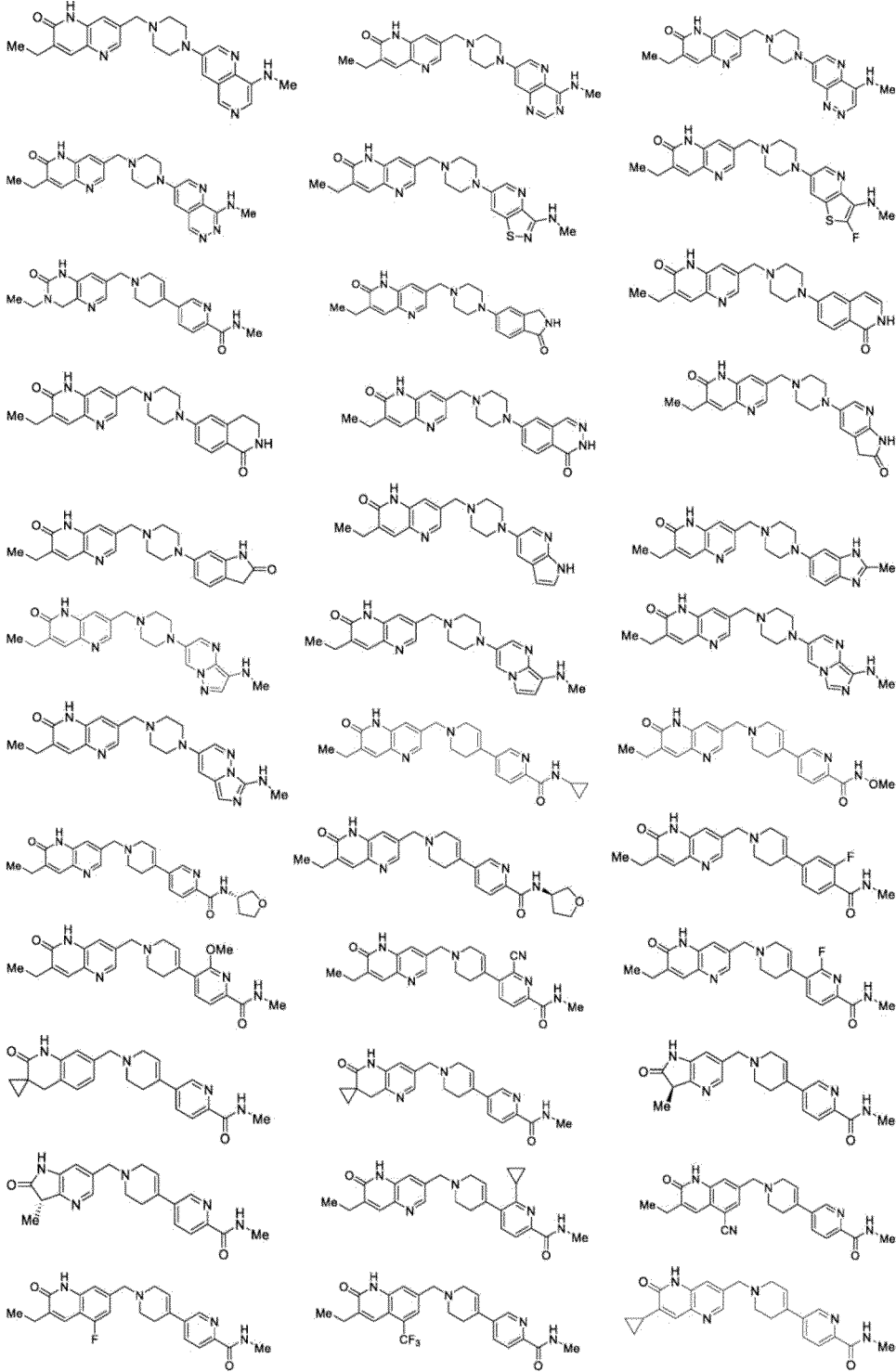
【化 2 5 A】



40

50

【化 2 5 B】



10

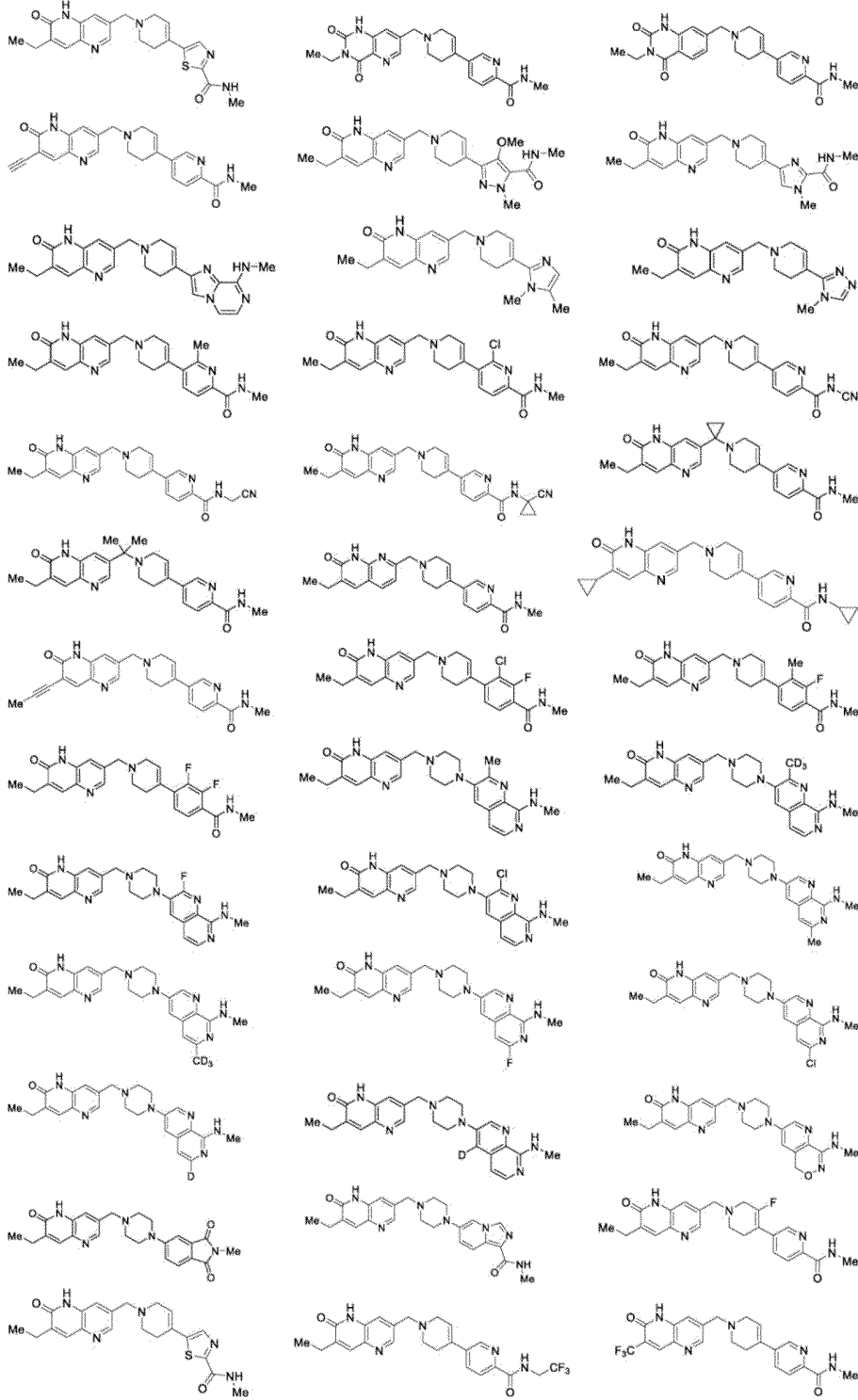
20

30

40

50

【化 2 5 C】



10

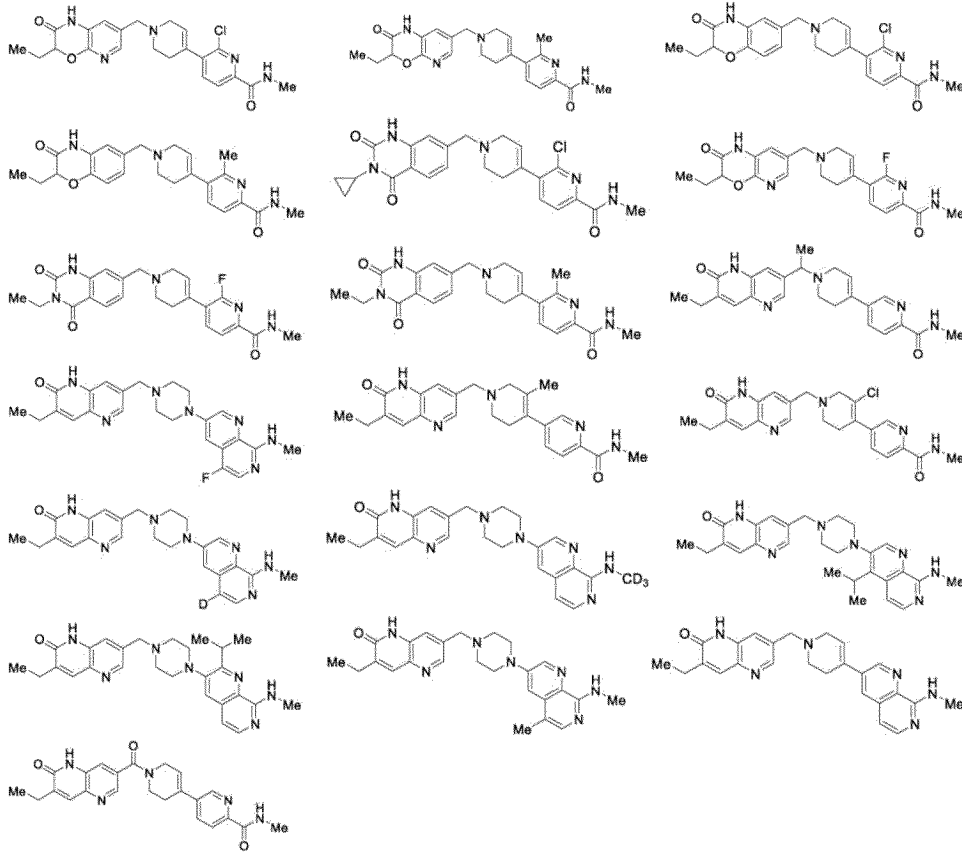
20

30

40

50

【化25D】



10

20

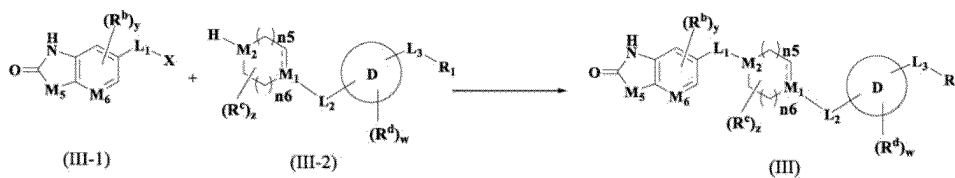
の通りであることを特徴とする、請求項1に記載の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩。

【請求項18】

式(III)の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩を調製するための方法であって、式(III-1)の化合物及び式(III-2)の化合物を、以下の反応に供して、式(III)の化合物を得る

