

【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12月7日(2006.12.7)

【公表番号】特表2006-514110(P2006-514110A)

【公表日】平成18年4月27日(2006.4.27)

【年通号数】公開・登録公報2006-017

【出願番号】特願2005-506646(P2005-506646)

【国際特許分類】

|         |         |           |
|---------|---------|-----------|
| C 0 7 C | 229/14  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 239/42  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/505  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 251/14  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/53   | (2006.01) |
| C 0 7 D | 401/12  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/506  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 403/12  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 241/20  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4965 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 213/74  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/44   | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/5377 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 405/10  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/192  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 207/325 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/40   | (2006.01) |
| C 0 7 D | 401/04  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 213/30  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 401/14  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 261/14  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/42   | (2006.01) |
| C 0 7 D | 231/38  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/415  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 277/20  | (2006.01) |
| C 0 7 D | 277/42  | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/426  | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 15/00   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/04   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/02    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 7/04    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 29/00   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/10   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 7/12    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/08   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/02   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 19/00   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/02    | (2006.01) |
| A 6 1 P | 15/08   | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/06   | (2006.01) |

**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/08 (2006.01)**

**C 0 7 B 61/00 (2006.01)**

**【 F I 】**

C 0 7 C 229/14

C 0 7 D 239/42 C S P Z

A 6 1 K 31/505

C 0 7 D 251/14

A 6 1 K 31/53

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 241/20

A 6 1 K 31/4965

C 0 7 D 213/74

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 405/10

A 6 1 K 31/192

C 0 7 D 207/325

A 6 1 K 31/40

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 213/30

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 261/14

A 6 1 K 31/42

C 0 7 D 231/38 Z

A 6 1 K 31/415

C 0 7 D 277/42

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 9/02

A 6 1 P 7/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 7/12

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/08

C 0 7 B 61/00 3 0 0

**【 手 続 補 正 書 】**

**【 提 出 日 】** 平成18年10月17日 (2006.10.17)

【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

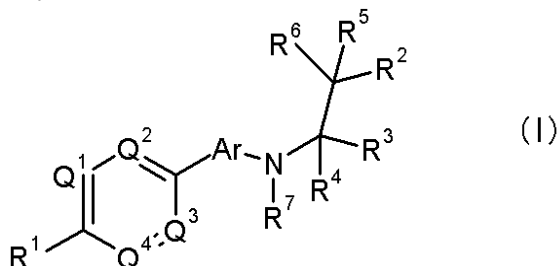
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



式中、

Ar は、フェニレンまたは、O、N および S からなる群から選択される 1 個ないし 3 個のヘテロ原子を含有する 5 員もしくは 6 員のヘテロアリールを表し、

ここで、該フェニルまたは 5 員もしくは 6 員のヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N, N - ジ(C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、ホルミル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ、および (C<sub>1</sub> - 6) アルキル (ヒドロキシまたは 1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基を有することもあり、

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup> および Q<sup>4</sup> は、独立して、CH、CR<sup>10</sup> または N を表し、ここで、R<sup>10</sup> は、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、メチルチオ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) または (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ (フェニルにより置換されていることもある) を表し、

R<sup>1</sup> は、-OR<sup>11</sup>、-CH<sub>2</sub>NHR<sup>11</sup>、-C(O)R<sup>11</sup>、-C(O)NHR<sup>11</sup>、-SR<sup>11</sup>、-SOR<sup>11</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、-NHR<sup>11</sup>、-NHC(O)OR<sup>11</sup>、-NHC(O)NR<sup>11</sup>、-NHC(O)R<sup>11</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、

O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環、

(C<sub>1</sub> - 6) アルキル { アリールオキシミノ、または、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ (アリールまたはヘテロアリールにより置換されていることもある) }、または、O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある、

(C<sub>2</sub> - 6) アルケニル (O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

(C<sub>2</sub> - 6) アルキニル (O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

を表し

[これらのいずれにおいても、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環は、

ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルチオ、  
(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)、

(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)、

アリール(ニトロ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルまたは(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシにより置換されていることもある)、

アラキル(アリール部分で、ニトロ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルまたは(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシにより置換されていることもある)、

