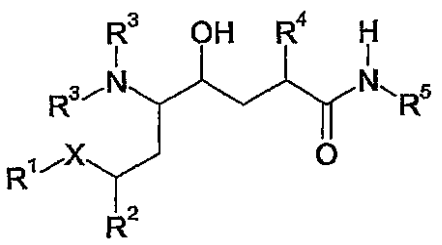
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年5月1日(2008.5.1)

【公表番号】特表2007-529474(P2007-529474A)
【公表日】平成19年10月25日(2007.10.25)
【年通号数】公開・登録公報2007-041
【出願番号】特願2007-503352(P2007-503352)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 209/18 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/405 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/12 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 209/18 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/405
Ｃ０７Ｄ 401/12
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｐ 9/12
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 9/04
Ａ６１Ｐ 27/06
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 13/12

【手続補正書】
【提出日】平成20年3月14日(2008.3.14)
【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】
一般式：
【化１】



(I)

{式中、
Xは、－CH_2－または＞CH－OHであり；
（A）R^1は、Xがヒドロキシメチレンの場合、場合により置換されているヘテロシクリル基もしくは場合により置換されている多環式不飽和炭化水素基であるか；または
（B）R^1は、ヘテロシクリル基もしくは多環式不飽和炭化水素基
［これらのそれぞれは、
C_1～C_6－アルキル、C_{3-8}－シクロアルキル、C_{3-8}－シクロアルコキシ、C_{3-8}－シクロアルコキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{3-8}－シクロアルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、アミノ－C_{1-6}－アルキル、アミノ－C_{2-7}－アルコキシ、ポリハロ－C_{1-6}－アルキル、ポリハロ－C_{2-7}－アルコキシ、ニトロ、アミノ、オキソ、オキシド、C_2～C_6－アルケニル、C_1～C_6－アルコキシ、C_1～C_6－アルカノイルオキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、カルボキシル、C_1～C_6－アルキレンジオキシ、フェニル、フェノキシ、フェニルチオ、フェニル－C_1～C_6－アルキルまたはフェニル－C_1～C_6－アルコキシ、ピリジルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{2-7}－アルケニルオキシ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、メトキシベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、メチレンジオキシベンジルオキシ、ジオキソラニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{3-8}－シクロアルキル－C_{1-6}－アルキル、C_{3-8}－シクロアルキル－C_{1-6}－アルコキシ、ヒドロキシ－C_{2-7}－アルコキシ、カルバモイルオキシ－C_{2-7}－アルコキシ、ピリジル－カルバモイルオキシ－C_{2-7}－アルコキシ、ベンゾイルオキシ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニル、C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、C_{1-6}－アルキル－カルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、（N－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、（N－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{3-8}－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{3-8}－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{2-7}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{2-7}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルカルボニルオキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルカルボニルオキシ－C_{2-6}－アルコキシ、シアノ－C_{1-6}－アルキル、シアノ－C_{1-6}－アルコキシ、2－オキソ－オキサゾリジニル－C_{1-6}－アルキル、2－オキソオキサゾリジニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニル－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、（N－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、（N－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{2-7}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルスルホニル－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルスルホニル－C_{1-6}－アルコキシ、カルボキシ－C_{1-6}－アルキル、カルボキシ－C_{1-6}－アルコキシ、カルボキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニル、アシル－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、（N－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ、（N－ヒドロキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（N－ヒドロキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（N－ヒ

