

【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21年10月15日(2009.10.15)

【公表番号】特表2009-508818(P2009-508818A)

【公表日】平成21年3月5日(2009.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-009

【出願番号】特願2008-529335(P2008-529335)

【国際特許分類】

C 0 7 D 223/16 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 223/16 C S P Z

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 409/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 417/14

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月27日(2009.8.27)

【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

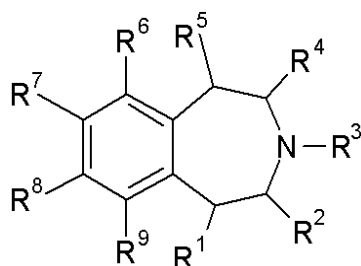
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物

【化 1】



(I)

(式中、

 R^1 は水素であり、 R^2 、 R^3 及び R^4 は各々水素であり、 R^5 は水素であり、

R^6 は - ($C_1 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_3$) アルキル - R^{10} 基、 - ($C_1 - C_3$) アルキル - NR¹² - ($C_0 - C_3$) アルキル - R^{11} 基、又は ($C_1 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_3$) アルキル - R^{13} 基であり、

 R^7 はクロロ基であり、 R^8 は水素であり、 R^9 は水素であり、 R^{10} は、

a) テトラゾリル、1,2,3-チアジアゾリル基、1,3,4-チアジアゾリル(1,2,4)-チアジアゾリル基、1,2,3-オキサジアゾリル基、1,3,4-オキサジアゾリル基及び1,2,4-オキサジアゾリル基からなる群から選択され、いずれも1~5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_4$) アルキル基、Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル基、Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル基、($C_1 - C_4$) アルキル - C(O) - 基、Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - 基、Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - 基、($C_1 - C_4$) アルキル部分が1~5個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_4$) アルキル - NR¹² - ($C_0 - C_3$) アルキル - 基、($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NR¹² - ($C_0 - C_3$) アルキル基、Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NR¹² - ($C_0 - C_3$) アルキル基、Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NR¹² - ($C_0 - C_3$) アルキル基からなる群から選択される置換基で任意に置換されてもよい芳香族複素環置換基、

b) イミダゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チオフェニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、1,2,3-トリアゾリル基、1,2,4-トリアゾリル基からなる群から選択される複素環、又はチアゾリニル基から選択される複素環(いずれも、

1~6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_6$) アルキル基、

1~6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい Ph¹ - ($C_1 - C_3$) アルキル基、

、

1~6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい Ar¹ - ($C_1 - C_3$) アルキル基、

、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - 基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - 基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - 基、

1~6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい($C_1 - C_6$) アルキル - NH - C(O) - 基、

1~6個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - 基及び

1~6個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい Ar¹ - ($C_0 - C$

3) アルキル - NH - C (O) - 基

からなる群から選択される 1 ~ 2 の置換基で任意に置換されてもよく、又は

ハロ、

シアノ、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = C H - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキコキシ基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキルチオ基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキルチオ基、

1 ~ 6 のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル - 基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル - 基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル - 基、

Het¹ - (C₀ - C₃) アルキル - 基、

(C₁ - C₆) アルキル - C (O) - NH - 基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - NH - 基、

Ar¹ が Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C (O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - C (O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - C (O) - NH - 基及び

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - C (O) - NH -

からなる群から選択される 1 又は 2 の置換基で炭素原子環が任意に置換されてもよく、又は二価の炭素数 3 ~ 4 の炭化水素置換基で 2 つの隣接する原子環 (それらが結合する環上の原子と共に、ベンゼン環又は部分的に飽和した 5 員環若しくは 6 員環を形成する) が任意に置換されてもよい)

c) フェニル基 (任意に、

i) 独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、-SCF₃、ニトロ、ヒドロキシ基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に更に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基及び 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に更に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルコキシル基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

iii) ハロ、シアノ、-SCF₃、メチル、-CF₃、メトキシ、-OCF₃、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が独立に任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₅) アルキル基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

Ph¹ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₅) アルキル基、

ハロ、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル - 及び (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル基からなる群から独立に選択される置換基で任意に置換されてもよいチアゾリル - (C₀ - C₁) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = C

