

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2019年9月19日(19.09.2019)



(10) 国際公開番号

WO 2019/177117 A1

(51) 国際特許分類:

A61K 31/551 (2006.01) A61K 45/00 (2006.01)
A61K 31/498 (2006.01) A61P 11/14 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61K 31/5513 (2006.01)

京都千代田区岩本町2丁目2番3号
Tokyo (JP). 学校法人星薬科大学 (HOSHI
UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒1428501 東京都品川
区荏原2-4-4 1 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2019/010652

(22) 国際出願日: 2019年3月14日(14.03.2019)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願 2018-046152 2018年3月14日(14.03.2018) JP
特願 2018-164852 2018年9月3日(03.09.2018) JP

(72) 発明者: 今井 利安(IMAI Toshiyasu); 〒3410005
埼玉県三郷市彦川戸1-2-2 日本ケミ
ファ株式会社 創薬研究所内 Saitama (JP).
亀井 淳三(KAMEI Junzo); 〒1428501 東京
都品川区荏原2-4-4 1 学校法人
星薬科大学内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 棚井 澄雄, 外 (TANAI Sumio et al.);
〒1006620 東京都千代田区丸の内一丁
目9番2号 Tokyo (JP).

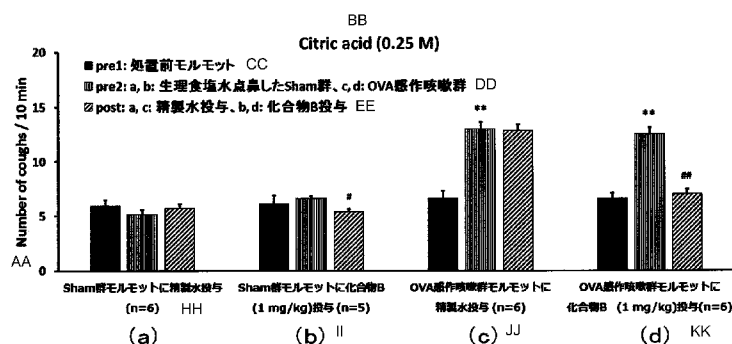
(71) 出願人: 日本ケミファ株式会社 (NIPPON
CHEMIPHAR CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1010032 東

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保
護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ,

(54) Title: DRUG FOR TREATING COUGH

(54) 発明の名称: 咳嗽の治療のための医薬

[図12]



AA Number of coughs/10 min
BB Citric acid
CC Pretreated guinea pig
DD a, b: Sham group with physiological saline instilled nasally; c, d: OVA-sensitized cough group
EE a, c: purified water administration, b, d: compound B administration
FF ** P < 0.01 vs. each pre-value
GG # P < 0.05, ## P < 0.01 vs. each post 1-value
HH Purified water administration to sham group guinea pigs
II Compound B (1 mg/kg) administration to sham group guinea pigs
JJ Purified water administration to OVA-sensitized cough group guinea pigs
KK Compound B (1 mg/kg) administration to OVA-sensitized cough group guinea pigs

(57) Abstract: The present invention pertains to a drug for preventing or treating cough, the drug containing as an active ingredient a compound having a P2X4 receptor antagonizing action, a tautomer, stereoisomer, or pharmacologically acceptable salt of said compound, or a hydrate or solvate thereof.

(57) 要約: 本発明は、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物を有効成分として含む、咳嗽の予防又は治療のための医薬に関する。

[続葉有]

BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第21条(3))

明 細 書

発明の名称： 咳嗽の治療のための医薬

技術分野

[0001] 本発明は、咳嗽の予防又は治療剤に関する。

本願は、2018年3月14日に、日本に出願された特願2018-46152号、及び2018年9月3日に、日本に出願された特願2018-164852号に基づき優先権を主張し、その内容をここに援用する。