ドロキシ）アミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、６－アルコキシアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－C_{1-6}－アルコキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－C_{1-6}－アルコキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－アシル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルアミノ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、１－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルイミダゾール－２－イル、１－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルテトラゾール－５－イル、５－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルテトラゾール－１－イル、２－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル－４－オキソイミダゾール－１－イル、カルバモイル－C_{1-6}－アルキル、カルバモイル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルカルバモイル、ジ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、C_{1-6}－アルキルスルホニル、C_{1-6}－アルキルアミジニル、アセトアミジニル－C_{1-6}－アルキル、Ｏ－メチルオキシミル－C_{1-6}－アルキル、Ｏ，Ｎ－ジメチルヒドロキシルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{3-6}－シクロアルキル－C_{1-6}－アルカノイル、アリール－C_{1-6}－アルカノイルまたはヘテロシクリル－C_{1-6}－アルカノイル（これらのそれぞれはハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_{1-6}－アルコキシ、ヒドロキシ、C_1～C_6－アルキルアミノ、ジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、C_{1-6}－アルコキシカルボニル、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルキルまたはトリフルオロメチルによって場合により置換されている）；および
ピリジル、ピリジルオキシ、ピリジルチオ、ピリジルアミノ、ピリジル－C_{1-6}－アルキル、ピリジル－C_{1-6}－アルコキシ、ピリミジニル、ピリミジニルオキシ、ピリミジニルチオ、ピリミジニルアミノ、ピリミジニル－C_{1-6}－アルキル、ピリミジニル－C_{1-6}－アルコキシ、チエニル、チエニル－C_{1-6}－アルキル、チエニル－C_{1-6}－アルコキシ、フリル、フリル－C_{1-6}－アルキルまたはフリル－C_{1-6}－アルコキシ、ピペリジノアルキル、ピペリジノアルコキシ、ピペリジノアルコキシアルキル、モルホリノアルキル、モルホリノアルコキシ、モルホリノアルコキシアルキル、ピペラジノアルキル、ピペラジノアルコキシ、ピペラジノアルコキシアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－１－イルアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－１－イルアルコキシ、〔１，２，４〕トリアゾール－４－イルアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－４－イルアルコキシ、〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルキル、〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、３－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルキル、３－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、５－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－３－イルアルキル、５－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－３－イルアルコキシ、テトラゾール－１－イルアルキル、テトラゾール－１－イルアルコキシ、テトラゾール－２－イルアルキル、テトラゾール－２－イルアルコキシ、テトラゾール－５－イルアルキル、テトラゾール－５－イルアルコキシ、５－メチルテトラゾール－１－イルアルキル、５－メチルテトラゾール－１－イルアルコキシ、チアゾール－４－イルアルキル、チアゾール－４－イルアルコキシ、オキサゾール－４－イルアルキル、オキサゾール－４－イルアルコキシ、２－オキソピロリジニルアルキル、２－オキソピロリジニルアルコキシ、イミダゾリルアルキル、イミダゾリルアルコキシ、２－メチルイミダゾリルアルキル、２－メチルイミダゾリルアルコキシまたはＮ－メチルピペラジノアルキル、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシアルキル、ジオキソラニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ジチアニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、３－アセトアミドメチルピロリジニル、３－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２