30

【化26】



(III-1)

(III-2)

(III)

(式中、Xはハロゲン、及び好ましくはフッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、好ましくは、反応は塩基及び触媒の存在下で行われ、塩基は好ましくはDIPEAであり、触媒は好ましくはヨウ化カリウムであり、

40

【化27】

//

、M₁、M₂、M₄、M₆、R^b、R^c、R^d、L₁、L₂、L₃、R₁、環D、n5、n6、y、z及びwは請求項2において規定した通りである)

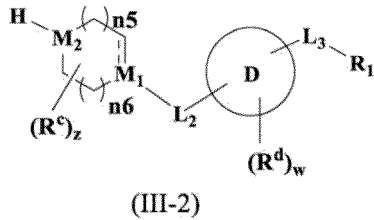
ことを特徴とする、方法。

【請求項19】

式(III-2)

50

【化 2 8】



(III-2)

(式中、

【化 2 9】

//

10

、 M_1 、 M_2 、 R^c 、 R^d 、 L_2 、 L_3 、 R_1 、環 D 、 n_5 、 n_6 、 z 及び w は請求項2において規定した通りである)

の化合物。

【請求項 2 0】

請求項1から17のいずれか一項に記載の治療有効量の化合物、その立体異性体又はその薬学的に許容される塩、及び1つ又は複数の薬学的に許容される担体、希釈剤又は賦形剤を含む、医薬組成物。

20

【請求項 2 1】

PARP阻害剤医薬としての使用のための、請求項20に記載の医薬組成物であって、PARPが好ましくはPARP1である、医薬組成物。

【請求項 2 2】

がん、虚血性疾患又は神経変性疾患の処置に使用するための、請求項20に記載の医薬組成物であって、がんが、好ましくは乳がん、卵巣がん、膵臓がん、前立腺がん、血液がん、胃がん、結腸直腸がん、胃腸がん及び肺がんからなる群から選択される、医薬組成物。

30

40

50