背景技術

[0002] 咳（咳嗽）は、本来気道に侵入する異物や病原体などに対する生体防御反応であるが、過剰な（病的な）咳は患者の苦痛、消耗をもたらす。

咳嗽は持続期間により、3週間未満の急性咳嗽、3週間以上8週間未満の遷延性咳嗽、8週間以上の慢性咳嗽に分類される。

急性咳嗽の原因の多くは感冒を含む気道の感染症であり、持続期間が長くなるにつれ感染症の頻度は低下する。慢性咳嗽においては感染症そのものが原因となることはまれである。また慢性咳嗽とは、「問診，身体所見，胸部単純X線写真やスパイログラフィーなどの一般検査では原因を特定できない8週間以上持続する咳嗽が唯一の症状であるもの」と定義される。

また、病的な咳は、痰を伴わない乾性咳嗽と痰を伴う湿性咳嗽に分類される。前者は種々の機械的・化学的刺激などによって生じる咳感受性亢進、気道攣縮で生じるのに対し、後者は痰による機械的刺激（痰を出すための咳）が主体である。

臨床的に鎮咳薬は、咳の末梢あるいは中枢内経路のいずれかの部位を遮断することによって咳を抑制することができる。

[0003] コデインのような中枢作動性の薬剤は咳のメカニズムの中で共通経路を遮断することより効果が大きく、現在、当該中枢作動性の薬剤が処方されることが多い。

その要因として、咳のメカニズムは明らかにされていないことが多く、現

在までに明らかにされているメカニズムも複雑なことが考えられる。例えば、気管や肺胞に炎症があったり、異物があったり、痰がたまっていたりすると、その部分の受容体（咳受容体）がそれを感知し、舌咽神経、上喉頭神経などの求心性神経を介して、延髄脳幹部の呼吸中枢内の咳反射を統合する中枢、いわゆる咳中枢に伝えられる。咳中枢に咳受容体からの情報が伝わると、呼吸運動の中枢性制御神経機構の活動が変調し、その信号が迷走神経、横隔神経などの遠心性神経を介して横隔膜や胸郭の筋肉などに伝えられ、急激な胸腔内圧の上昇に伴う強力な呼気努力が生じ、咳反射が起こる、といったメカニズムである。

[0004] これまでの知見では咳の誘発に関与する受容体としては、A δ 線維の終末受容体である *rapid adapting receptor* (RARs) あるいは気管支肺のC線維終末がその代表的なものとして考えられている。A δ 線維、C線維に関連するものの一つにATP (*adenosine triphosphate*) が知られている。ATPは後根神経節 (DRG) ニューロン、後角ニューロン、脊髄ミクログリア及び上位中枢神経系などに発現する様々なATP受容体サブタイプを介して痛み情報伝達に多様に関与していることが明らかになっている。ATP受容体はイオンチャネル型ATP受容体 (P2X) とGタンパク質共役型ATP受容体 (P2Y) とに大別され、それぞれの7種類 (P2X1-7)、8種類 (P2Y1, 2, 4, 6, 11-14) のサブタイプの存在が明らかになっている。

これらATP受容体サブタイプのうち、P2X受容体はカプサイシン受容体TRPV1などと共存して、後根神経節神経のC及びA δ 線維に発現していることが明らかになっている（非特許文献2）。

また、非特許文献1において亀井らは、モルモットを用いたクエン酸により刺激して咳嗽を誘発する（以下、クエン酸誘発咳嗽）実験で濃度依存的及び有意な上昇をATPが示し、この効果はPPADSエアロゾルではなく吸入TNP-ATPによる前処置によって完全に阻止されたことを報告している。

TNP-ATPはP2X1-4の受容体拮抗薬として知られ、PPADSはP2X1, 2, 3, 5, 7の受容体拮抗薬として知られる。

そこで、気道におけるP2X受容体、特にP2X4受容体の刺激がATP誘発咳反射の増強に必要であることを示唆していると報告している。

非特許文献2において亀井らは、咳嗽反射の調節にATP受容体が関与している可能性を検討したところ、A δ 線維の興奮性を直接的に調節して咳嗽反射の発現に関与していることを示唆するデータを得ていることを報告している。また、クエン酸誘発によりATPの濃度に依存して増加した咳嗽数は、P2Xタイプ受容体拮抗薬であるTNP-ATPにより減少したことから、ATPは気道上のATP受容体、特にP2Xタイプ受容体を介して、RARsあるいはcough receptorの感受性を亢進させ咳嗽反射を増加させている可能性が考えられると報告している。