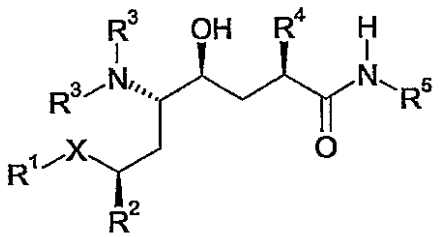
，６－ジメチルモルホリニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ〔１，３〕オキサジニル、２－オキソテトラヒドロピリミジニル（これらのそれぞれは、ハロゲン、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ、もしくはジヒドロキシ－C_1～C_6－アルキルアミノカルボニルによって場合により置換されている）；および
－Ｏ－CH_2CH（ＯＨ）CH_2NR_x基（式中、NR_xは、モノ－もしくはジ－C_1～C_6－アルキルアミノ、ピペリジノ、モルホリノ、ピペラジノ、またはＮ－メチルピペラジノ基である）
から選択される基１～４個により置換されている〕であり、
ここで、R^1がナフチルもしくはシクロヘキセノフェニルである場合には、少なくともＸに直接結合していない該R^1基の環系は明記したとおり置換されており；または
（Ｃ）R^1は、ピラジニル、トリアゾリル、イミダゾリル、ベンゾチアゾリル、ピラニル、テトラヒドロピラニル、アゼチジニル、モルホリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、イソキノリル、ベンゾ〔ｂ〕チエニル、イソベンゾフラニル、ベンゾイミダゾリル、２－オキソベンゾイミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ピロリル、ピラゾリル、トリアジニル、ジヒドロベンゾフラニル、２－オキソジヒドロベンゾ〔ｄ〕〔１，３〕オキサジニル、４－オキソジヒドロイミダゾリル、５－オキソ－４Ｈ－〔１，２，４〕トリアジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ〔１，４〕チアジニル、テトラヒドロキノキサリニル、１，１，３－トリオキソジヒドロ－２Ｈ－１λ^6－ベンゾ〔１，４〕チアジニル、１－オキソ－ピリジル、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、２－オキソテトラヒドロベンゾ〔ｅ〕〔１，４〕ジアゼピニル、２－オキソジヒドロベンゾ〔ｅ〕〔１，４〕ジアゼピニル、１Ｈ－ピロリジニル、フタラジニル、１－オキソ－３Ｈ－イソベンゾフラニル、４－オキソ－３Ｈ－チエノ〔２，３－ｄ〕ピリミジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、〔１，５〕ナフチリジル、ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ〔１，４〕チアジニル、１，１－ジオキソジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ〔１，４〕チアジニル、２－オキソ－１Ｈ－ピリド〔２，３－ｂ〕〔１，４〕オキサジニル、ジヒドロ－１Ｈ－ピリド〔２，３－ｂ〕〔１，４〕オキサジニル、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジル、ベンゾ〔１，３〕ジオキソリル、ベンゾオキサゾリル、２－オキソベンゾオキサゾリル、２－オキソ－１，３－ジヒドロインドリル、２，３－ジヒドロインドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ジオキソラニル、ジオキサニル、ジチオラニル、ジチアニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２，６－ジメチルモルホリニル、テトラヒドロピラニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピペリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ〔１，３〕オキサジニル、２－オキソアゼパニル、または２－オキソテトラヒドロピリミジニルであり；
R^2は、C_1～C_6－アルキルまたはC_3～C_6－シクロアルキルであり；
R^3は、それぞれ独立して、Ｈ、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシカルボニルまたはC_1～C_6－アルカノイルであり；
R^4は、C_1～C_6－アルキル、C_3～C_6－シクロアルキル、C_2～C_6－アルケニル、または非置換もしくは置換されているアリール－C_1～C_6－アルキルであり；
R^5は、C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－ヒドロキシアルキル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルカノイルオキシ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アミノアルキル、C_1～C_6－アルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－ジアルキルアミノ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルカノイルアミド－C_1～C_6－アルキル、ＨＯ（Ｏ）Ｃ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキル－Ｏ－（Ｏ）Ｃ－C_1～C_6－アルキル、H_2N－Ｃ（Ｏ）－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルキル－ＨＮ－Ｃ（Ｏ）－C_1～C_6－アルキル、（C_1～C_6－アルキル）$_2$Ｎ－Ｃ（Ｏ）－C_1～C_6－アルキル

、C_2～C_8－アルケニル、C_2～C_8－アルキニル、シアノ－C_1～C_6－アルキル、ハロ－C_1～C_6－アルキル、場合により置換されているアリール－C_0～C_6－アルキル、場合により置換されているC_3～C_8－シクロアルキル－C_0～C_6－アルキル、または場合により置換されているヘテロシクリル－C_0～C_6－アルキルである}
で示される化合物、またはそのプロドラッグ（これは、インビボで適用したときに、化学的または生理学的過程により式（Ｉ）で示される化合物を放出する）、あるいは原子１個以上がそれらの安定した非放射性同位体に置き換わっているもの、あるいはその塩、特に薬学的に使用され得るその塩。

【請求項２】

一般式（ＩＡ）：

【化２】



(IA)

（式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5およびＸは、それぞれ、式（Ｉ）で示される化合物に関して定義したとおりである）で示される化合物であることを特徴とする、請求項１記載の化合物。

【請求項３】

Ｘが、CH_2であり；

R^1が、（Ｂ）または（Ｃ）に関して明記したとおりであり；

R^2が、C_1～C_6－アルキルであり；

R^4が、C_1～C_6－アルキルである、請求項１または２記載の化合物。

【請求項４】

Ｘが、CH_2であり；

R^1が、（Ｂ）または（Ｃ）に関して明記したとおりであり；

R^2が、C_1～C_6－アルキルであり；

R^3が、Ｈであり；

R^4が、C_1～C_6－アルキルであり；

R^5が、C_1～C_6－アルキル、ハロ－C_1～C_6－アルキル、C_1～C_6－アルコキシ－C_1～C_6－アルキル、C_2～C_8－アルキニル、シアノ－C_1～C_6－アルキル、場合により置換されているC_3～C_6－シクロアルキル、C_3～C_8－シクロアルキル－C_1～C_6－アルキル、場合により置換されているアリール、場合により置換されているヘテロシクリル－C_0～C_6－アルキル（これは、C_0－アルキルの場合には、炭素原子を介して結合している）、またはH_2N－Ｃ（Ｏ）－C_1～C_6－アルキルである、請求項１～３のいずれか１項記載の化合物、またはその薬学的に使用され得るその塩。