および、

アリールオキシ(ニトロ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルまたは(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシにより置換されていることもある)、

からなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されていることもあり、

ここで、

R<sup>1</sup>は、(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(C<sub>1</sub> - 6)アルキレン、

OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環、

(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個もしくは3個のハロゲンにより、または、OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

(C<sub>2</sub> - 6)アルケニル(OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、または、

(C<sub>2</sub> - 6)アルキニル(OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

を表し、

これらのいずれにおいても、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環は、

ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、

(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)、および、

(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)

からなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されていることもある]；

R<sup>2</sup>は、水素、ヒドロキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6)アルキルアミノ、(C<sub>2</sub> - 6)アルケニル、(C<sub>2</sub> - 6)アルキニル、(C<sub>3</sub> - 7)シクロアルキル、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルチオ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルスルホニル、アリール、ヘテロアリール、

(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個もしくは3個のハロゲン、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルチオ、アリールまたはヘテロアリールにより置換されていることもある)、または、

(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(1個、2個もしくは3個のハロゲン、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルスルホニル、アリールまたはヘテロアリールにより置換されていることもある)

を表し

[これらのいずれにおいても、アリールまたはヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6)アルキルアミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub> - 6)アルキルアミノ、N - (4,5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール)アミノ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキル、フェニル、O、NおよびSからなる群から選択される1個ないし3個のヘテロ原子を有

する5員または6員のヘテロアリール、および、(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(モルホリノ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6)アルキルアミノまたはN,N - ジ(C<sub>1</sub> - 6)アルキルアミノにより置換されていることもある)からなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されていることもある]；

R<sup>3</sup> は、水素、または1個、2個もしくは3個のハロゲンにより置換されていることもあるC<sub>1</sub> - 6アルキルを表し；

R<sup>4</sup> は、カルボキシ、テトラゾリルまたはN - (ヒドロキシ)アミノカルボニルを表し；

R<sup>5</sup> は、水素、(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ、アリール、ヘテロアリールまたは(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)を表し；

R<sup>6</sup> は、水素または(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)を表し；そして、

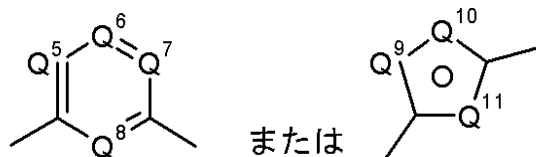
R<sup>7</sup> は、水素または(C<sub>1</sub> - 6)アルキルを表す、  
のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項2】

式中、

Arが、

#### 【化2】



または

を表し、

Q<sup>5</sup>、Q<sup>6</sup>、Q<sup>7</sup> および Q<sup>8</sup> は、独立して、CH、CR<sup>8</sup> またはNを表し、

Q<sup>9</sup>、Q<sup>10</sup> および Q<sup>11</sup> は、独立して、O、S、CH、CR<sup>8</sup>、CH<sub>2</sub>、NHまたはNR<sup>9</sup>を表し、

ここで、R<sup>8</sup> は、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、メチルチオ、(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ、または、(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)を表し、

R<sup>9</sup> は、(C<sub>1</sub> - 6)アルキルを表し；

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup> および Q<sup>4</sup> が、独立して、CH、CR<sup>10</sup> またはNを表し、

ここで、R<sup>10</sup> は、ハロゲン、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、メチルチオ、(C<sub>1</sub> - 6)アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)または(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(フェニルにより置換されていることもある)を表し；

R<sup>1</sup> が、-OR<sup>11</sup>、-CH<sub>2</sub>NHR<sup>11</sup>、-C(O)R<sup>11</sup>、-C(O)NHR<sup>11</sup>、-SR<sup>11</sup>、-SOR<sup>11</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、-NHR<sup>11</sup>、-NHC(O)R<sup>11</sup>、-NHC(O)OR<sup>11</sup>、-NHC(O)NR<sup>11</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、

OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環、

(C<sub>1</sub> - 6)アルキル{アリーロキシイミノ、または、(C<sub>1</sub> - 6)アルコキシ(アリールもしくはヘテロアリールにより置換されていることもある)、または、OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環により置換されていることもある}、

