

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-533464(P2004-533464A)

【公表日】平成16年11月4日(2004.11.4)

【年通号数】公開・登録公報2004-043

【出願番号】特願2003-503594(P2003-503594)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

C 0 7 D 215/36 (2006.01)

C 0 7 D 261/10 (2006.01)

C 0 7 D 271/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/70

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/472

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 9/06

C 0 7 D 215/36

C 0 7 D 261/10

C 0 7 D 271/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月25日(2005.5.25)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

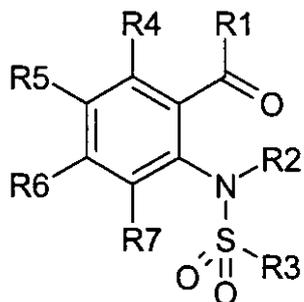
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】

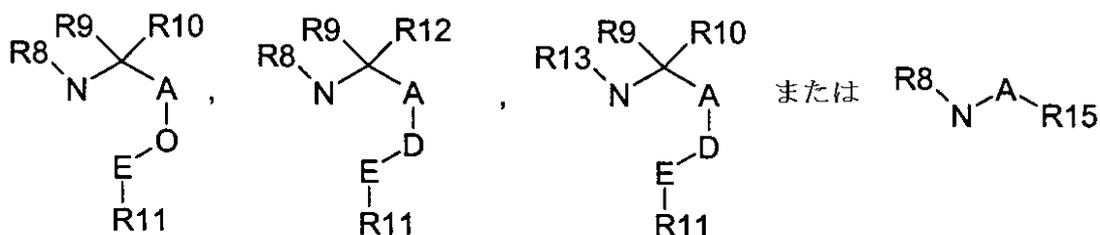


I

{ 式中 :

R (1) は、

【化2】

[A は、 $-C_nH_{2n}-$ であり ;

n = 0、1、2、3、4 または 5 であり ;

D は、結合または $-O-$ であり ;E は、 $-C_mH_{2m}-$ であり ;

m = 0、1、2、3、4 または 5 であり ;

R (8) は、水素、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキルまたは $C_pH_{2p}-R(14)$ であり ;

p は、0、1、2、3、4 または 5 であり ;

R (14) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、CN、 $COOMe$ 、 $CONH_2$ 、 $COMe$ 、 NH_2 、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されており ;

R (9) は、水素または 1、2、3、4、5 または 6 個の炭素原子を有するアルキルであり ;

R (10) は、水素、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 OCF_3 、 NO_2 、CN、 $COOMe$ 、 $CONH_2$ 、 $COMe$ 、 NH_2 、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されており ;

R (11) は、3、4、5 または 6 個の炭素原子を有するシクロアルキル、フェニル、ナフチル、チエニル、フリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、チエニル、フリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、Br、I、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(12)は、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキニル、3、4、5または6個の炭素原子を有するシクロアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、Br、I、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(13)は、C_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0、1、2、3、4または5であり；

R(15)は、3、4、5、6、7または8個の炭素原子を有するシクロアルキルである]であり；

R(2)は、水素または1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキルであり；

R(3)は、ヘテロアリールであって、

ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、Br、I、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

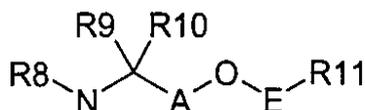
R(4)、R(5)、R(6)およびR(7)は、相互に独立して水素、F、Cl、Br、I、CF₃、OCF₃、NO₂、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである}

の化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項2】

R(1)が

【化3】



[Aは、-C_nH_{2n}-であり；

nは、0、1、2または3であり；

Eは、-C_mH_{2m}-であり；

mは、0、1、2または3であり；

R(8)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキルまたはC_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0、1、2または3であり；

R(14)は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3

または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(9)は、水素または1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキルであり；

R(10)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(11)は、フェニル、ナフチル、チエニル、フリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、チエニル、フリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されている]であり；