[0005] 特許文献1においては、P2X受容体拮抗化合物からなる呼吸器疾患治療剤が記載されており請求項7、8には「P2X受容体がP2X4受容体である」ことがさらに特定されている。

しかしながら、P2X受容体拮抗化合物については具体的な開示はなされていないし、P2X4受容体拮抗化合物については化合物の名称や構造等、化合物を製造及び同定必要な情報が何も開示されておらず、P2Xタイプの受容体拮抗剤であれば鎮咳効果が得られることを示すものではない。

また、本願出願人は、P2X4受容体拮抗剤に関する特許出願の特許文献2ないし8のとおり行っているが、いずれの出願も、咳（咳嗽）に対する予防又は治療に関する記載や示唆は全くない。

先行技術文献

特許文献

[0006] 特許文献1：国際公開2005/107804

特許文献2：国際公開2008/023847

特許文献3：国際公開2010/093061

特許文献4：国際公開2012/008478

特許文献5：国際公開2012/014910

特許文献6：国際公開2012/017876

特許文献7：国際公開2013/105608

特許文献8：国際公開2015/005468

特許文献9：国際公開2015/005467

非特許文献

[0007] 非特許文献1：European Journal of Pharmacology 528, 158-161 (2005)

非特許文献2：日薬理誌 (Folia Pharmacol. Jpn.) 131, 429~433 (2008)

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0008] 本発明の課題は、咳嗽の予防又は治療のための医薬を提供することにある。より具体的には、急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽、特に慢性咳嗽の予防又は治療のための医薬を提供することにある。

[0009] 上述したとおり、コデインのような中枢作動性の薬剤は咳のメカニズムの中で共通経路を遮断することより効果が大きい反面、生体防御として必要な本来止めてはならない咳も止めてしまう問題がある。また、中枢作動性の薬剤であるため咳以外の中枢作用に起因する便秘や眠気などの副作用が多い。さらに、咳喘息や胃食道逆流症などの咳に対してコデインの最大量でもしばしば抵抗性である。これらを考慮すると、中枢性の薬剤で咳を遮断することは好ましくなく、より選択的な手段で鎮咳をもたらすべきである。

課題を解決するための手段

[0010] そこで本発明者は、上記課題を解決すべく、鋭意研究を行った結果、P2X4受容体アンタゴニスト作用を有する一般式(A1)ないし(H11)で表される化合物が、咳嗽の予防又は治療に有用であることを見出し、本発明を完成させた。

[0011] すなわち、本発明により、咳嗽の予防又は治療のための医薬であって、 $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物を有効成分として含む医薬が提供される。

[0012] $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物としては、例えば、下記の一般式 (A1) ないし (H11) で表される化合物を用いることができる。

より好ましくは、 $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物として、下記の一般式 (A1)、(E1)、(F1) 又は (G1) で表される化合物を用いることができる。

[0013] $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物は、末梢に存在する $P2 \times 4$ 受容体へ選択的に作用し、末梢性に咳嗽を抑制する。したがって、 $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物は、気道などの組織及び咳嗽反射刺激を伝達する1次求心性線維の細胞体 (DRG：脊髄後根神経節) など、末梢に存在する ATP 受容体 ($P2 \times 4$ 受容体) に作用し、延髄に存在する咳中枢に直接作用しない、末梢性鎮咳薬として有用であり得る。

[0014] 本発明の医薬は、例えば、咳嗽、好ましくは急性咳嗽、遷延性咳嗽及び慢性咳嗽、より好ましくは慢性咳嗽の予防又は治療のために用いることができる。さらには、例えば慢性咳嗽の原因疾患として挙げられる乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、アレルギー性咳嗽などの咳嗽、又は湿性咳嗽として挙げられる慢性閉そく性肺疾患、喘息などの咳嗽の予防又は治療に用いることができる。

