

【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10月26日(2006.10.26)

【公表番号】特表2006-500393(P2006-500393A)

【公表日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2006-001

【出願番号】特願2004-534697(P2004-534697)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/10	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	5/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/14	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(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	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	25/36	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/10	1 0 3
C 0 7 D	471/10	C S P
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/14	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/08	

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 25/30
A 6 1 P 25/36
A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月5日(2006.9.5)

【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

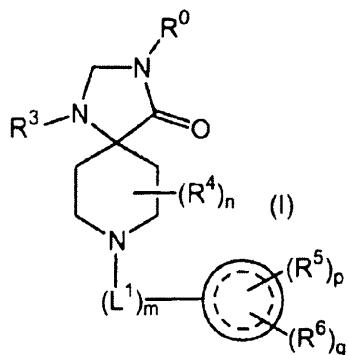
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

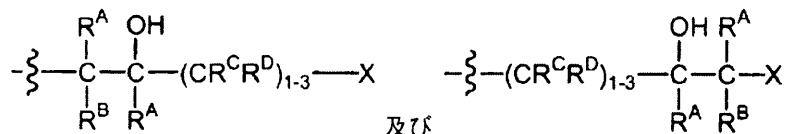
【化1】



[式中、

R⁰は、

【化2】



から成る群から選択され、

各R^AおよびR^Bは、独立して、水素およびC₁₋₄アルキルから成る群から選択され、各R^CおよびR^Dは、独立して、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ニトロ、シアノ、N(R^E)₂、アリール、ar C₁₋₄アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、ar C₁₋₄アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル置換基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ニトロ、シアノまたはN(R^E)₂から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

各R^Eは、独立して、水素およびC₁₋₄アルキルから成る群から選択され、

Xは、-NR¹R²、-C(O)-NR¹R²、-NR¹-C(O)-R²、-OR¹、-SR¹、-SOR¹、-SO₂R¹、-S-(C₂₋₄アルキル)-NR¹R²、-S-(C₂₋₄アルキル)-C(O)O-C(CH₃)₃、-SO-(C₁₋₄アルキル)-NR¹R²および-SO₂-(C₁₋₄アルキル)-NR¹R²から成る群から選択され、ここで、前記-S-(C₂₋₄ア

ルキル) - N R¹ R²、 - SO - (C₁₋₄アルキル) - N R¹ R²または - SO₂ - (C₁₋₄アルキル) - N R¹ R²基のアルキル部分は場合によりカルボキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルまたは - CONR¹ R²から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

各 R¹および R²は、独立して、水素、C₁₋₈アルキル、C₁₋₈アルコキシ、C₁₋₈アルコキシカルボニル、シクロアルキル、シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、部分不飽和カルボシクリル、部分不飽和カルボシクリル - C₁₋₄アルキル、アリール、ar C₁₋₄アルキル、ar C₁₋₄アルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリール - C₁₋₄アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル - C₁₋₄アルキル、- C(O) - C₁₋₆アルキル、- C(O) - アリール、- C(O) - ar C₁₋₄アルキル、- C(O) - ヘテロアリール、- C(O) - ヘテロシクロアルキル、- C(O)O - シクロアルキルおよび - C(O)O - アリール、- C(O)O - ar C₁₋₄アルキル、- C(O)O - (部分不飽和カルボシクリル)、- C(O)O - ヘテロアリール、- C(O)O - ヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記 C₁₋₈アルキル、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、ar C₁₋₈アルキル、ヘテロシクロアルキル基は、単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、- C(O) - C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、N(R^E)₂、N(R^E)₂ - C₁₋₄アルキル、N(R^E) - C(O)C(CH₃)₃、- C₁₋₄アルキル - N(R^E) - C(O)O - C₁₋₄アルキルおよび - N(R^E) - C(O)O - C₁₋₄アルキル、アリール、アリールオキシ、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール置換ヘテロアリールアミノスルホニルまたは C₁₋₆アルキルチオから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい、

または、R¹および R²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹と R²が、これらが結合している窒素原子と一緒にになってヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基を形成しており、ここで、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、ヒドロキシ置換 C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、N(R^E)₂、アリール、ar C₁₋₄アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、ジ(C₁₋₆)アルキルアミノ - カルボニル、C₁₋₄アルコキシカルボニル - N(R^E) - またはアリールアミノ - C₁₋₄アルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、前記アリール、ar C₁₋₄アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル置換基は場合により更にハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、N(R^E)₂、フェニルまたは置換フェニル(ここで、フェニル上の置換基はハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは N(R^E)₂から独立して選択される1個以上である)から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

R³は、アリール、ar C₁₋₆アルキルおよびヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記アリール、ar C₁₋₆アルキルまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは N(R^E)₂から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

nは、0から2の整数であり、

R⁴は、ヒドロキシ、C₁₋₄アルキルおよびヒドロキシ置換 C₁₋₄アルキルから成る群から選択され、

mは、0から1の整数であり、

L¹は、C₁₋₆アルキルおよび C₃₋₆アルケニルから成る群から選択され、ここで、前記 C₃₋₆アルケニル基の二重結合はN原子との結合点から少なくとも炭素原子1個分離れており

、そしてここで、前記C₁₋₆アルキルまたはC₃₋₆アルケニル基は場合によりヒドロキシ、フルオロ、C₁₋₆アルキル、フッ素置換C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルコキシから独立して選択される1から2個の置換基で置換されていてもよく、

【化3】



は、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、

pは、0から5の整数であり、

R⁵は、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキル、ヒドロキシ置換C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、ニトロ、シアノ、NR¹R²、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、C₁₋₄アルコキシカルボニル、-SO-NR¹R²、-SO₂-NR¹R²および-C(O)-NR¹R²から成る群から選択され、

qは、0から1の整数であり、

R⁶は、-(L²)₀₋₁-R⁷から成る群から選択され、

L²は、-C₁₋₆アルキル-、-C₂₋₄アルケニル-、-C₂₋₆アルキニル-、-O-、-S-、-NH-、-N(C₁₋₄アルキル)-、-C₁₋₆アルキル-O-、-C₁₋₆アルキル-S-、-O-C₁₋₆アルキル-、-S-C₁₋₆アルキル-、-O-C₂₋₆アルキル-O-、-S-C₂₋₆アルキル-S-、-SO₂-、-SO₂NH-、-SO₂N(C₁₋₄アルキル)-、-NH-SO₂-、-N(C₁₋₄アルキル)-SO₂-、-C(O)-O-および-O-C(O)-から成る群から選択され、

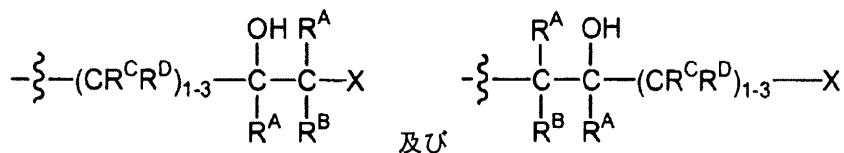
R⁷は、アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、ニトロ、シアノ、N(R^E)₂、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、C₁₋₄アルコキシカルボニル、-SO₂-N(R^E)₂および-C(O)-N(R^E)₂から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい】

で表される化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項2】

R⁰が

【化4】



から成る群から選択され、

各R^CおよびR^Dが独立して水素、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシまたはアリールから選択され、ここで、前記アリールが場合によりヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ニトロ、シアノまたはN(R^E)₂から独立して選択される1から2個の置換基で置換されていてもよく、