【請求項５】

R^1基が、ベンゾイミダゾリル、ジ－C_{1-6}－アルコキシピリミジニル、２－または５－ベンゾ〔ｂ〕チエニル、６－または７－イソキノリル、６－または７－テトラヒドロキノリル、６－または７－テトラヒドロイソキノリル、６－キノキサリニル、６－または７－キナゾリニル、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、３－オキソ－４Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、２－オキソベンゾオキサゾリル、２－オキソ－１，３－ジヒドロインドリル、２，３－ジヒドロインドリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、６－または７－キノリル、６－または７－イソキノリル、６－または７－テトラヒドロキノリル、オキソテトラヒドロキノリル、６－または７－テトラヒドロイソキノリル、６－キノキサリニル、６－または７－

キナゾリニル、インドリル、３－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ベンゾ〔１，４〕オキサジニル、２－オキソ－２，３－ジヒドロベンゾオキサゾリル、２，３－ジヒドロベンゾチアジニル、イミダゾリル、ピリジニル、ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジニル、ピロロ〔３，２－ｃ〕ピリジニル、ピロロ〔２，３－ｃ〕ピリジニル、ピロロ〔３，２－ｂ〕ピリジニル、〔１，２，３〕トリアゾロ〔１，５－ａ〕ピリジニル、〔１，２，４〕トリアゾロ〔４，３－ａ〕ピリジニル、イミダゾロ〔１，５－ａ〕ピリジニル、イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリミジニル、ナフチル及びシクロヘキセノフェニル
（これらのそれぞれは、ヒドロキシ、ハロゲン、オキソ、オキシド、カルバモイル、カルボキシル、シアノ、トリフルオロメチル、C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシ、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノ、２，３－ジヒドロキシプロポキシ、２，３－ジヒドロキシプロポキシ－C_{1-6}－アルコキシ、２，３－ジメトキシプロポキシ、メトキシベンジルオキシ、ヒドロキシベンジルオキシ、フェネチルオキシ、メチレンジオキシベンジルオキシ、ジオキソラニル－C_{1-6}－アルコキシ、シクロプロピル－C_{1-6}－アルコキシ、ピリジルカルバモイルオキシ－C_{1-6}－アルコキシ、３－モルホリノ－２－ヒドロキシプロポキシ、ベンジルオキシ－C_{1-6}－アルコキシ、ピコリルオキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{3-6}－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{3-6}－シクロアルキルカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ヒドロキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、C_1～C_6－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルカルボニルオキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルカルボニルオキシ－C_{1-6}－アルコキシ、シアノ－C_{1-6}－アルキル、シアノ－C_{1-6}－アルコキシ、２－オキソ－オキサゾリジニル－C_{1-6}－アルキル、２－オキソオキサゾリジニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシカルボニル－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルキルスルホニルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルキル、ジ－C_{1-6}－アルキルアミノ－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルスルホニル－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルキルスルホニル－C_{1-6}－アルコキシ、カルボキシ－C_{1-6}－アルキル、カルボキシ－C_{1-6}－アルコキシ、カルボキシ－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニル、アシル－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシカルボニルアミノ、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－ヒドロキシ）アミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルコキシ－アミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、６－アルコキシアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－C_{1-6}－アルコキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルキル、（Ｎ－C_{1-6}－