H - 基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル基が任意に置換され、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $CH = CH$ - 基 (但し3つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Het¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NHC(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - C(O) - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - SO₂ - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基

からなる群から独立に選択される 1 つの置換基で任意に置換されてもよい)、

d) ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基からなる群から選択される芳香族複素環置換基 (いずれもハロ、シアノ、 $-SCF_3$ 、メチル、 $-CF_3$ 、メトキシ、 $-OCF_3$ 、ニトロ、ヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 1 又は 2 個の置換基で任意に置換されてもよく、更に任意に

任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が更に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_5$) アルキル基 (3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

Ph^1 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

ハロ、任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NR^{1,2}$ - ($C_0 - C_3$) アルキル - 基及び ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NR^{1,2}$ - ($C_0 - C_3$) アルキル基からなる群から独立に選択される置換基で任意に置換されてもよいチアゾリル - ($C_0 - C_1$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $CH=CH$ - 基、

任意にアルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $CH=CH$ - 基 (3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Het¹ - (C₀ - C₅) アルキル - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NH C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₁ - C₆) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基

からなる群から選択される 1 つの置換基で置換されてもよい)、又は、

e) - ナフタリル基、キノリン - 2 - イル基、キノリン - 3 - イル基又はキノリン - 4 - イル基であり、

R^{1 1} は、

a) フェニル基 (任意に

i) 独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、メチル、ヒドロキシ及びメトキシ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

iii) ハロ、シアノ、メチル、-CF₃、-SCF₃、メトキシ、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = CH - 基、

アルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - CH = CH - 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、
 (C₁ - C₆) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、
 (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NHC(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Het¹ - (C₀ - C₅) アルキル - 基、

(C₁ - C₆) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基

からなる群から選択される 1 つの置換基で置換されてもよい)、又は、

b) ピリジル基 (任意に、

i) ハロ、シアノ、メチル、ヒドロキシ及びメトキシ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、メチル、-CF₃、-SCF₃、メトキシ、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = CH - 基、

アルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - CH = CH - 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アル

キル基、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{SO}_2 - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

1～6個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル}$ 部分が任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

1～6個のフルオロ置換基で $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル}$ 部分が任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{NHC}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{NH} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{NH} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ で置換されてもよい)、又は

c) ピリダジニル基(独立にハロ、シアノ、ヒドロキシ、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル基}$ 、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルコキシル基}$ 、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキルチオ基}$ からなる群から選択される1つ又は2つの置換基で任意に置換されてもよい)、又は、

d) 5員環の芳香族複素環(チオフェニル基、チアゾール基、イソチアゾール基から選択され、はハロ、シアノ、ヒドロキシ基、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル基}$ 、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルコキシル基}$ 、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキルチオ基}$ 、1～6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキルアミノ基}$ 及び $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{C}(\text{O}) - \text{基}$ からなる群から独立に選択される1又は2個の置換基で任意に置換されてもよい)であり、

$\text{R}^{1,2}$ は水素又はメチル基であり、

$\text{R}^{1,3}$ は a) フェニル基(任意に、

i) 独立に選択される1～5個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、 $-\text{SCF}_3$ 、ニトロ、ヒドロキシ、1～6個のフルオロ置換基により更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル基}$ 及び1～6個のフルオロ置換基により更に任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルコキシル基}$ からなる群から独立に選択される1～3個の置換基、又は

iii) ハロ、シアノ、 $-\text{SCF}_3$ 、メチル、 $-\text{CF}_3$ 、メトキシ、 $-\text{OCF}_3$ 、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される0、1又は2個の置換基と共に、

任意に1～6個のフルオロ置換基でアルキル部分が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から選択される1～6個の置換基でシクロアルキル部分が独立に任意に置換されてもよい $(\text{C}_3 - \text{C}_7) \text{シクロアルキル} - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ (但し3つ以上の置換基がメチル基ではない)、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

$\text{Ar}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_5) \text{アルキル基}$ 、

1～6個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(\text{C}_1 - \text{C}_6) \text{アルキル} - \text{CH} = \text{C}$