[0015] 別の観点からは、本発明により、上記の医薬の製造のための $P2 \times 4$ 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の使用；及び乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽及びアレルギー性咳嗽などの咳嗽、又は湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽及び喘息による咳嗽などの咳予防又は治療方法であって、 $P2 \times$

4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の予防又は治療有効量をヒトを含む哺乳類動物に投与する工程を含む方法が提供される。

発明の効果

[0016] 本発明の医薬は、咳嗽、好ましくは急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽、より好ましくは慢性咳嗽の予防又は治療のための医薬として有用であり、さらには、例えば慢性咳嗽の原因疾患として挙げられる乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽若しくはアレルギー性咳嗽などの咳嗽、又は湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽若しくは喘息による咳嗽などの咳嗽の予防又は治療において高い有効性が期待される。特に、乾性咳嗽に有用であり、中でも咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽に有用である。

図面の簡単な説明

[0017] [図1]処置前マウスに化合物Aを経口投与した後、クエン酸（0.25 M）誘発咳嗽に対する化合物Aの咳嗽抑制作用を示した図である。

[図2]図1の試験結果より咳嗽回数0を100%としたときの抑制率を表した図である。

[図3]処置前マウスにジヒドロコデイン10 mg/kgを経口投与した後、クエン酸（0.25 M）誘発咳嗽に対するジヒドロコデインの咳嗽抑制作用を示した図であり、試験結果より咳嗽回数0を100%としたときの抑制率を表した図である。

[図4]気道炎症させた気道炎症モデルマウスに化合物A（0.3 mg/kg）を経口投与した後、クエン酸（0.1 M）誘発咳嗽に対する化合物Aの咳嗽抑制作用を示した図である。クエン酸（0.1 M）刺激は、化合物Aを投与1時間後に行った。

[図5]気道炎症させた気道炎症モデルマウスに化合物A（10～100 µg/

mL) をネブライザーにて吸入投与した後、クエン酸 (0.25 M) 刺激に対する化合物 A の咳嗽抑制作用を示した図である。クエン酸 (0.25 M) 刺激は、化合物 A を投与 4 分後に行った。

[図6] 図 5 の試験結果より咳嗽回数 0 を 100% としたときの抑制率を表した図である。

[図7] 処置前モルモットに化合物 A を経口投与した後、クエン酸 (0.5 M) 誘発咳嗽に対する化合物 A の咳嗽抑制作用を示した図である。

[図8] 図 7 の試験結果より咳嗽回数 0 を 100% としたときの抑制率を表した図である。

[図9] 処置前モルモットに化合物 B を経口投与した後、クエン酸 (0.5 M) 誘発咳嗽に対する化合物 B の咳嗽抑制作用を示した図である。

[図10] 図 9 の試験結果より咳嗽回数 0 を 100% としたときの抑制率を表した図である。

[図11] オブアルブミン (Ovalbumin、以下「OVA」と称する) で感作したモルモット (モルモット OVA 感作咳嗽モデル) に化合物 A (1.0 mg/kg) を経口投与した後、クエン酸 (0.25 M) 誘発咳嗽に対する化合物 A の咳嗽抑制作用を示した図である。クエン酸 (0.25 M) 刺激は、化合物 A を投与 1 時間後に行った。

[図12] モルモット OVA 感作咳嗽モデルに化合物 B (1.0 mg/kg) を経口投与した後、クエン酸 (0.25 M) 誘発咳嗽に対する化合物 B の咳嗽抑制作用を示した図である。クエン酸 (0.25 M) 刺激は、化合物 B を投与 1 時間後に行った。

[図13] 処置前モルモットに化合物 C 及び化合物 D を経口投与した後、クエン酸 (0.5 M) 誘発咳嗽に対する化合物 C 及び化合物 D の咳嗽抑制作用を示した図である。