R(2)が水素または1、2または3個の炭素原子を有するアルキルであり；

R(3)がヘテロアリールであって、

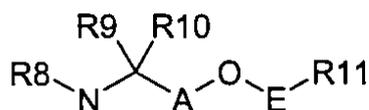
ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(4)、R(5)、R(6)およびR(7)が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1に記載の式Iの化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項3】

R(1)が

【化4】



[Aは、-C_nH_{2n}-であり；

nは、0または1であり；

Eは、-C_mH_{2m}-であり；

mは、0または1であり；

R(8)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキルまたはC_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0または1であり；

R(14)は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル

、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (9) は、水素、メチルまたはエチルであり；

R (10) は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (11) は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されている]であり；

R (2) が水素、メチルまたはエチルであり；

R (3) がヘテロアリアルであって、

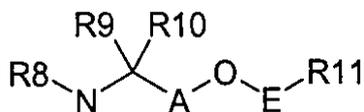
ここでヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (4)、R (5)、R (6) および R (7) が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1または2に記載の式Iの化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項4】

R (1) が

【化5】



[A は、 - C_nH_{2n} - であり；

n は、0または1であり；

E は、 - C_mH_{2m} - であり；

m は、0または1であり；

R (8) は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキルまたは C_pH_{2p} - R (14) であり；

p は、0または1であり；

R (14) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルまたはメチルスルホニルより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (9) は、水素、メチルまたはエチルであり ;

R (1 0) は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルまたはメチルスルホニルより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており ;

R (1 1) は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルまたはメチルスルホニルより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されている] であり ;

R (2) が水素であり ;

R (3) がヘテロアリールであって、

ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルまたはメチルスルホニルより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており ;

R (4) が水素、F、Cl、CF₃、メチルまたはメトキシであり ;

R (5) が水素、F、Cl、CF₃、メチル、メトキシ、COMe、OCF₃、CNまたはOHであり ;

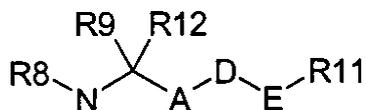
R (6) が水素、F、Cl、CF₃、メチルまたはメトキシであり ;

R (7) が水素、F、Cl、CF₃、メチル、エチル、メトキシまたはOHである、請求項1~3のいずれか1項に記載の式Iの化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項5】

R (1) が

【化6】



[A は、 - C_nH_{2n} - であり ;

n は、0、1、2または3であり ;

D は、結合または - O - であり ;

E は、 - C_mH_{2m} - であり ;

m は、0、1、2または3であり ;

R (8) は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキルまたは C_pH_{2p} - R (1 4) であり ;

p は、0、1、2または3であり ;

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており ;

R (9) は、水素または1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキルであり ;

R (1 1) は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジ

ニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(12)は、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、1、2または3個の炭素原子を有するアルキニル、3、4、5または6個の炭素原子を有するシクロアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されている]であり；

R(2)が水素または1、2または3個の炭素原子を有するアルキルであり；

R(3)がヘテロアリールであって、

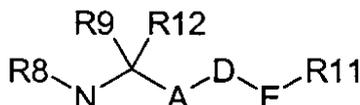
ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(4)、R(5)、R(6)およびR(7)が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1に記載の式Iの化合物およびその薬理的に受容できる塩。

【請求項6】

R(1)が

【化7】



[Aは、-C_nH_{2n}-であり；

nは、0または1であり；

Dは、結合または-O-であり；

Eは、-C_mH_{2m}-であり；

mは、0または1であり；

R(8)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキルまたはC_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0または1であり；

R(14)は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されて

あり；

R (9) は、水素、メチルまたはエチルであり；

R (1 1) は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (1 2) は、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、エチニル、シクロプロピル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されている]であり；

R (2) が水素、メチルまたはエチルであり；

R (3) がヘテロアリールであって、

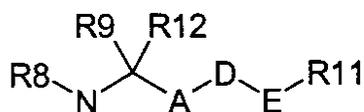
ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (4)、R (5)、R (6) および R (7) が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1または5に記載の式Iの化合物およびその薬理学的に受容できる塩。