H - 基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル基が任意に置換され、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $CH = CH$ - 基 (但し3つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Het¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NHC(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - C(O) - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - C(O) - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - C(O) - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar¹ - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - SO₂ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - SO₂ NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基

からなる群から独立に選択される 1 つの置換基で任意に置換されてもよい)、又は

b) チオフェニル基

(ハロ、

シアノ、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基

、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基

、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - 基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - C(O) - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - NH - C(O) - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - NH - C(O) - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - CH = CH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキルコキシ基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキルチオ基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキルチオ基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$Het^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

($C_1 - C_6$) アルキル - C(O) - NH - 基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - NH - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - O - C(O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - O - C(O) - NH - 基及び

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - O - C(O) - NH -

からなる群から選択される 1 又は 2 の置換基で炭素原子環が任意に置換されてもよい) であり、

Ar^1 はピリジル基 (独立に選択される 1 ~ 4 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチル、 $-CF_3$ 、メトキシ、 $-OCF_3$ 、メチルチオ、 $-SCF_3$ からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、

、

Ph^1 はフェニル基 (独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチルチオ、 $-SCF_3$ 、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル基、及び 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意

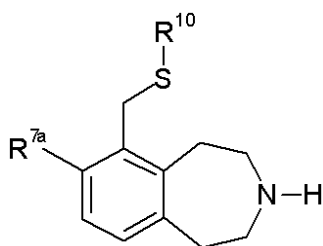
に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルコキシル基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、

H e t¹ は、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、モルフォリニル基、チオモルフォリニル基、ホモモルフォリニル基及びホモチオモルフォリニル基からなる群から選択される飽和窒素含有複素環置換基であり、いずれも ($C_1 - C_6$) アルキル基又は 2 つのメチル置換基で任意に置換されてもよい)、又はその薬学的に許容できる塩。

【請求項 2】

式 (I a) の化合物

【化 2】



Ia

(式中、

R^{7a} はクロロ基であり、

R^{10} は

a) テトラゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル基、1, 3, 4 - チアジアゾリル ($C_1, 2, 4$) - チアジアゾリル基、1, 2, 3 - オキサジアゾリル基、1, 3, 4 - オキサジアゾリル基及び 1, 2, 4 - オキサジアゾリル基からなる群から選択され、いずれも 1 ~ 5 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル基、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基、 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基、($C_1 - C_4$) アルキル - $C(O)$ - 基、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O)$ - 基、 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O)$ - 基、($C_1 - C_4$) アルキル部分が 1 ~ 5 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル - $NR^{12} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NR^{12} - (C_0 - C_3)$ アルキル基、 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{12} - (C_0 - C_3)$ アルキル基、 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{12} - (C_0 - C_3)$ アルキル基からなる群から選択される置換基で任意に置換されてもよい芳香族複素環置換基、

b) イミダゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チオフェニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、1, 2, 3 - トリアゾリル基、1, 2, 4 - トリアゾリル基からなる群から選択される複素環、又はチアゾリニル基から選択される複素環 (いずれも、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_1 - C_3)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_1 - C_3)$ アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - $C(O)$ - 基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O)$ - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O)$ - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NH - C(O)$ - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - C(O)$ - 基及び

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - NH - C(O) - 基

からなる群から選択される 1 ~ 2 の置換基で任意に置換されてもよく、又は
ハロ、

シアノ、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - CH = CH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキコキシ基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキルチオ基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1 - C_6)$ アルキル部分が任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$Het^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、

$(C_1 - C_6)$ アルキル - C(O) - NH - 基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - NH - 基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - C(O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - O - C(O) - NH - 基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - O - C(O) - NH - 基及び

1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - O - C(O) - NH -

からなる群から選択される 1 又は 2 の置換基で炭素原子環が任意に置換されてもよく、又は

二価の炭素数 3 ~ 4 の炭化水素置換基で 2 つの隣接する原子環（それらが結合する環上の原子と共に、ベンゼン環又は部分的に飽和した 5 員環若しくは 6 員環を形成する）が任意に置換されてもよい）

c) フェニル基

(任意に、

i) 独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、-SCF₃、ニトロ、ヒドロキシ基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に更に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル基及び 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に更に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルコキシ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

iii) ハロ、シアノ、-SCF₃、メチル、-CF₃、メトキシ、-OCF₃、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が独立に任意に置換されてもよい $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_5)$ アルキル基（但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない）、