[図14] 図 13 の試験結果より、咳嗽回数が増減しなかった場合を 0%、咳嗽回数が 0 となった場合を 100%、としたときの抑制率を表した図である。

[図15] モルモット摘出気管・気管支平滑筋収縮に対する化合物 A の作用を示

した図である。

[図16]モルモット摘出気管・気管支平滑筋収縮に対する化合物Bの作用を示した図である。

発明を実施するための形態

[0018] 本発明の医薬は、咳嗽の予防又は治療のための医薬として用いることができるが、下記の用途のための医薬としても用いることができる

本発明の医薬は、前記咳嗽が急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽の予防又は治療のための医薬として用いることができる。

本発明の医薬は、前記咳嗽が慢性咳嗽の咳嗽の予防又は治療のための医薬として用いることができる。

本発明の医薬は、前記咳嗽が乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽又はアレルギー性咳嗽などの咳嗽の予防又は治療のための医薬として用いることができる。

本発明の医薬は、前記咳嗽が湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽又は喘息による咳嗽などの咳嗽の予防又は治療のための医薬として用いることができる。

[0019] 本発明の医薬の有効成分としては、下記に示す一般式（A I）ないし（H I I）で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物を用いることができる。

下記に示す表中などに用いられる略号は以下のとおりである。

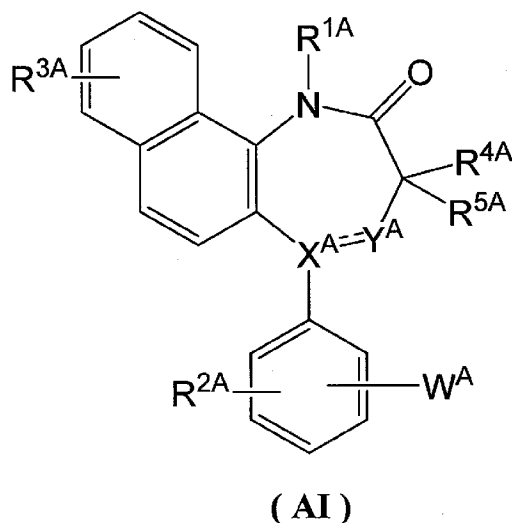
Me：メチル基、Et：エチル基、Pr：n-プロピル基、iPr：イソプロピル基、tBu：tert-ブチル基、Ac：アセチル基、Ph：フェニル基。

下記に示す表中などにおいて、置換基をその置換位置の位置番号とともに記す場合がある。また、化学式において、見かけ上同一の位置番号を区別するため、便宜的に一方の位置番号にプライム「'」を付して表示する場合があるが、化合物名において、一義的に構造を特定し得る限り、前記プライム

を用いることなく位置番号を表記することがある。

[0020] (A-1) 下記の一般式 (A1) :

[化1]



(式中、 R^{1A} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{2A} 及び R^{3A} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{4A} 及び R^{5A} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又

はフェニル基で置換された炭素数 1 ～ 3 のアルキル基を表し、

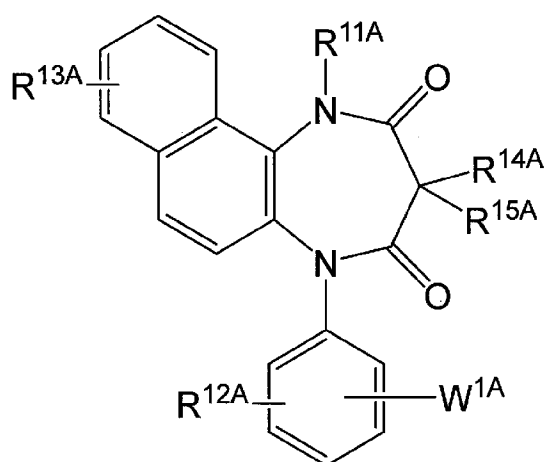
W^Aは置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を 1 ～ 4 個含む 5 又は 6 員環の複素環を表し、