(C<sub>2</sub> - 6)アルケニル(OまたはNから独立して選択される1個または2個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3員ないし10員、単環式または二環式の環

により置換されていることもある)、

( $C_{2-6}$ ) アルキニル (O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

を表し

[ これらのいずれにおいても、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環は、

ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、

( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある)、

( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある)、

アリール (ニトロ、( $C_{1-6}$ ) アルキルまたは ( $C_{1-6}$ ) アルコキシにより置換されていることもある)、

アラキル (アリール部分で、ニトロ、( $C_{1-6}$ ) アルキルまたは ( $C_{1-6}$ ) アルコキシにより置換されていることもある)、

および、

アリーロキシ (ニトロ、( $C_{1-6}$ ) アルキルまたは ( $C_{1-6}$ ) アルコキシにより置換されていることもある)、

からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基により置換されていることもあり、

ここで、

$R^{11}$  は、( $C_{1-6}$ ) アルコキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキレン、

O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環、

( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンにより、または、O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

( $C_{2-6}$ ) アルケニル (O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、または、

( $C_{2-6}$ ) アルキニル (O または N から独立して選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を有することもある、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環により置換されていることもある)、

を表し、

これらのいずれにおいても、飽和または不飽和、3 員ないし 10 員、単環式または二環式の環は、

ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、

( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある)、および、

( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある)

からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基により置換されていることもある]

$R^2$  が、水素、ヒドロキシ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、( $C_{2-6}$ ) アルケニル、( $C_{2-6}$ ) アルキニル、( $C_{3-7}$ ) シクロアルキル、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、( $C_{1-6}$ ) アルキルスルホニル、アリール、ヘテロアリール、

( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲン、( $C_{1-6}$ ) アルキルスルホニル、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、アリールまたはヘテロアリールにより置換されていることもある)、または、

( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲン、( $C_{1-6}$ ) アルキルスルホニル、アリールまたはヘテロアリールにより置換されていることもある)

を表し

[ これらのいずれにおいても、アリールまたはヘテロアリールは、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、N,N - ジ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、N - (4,5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール) アミノ、( $C_{1-6}$ ) アルキル、フェニル、O、N および S からなる群から選択される 1 個ないし 4 個のヘテロ原子を有する 5 員または 6 員のヘテロアリール、および、( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (モルホリノ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノまたは N,N - ジ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の置換基により置換されていることもある ] ;

$R^3$  が、水素、または 1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンにより置換されていることもある  $C_{1-6}$  アルキルを表し ;

$R^4$  が、カルボキシ、テトラゾリルまたは N - (ヒドロキシ) アミノカルボニルを表し ;

$R^5$  が、水素、( $C_{1-6}$ ) アルキル、( $C_{1-6}$ ) アルコキシ、アリールまたはヘテロアリールを表し ;

$R^6$  が、水素を表し ; そして、

$R^7$  が、水素または ( $C_{1-6}$ ) アルキルを表す、

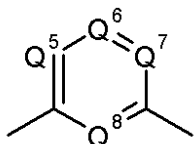
請求項 1 に記載の式 (I) のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

【請求項 3】

式中、

Ar が、

【化 3】



を表し、

$Q^5$ 、 $Q^6$ 、 $Q^7$  および  $Q^8$  は、独立して、CH、 $CR^8$  または N を表し、

ここで、 $R^8$  は、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、メチルチオ、( $C_{1-6}$ ) アルコキシ、または、1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンにより置換されていることもある ( $C_{1-6}$ ) アルキルを表し、

$Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $Q^3$  および  $Q^4$  が、独立して、CH、 $CR^{10}$  または N を表し、

ここで、 $R^{10}$  は、ハロゲン、アミノ、ニトロ、ホルミル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、メチルチオまたはベンジルオキシを表し ;

$R^1$  が、 $-OR^{11}$ 、 $-CH_2OR^{11}$ 、 $-CH_2NHR^{11}$ 、 $-C(O)R^{11}$ 、 $-C(O)NHR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-SOR^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、 $-NHR^{11}$ 、 $-NHC(O)R^{11}$ 、 $-NHC(O)OR^{11}$ 、 $-NHC(O)NR^{11}$ 、 $-NHOSO_2R^{11}$ 、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、