【請求項7】

R (1) が

【化8】



[A は、 - C_nH_{2n} - であり；

n は、0 または 1 であり；

D は、結合または - O - であり；

E は、 - C_mH_{2m} - であり；

m は、0 または 1 であり；

R (8) は、水素、1、2 または 3 個の炭素原子を有するアルキルまたは C_pH_{2p} - R (1 4) であり；

p は、0 または 1 であり；

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R (9) は、水素、エチルまたはメチルであり；

、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(13)は、C_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0、1、2または3であり；

R(14)は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されている]であり；

R(2)が水素または1、2または3個の炭素原子を有するアルキルであり；

R(3)がヘテロアリールであって、

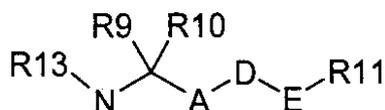
ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COOMe、CONH₂、COMe、NH₂、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1、2または3個の置換基によって置換されており；

R(4)、R(5)、R(6)およびR(7)が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1に記載の式Iの化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項9】

R(1)が

【化10】



[Aは、-C_nH_{2n}-であり；

nは、0または1であり；

Dは、結合または-O-であり；

Eは、-C_mH_{2m}-であり、

mは、0または1であり；

R(9)は、水素、メチルまたはエチルであり；

R(10)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、NH₂、OH、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R(11)は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、イ

ンドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R(13)は、C_pH_{2p}-R(14)であり；

pは、0または1であり；

R(14)は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されている]であり；

R(2)が水素、メチルまたはエチルであり；

R(3)がヘテロアリアルであって、

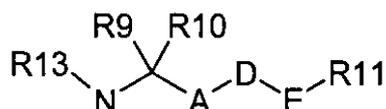
ここでヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R(4)、R(5)、R(6)およびR(7)が相互に独立して水素、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、OH、1、2、3または4個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項1または8に記載の式Iの化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項10】

R(1)が

【化11】



[Aは、-C_nH_{2n}-であり；

nは、0または1であり；

Dは、結合または-O-であり；

Eは、-C_mH_{2m}-であり、

mは、0または1であり；

R(9)は、水素、メチルまたはエチルであり；

R(10)は、水素、1、2または3個の炭素原子を有するアルキル、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される1または2個の置換基によって置換されており；

R(11)は、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルであって、

ここでフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、インドリル、インダゾリル、キノリル、イソキノリル、フタラジニル、キノキサリニル、キナゾリニルまたはシンノリニルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルおよび

メチルスルホニルより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されており；

R (1 3) は、 $C_p H_{2p} - R (1 4)$ であり；

p は、0 または 1 であり；

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルおよびメチルスルホニルより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されている] であり；

R (2) が水素であり；

R (3) がヘテロアリールであって、

ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルおよびメチルスルホニルより成る群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されており；

R (4) が水素、F、Cl、 CF_3 、メチルまたはメトキシであり；

R (5) が水素、F、Cl、 CF_3 、メチル、メトキシ、COMe、 OCF_3 、CN または OH であり；

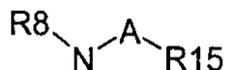
R (6) が水素、F、Cl、 CF_3 、メチル、メトキシまたは OH であり；

R (7) が水素、F、Cl、 CF_3 、メチル、エチル、メトキシまたは OH である、請求項 1、8 または 9 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項 1 1】

R (1) が

【化 1 2】



[A は、 $-C_n H_{2n}-$ であり；

n = 0、1、2 または 3 であり；

R (8) は、水素、1、2 または 3 個の炭素原子を有するアルキルまたは $C_p H_{2p} - R (1 4)$ であり；

p は、0、1、2、または 3 であり；

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、 $COOMe$ 、 $CONH_2$ 、COMe、 NH_2 、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されており；