そして、X^AがNのとき、Y^AはC=Oで、かつ実線と破線からなる二重線は単結合を表し、

X^AがCのとき、Y^AはNで、かつ実線と破線からなる二重線は二重結合を表す。) で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0021] (A-2) 下記の一般式 (A II) :

[化2]



(AII)

(式中、R^{11A}は水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数 1 ～ 3 のアルキル基を表し、

R^{12A}及びR^{13A}は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のジアルキル

アミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{14A} 及び R^{15A} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

そして、 W^{1A} は置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環を表す。）で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0022] 一般式(A I)及び(A I I)において、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^{3A} 、 R^{4A} 及び R^{5A} 又は R^{11A} 、 R^{12A} 、 R^{13A} 、 R^{14A} 及び R^{15A} の炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

R^{1A} 又は R^{11A} の炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^{3A} 、 R^{4A} 及び R^{5A} 又は R^{11A} 、 R^{12A} 、 R^{13A} 、 R^{14A} 及び R^{15A} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は*t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

R^{1A} 、 R^{4A} 及び R^{5A} 又は R^{11A} 、 R^{14A} 及び R^{15A} のフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基としては、ベンジル基等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0023] R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は*t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基が挙げられる。

[0024] R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ基が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} のアルコシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数1～8）としては、メトシカルボニル基、エトシカルボニル基等が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルキルチオ基としては、メチルチオ基が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル基が挙げられる。

R^{2A} 及び R^{3A} 又は R^{12A} 及び R^{13A} の炭素数1～8のアルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基が挙げられる。

[0025] W^A 又は W^{1A} の置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環としては、テトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール、イミダゾール、オキサゾール、イソキサゾール、ピロール、チアゾール、ピリジン、ピロリジンが挙げられる。

W^A 又は W^{1A} の置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環が有していてもよい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基等が挙げられる。

一般式(A I)中の R^{2A} 及び R^{3A} は、 R^{2A} 、 R^{3A} が置換しているベンゼン環に、同一又は異なったものが1～3個存在していてもよい。また同様に一般式(A I I)中の R^{12A} 及び R^{13A} は、 R^{12A} 、 R^{13A} が置換しているベンゼン環に、同一又は異なったものが1～3個存在していてもよい。

[0026] 一般式(A I)の化合物としては以下に示す化合物が好ましい。

(A-1-1) W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである(A-1)に記載の化合物。

(A-1-2) W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハ

ロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (A-1) 又は (A-1-1) に記載の化合物。

(A-1-3) W^A が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-2) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-4) W^A がテトラゾールである (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-3) のいずれかに記載の化合物。

[0027] (A-1-5) R^{1A} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-4) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-6) R^{1A} が水素原子である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-5) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-7) R^{4A} が水素原子で、 R^{5A} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-6) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-8) R^{4A} 及び R^{5A} が共に水素原子である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-7) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-9) R^{2A} が水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-8) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-10) R^{2A} が水素原子である (A-1) 又は (A-1-1) ないし (A-1-9) のいずれかに記載の化合物。

(A-1-11) R^{3A}が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）である（A-1）又は（A-1-1）ないし（A-1-10）のいずれかに記載の化合物。

(A-1-12) R^{3A}が水素原子である（A-1）又は（A-1-1）ないし（A-1-11）のいずれかに記載の化合物。

[0028] (A-1-13) X^AがNで、Y^AがC=Oで、実線と破線からなる二重線が、単結合である（A-1）又は（A-1-1）ないし（A-1-12）のいずれかに記載の化合物。

(A-1-14) X^AがCで、Y^AがNで、実線と破線からなる二重線が、二重結合である（A-1）又は（A-1-1）ないし（A-1-12）のいずれかに記載の化合物。

[0029] 一般式（A-1）の化合物としては以下に示す化合物が好ましい。

(A-2-1) W^Aが置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである（A-2）に記載の化合物。