( $C_{1-6}$ ) アルキル (フェノキシイミノ、( $C_{1-6}$ ) アルコキシまたは  $R^{12}$  により置換されていることもあり、該 ( $C_{1-6}$ ) アルコキシは、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルまたはジヒドロイソキノリルにより置換されていることもある)、

$R^{12}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、

$R^{12}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、または、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロ

リル、ピペリジノ、ピペリジル、ピペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、  
 プリジル、ピラジニル、プリダジニル、プリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、  
 インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルから  
 なる群から選択される炭素環式または複素環式環の1つ、  
 を表し

[これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニ  
 トロ、シアノ、カルボキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub>  
 - 6) アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル  
 、ナフチル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されて  
 いることもある)、および、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(1個、2個もしくは3個のハロゲ  
 ンまたはフェニルにより置換されていることもある)からなる群から選択される1個ない  
 し3個の置換基で置換されていることもあり、

ここで、

R<sup>1 1</sup> は、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(C<sub>1</sub> - 6) アルキレン、

R<sup>1 0 1</sup> により置換されていることもある(C<sub>1</sub> - 6) アルキル、

R<sup>1 0 1</sup> により置換されていることもある(C<sub>2</sub> - 6) アルケニル、

R<sup>1 0 1</sup> により置換されていることもある(C<sub>2</sub> - 6) アルキニル、または、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロ  
 リル、ピペリジノ、ピペリジル、ピペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、  
 プリジル、ピラジニル、プリダジニル、プリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、  
 インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルから  
 なる群から選択される炭素環式または複素環式環の1つ、

を表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニト  
 ロ、シアノ、カルボキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル) アミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub>  
 - 6 アルキル) アミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、  
 ナフチル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されてい  
 ることもある)および(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(1個、2個または3個のハロゲンにより  
 置換されていることもある)からなる群から選択される1個ないし3個の置換基で置換さ  
 れていることもあり、

R<sup>1 0 1</sup> は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリ  
 ジニル、ピロリル、ピペリジノ、ピペリジル、ピペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル  
 、フェニル、プリジル、ピラジニル、プリダジニル、プリミジニル、ベンゾジオキソリル  
 、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソ  
 キノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の1つを表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニト  
 ロ、シアノ、カルボキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル) アミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub>  
 - 6 アルキル) アミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、  
 ナフチル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されてい  
 ることもある)および(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(1個、2個または3個のハロゲンにより  
 置換されていることもある)からなる群から選択される1個ないし3個の置換基で置換さ  
 れていることもあり；

R<sup>1 2</sup> は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジ  
 ニル、ピロリル、ピペリジノ、ピペリジル、ピペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、  
 フェニル、プリジル、ピラジニル、プリダジニル、プリミジニル、ベンゾジオキソリル、  
 ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキ  
 ノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の1つを表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニト  
 ロ、シアノ、カルボキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6 アルキル) アミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub>  
 - 6 アルキル) アミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、



ナフチル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) および (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもある] ;

R<sup>2</sup> が、水素、ヒドロキシ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、(C<sub>2</sub> - 6) アルケニル、(C<sub>2</sub> - 6) アルキニル、(C<sub>3</sub> - 7) シクロアルキル、ピリミジニル、インドリル、ピリジル、

(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ (アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N, N - ジ (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノまたはフェニルにより置換されていることもある)、

(C<sub>1</sub> - 6) アルキル (フェニル、1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲン、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオまたは (C<sub>1</sub> - 6) アルキルスルホニルにより置換されていることもある)、フェニル {ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N - (ジヒドロイミダゾリル) アミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルまたは (C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ (R<sup>2 1</sup> により置換されていることもあり、R<sup>2 1</sup> は、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N, N - ジ (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノまたはモルホリノを表す) により置換されていることもある} を表し ;

R<sup>3</sup> が、水素または (C<sub>1</sub> - 6) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) を表し ;

R<sup>4</sup> が、カルボキシ、テトラゾリルまたは N - (ヒドロキシ) アミノカルボニルを表し ;