Xが-NR¹R²、-C(O)-NR¹R²、-NR¹-C(O)-R²、-OR¹、-SR¹、-SO-R¹、-SO₂-R¹、-SO₂-R¹、-S-(C₂₋₄アルキル)-NR¹R²、-S-(C₂₋₄アルキル)-NR¹-C(O)OC(CH₃)₃、-SO-(C₁₋₄アルキル)-NR¹R²および-SO₂-(C₁₋₄アルキル)-NR¹R²から成る群から選択され、ここで、前記-S-(C₂₋₄アルキル)-NR¹R²、-SO-(C₁₋₄アルキル)-NR¹R²または-SO₂-(

C_{1-4} アルキル) - $N R^1 R^2$ 基のアルキル部分が場合により C_{1-4} アルキル、ヒドロキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルまたはカルボキシから独立して選択される 1 から 2 個の置換基で置換されていてもよく、

R^1 が水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、 $a r C_{1-4}$ アルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリール - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル - アルキル、シクロアルキル - アルキル、 $C(O) - C_{1-4}$ アルキルおよび - $C(O) -$ ヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記 C_{1-4} アルキル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキルまたはシクロアルキル基が単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N(R^E)_2$ 、 $N(R^E)_2 - C_{1-4}$ アルキル、 $N(R^E) - C(O)OC(CH_3)_3$ 、ニトロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、フェニル、フェノキシ、ヘテロアリール、シクロアルキル、1 - フェニル - ピラゾール - 2 - イル - アミノスルホニルまたは C_{1-4} アルキルチオから独立して選択される 1 から 3 個の置換基で置換されていてもよく、 R^2 が水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキル - C_{1-4} アルキル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、 $a r C_{1-4}$ アルキルオキシ、部分不飽和カルボシクリル、部分不飽和カルボシクリル - C_{1-4} アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール - C_{1-4} アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル - C_{1-4} アルキル、- $C(O) - C_{1-4}$ アルキル、- $C(O) -$ アリール、- $C(O) - a r C_{1-4}$ アルキル、- $C(O) -$ ヘテロアリール、- $C(O) -$ ヘテロシクロアルキル、- $C(O)O -$ シクロアルキルおよび - $C(OO) - C_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され、ここで、前記 C_{1-4} アルキル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、部分不飽和カルボシクリル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキルまたはシクロアルキル基が単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N(R^E)_2$ 、 $N(R^E)_2 - C_{1-4}$ アルキル、 $(CH_3)_3COOC(O) - N(R^E) - C_{1-4}$ アルキル、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、フェニル、フェノキシ、ヘテロアリール、シクロアルキル、1 - フェニル置換ヘテロアリール - アミノスルホニル、- $C(O) - C_{1-4}$ アルキルまたは C_{1-4} アルキルチオから独立して選択される 1 から 3 個の置換基で置換されていてもよい。

または、 R^1 および R^2 の両方が同じ窒素原子と結合している時には、 R^1 と R^2 がこれらが結合している窒素原子と一緒にになってヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基を形成しており、ここで、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基が場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、ヒドロキシ置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ 、フェニル、 $a r C_{1-4}$ アルキル、ヘテロシクロアルキル、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ - カルボニル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルアミノまたはフェニルアミノ - C_{1-4} アルキルから独立して選択される 1 から 3 個の置換基で置換されていてもよく、

ここで、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基上のフェニルまたは $a r C_{1-4}$ アルキル置換基が場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ または置換フェニル(ここで、フェニル上の置換基はハロゲンから独立して選択される 1 から 3 個である)から独立して選択される 1 または 2 個の置換基で置換されていてもよく、

R^3 がアリールおよび $a r C_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリールまたは $a r C_{1-4}$ アルキル基が場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは $N(R^E)_2$ から独立して選択される 1 から 3 個の置換基で置換されていてもよく、 n が 0 から 1 の整数であり、

L^1 が C_{1-4} アルキルであり、ここで、前記 C_{1-4} アルキル基が場合によりヒドロキシ、フルオロ、 C_{1-4} アルキル、フッ素置換 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシから独立して選択される 1 から 2 個の置換基で置換されていてもよく、

R^5 がヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO-N(R^E)_2$ 、 $-SO_2-N(R^E)_2$ および $-C(O)-N(R^E)_2$ から成る群から選択され

L^2 が $-C_{1-4}$ アルキル - 、 - O - 、 - S - 、 - N(R^E) - 、 - C(O)O - および - O - C(O) - から成る群から選択され、

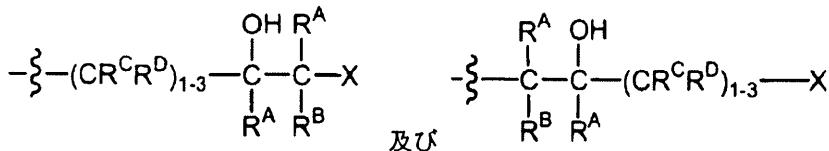
R^7 がシクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基が場合によりヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシまたは C_{1-4} アルコキシカルボニルから独立して選択される 1 から 2 個の置換基で置換されていてもよい、

請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 3】

R^0 が

【化 5】



から成る群から選択され、

各 R^A 、 R^B 、 R^C および R^D が水素であり、

X が $-NR^1R^2$ 、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-S-(C_{2-4}$ アルキル $)-NR^1R^2$ および $-S-(C_{2-4}$ アルキル $)-NR^1-C(O)O-C(CH_3)_3$ から成る群から選択され、ここで、前記 $-S-(C_{2-4}$ アルキル $)-NR^1R^2$ または $-S-(C_{1-4}$ アルキル $)-NR^1-C(O)O-C(CH_3)_3$ 基のアルキル部分が場合によりカルボキシまたは C_{1-4} アルコキシカルボニル基で置換されていてもよく、

R^1 が水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $a r C_{1-4}$ アルキルおよび $C(O)-C_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され、ここで、前記 C_{1-4} アルキルまたはアリール基が単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず場合によりカルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N(R^E)_2$ または $N(R^E)-C(O)OC(CH_3)_3$ から独立して選択される 1 から 2 個の置換基で置換されていてもよく、

R^2 が水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、シクロアルキル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、 $a r C_{1-4}$ アルキルオキシ、部分不飽和カルボシクリル、部分不飽和カルボシクリル- C_{1-4} アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール- C_{1-4} アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル- C_{1-4} アルキル、シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 $-C(O)arC_{1-4}$ アルキル、 $-C(O)-HeTeRoアリール$ 、 $-C(OO)-シクロアルキル$ および $-C(O)-C_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され、ここで、前記 C_{1-4} アルキル、アリール、 $a r C_{1-4}$ アルキル、部分不飽和カルボシクリル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキルまたはシクロアルキル基が単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $N(R^E)_2$ 、 $N(R^E)_2-C_{1-4}$ アルキル、 $(CH_3)_3CO-C(O)-N(R^E)-C_{1-4}$ アルキル、ニトロ、トリフルオロメチル、トリフ

ルオロメトキシ、フェニル、フェノキシ、ヘテロアリール、シクロアルキル、1-フェニル-ピラゾール-2-イル-アミノスルホニルまたはC₁₋₄アルキルチオから独立して選択される1から3個の置換基で置換されていてもよいが、