(A-2-2) W^Aが置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は1, 2, 3-トリアゾールである（A-2）又は（A-2-1）に記載の化合物。

(A-2-3) W^Aが5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は5-

チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (A-2) 又は (A-2-1) ないし (A-2-2) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-4) W^Aがテトラゾールである (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-3) のいずれかに記載の化合物。

[0030] (A-2-5) R^{1A}が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-4) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-6) R^{1A}が水素原子である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-5) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-7) R^{4A}が水素原子で、R^{5A}が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-6) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-8) R^{4A}及びR^{5A}が共に水素原子である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-7) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-9) R^{2A}が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-8) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-10) R^{2A}が水素原子である (A-1) 又は (A-2-1) ないし (A-2-9) のいずれかに記載の化合物。

(A-2-11) R^{3A}が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ

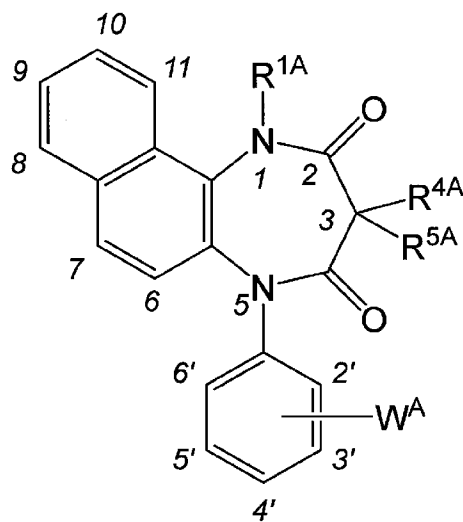
部分の炭素数は1～8。)である(A-1)又は(A-2-1)ないし(A-2-10)のいずれかに記載の化合物。

(A-2-12) R^{3A} が水素原子である(A-1)又は(A-2-1)ないし(A-2-11)のいずれかに記載の化合物。

[0031] 一般式(A1)に包含される代表的化合物を以下に示す。

<代表化合物A-100>

[化3]



(式中、 R^{1A} 、 R^{4A} 、 R^{5A} 及び W^A 並びに W^A の置換位置は表1～3に記載のとおりである。)

表1～3において、 W^A の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の2位、3位及び4位は、代表化合物A-100の式中の2'位、3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0032]

[表1]

R ^{1A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{4A} /R ^{5A}
H	2-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H/H
H	4-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	Me/H
Bn	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-1-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-1-イル	Me/Me
H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	H/H
H	3-	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H/H
H	4-	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H/H

[0033] [表2]

R ^{1A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{4A} /R ^{5A}
H	2-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-	[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール]-3-イル	H/H
H	3-	[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール]-3-イル	Et/H
H	3-	[5-フルオロ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	H/H
H	3-	[5-フルオロ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	Me/Me
H	3-	[5-シアノ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	H/H
H	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	4-	1H-イミダゾール-1-イル	Pr/H
H	3-	1H-イミダゾール-2-イル	H/H
H	3-	1H-イミダゾール-4-イル	H/H
H	3-	イミダゾリン-2-イル	H/H

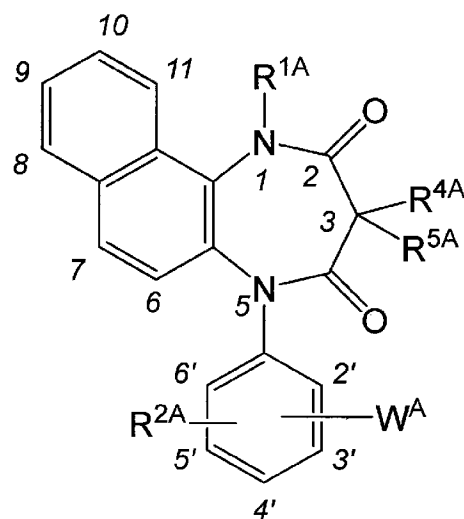
[0034]

[表3]