R<sup>5</sup> が、水素、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニルまたはピリダジニルを表し ;

R<sup>6</sup> が、水素を表し ; そして、

R<sup>7</sup> が、水素または (C<sub>1</sub> - 6) アルキルを表す、

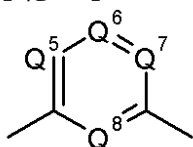
請求項 1 に記載の式 (I) のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 4】

式中、

Ar が、

#### 【化 4】



を表し、

Q<sup>5</sup> および Q<sup>7</sup> は、独立して CH または N を表し、

Q<sup>6</sup> および Q<sup>8</sup> は、独立して CH または CR<sup>8</sup> を表し、

ここで、R<sup>8</sup> は、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、メチルチオまたはトリフルオロメチルを表し ;

Q<sup>1</sup> が、独立して、CH または CR<sup>1 0</sup> を表し、

ここで、R<sup>1 0</sup> は、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、ホルミル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、メチルチオまたはベンジルオキシを表し ;

Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup> および Q<sup>4</sup> が、CH を表し ;

R<sup>1</sup> が、-OR<sup>1 1</sup>、-CH<sub>2</sub>NHR<sup>1 1</sup>、-C(O)R<sup>1 1</sup>、-C(O)NHR<sup>1 1</sup>、-SR<sup>1 1</sup>、-SOR<sup>1 1</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>1 1</sup>、-NHR<sup>1 1</sup>、-NHC(O)R<sup>1 1</sup>、-NHC(O)OR<sup>1 1</sup>、-NHC(O)NR<sup>1 1</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>1 1</sup>、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、

(C<sub>1</sub> - 6) アルキル ((C<sub>1</sub> - 6) アルコキシまたは R<sup>1 2</sup> により置換されていること

もあり、該 ( $C_{1-6}$ ) アルコキシは、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルまたはジヒドロイソキノリルにより置換されていることもある)、

$R^{1,2}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、

$R^{1,2}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、または、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、ペペリジノ、ペペリジル、ペペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の 1 つ、

を表し

[これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ、N,N - ジ ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) および ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもあり、

$R^{1,1}$  は、( $C_{1-6}$ ) アルコキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキレン、

$R^{1,0,1}$  により置換されていることもある ( $C_{1-6}$ ) アルキル、

$R^{1,0,1}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、

$R^{1,0,1}$  により置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、または、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、ペペリジノ、ペペリジル、ペペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、フェニル、ピリジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の 1 つ、

を表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、N,N - ジ ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) および ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもあり、

$R^{1,0,1}$  は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の 1 つを表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、N - ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ、N,N - ジ ( $C_{1-6}$  アルキル) アミノ、( $C_{1-6}$ ) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、( $C_{1-6}$ ) アルキル (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) および ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ (1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある) からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもあり、

$R^{1,2}$  は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルおよびジヒドロイソキノリルから

なる群から選択される炭素環式または複素環式環の1つを表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) - アルキルアミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub> - 6) - アルキルアミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)および(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(1個、2個または3個のハロゲンにより置換されていることもある)からなる群から選択される1個ないし3個の置換基で置換されていることもある]；

R<sup>2</sup> が、水素、ヒドロキシ、(C<sub>2</sub> - 6) アルケニル、(C<sub>2</sub> - 6) アルキニル、(C<sub>3</sub> - 7) シクロアルキル、ピリジニル、インドリル、ピリジル、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノまたはフェニルにより置換されていることもある)、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル(フェニル、1個、2個もしくは3個のハロゲン、(C<sub>1</sub> - 6) アルキルチオまたは(C<sub>1</sub> - 6) アルキルスルホニルにより置換されていることもある)、フェニル{ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N - (ジヒドロイミダゾリル)アミノ、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル、または(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ(R<sup>2 1</sup>により置換されていることもあり、R<sup>2 1</sup>は、アミノ、N - (C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノ、N,N - ジ(C<sub>1</sub> - 6) アルキルアミノまたはモルホリノを表す)により置換されていることもある}を表し；

R<sup>3</sup> が、水素、または1個、2個もしくは3個のハロゲンにより置換されていることもある(C<sub>1</sub> - 6) アルキルを表し；