$Ph^1 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

ハロ、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1 - C_6)$ アルキル部分が任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 及び $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル基からなる群

から独立に選択される置換基で任意に置換されてもよいチアゾリル - (C₀ - C₁) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = CH - 基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル基が任意に置換され、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - CH = CH - 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、
(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₁ - C₆) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Het¹ - (C₀ - C₃) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NHC(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₁ - C₆) アルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - C(O) - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NH - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NH - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - NH - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - NH - (C₀ - C₅) アルキル基

からなる群から独立に選択される 1 つの置換基で任意に置換されてもよい)、

d) ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基からなる群から選択される芳香族複素環置換基 (いずれもハロ、シアノ、-SCF₃、メチル、-CF₃、メトキシ、-OCF₃、ニトロ、ヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 1 又は 2 個の置換基で任意に置換されてもよく、更に任意に

任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が更に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₅) アルキル基 (3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

Ph¹ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₅) アルキル基、

ハロ、任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル - 基及び (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - NR^{1 2} - (C₀ - C₃) アルキル基からなる群から独立に選択される置換基で任意に置換されてもよいチアゾリル - (C₀ - C₁) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - CH = CH - 基、

任意にアルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - CH = CH - 基 (3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - S - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - O - (C₀ - C₅) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C₁ - C₆) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C₁ - C₆) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ar¹ - (C₀ - C₃) アルキル - SO₂ - (C₀ - C₅) アルキル基、

(C₁ - C₆) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

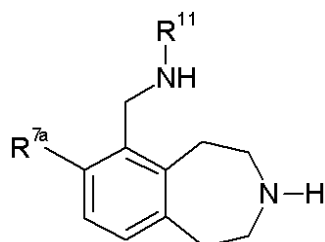
(C₃ - C₇) シクロアルキル - (C₀ - C₃) アルキル - C(O) - (C₀ - C₅) アルキル基、

Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ar^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ar^1 - (C_0 - C_3) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Het^1 - (C_0 - C_5) アルキル - 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - $\text{NHC}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{NH} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{NH} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 Ar^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{NH} - \text{C}(\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 (C_1 - C_6) アルキル - $\text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基、
 Ar^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基
 からなる群から選択される 1 つの置換基で置換されてもよい)、又は、
 e) - ナフタリル基、キノリン - 2 - イル基、キノリン - 3 - イル基又はキノリン - 4 - イル基であり、
 Ar^1 はピリジル基 (独立に選択される 1 ~ 4 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチル、 $-\text{CF}_3$ 、メトキシ、 $-\text{OCF}_3$ 、メチルチオ、 $-\text{SCF}_3$ からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、
 Ph^1 はフェニル基 (独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチルチオ、 $-\text{SCF}_3$ 、1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル基、及び 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルコキシル基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、
 Het^1 は、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、モルフォリニル基、チオモルフォリニル基、ホモモルフォリニル基及びホモチオモルフォリニル基からなる群から選択される飽和窒素含有複素環置換基であり、いずれも (C_1 - C_6) アルキル基又は 2 つのメチル置換基で任意に置換されてもよい)、
 又はその薬学的に許容できる塩。

【請求項 3】

式 (I b) の化合物

【化 3】



Ib

(式中、

R^{7a} はクロロ基であり、

R^{11} は

a) フェニル基 (任意に

i) 独立に選択される 1 ~ 5 個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、メチル、ヒドロキシ及びメトキシ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

iii) ハロ、シアノ、メチル、 $-CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、メトキシ、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $CH = CH$ - 基、

アルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $CH = CH$ - 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - O - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - S - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - SO_2 - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - $C(O)$ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $C(O)$ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - $C(O)$ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - $C(O)$ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - NH - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NHC(O)$ - ($C_0 - C_5$) アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