R (1 5) が 3、4、5、6 または 7 個の炭素原子を有するシクロアルキルである] であり；

R (2) が水素または 1、2 または 3 個の炭素原子を有するアルキルであり；

R (3) がヘテロアリールであって、

ここでヘテロアリールは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、 $COOMe$ 、 $CONH_2$ 、COMe、 NH_2 、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1、2 または 3 個の置換基によって置換されており；

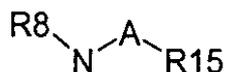
R (4)、R (5)、R (6) および R (7) が相互に独立して水素、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチ

ルスルホニルアミノである、請求項 1 に記載の式 I の化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項 1 2】

R (1) が

【化 1 3】



[A は、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n}-$ であり；

n は、0 または 1 であり；

R (8) は、水素、1、2 または 3 個の炭素原子を有するアルキルまたは $\text{C}_p\text{H}_{2p}-\text{R}$ (1 4) であり；

p は、0 または 1 であり；

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されており；

R (1 5) が 3、4、5、6 または 7 個の炭素原子を有するシクロアルキルである] であり；

R (2) が水素、メチルまたはエチルであり；

R (3) がヘテロアリアルであって、

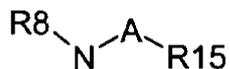
ここでヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されており；

R (4)、R (5)、R (6) および R (7) が相互に独立して水素、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、OH、1、2、3 または 4 個の炭素原子を有するアルキル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイル、メチルスルホニルおよびメチルスルホニルアミノである、請求項 1 または 1 1 に記載の式 I の化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項 1 3】

R (1) が

【化 1 4】



[A は、 $-\text{C}_n\text{H}_{2n}-$ であり；

n は、0 または 1 であり；

R (8) は、水素、1、2 または 3 個の炭素原子を有するアルキルまたは $\text{C}_p\text{H}_{2p}-\text{R}$ (1 4) であり；

p は、0 または 1 であり；

R (1 4) は、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルであって、

ここでフェニル、ナフチルおよびヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、 CF_3 、 OCF_3 、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルおよびメチルスルホニルより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されており；

R (1 5) が 3、4、5、6 または 7 個の炭素原子を有するシクロアルキルである] であり；

R (2) が水素であり ;

R (3) がヘテロアリアルであって、

ここでヘテロアリアルは、未置換であるかまたは、F、Cl、CF₃、OCF₃、CN、COMe、メチル、メトキシ、エトキシ、ジメチルアミノ、スルファモイルまたはメチルスルホニルより成る群から選択される 1 または 2 個の置換基によって置換されており ;

R (4) が水素、F、Cl、CF₃、メチルまたはメトキシであり ;

R (5) が水素、F、Cl、CF₃、メチル、メトキシ、COMe、OCF₃、CN または OH であり ;

R (6) が水素、F、Cl、CF₃、メチル、メトキシまたは OH であり ;

R (7) が水素、F、Cl、CF₃、メチル、エチル、メトキシまたは OH である、請求項 1、11 または 12 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物およびその薬学的に受容できる塩。

【請求項 14】

医薬として使用するための請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物およびその生理学的に許容される塩。

【請求項 15】

活性成分としての有効量の少なくとも 1 種の請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩、ならびに薬学的に受容できるキャリアーおよび添加剤および、適当な場合、さらに 1 種またはそれ以上の他の薬理学的活性成分を含む医薬製剤。

【請求項 16】

K⁺チャンネルに媒介される疾患の治療および予防用の K⁺チャンネル - 遮断作用を有する医薬を製造するための、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 17】

活動電位の延長によって取り除くことができる心不整脈の治療または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 18】

再入不整脈の治療および予防用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 19】

上室性不整脈の治療および予防用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 20】

心房細動または心房粗動の治療および予防用の医薬を製造するための、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 21】

活性成分としての有効量の少なくとも 1 種の請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物および / またはその生理学的に許容される塩およびベータ - 遮断薬、ならびに薬学的に受容できるキャリアーおよび添加剤を含む医薬製剤。