R<sup>4</sup> が、カルボキシ、テトラゾリルまたはN - (ヒドロキシ)アミノカルボニルを表し；

R<sup>5</sup> が、水素、(C<sub>1</sub> - 6) アルキル、(C<sub>1</sub> - 6) アルコキシ、フェニルまたはピリジニルを表し；

R<sup>6</sup> が、水素を表し；そして、

R<sup>7</sup> が、水素、メチルまたはエチルを表す、

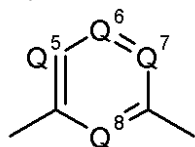
請求項1に記載の式(I)のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

【請求項5】

式中、

Ar が、

【化5】



を表し、

Q<sup>5</sup> および Q<sup>7</sup> は、Nを表し、

Q<sup>6</sup> および Q<sup>8</sup> は、独立してCHまたはCR<sup>8</sup>を表し、

ここで、R<sup>8</sup> は、フルオロ、クロロ、アミノ、ニトロ、ホルミル、ヒドロキシメチル、トリフルオロメチルまたはメチルチオを表し；

Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup> および Q<sup>4</sup> が、CHまたはCR<sup>1 0</sup>を表し、

ここで、R<sup>1 0</sup> は、ハロゲン、アミノ、ニトロ、ホルミル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、メチルチオまたはベンジルオキシを表し；

R<sup>1</sup> が、-OR<sup>1 1</sup>、-CH<sub>2</sub>NHR<sup>1 1</sup>、-C(O)R<sup>1 1</sup>、-C(O)NHR<sup>1 1</sup>、-SR<sup>1 1</sup>、-SOR<sup>1 1</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>1 1</sup>、-NHR<sup>1 1</sup>、-NHC(O)R<sup>1 1</sup>、-NHC(O)OR<sup>1 1</sup>、-NHC(O)NR<sup>1 1</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>1 1</sup>、水素、ヒドロ

キシ、ハロゲン、ベンゾジオキソリル、ナフチル、フェニル（ニトロ、 $(C_1 - 6)$ アルコキシ、 $(C_1 - 6)$ アルキルチオ、フェニルおよびフェノキシからなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもある）、

$(C_1 - 6)$ アルキル{アニリノ、N - (ベンジル)アミノ、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリル、ジヒドロイソキノリル、フェノキシイミノ、フェニル（ハロゲンにより置換されていることもある）または $(C_1 - 6)$ アルコキシにより置換されていることもあり、該 $(C_1 - 6)$ アルコキシは、フェニル、ピリジル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリルまたはジヒドロイソキノリルにより置換されていることもある}、

フェニルにより置換されていることもある $(C_2 - 6)$ アルケニル、  
フェニルにより置換されていることもある $(C_2 - 6)$ アルキニル

を表し

$[R^{11}]$  は、 $(C_1 - 6)$ アルコキシ $(C_1 - 6)$ アルキレン、

$R^{101}$  により置換されていることもある $(C_1 - 6)$ アルキル、

$R^{101}$  により置換されていることもある $(C_2 - 6)$ アルケニル、

$R^{101}$  により置換されていることもある $(C_2 - 6)$ アルキニル、または、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリルおよびジヒドロイソキノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の 1 つ、

を表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - 6)$ アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、 $(C_1 - 6)$ アルキル（1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある）および $(C_1 - 6)$ アルコキシ（1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある）からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもあり、

$R^{101}$  は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピロリジニル、ピロリル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ベンゾジオキソリル、ナフチル、インドリル、イソインドリル、キノリルおよびジヒドロイソキノリルからなる群から選択される炭素環式または複素環式環の 1 つを表し、

これらのいずれにおいても、炭素環式または複素環式環は、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $(C_1 - 6)$ アルキルチオ、フェニル、フェノキシ、ベンジル、ナフチル、 $(C_1 - 6)$ アルキル（1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある）、および $(C_1 - 6)$ アルコキシ（1 個、2 個または 3 個のハロゲンにより置換されていることもある）からなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもある]；