Ph^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

Ar^1 - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

Het^1 - (C_0 - C_5) アルキル - 基、
 (C_1 - C_6) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ar^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5) アルキル基
 からなる群から選択される 1 つの置換基で置換されてもよい)、又は、
 b) ピリジル基 (任意に、
 i) ハロ、シアノ、メチル、ヒドロキシ及びメトキシ基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は
 ii) ハロ、シアノ、メチル、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、メトキシ、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - O - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - $\text{CH}=\text{CH}$ - 基、
 アルキル基が 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{CH}=\text{CH}$ - 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - O - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - O - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - S - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - S - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - S - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - SO_2 - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - SO_2 - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - SO_2 - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_1 - C_6) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で (C_1 - C_6) アルキル部分が任意に置換されてもよい (C_1 - C_6) アルキル - $\text{NHC}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - NH - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 Ph^1 - (C_0 - C_3) アルキル - NH - $\text{C}(\text{O})$ - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_1 - C_6) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5) アルキル基、
 (C_3 - C_7) シクロアルキル - (C_0 - C_3) アルキル - $\text{C}(\text{O})$ - NH - (C_0 - C_5)

5) アルキル基、

$\text{Ph}^1 - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$ アルキル - $\text{C}(\text{O}) - \text{NH} - (\text{C}_0 - \text{C}_5)$ アルキル基

で置換されてもよい)、又は

c) ピリダジニル基(独立にハロ、シアノ、ヒドロキシ、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルコキシル基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキルチオ基からなる群から選択される1つ又は2つの置換基で任意に置換されてもよい)、又は、

d) 5員環の芳香族複素環(チオフェニル基、チアゾール基、イソチアゾール基から選択され、ハロ、シアノ、ヒドロキシ基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルコキシル基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキルチオ基、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキルアミノ基及び($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル - $\text{C}(\text{O}) -$ 基からなる群から独立に選択される1又は2個の置換基で任意に置換されてもよい)であり、

$\text{R}^{1,2}$ は水素又はメチル基であり、

Ar^1 はピリジル基(独立に選択される1~4個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチル、 $-\text{CF}_3$ 、メトキシ、 $-\text{OCF}_3$ 、メチルチオ、 $-\text{SCF}_3$ からなる群から独立に選択される1~3個の置換基で任意に置換されてもよい)であり、

Ph^1 はフェニル基(独立に選択される1~5個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチルチオ、 $-\text{SCF}_3$ 、1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル基、及び1~6個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルコキシル基からなる群から独立に選択される1~3個の置換基で任意に置換されてもよい)であり、

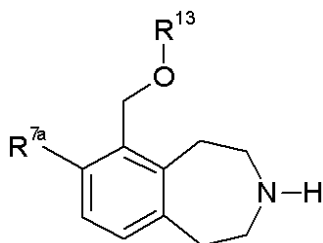
Het^1 は、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、モルフォリニル基、チオモルフォリニル基、ホモモルフォリニル基及びホモチオモルフォリニル基からなる群から選択される飽和窒素含有複素環置換基であり、いずれも($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル基又は2つのメチル置換基で任意に置換されてもよい)、

又はその薬学的に許容できる塩。

【請求項4】

式(Ic)の化合物

【化4】



Ic

(式中、

R^{7a} はクロロ基であり、

$\text{R}^{1,3}$ は

a) フェニル基(任意に、

i) 独立に選択される1~5個のハロ置換基、又は

ii) ハロ、シアノ、 $-\text{SCF}_3$ 、ニトロ、ヒドロキシ、1~6個のフルオロ置換基により更に任意に置換されてもよい($\text{C}_1 - \text{C}_6$)アルキル基及び1~6個のフルオロ置換基

により更に任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルコキシル基からなる群から独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基、又は

i i i) ハロ、シアノ、 $-SCF_3$ 、メチル、 $-CF_3$ 、メトキシ、 $-OCF_3$ 、ニトロ及びヒドロキシ基からなる群から独立に選択される 0、1 又は 2 個の置換基と共に、

任意に 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が置換されてもよく、フルオロ基及びメチル基から選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が独立に任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_5$) アルキル基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