または、R¹およびR²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹とR²がこれらが結合している窒素原子と一緒にになってヘテロシクロアルキルおよびヘテロアリールから選択される基を形成しており、ここで、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルが場合によりヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄アルキル、ヒドロキシ置換C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、フェニル、a r C₁₋₄アルキル、ヘテロシクロアルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、アミノ、C₁₋₄アルキルアミノ、ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ、ジ(C₁₋₄アルキル)アミノ-カルボニル、t-ブトキシカルボニルアミノまたはフェニルアミノ-C₁₋₄アルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、前記フェニルまたはa r C₁₋₄アルキル置換基が場合によりクロロ、トリフルオロメチルまたはクロロフェニルから独立して選択される1または2個の置換基で置換されていてもよく、

R³がアリールであり、ここで、前記アリール基が場合によりハロゲンから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

nが0であり、

L¹がC₁₋₄アルキルであり、

R⁵がハロゲン、C₁₋₄アルキルおよびトリフルオロメチルから成る群から選択され、

R⁶が-(L²)₀-R⁷であり、

R⁷がアリールおよびヘテロアリールから成る群から選択される、

請求項2記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

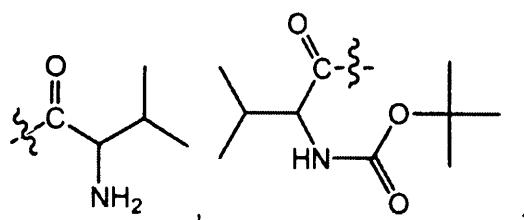
【請求項4】

R⁰が-CH₂-CH(OH)-CH₂-Xおよび-CH₂-CH₂-CH(OH)-CH₂-Xから成る群から選択され、

Xが-NR¹R²、-OR¹、-SR¹、-S-CH₂CH(CO₂H)-NH-C(O)-CH₃および-S-CH₂CH(CO₂H)-NH-C(O)OC(CH₃)₃から成る群から選択され、

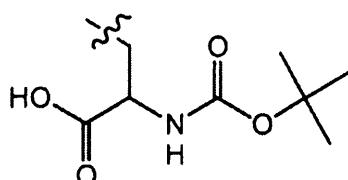
R¹が水素、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、アミノ-n-プロピル、ジメチルアミノエチル、ベンジル、フェニルエチル、4-メチル-ベンジル、

【化6】



2-(3,4-ジメトキシ-フェニル)エチル、3-メチル-フェニル、エトキシ-カルボニル-メチル、2-アミノ-2-メトキシカルボニル-エチル、t-ブトキシカルボニルおよび

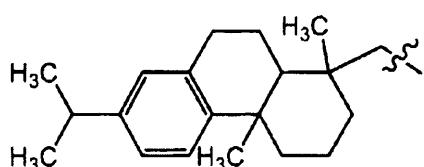
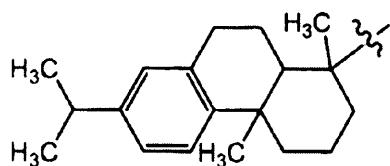
【化7】



から成る群から選択され、

R²が水素、メチル、メトキシ、エチル、カルボキシ-メチル、エトキシカルボニルメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、エトキシ、ジメチルアミノエチル、t-ブトキシカルボニルアミノ-エチル、n-ブチル、t-ブチル、n-プロピル、3-ヒドロキシ-n-プロピル、3-メトキシ-n-プロピル、メチルアミノ-n-プロピル、ジメチルアミノ-n-プロピル、ジ(n-ブチル)アミノ-n-プロピル、t-ブトキシカルボニルアミノ-n-プロピル、3-フェニル-n-プロピル、3-(2-ピリジル)-n-プロピル、t-ブトキシカルボニル、シクロプロピル、フェニル、4-フルオロフェニル、4-メチルフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、2-アミノフェニル、4-ビフェニル、2-エトキシフェニル、4-((1-フェニル-ピラゾール-2-イル)-アミノスルホニル)-フェニル、4-シクロヘキシルフェニル、4-(アミノエチル)-フェニル、4-(t-ブトキシカルボニルアミノ-エチル)-フェニル、-CH(CH₃)-フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-メトキシベンジル、2-エトキシベンジル、3-エトキシベンジル、2-プロモベンジル、3-プロモベンジル、4-プロモベンジル、3-クロロベンジル、4-クロロベンジル、3-ヨードベンジル、2-フルオロベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、2-トリフルオロメチルベンジル、3-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメチルベンジル、4-トリフルオロメトキシベンジル、4-メトキシカルボニルベンジル、2,3-ジメトキシベンジル、2,4-ジクロロベンジル、3,4-ジクロロベンジル、2,4-ジフルオロベンジル、2,5-ジフルオロベンジル、3,4-ジフルオロベンジル、3,4,5-トリメトキシベンジル、2,4,6-トリメトキシベンジル、4-カルボキシベンジル、3-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、2,4-ジメトキシベンジル、3,4-ジメトキシベンジル、3,5-ジメトキシベンジル、3,4-ジフルオロベンジル、3,5-ジ(トリフルオロメチル)ベンジル、4-(ジメチルアミノ)ベンジル、2-フェニルエチル、2-(4-プロモフェニル)エチル、2-(3-メトキシフェニル)エチル、2-(4-メトキシフェニル)エチル、2-(3,4-ジメトキシフェニル)エチル、2-(2-ニトロ-4,5-ジメトキシフェニル)エチル、3-(4-モルホリニル)-n-プロピル、2-(4-モルホリニル)エチル、2-(4-イミダゾリル)エチル、1-アダマンタニル、1-アダマンタニル-メチル、(2,5-ジメトキシ-2,5-ジヒドロ-フリ-2-イル)メチル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-ピリジル-メチル、3-ピリジル-メチル、4-ピリジル-メチル、2-(3,4-ジメチル-ピリジル)、2-(5-プロモピリジル)、2-(4,6-ジメチル-ピリジル)、2-(5-メチル-ピリジル)、3-(6-メトキシ-ピリジル)、6-メチルチオ-2-ピリジル-カルボニル、チエニル-メチル、2-チエニルエチル、4-ピリジニル、1-ナフチル、1-ナフチル-メチル、1-(3,4-メチレンジオキシフェニル)メチル、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)エチル、1-フェニル-2-(t-ブトキシカルボニル)エチル、-C(O)-C(OCH₃)(CF₃)-フェニル、-C(O)O-(2-イソプロピル-5-メチル-シクロヘキシル)、1-(4-エトキシカルボニル-ペリジニル)、2-(3H-イミダゾール-4-イル)エチル、2-(1,2,3,-テトラヒドロイソキノリニル)、2-フリル-メチル、

【化 8】



2S - ヒドロキシ - S - シクロペンチル - メチル、2S - ヒドロキシ - S - シクロヘキシリ - メチル、2S - ヒドロキシ - S - シクロヘプチル - メチル、2 - フェノキシ - エチル、2 - (2 - ピリジル) - エチル、2 - (6 - フルオロ - 2 - インドリル) エチルおよび2 - フェニル - シクロプロピルから成る群から選択されるか、