$R^2$  が、水素、ヒドロキシ、 $(C_2 - 6)$ アルケニル、 $(C_2 - 6)$ アルキニル、ピリミジニル、インドリル、ピリジル、

フェニルにより置換されていることもある $(C_1 - 6)$ アルコキシ、

$(C_1 - 6)$ アルキル（フェニル、メチルチオ、1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンまたは $(C_1 - 6)$ アルキルスルホニルにより置換されていることもある）、

フェニル（ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N - (ジヒドロイミダゾリル)アミノまたは $(C_1 - 6)$ アルコキシにより置換されていることもあり、該 $(C_1 - 6)$ アルコキシは、アミノ、N -  $(C_1 - 6)$ アルキルアミノ、N,N - ジ $(C_1 - 6)$ アルキルアミノまたはモルホリノにより置換されていることもある）

を表し；

$R^3$  が、水素または $(C_1 - 6)$ アルキルを表し；

$R^4$  が、カルボキシ、テトラゾリルまたは N - (ヒドロキシ)アミノカルボニルを表し

;

$R^5$  が、水素、フェニルまたはピリジルを表し；

$R^6$  が、水素を表し；そして、

$R^7$  が、水素を表す、

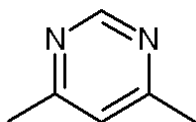
請求項 1 に記載の式 (I) のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

【請求項 6】

式中、

Ar が、

【化 6】



を表し、

$Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $Q^3$  および  $Q^4$  が、CH を表し、

$R^1$  が、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、ベンゾジオキソリル、ナフチル、シクロプロピルメトキシ、シクロブチルメトキシ、シクロペンチルメトキシ、シクロヘキシルメトキシ、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、ピロリジニルメトキシ、ピロリジニルエトキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、フルオロベンジルオキシ、ジフルオロベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、メトキシベンジルオキシ、ジメトキシベンジルオキシ、1H-ピロリルメトキシ、1H-ピロリルエトキシ、ピリジニルオキシ、トリフルオロメチルピリジニルオキシ、ピリジニルメトキシ、フェニルエトキシ、ピリジニルエトキシ、フェニルプロポキシ、シアノピリジニルオキシ、ピリミジニルオキシ、トリフルオロメチルピリミジニルオキシ、キノリニルオキシ、ベンゾイル、フルオロベンゾイル、クロロベンゾイル、アニリノカルボニル、ベンジルアミノ、ベンゾイルアミノ、フェニルアセチルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、フルオロフェニルスルホニルアミノ、シクロプロピルメチルアミノ、アニリノメチル、

フェニル（ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチルチオ、フェニルおよびフェノキシからなる群から選択される 1 個ないし 3 個の置換基で置換されていることもある）、

( $C_{1-6}$ ) アルキル { アニリノ、N-（ベンジル）アミノ、インドリル、イソインドリル、キノリル、イソキノリル、ジヒドロイソキノリル、フェノキシ、フェノキシイミノまたは フェニル（ハロゲンにより置換されていることもある）により置換されていることもある }、

フェニルにより置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルケニル、

フェニルにより置換されていることもある ( $C_{2-6}$ ) アルキニル、または、

トリフルオロまたはメトキシにより置換されていることもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシを表し；

$R^2$  が、水素、( $C_{2-6}$ ) アルケニル、( $C_{2-6}$ ) アルキニル、ピリミジニル、インドリル、ピリジル、

フェニルにより置換されていることもある ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ、

( $C_{1-6}$ ) アルキル（フェニル、メチルチオ、1 個、2 個もしくは 3 個のハロゲンまたは ( $C_{1-6}$ ) アルキルスルホニルにより置換されていることもある）、

フェニル { ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、N-（ジヒドロイミダゾリル）アミノまたは ( $C_{1-6}$ ) アルコキシ（アミノ、N-（ $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ、N,N-ジ（ $C_{1-6}$ ) アルキルアミノまたはモルホリノにより置換されていることもある）により置換されていることもある }、