$Ph^1 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $CH = CH -$ 基、1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル基が任意に置換され、フルオロ基及びメチル基から独立に選択される 1 ~ 6 個の置換基でシクロアルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $CH = CH -$ 基 (但し 3 つ以上の置換基がメチル基ではない)、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $S - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $S - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $S - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $S - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $O - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $O - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $O - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $O - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_1 - C_6$) アルキル - $C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Het^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基、

1 ~ 6 個のフルオロ置換基で ($C_1 - C_6$) アルキル部分が任意に置換されてもよい ($C_1 - C_6$) アルキル - $NHC(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

($C_3 - C_7$) シクロアルキル - ($C_0 - C_3$) アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、

$Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - C(O) - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) - NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $C(O) - NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1 - C_6)$ アルキル部分が任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $NH - SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - SO_2 - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $SO_2 NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基、
 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $SO_2 - NH - (C_0 - C_5)$ アルキル基からなる群から独立に選択される 1 つの置換基で任意に置換されてもよい)、又は
 b) チオフェニル基
 (ハロ、
 シアノ、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基、
 、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル基、
 、
 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $C(O) -$ 基、
 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) -$ 基、
 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $NH - C(O) -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - C(O) -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NH - C(O) -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $CH = CH -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $CO -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ基、
 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキルチオ基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で $(C_1 - C_6)$ アルキル部分が任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、
 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル - $(C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル基、
 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、
 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $NR^{1,2} - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、
 $Het^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - 基、
 $(C_1 - C_6)$ アルキル - $C(O) - NH -$ 基、
 $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) - NH -$ 基、
 $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $C(O) - NH -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基で任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル - $O - C(O) - NH -$ 基、
 1 ~ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ph^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - $O - C(O) - NH -$ 基及び

1 ～ 6 個のフルオロ置換基でアルキル部分が任意に置換されてもよい $Ar^1 - (C_0 - C_3)$ アルキル - O - C (O) - NH -

からなる群から選択される 1 又は 2 の置換基で炭素原子環が任意に置換されてもよい) であり、

Ar^1 はピリジル基 (独立に選択される 1 ～ 4 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチル、 $-CF_3$ 、メトキシ、 $-OCF_3$ 、メチルチオ、 $-SCF_3$ からなる群から独立に選択される 1 ～ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、

Ph^1 はフェニル基 (独立に選択される 1 ～ 5 個のハロ置換基、又は、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、アセチル、メチルチオ、 $-SCF_3$ 、1 ～ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルキル基、及び 1 ～ 6 個のフルオロ置換基で更に任意に置換されてもよい $(C_1 - C_6)$ アルコキシル基からなる群から独立に選択される 1 ～ 3 個の置換基で任意に置換されてもよい) であり、

Het^1 は、ピロリジニル基、ピペリジニル基、ホモピペリジニル基、モルフォリニル基、チオモルフォリニル基、ホモモルフォリニル基及びホモチオモルフォリニル基からなる群から選択される飽和窒素含有複素環置換基であり、いずれも $(C_1 - C_6)$ アルキル基又は 2 つのメチル置換基で任意に置換されてもよい)、

又はその薬学的に許容できる塩。

【請求項 5】

薬学的に許容できる担体、希釈剤又は添加剤との組み合わせで、有効成分として請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容できる塩を含んでなる医薬品組成物。

【請求項 6】

薬学的に許容できる担体、希釈剤又は添加剤との組み合わせで、有効成分として請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容できる塩を含んでなる、肥満の治療用の医薬品組成物。

【請求項 7】

薬学的に許容できる担体、希釈剤又は添加剤との組み合わせで、有効成分として請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容できる塩を含んでなる、強迫性障害の治療用の医薬品組成物。

【請求項 8】

薬学的に許容できる担体、希釈剤又は添加剤との組み合わせで、有効成分として請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容できる塩を含んでなる、うつ病の治療用の医薬品組成物。

【請求項 9】

薬学的に許容できる担体、希釈剤又は添加剤との組み合わせで、有効成分として請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物又はその薬学的に許容できる塩を含んでなる、不安の治療用の医薬品組成物。