または、R¹およびR²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹とR²がこれらが結合している窒素原子と一緒にになって1 - モルホリニル、1 - (4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジニル)、1 - (4 - ピペリジニル - ピペリジニル)、1 - (4 - ピロリジニル - ピペリジニル)、1 - (4 - フェニル - ピペリジニル)、1 - (3 - ヒドロキシ - ピペリジニル)、1 - (4 - ヒドロキシ - ピペリジニル)、1 - (3 - ヒドロキシメチル - ピペリジニル)、1 - (3, 5 - ジメチル - ピペリジニル)、1 - (4 - ジメチルアミノ - ピペリジニル)、1 - (4 - (3, 4 - メチレンジオキシフェニルメチル) - ピペラジニル)、1 - (3 - (ジエチルアミノカルボニル) - ピペリジニル)、1 - (4 - t - ブトキシカルボニルアミノ - ピペリジニル)、1 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロリル)、1 - (4 - [(4 - クロロフェニル) - フェニル - メチル] - ピペラジニル)、2 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - イソキノリニル)、1 - (4 - t - ブトキシカルボニル - ピペラジニル)、2 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6, 7 - ジメトキシ - イソキノリニル)、4 - (2, 6 - ジメチル - モルホリニル)、1 - (4 - ベンジル - ピペラジニル)、1 - ピロリジニル、1 - (2, 3 - ジヒドロ - ピロリジニル)、1 - (3 - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - ピペリジニル、1 - (3 - エトキシカルボニル - ピペリジニル)、1 - イミダゾリル、1 - (2 - (フェニルアミノメチル) - N - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - ジメチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - (3, 4 - ジヒドロキシ - 2, 5 - ビス - ヒドロオキシメチル - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - t - ブトキシカルボニルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - エチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - アミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - アミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - メチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - メチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (N - メチル - N - t - ブトキシカルボニル - アミノ) - ピロリジニル) または 1 - (2 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - メチル - 5 - カルボキシ - 1, 2, 4 - トリアゾリル) から選択される基を形成しており、

R³がフェニルおよび4 - フルオロフェニルから成る群から選択され、

L¹が - CH₂ - 、 - CH(C₂H₅) - および - CH₂CH₂ - から成る群から選択され、

【化 9】



がシクロオクチル、1 - アセナフテニル、R - 1 - アセナフテニル、S - 1 - アセナフテニル、シクロヘキシリ、フェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフチル、2 - チエニル、ベンゾチエニル、4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ - ベンゾチエニル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプテン - 2 - イル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプチルおよび (3 a S) - 2, 3, 3 a, 4, 5, 6 - ヘキサヒドロ - 1 H - フェナレン - 1 - イルから成る群から選択され、

R⁵ がクロロ、メチル、n-プロピルおよびトリフルオロメチルから成る群から選択され

「アーリからアーリか？アーリからアーリか？」
アーリがアーリを睨みながら、アーリの頭を搔いていた。

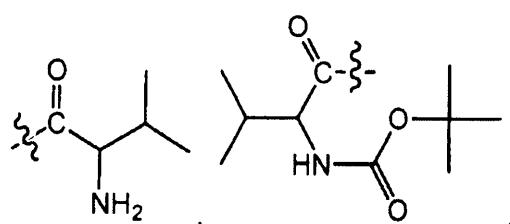
R' がフェニルおよび2-チル基から成る群から選択される、請求項2記載の化合物またはこれの薬理的に活性なこれを

單記項次

【請求項5】 X が - N R¹ R²、 - S R¹ および - S - C H₂ C H (C O₂ H) - N H - C (O) - C H₃ から成る群から選択され

R^1 が水素、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、ジメチルアミノエチル、ベンジル、フェニルエチル

【化 10】

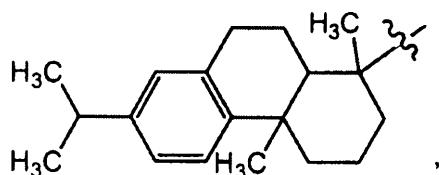


3 - メチル - フェニル、2 - (3, 4 - ジメトキシフェニル)エチル、エトキシ - カルボニル - メチル、ジメチルアミノ - エチルおよび2 - アミノ - 2 - メトキシカルボニル - エチルから成る群から選択され、

R^2 が水素、メチル、メトキシ、エチル、エトキシカルボニル - メチル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、エトキシ、ジメチルアミノエチル、n - ブチル、t - ブチル、n - プロピル、ジ (n - ブチル) アミノ - n - プロピル、3 - フェニル - n - プロピル、3 - (2 - ピリジル) - n - プロピル、シクロプロピル、フェニル、4 - フルオロフェニル、4 - メチルフェニル、2 - アミノフェニル、4 - (t - ブトキシカルボニルアミノ - エチル) - フェニル、3 , 4 - ジメトキシフェニル、4 - ビフェニル、2 - エトキシフェニル、4 - ((1 - フェニル - ピラゾール - 2 - イル) - アミノスルホニル) - フェニル、4 - (アミノエチル) - フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、2 - メチルベンジル、3 - メチルベンジル、4 - メチルベンジル、2 - メトキシベンジル、3 - メトキシベンジル、4 - メトキシベンジル、2 - エトキシベンジル、3 - エトキシベンジル、2 - ブロモベンジル、3 - ブロモベンジル、4 - ブロモベンジル、3 - クロロベンジル、4 - クロロベンジル、3 - ヨードベンジル、2 - フルオロベンジル、3 - フルオロベンジル、4 - フルオロベンジル、2 - トリフルオロメチルベンジル、3 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメトキシベンジル、4 - メトキシカルボニルベンジル、2 , 3 - ジメトキシベンジル、2 , 4 - ジクロロベンジル、3 , 4 - ジクロロベンジル、2 , 4 - ジフルオロベンジル、2 , 5 - ジフルオベンジル、3 , 4 - ジフルオロベンジル、3 , 4 , 5 - トリメトキシベンジル、2 , 4 , 6 - トリメトキシベンジル、4 - カルボキシベンジル、3 - ニトロベンジル、4 - ニトロベンジル、2 , 4 - ジメトキシベンジル、3 , 4 - ジメトキシベンジル、3 , 5 - ジメトキシベンジル、3 , 4 - ジ

フルオロベンジル、3,5-ジ(トリフルオロメチル)ベンジル、2-フェニルエチル、2-(4-ブロモフェニル)エチル、2-(3-メトキシフェニル)エチル、2-(4-メトキシフェニル)エチル、2-(3,4-ジメトキシフェニル)エチル、2-(2-ニトロ-4,5-ジメトキシフェニル)エチル、3-(4-モルホリニル)-n-プロピル、2-(4-モルホリニル)エチル、2-(4-イミダゾリル)エチル、アダマンタニル、1-アダマンタニル-メチル、2-(2,5-ジメトキシ-2,5-ジヒドロ-フリル)メチル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-ピリジル-メチル、3-ピリジル-メチル、4-ピリジル-メチル、2-(3,4-ジメチル-ピリジル)、2-(5-ブロモピリジル)、2-(4,6-ジメチル-ピリジル)、2-(5-メチル-ピリジル)、3-(6-メトキシ-ピリジル)、チエニルメチル、2-チエニルエチル、1-ナフチル、1-ナフチル-メチル、1-(3,4-メチレンジオキシフェニル)メチル、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)エチル、2-フリル-メチル、