を表し；

$R^3$  が、水素を表し；

$R^4$  が、カルボキシまたはテトラゾリルを表し；

R<sup>5</sup> が、水素を表し；

R<sup>6</sup> が、水素を表し；そして、

R<sup>7</sup> が、水素を表す、

請求項 1 に記載の式 (I) のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

【請求項 7】

該誘導体が、以下の化合物；

3 - ( 2 - アミノエトキシ ) - N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラニン；

4 - クロロ - N - { 6 - [ 4 - ( シクロプロピルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 2 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) - 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) ノルロイシン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) - 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) ノルロイシン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3, 5 - ジメトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) - 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3 - メトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) - 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3 - メトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) ノルロイシン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 3 - メトキシベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ ( 4 - フルオロベンジル ) オキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - ( 6 - { 4 - [ 2 - ( 1H - ピロール - 1 - イル ) エトキシ ] フェニル } ピリミジン - 4 - イル ) フェニルアラニン；

N - [ 6 - ( 3' - メトキシビフェニル - 4 - イル ) ピリミジン - 4 - イル ] フェニルアラニン；

N - [ 6 - ( 4' - メトキシビフェニル - 4 - イル ) ピリミジン - 4 - イル ] フェニルアラニン；

N - { 6 - [ 4 - ( 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラニン；

N - { 6 - [ 4 - ( 2 - フェニルエトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン；

N - { 6 - [ 4 - ( 2 - フェニルエトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラニン；

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) - 3 - フルオロフェニル ] ピリミジン - 4 - イル }

- 3 - ピリジン - 2 - イルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) - 3 - フルオロフェニル ] ピリミジン - 4 - イル }  
フェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] - 5 - フルオロピリミジン - 4 - イル }  
フェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - ( 2 - モ  
ルホリン - 4 - イルエトキシ ) フェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - [ 2 - (   
ジメチルアミノ ) エトキシ ] フェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - ヒドロキ  
シフェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - ピリジン  
- 2 - イル - アラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 4 - クロロフ  
ェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 4 - フルオロ  
フェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - ノルロイシン  
;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - フェニルアラ  
ニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } トリプトファン  
;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } チロシン ;

N - { 6 - [ 4 - ( シクロプロピルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 4 -  
フルオロフェニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( シクロプロピルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - フェ  
ニルアラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( フェノキシメチル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラ  
ニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( フェニルエチニル ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フェニルアラ  
ニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ピリジン - 3 - イルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } フ  
ェニルアラニン ; および

N - { 6 - [ 6 - ( ベンジルオキシ ) ピリジン - 3 - イル ] ピリミジン - 4 - イル } フェ  
ニルアラニン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載のフェニルまたはヘテロアリールアミノアル  
カン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの塩。

#### 【請求項 8】

該誘導体が、以下の化合物 ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - 3 - ピリジン  
- 2 - イル - D - アラニン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - D - ノルロイ  
シン ;

N - { 6 - [ 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - D - フェニル  
アラニン ; および

N - { 6 - [ 4 - ( シクロプロピルメトキシ ) フェニル ] ピリミジン - 4 - イル } - D -  
フェニルアラニン

からなる群から選択される、請求項 1 に記載のフェニルまたはヘテロアリールアミノアル  
カン誘導体、その互変体、またはそれらの塩。

## 【請求項 9】

請求項 1 に記載のフェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの生理的に許容し得る塩を有効成分として含む医薬。

## 【請求項 10】

1 種またはそれ以上の医薬的に許容し得る賦形剤をさらに含む、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 11】

フェニルまたはヘテロアリールアミノアルカン誘導体、その互変体もしくは立体異性体、またはそれらの生理的に許容し得る塩が IP 受容体アンタゴニストである、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 12】

泌尿器の障害または疾患の予防および/または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 13】

疼痛の予防および/または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 14】

低血圧の予防および/または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 15】

血友病および出血の予防および/または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 16】

炎症の予防および/または処置のための、請求項 9 に記載の医薬。

## 【請求項 17】

泌尿器の障害の処置および/または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 18】

疼痛の処置および/または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 19】

低血圧の処置および/または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 20】

血友病および出血の処置および/または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 21】

炎症の処置および/または予防用の医薬を製造するための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 22】

IP 受容体アンタゴニスト的に有効な量の少なくとも 1 種の請求項 1 に記載の化合物を投与することによる、ヒトおよび動物における泌尿器障害の制御方法。