アルコキシ）－C_{1-6}－アルキルアミノカルボニル－C_{1-6}－アルコキシ、（Ｎ－アシル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルアミノ、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニル、C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、（Ｎ－C_{1-6}－アルキル）－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルカルボニルアミノ、１－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルイミダゾール－２－イル、１－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルテトラゾール－５－イル、５－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルテトラゾール－１－イル、２－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキル－４－オキソイミダゾール－１－イル、カルバモイル－C_{1-6}－アルキル、カルバモイル－C_{1-6}－アルコキシ、C_{1-6}－アルキルカルバモイル、ジ－C_{1-6}－アルキルカルバモイル、C_{1-6}－アルキルスルホニル、ピペリジノアルキル、ピペリジノアルコキシ、ピペリジノアルコキシアルキル、モルホリノアルキル、モルホリノアルコキシ、モルホリノアルコキシアルキル、ピペラジノアルキル、ピペラジノアルコキシ、ピペラジノアルコキシアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－１－イルアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－１－イルアルコキシ、〔１，２，４〕トリアゾール－４－イルアルキル、〔１，２，４〕トリアゾール－４－イルアルコキシ、〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルキル、〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、３－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルキル、３－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－５－イルアルコキシ、５－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－３－イルアルキル、５－メチル〔１，２，４〕オキサジアゾール－３－イルアルコキシ、テトラゾール－１－イルアルキル、テトラゾール－１－イルアルコキシ、テトラゾール－２－イルアルキル、テトラゾール－２－イルアルコキシ、テトラゾール－５－イルアルキル、テトラゾール－５－イルアルコキシ、５－メチルテトラゾール－１－イルアルキル、５－メチルテトラゾール－１－イルアルコキシ、チアゾール－４－イルアルキル、チアゾール－４－イルアルコキシ、オキサゾール－４－イルアルキル、オキサゾール－４－イルアルコキシ、２－オキソピロリジニルアルキル、２－オキソピロリジニルアルコキシ、イミダゾリルアルキル、イミダゾリルアルコキシ、２－メチルイミダゾリルアルキル、２－メチルイミダゾリルアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルキル、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシ、Ｎ－メチルピペラジノアルコキシアルキル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリル、４－メチルピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、２－ヒドロキシメチルピロリジニル、３－ヒドロキシピロリジニル、３，４－ジヒドロキシピロリジニル、３－アセトアミドメチルピロリジニル、３－C_{1-6}－アルコキシ－C_{1-6}－アルキルピロリジニル、４－ヒドロキシピペリジニル、４－オキソピペリジニル、３，５－ジメチルモルホリニル、４，４－ジオキソチオモルホリニル、４－オキソチオモルホリニル、２，６－ジメチルモルホリニル、２－オキソイミダゾリジニル、２－オキソオキサゾリジニル、２－オキソピロリジニル、２－オキソ－〔１，３〕オキサジニル及び２－オキソテトラヒドロピリミジニルから選択される基１～４個により置換されている）
からなる群から選択され、ここで、ナフチルまたはシクロヘキセノフェニルの場合には、少なくともＸに直接結合していない該R^1基の環系は明記したとおり置換されている、請求項１～４のいずれか１項記載の化合物。

【請求項６】

人または動物の体を治療的に処置する方法において使用される、請求項１～５のいずれか１項記載の化合物。

【請求項７】

活性医薬成分としての請求項１～５のいずれか１項記載の化合物を、遊離形態でまたは薬学的に使用され得る塩として含む医薬製剤。

【請求項８】

高血圧、心不全、緑内障、心筋梗塞、腎不全または再狭窄の治療または予防のための医薬を製造するための、請求項１～５のいずれか１項記載の化合物の使用。

【請求項９】

心臓血管作用を有する薬剤、例えばα－およびβ－ブロッカー（例えば、フェントラミン、フェノキシベンザミン、プラゾシン、テラゾシン、トラジン、アテノロール、メトプロロール、ナドロール、プロプラノロール、チモロール、カルテオロールなど）、血管弛緩剤（例えば、ヒドララジン、ミノキシジル、ジアゾキシド、ニトロプルシド、フロセキナンなど）、カルシウム拮抗剤（例えば、アムリノン、ベンシクラン、ジルチアゼム、フェンジリン、フルナリジン、ニカルジピン、ニモジピン、パーヘキシレン、ベラパミル、ガロパミル、ニフェジピンなど）、ＡＣＥ阻害剤（例えば、シラザプリル、カプトプリル、エナラプリル、リシノプリルなど）、カリウム活性化剤（例えばピナシジル）、抗セロトニン作動薬（例えばケタンセリン）、トロンボキサン合成酵素阻害剤、中性エンドペプチダーゼ阻害剤（ＮＥＰ阻害剤）、アンギオテンシンII拮抗剤；利尿薬（例えば、ヒドロクロロチアジド、クロロチアジド、アセタゾラミド、アミロリド、ブメタニド、ベンズチアジド、エタクリン酸、フロセミド、インダクリノン、メトラゾン、スピロノラクトン、トリアムテレン、クロルタリドンなど）、交感神経遮断薬（例えば、メチルドパ、クロニジン、グアナベンズ、レセルピン）、ならびにヒトおよび動物における、糖尿病または腎臓疾患（例えば急性または慢性腎不全）に関連する高血圧、心不全または血管疾患の処置に適した他の薬剤を追加的に１種以上用いて製造を実施することを特徴とする、請求項８記載の使用。