【化11】



2S-ヒドロキシ-S-シクロペンチル-メチル、2S-ヒドロキシ-S-シクロヘキシリ-メチル、2S-ヒドロキシ-S-シクロヘプチル-メチル、2-フェノキシ-エまたは、R¹およびR²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹とR²がこれらが結合している窒素原子と一緒にになって1-(4-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-ピペラジニル)、1-(4-フェニル-ピペリジニル)、1-(4-ピペリジニル-ピペリジニル)、1-(4-(3,4-メチレンジオキシフェニルメチル)-ピペラジニル)、1-(3-(ジエチルアミノカルボニル)-ピペリジニル)、1-(4-[4-クロロフェニル]-フェニル-メチル]-ピペラジニル)、2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-イソキノリニル)、1-(4-t-ブトキシカルボニル-ピペラジニル)、2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-6,7-ジメトキシ-イソキノリニル)、4-(2,6-ジメチル-モルホリニル)、1-(4-ベンジル-ピペラジニル)、1-モルホリニル、1-ピロリジニル、1-(2,3-ジヒドロ-ピロリジニル)、1-ピペリジニル、1-(3,5-ジメチル-ピペリジニル)、1-(3-ヒドロキシメチル-ピペリジニル)、1-(3-エトキシカルボニル-ピペリジニル)、1-(4-(エトキシカルボニル)-ピペリジニル)、1-イミダゾリルおよび1-(2-(フェニルアミノ-メチル)-N-ピロリジニル)から選択される基を形成しており、

L¹が-C H₂-および-C H₂C H₂-から成る群から選択され、

【化12】



がシクロオクチル、1-アセナフテニル、R-1-アセナフテニル、S-1-アセナフテニル、シクロヘキシリ、フェニル、1-ナフチルおよび(3a-S)-2,3,3a,4,5,6-ヘキサヒドロ-1H-フェナレン-2-イルから成る群から選択され、pが0から2の整数であり、

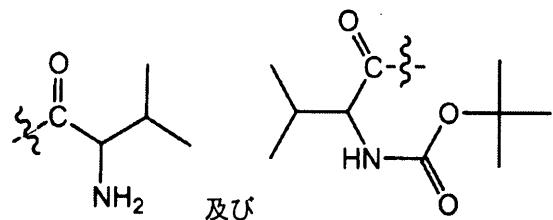
R⁷が2-チエニルである、

請求項4記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項6】

R¹が水素、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、ジメチルアミノエチル、ベンジル、フェニルエチル、2-(3,4-ジメトキシフェニル)エチル、ジ

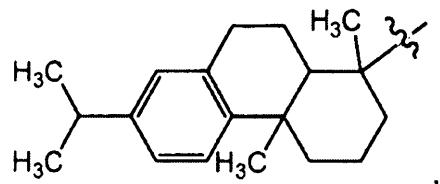
メチルアミノ - エチル、エトキシカルボニル - メチル、
【化 13】



から成る群から選択され、

R^2 が水素、メチル、メトキシ、エチル、エトキシカルボニルメチル、エトキシ、ジメチルアミノエチル、n - プチル、n - プロピル、ジ (n - プチル) アミノ - n - プロピル、3 - フェニル - n - プロピル、3 - (2 - ピリジル) - n - プロピル、シクロプロピル、フェニル、4 - フルオロフェニル、4 - メチルフェニル、2 - アミノフェニル、3 , 4 - デメトキシフェニル、4 - (t - ブトキシカルボニルアミノ - エチル) - フェニル、4 - ビフェニル、2 - エトキシフェニル、4 - ((1 - フェニル - ピラゾール - 2 - イル) - アミノスルホニル) - フェニル、4 - (アミノエチル) - フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、2 - メチルベンジル、3 - メチルベンジル、4 - メチルベンジル、2 - メトキシベンジル、3 - メトキシベンジル、4 - メトキシベンジル、2 - エトキシベンジル、3 - エトキシベンジル、2 - プロモベンジル、3 - プロモベンジル、4 - プロモベンジル、 - クロロベンジル、4 - クロロベンジル、3 - ヨードベンジル、2 - フルオロベンジル、3 - フルオロベンジル、4 - フルオロベンジル、2 - トリフルオロメチルベンジル、3 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメトキシベンジル、4 - メトキシカルボニルベンジル、2 , 3 - デメトキシベンジル、2 , 4 - デクロロベンジル、3 , 4 - デクロロベンジル、2 , 4 - デフルオロベンジル、2 , 5 - デフルオロベンジル、3 , 4 , 5 - トリメトキシベンジル、2 , 4 , 6 - トリメトキシベンジル、3 - ニトロベンジル、4 - ニトロベンジル、2 , 4 - デメトキシベンジル、3 , 4 - デメトキシベンジル、3 , 5 - デメトキシベンジル、3 , 4 - デフルオロベンジル、3 , 5 - デ (トリフルオロメチル) ベンジル、2 - フェニルエチル、2 - (4 - プロモフェニル) エチル、2 - (3 - メトキシフェニル) エチル、2 - (4 - メトキシフェニル) エチル、2 - (3 , 4 - デメトキシフェニル) エチル、2 - (2 - ニトロ - 4 , 5 - デメトキシフェニル) エチル、3 - (4 - モルホリニル) - n - プロピル、2 - (4 - モルホリニル) エチル、2 - (4 - イミダゾリル) エチル、1 - アダマンタニル、1 - アダマンタニル - メチル、2 - (2 , 5 - デメトキシ - 2 , 5 - デヒドロ - フリル) メチル、2 - ピリジル、3 - ピリジル、4 - ピリジル、2 - ピリジル - メチル、3 - ピリジル - メチル、4 - ピリジル - メチル、2 - (3 , 4 - デメチル - ピリジル) 、2 - (5 - プロモピリジル) 、2 - (4 , 6 - デメチル - ピリジル) 、2 - (5 - メチル - ピリジル) 、3 - (6 - メトキシ - ピリジル) 、チエニルメチル、2 - チエニルエチル、1 - ナフチル、1 - ナフチル - メチル、1 - (3 , 4 - メチレンジオキシフェニル) メチル、2 - (3 , 4 - メチレンジオキシフェニル) エチル、2 - フリル - メチル、

【化 14】



2S - ヒドロキシ - S - シクロペンチル - メチル、2S - ヒドロキシ - S - シクロヘキシ

ル - メチル、2 S - ヒドロキシ - S - シクロヘプチル - メチルおよび2 - フェノキシ - エチルから成る群から選択されるか、

または、R¹およびR²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹とR²がこれらが結合している窒素原子と一緒にになって1 - (4 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ピペラジニル)、1 - (4 - フェニル - ピペリジニル)、1 - (4 - ピペリジニル - ピペリジニル)、1 - (4 - (3, 4 - メチレンジオキシフェニルメチル) - ピペラジニル)、1 - (3 - (ジエチルアミノカルボニル) - ピペリジニル)、1 - (4 - [(4 - クロロフェニル) - フェニル - メチル] - ピペラジニル)、2 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - イソキノリニル)、1 - (4 - t - プトキシカルボニル - ピペラジニル)、2 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6, 7 - ジメトキシ - イソキノリニル)、4 - (2, 6 - ジメチル - モルホリニル)、1 - (4 - ベンジル - ピペラジニル)、1 - (3, 5 - ジメチル - ピペリジニル)、1 - (3 - ヒドロキシメチル - ピペリジニル)、1 - (3 - エトキシカルボニル - ピペリジニル)、1 - (4 - (エトキシカルボニル) - ピペリジニル)、1 - ピペリジニル、1 - モルホリニル、1 - ピロリジニル、1 - イミダゾリル、1 - (2, 3 - ジヒドロ - ピロリジニル)および1 - (2 - (フェニルアミノ - メチル) - N - ピロリジニル)から選択される基を形成しており、

p が 0 から 1 の整数であり、

R⁵がメチル、n - プロピルおよびトリフルオロメチルから成る群から選択される、請求項 5 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 7】

R⁰が - C H₂ - C H (O H) - C H₂ - X であり、
X が - N R¹ R² であり、

R¹が水素、2 - (3, 4 - ジメトキシ - フェニル)エチル、1 - (3, 4 - ジメトキシフェニル) - n - エチルおよびアミノ - n - プロピルから成る群から選択され、

R²が水素、メチル、n - ブチル、3 - ヒドロキシ - n - プロピル、3 - メトキシ - n - プロピル、メチルアミノ - n - プロピル、ジメチルアミノ - n - プロピル、t - プトキシカルボニルアミノ - n - プロピル、N - メチル - N - t - プトキシカルボニル - アミノ - n - エチル、3 - ニトロベンジル、4 - メトキシカルボニル - ベンジル、- C H (C H₃) - フェニル、4 - ピリジニル、1 - (4 - エトキシカルボニル - ピペリジニル)および2 - (3 H - イミダゾール - 4 - イル)エチルから成る群から選択されるか、

または、R¹およびR²の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹とR²がこれらが結合している窒素原子と一緒にになって2 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6, 7 - ジメトキシ - イソキノリニル)、1 - (4 - [(4 - クロロフェニル) - フェニル - メチル] - ピペラジニル)、1 - ピロリジニル、1 - (3 - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - ヒドロキシ - ピロリジニル)、1 - (4 - ヒドロキシ - ピペリジニル)、1 - (3 - (R) - ジメチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (4 - t - プトキシカルボニルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - t - プトキシカルボニルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - アミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - アミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (R) - メチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - メチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (S) - エチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (4 - ジメチルアミノ - ピロリジニル)、1 - (3 - (N - メチル - N - t - プトキシカルボニル - アミノ) - ピロリジニル)または1 - (2 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 3 - メチル - 5 - カルボキシ - 1, 2, 4 - トリアゾリル)から選択される基を形成しており、

R³がフェニルおよび4 - フルオロフェニルから成る群から選択され、

L¹が - C H₂ - および - C H₂ C H₂ - から成る群から選択され、

【化15】



がシクロオクチル、1 - ナフチル、1 - アセナフテニル、R - 1 - アセナフテニル、S - 1 - アセナフテニル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプテン - 2 - イル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプチルおよび(3 a S) - 2 , 3 , 3 a , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロ - 1 H - フェナレン - 1 - イルから成る群から選択され、

p が 0 から 1 の整数であり、

R⁵ がメチルであり、

q が 0 である、

請求項 4 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 8】

R¹ が水素、1 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - n - エチルおよびアミノ - n - プロピルから成る群から選択され、

R² が水素、メチル、n - ブチル、3 - ヒドロキシ - n - プロピル、3 - メトキシ - n - プロピル、メチルアミノ - n - プロピル、ジメチルアミノ - n - プロピル、N - メチル - N - t - プトキシカルボニル - アミノ - n - エチル、3 - ニトロベンジル、4 - メトキシカルボニル - ベンジル、- C H (C H₃) - フェニル、4 - ピリジニルおよび2 - (3 H - イミダゾール - 4 - イル) エチルから成る群から選択されるか、

別法として、R¹ および R² の両方が同じ窒素原子と結合している時には、R¹ と R² がこれらが結合している窒素原子と一緒にになって2 - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 6 , 7 - ジメトキシ - イソキノリニル) 、1 - (4 - [(4 - クロロフェニル) - フェニル - メチル] - ピペラジニル) 、1 - ピロリジニル、1 - (3 - ヒドロキシ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (R) - ヒドロキシ - ピロリジニル) 、1 - (4 - ヒドロキシ - ピペリジニル) 、1 - (3 - (R) - ジメチルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (4 - t - プトキシカルボニルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (R) - t - プトキシカルボニルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (R) - アミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (S) - アミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (R) - メチルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (S) - メチルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (4 - ジメチルアミノ - ピロリジニル) 、1 - (3 - (N - メチル - N - t - プトキシカルボニル - アミノ - ピロリジニル) または1 - (2 - (3 , 5 - ジクロロフェニル) - 3 - メチル - 5 - カルボキシ - 1 , 2 , 4 - トリアゾリル) から選択される基を形成しており、

【化16】



がシクロオクチル、1 - ナフチル、1 - アセナフテニル、R - 1 - アセナフテニル、S - 1 - アセナフテニル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプテン - 2 - イル、ビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプチルおよび(3 a S) - 2 , 3 , 3 a , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロ - 1 H - フェナレン - 1 - イルから成る群から選択される、

請求項 7 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 9】

8 - (R) アセナフテン - 1 - イル - 3 - (3 - アミノ - 2 - (S) - ヒドロキシ - プロピル) - 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカン - 4 - オン；

8 - (R) アセナフテン - 1 - イル - 3 - (3 - アミノ - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロ

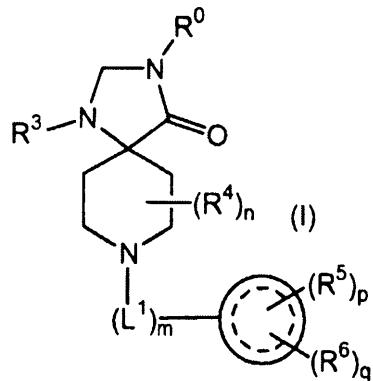
ピル) - 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ
カン - 4 - オン ;
 8 - (R) - アセナフテン - 1 - イル - 3 - (3 - ジメチルアミノ - 2 - (R) - ヒドロ
キシ - プロピル) - 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ
カン - 4 - オン ;
 3 - (3 - アミノ - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロピル) - 1 - (4 - フルオロ - フェニ
ル) - 8 - (8 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピ
ロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ;
 3 - (3 - ジメチルアミノ - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロピル) - 1 - (4 - フルオロ
- フェニル) - 8 - (8 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1 , 3 , 8 - トリア
ザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ;
 8 - (R) - アセナフテン - 1 - イル - 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 - [2 - (R)
- ヒドロキシ - 3 - (3 - ヒドロキシメチル - ピペリジン - 1 - イル) - プロピル]
- 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ;
 3 - (3 - アミノ - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロピル) - 8 - シクロオクチル - 1 - (4
- フルオロ - フェニル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン
;
 3 - (3 - アミノ - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロピル) - 1 - (4 - フルオロ - フェニ
ル) - 8 - 1 - (S) - (3aS) - (2 , 3 , 3a , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロ - 1H
- フェナレン - 1 - イル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン
;
 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 - [2 - (R) - ヒドロキシ - 3 - (3 - ヒドロキ
シ - プロピルアミノ) - プロピル] - 8 - (8 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチル)
- 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ;
 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 - [2 - (R) - ヒドロキシ - 3 - (3 - メチルア
ミノ - プロピルアミノ) - プロピル] - 8 - (8 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチル)
- 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ;
 3 - [3 - (3 - ジメチルアミノ - プロピルアミノ) - 2 - (R) - ヒドロキシ - プロピ
ル] - 1 - (4 - フルオロ - フェニル) - 8 - (8 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチ
ル) - 1 , 3 , 8 - トリアザ - スピロ [4 . 5] デカ - 4 - オン ; およびこれらの薬学
的に受け入れられる塩、

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】

式 (I)

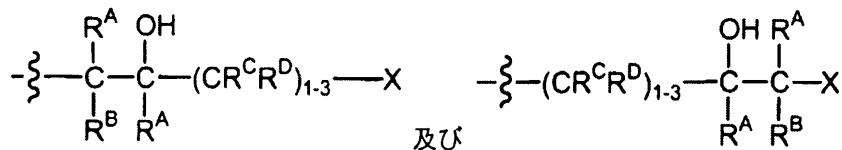
【化 17】



[式中、

R⁰ は、

【化18】



から成る群から選択され、

各 R^A および R^B は、独立して、水素および C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、各 R^C および R^D は、独立して、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $\text{N}(\text{R}^E)_2$ 、アリール、 ar C_{1-4} アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、 ar C_{1-4} アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル置換基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ニトロ、シアノまたは $\text{N}(\text{R}^E)_2$ から独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、

各 R^E は、独立して、水素および C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

X は、 $-\text{NR}^1\text{R}^2$ 、 $-\text{C(O)-NR}^1\text{R}^2$ 、 $-\text{NR}^1-\text{C(O)-R}^2$ 、 $-\text{OR}^1$ 、 $-\text{SR}^1$ 、 $-\text{SOR}^1$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^1$ 、 $-\text{S-}(\text{C}_{2-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ 、 $-\text{S-}(\text{C}_{2-4}\text{アルキル})-\text{C(O)O-C(CH}_3)_3$ 、 $-\text{SO-}(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ および $-\text{SO}_2-\text{(C}_{1-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ から成る群から選択され、ここで、前記 $-\text{S-}(\text{C}_{2-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ 、 $-\text{SO-}(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ または $-\text{SO}_2-\text{(C}_{1-4}\text{アルキル})-\text{NR}^1\text{R}^2$ 基のアルキル部分は場合によりカルボキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシカルボニルまたは $-\text{CONR}^1\text{R}^2$ から独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、

各 R^1 および R^2 は、独立して、水素、 C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキル- C_{1-4} アルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、 ar C_{1-4} アルキル、 ar C_{1-4} アルコキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリール- C_{1-4} アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル- C_{1-4} アルキル、 $-\text{C(O)-C}_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-\text{C(O)-アリール}$ 、 $-\text{C(O)-ar C}_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $-\text{C(O)-ヘテロアリール}$ および $-\text{C(O)-ヘテロシクロアルキル}$ から成る群から選択され、ここで、前記 C_{1-8} アルキル、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、 ar C_{1-8} アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は、単独であるか或は置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、 $-\text{C(O)-C}_{1-4}\text{アルキル}$ 、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $\text{N}(\text{R}^E)_2$ 、 $\text{N}(\text{R}^E)_2-\text{C}_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $\text{N}(\text{R}^E)-\text{C(O)C(CH}_3)_3$ 、アリール、アリールオキシ、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール置換ヘテロアリールアミノスルホニルまたは C_{1-6} アルキルチオから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい、

または、 R^1 および R^2 の両方が同じ窒素原子と結合している時には、 R^1 と R^2 がこれらが結合している窒素原子と一緒にになってヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基を形成しており、ここで、前記ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、 $\text{N}(\text{R}^E)_2$ 、アリール、 ar C_{1-4} アルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、ジ(C_{1-6})アルキルアミノ-カルボニル、 t -ブトキシカルボニルまたはアリールアミノ- C_{1-4} アルキルから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、前記アリール、 ar C_{1-4} アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル置換基は場合により更にハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノ、 $\text{N}(\text{R}^E)_2$ または置換フェニル(ここで、フェニル上の置換基はハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキ

ル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは $N(R^E)_2$ から独立して選択される1個以上である)から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

R^3 は、アリール、 $a_r C_{1-6}$ アルキルおよびヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記アリール、 $a_r C_{1-6}$ アルキルまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは $N(R^E)_2$ から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

n は、0から2の整数であり、

R^4 は、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキルおよびヒドロキシ置換 C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

m は、0から1の整数であり、

L^1 は、 C_{1-6} アルキルおよび C_{3-6} アルケニルから成る群から選択され、ここで、前記 C_{3-6} アルケニル基の二重結合はN原子との結合点から少なくとも炭素原子1個分離しており、そしてここで、前記 C_{1-6} アルキルまたは C_{3-6} アルケニル基は場合によりヒドロキシ、フルオロ、 C_{1-6} アルキル、フッ素置換 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} アルコキシから独立して選択される1から2個の置換基で置換されていてもよく、

【化19】



は、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、

p は、0から5の整数であり、

R^5 は、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 NR^1R^2 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO-NR^1R^2$ 、 $-SO_2-NR^1R^2$ および $-C(O)-NR^1R^2$ から成る群から選択され、

q は、0から1の整数であり、

R^6 は、 $- (L^2)_{0-1} - R^7$ から成る群から選択され、

L^2 は、 $-C_{1-6}$ アルキル-、 $-C_{2-4}$ アルケニル-、 $-C_{2-6}$ アルキニル-、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_{1-4}$ アルキル)-、 $-C_{1-6}$ アルキル-O-、 $-C_{1-6}$ アルキル-S-、 $-O-C_{1-6}$ アルキル-、 $-S-C_{1-6}$ アルキル-、 $-O-C_{2-6}$ アルキル-O-、 $-S-C_{2-6}$ アルキル-S-、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-SO_2N(C_{1-4}$ アルキル)-、 $-NH-SO_2-$ 、 $-N(C_{1-4}$ アルキル)-SO₂-、 $-C(O)-O-$ および $-O-C(O)-$ から成る群から選択され、

R^7 は、アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO_2-N(R^E)_2$ および $-C(O)-N(R^E)_2$ から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい】

で表される化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項11】

薬学的に受け入れられる担体と請求項1記載の化合物を含んで成る薬剤組成物。

【請求項12】

請求項1記載の化合物と薬学的に受け入れられる担体を混合することで作られた薬剤組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 記載の化合物と薬学的に受け入れられる担体を混合することを含んで成る薬剤組成物製造方法。

【請求項 1 4】

O R L - 1 受容体が媒介する障害の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 5】

前記 O R L - 1 受容体が媒介する障害が不安、鬱病、恐怖、躁病、痴呆、躁鬱病、薬物乱用、神経障害痛、急性痛、慢性痛、片頭痛、喘息、咳、精神病、統合失調症、てんかん、高血圧、肥満、摂食障害、禁断症状、糖尿病、心不整脈、過敏性腸症候群、クローン病、尿失禁、副腎機能障害、注意力欠如障害（A D D）、注意欠陥過活動性障害（A D H D）、アルツハイマー病、認識力改善、記憶力改善および気分安定化から成る群から選択される請求項 1 4 記載の使用。

【請求項 1 6】

O R L - 1 受容体が媒介する障害の治療するための請求項 1 1 記載の組成物。

【請求項 1 7】

不安、鬱病、恐怖、躁病、痴呆、躁鬱病、薬物乱用、神経障害痛、急性痛、慢性痛、片頭痛、喘息、咳、精神病、統合失調症、てんかん、高血圧、肥満、摂食障害、禁断症状、糖尿病、心不整脈、過敏性腸症候群、クローン病、尿失禁、副腎機能障害、注意力欠如障害（A D D）、注意欠陥過活動性障害（A D H D）、アルツハイマー病、認識力改善、記憶力改善および気分安定化から成る群から選択される状態の治療用医薬組成物を製造するための請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 1 8】

不安、鬱病、恐怖、躁病、痴呆、躁鬱病、薬物乱用、神経障害痛、急性痛、慢性痛、片頭痛、喘息、咳、精神病、統合失調症、てんかん、高血圧、肥満、摂食障害、禁断症状、糖尿病、心不整脈、過敏性腸症候群、クローン病、尿失禁、副腎機能障害、注意力欠如障害（A D D）、注意欠陥過活動性障害（A D H D）、アルツハイマー病、認識力改善、記憶力改善および気分安定化から成る群から選択される状態の治療用医薬組成物を製造するための請求項 7 記載の化合物の使用。

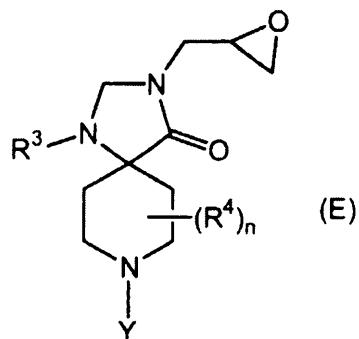
【請求項 1 9】

(a) 不安、(b) 郁病、(c) 恐怖、(d) 躁病、(e) 痴呆、(f) 躁鬱病、(g) 薬物乱用、(h) 神経障害痛、(i) 急性痛、(j) 慢性痛、(k) 片頭痛、(l) 喘息、(m) 咳、(n) 精神病、(o) 統合失調症、(p) てんかん、(q) 高血圧、(r) 肥満、(s) 摂食障害、(t) 禁断症状、(u) 糖尿病、(v) 心不整脈、(w) 過敏性腸症候群、(x) クローン病、(y) 尿失禁、(z) 副腎機能障害、(a a) 注意力欠如障害（A D D）、(b b) 注意欠陥過活動性障害（A D H D）、(c c) アルツハイマー病の治療、(d d) 認識力の改善、(e e) 記憶力の改善または(f f) 気分の安定化用薬剤を製造するための請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 2 0】

式 (E)

【化20】



[式中、

R^3 は、アリール、 $a r C_{1-6}$ アルキルおよびヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記アリール、 $a r C_{1-6}$ アルキルまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたは $N(R^E)_2$ から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

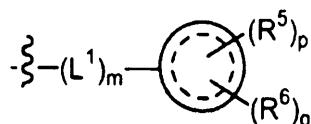
各 R^E は、独立して、水素または C_{1-4} アルキルから選択され、

n は、0から2の整数であり、

R^4 は、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキルおよびヒドロキシ置換 C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

Yは、水素、 C_{1-4} アルキル、t-ブトキシカルボニルおよび

【化21】



から成る群から選択され、

m は、0から1の整数であり、

L^1 は、 C_{1-6} アルキルおよび C_{3-6} アルケニルから成る群から選択され、ここで、前記 C_{3-6} アルケニル基の二重結合はN原子との結合点から少なくとも炭素原子1個分離しており、そしてここで、前記 C_{1-6} アルキルまたは C_{3-6} アルケニル基は場合によりヒドロキシ、フルオロ、 C_{1-6} アルキル、フッ素置換 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} アルコキシから独立して選択される1から2個の置換基で置換されていてもよく、

【化22】



は、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、

p は、0から5の整数であり、

R^5 は、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ置換 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N R^1 R^2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO-N R^1 R^2$ 、 $-SO_2-N R^1 R^2$ および $-C(O)-N R^1 R^2$ から成る群から選択され、

q は、0から1の整数であり、

R^6 は、 $- (L^2)_{0-1} - R^7$ から成る群から選択され、

L^2 は、 $-C_{1-6}$ アルキル-、 $-C_{2-4}$ アルケニル-、 $-C_{2-6}$ アルキニル-、 $-O-$ 、 $-S$

-、 - N H - 、 - N (C₁₋₄ アルキル) - 、 - C₁₋₆ アルキル - O - 、 - C₁₋₆ アルキル - S - 、 - O - C₁₋₆ アルキル - 、 - S - C₁₋₆ アルキル - 、 - O - C₂₋₆ アルキル - O - 、 - S - C₂₋₆ アルキル - S - 、 - SO₂ - 、 - SO₂NH - 、 - SO₂N (C₁₋₄ アルキル) - 、 - NH - SO₂ - 、 - N (C₁₋₄ アルキル) - SO₂ - 、 - C (O) - O - および - O - C (O) - から成る群から選択され、

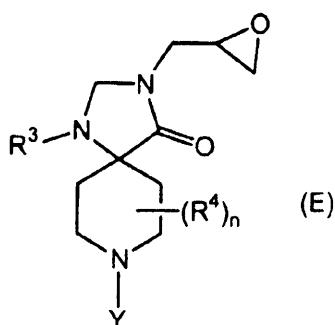
R⁷は、アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ、ニトロ、シアノ、N (R^E)₂、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、C₁₋₄ アルコキシカルボニル、- SO₂ - N (R^E)₂ および - C (O) - N (R^E)₂ から独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい】

で表される化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 21】

式 (E)

【化 23】



[式中、

R³は、アリール、a r C₁₋₆ アルキルおよびヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記アリール、a r C₁₋₆ アルキルまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ニトロ、シアノまたはN (R^E)₂ から独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、

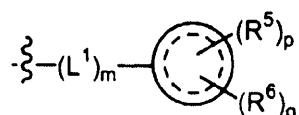
各 R^Eは、独立して、水素またはC₁₋₄ アルキルから選択され、

nは、0 から 2 の整数であり、

R⁴は、ヒドロキシ、C₁₋₄ アルキルおよびヒドロキシ置換 C₁₋₄ アルキルから成る群から選択され、

Yは、水素、C₁₋₄ アルキル、t - ブトキシカルボニルおよび

【化 24】



から成る群から選択され、

mは、0 から 1 の整数であり、

L¹は、C₁₋₆ アルキルおよびC₃₋₆ アルケニルから成る群から選択され、ここで、前記 C₃₋₆ アルケニル基の二重結合はN原子との結合点から少なくとも炭素原子 1 個分離しており、そしてここで、前記 C₁₋₆ アルキルまたはC₃₋₆ アルケニル基は場合によりヒドロキシ、フルオロ、C₁₋₆ アルキル、フッ素置換 C₁₋₆ アルキルまたはC₁₋₆ アルコキシから独立して選択される 1 から 2 個の置換基で置換されていてもよく、

【化25】



は、シクロアルキル、部分不飽和カルボシクリル、アリール、ヘテロアリールおよびヘロシクロアルキルから成る群から選択され、

pは、0から5の整数であり、

R^5 は、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N R^1 R^2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO-N R^1 R^2$ 、 $-SO_2-N R^1 R^2$ および $-C(O)-N R^1 R^2$ から成る群から選択され、

qは、0から1の整数であり、

R^6 は、 $- (L^2)_{0-1} - R^7$ から成る群から選択され、

L^2 は、 $-C_{1-6}$ アルキル-、 $-C_{2-4}$ アルケニル-、 $-C_{2-6}$ アルキニル-、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_{1-4}$ アルキル)-、 $-C_{1-6}$ アルキル-O-、 $-C_{1-6}$ アルキル-S-、 $-O-C_{1-6}$ アルキル-、 $-S-C_{1-6}$ アルキル-、 $-O-C_{2-6}$ アルキル-O-、 $-S-C_{2-6}$ アルキル-S-、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-SO_2N(C_{1-4}$ アルキル)-、 $-NH-SO_2-$ 、 $-N(C_{1-4}$ アルキル)-SO₂-、 $-C(O)-O-$ および $-O-C(O)-$ から成る群から選択され、

R^7 は、アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記アリール、部分不飽和カルボシクリル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は場合によりヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ニトロ、シアノ、 $N(R^E)_2$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 C_{1-4} アルコキシカルボニル、 $-SO_2-N(R^E)_2$ および $-C(O)-N(R^E)_2$ から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい】

で表される化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。