R ^{1A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{4A} /R ^{5A}
H	2-	ピラゾール-3-イル	H/H
H	3-	ピラゾール-4-イル	H/H
H	3-	ピラゾール-5-イル	Me/H
H	3-	(1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H/H
H	3-	(1,3,4-オキサジアゾール)-2-イル	H/H
H	3-	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H/H
H	3-	ピロール-1-イル	H/H
H	4-	ピロリジン-2-イル	H/H
Me	4-	ピロリジン-2-イル	Me/H
H	4-	(1,3-オキサゾール)-5-イル	H/H
H	3-	(1,3-オキサゾール)-5-イル	H/H
H	2-	(1,3-チアゾール)-5-イル	H/H

[0035] <代表化合物 A-200>

[化4]



(式中、R^{1A}、R^{2A}、R^{4A}、R^{5A}及びW^A並びにW^Aの置換位置は表4及び5に記載のとおり)

表4及び5において、W^Aの置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の2位、3位及び4位は、代表化合物A-200の式中の2'位、3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0036]

[表4]

R ^{1A}	R ^{2A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{4A} /R ^{5A}
H	4-OH	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-OMe	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	2-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	2,6-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-F	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-Br	3-	1H-テトラゾール-5-イル	Et/H
H	3-OMe	4-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H/H
H	4-Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H

[0037] [表5]

R ^{1A}	R ^{2A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{4A} /R ^{5A}
H	4-Cl	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	Me/H
H	4-CF ₃	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	H/H
H	3-SMe	4-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-SO ₂ Me	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	3-NHSO ₂ Me	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	4-OMe	3-	1H-イミダゾール-4-イル	H/H
H	4-F	2-	ピラゾール-3-イル	H/H

[0038] <代表化合物 A-300>

[化5]

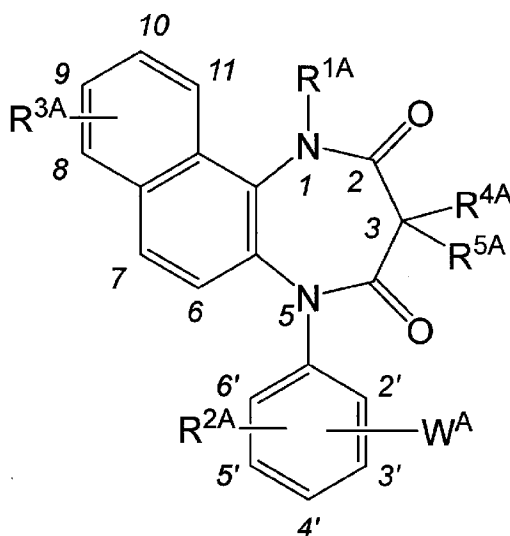
(式中、R^{1A}、R^{2A}、R^{3A}、R^{4A}、R^{5A}及びW^A並びにW^Aの置換位置は

表 6 及び 7 に記載のとおり)

表 6 及び 7 において、W^Aの置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。
すなわち、表中の 3 位及び 4 位は、代表化合物 A-300 の式中の 3' 位及び 4' 位にそれぞれ対応する。

[0039] [表6]

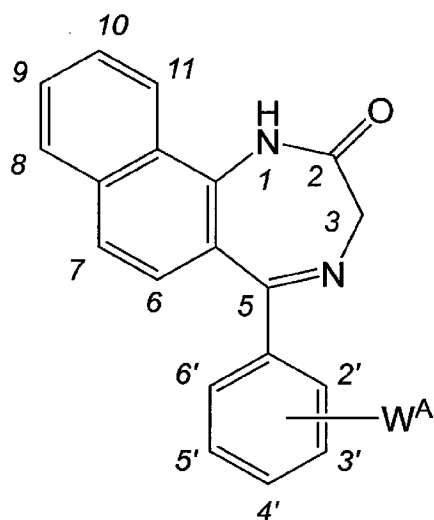
R ^{1A}	R ^{2A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{3A}	R ^{4A} /R ^{5A}
H	H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Br	H/H
H	4-OMe	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Cl	H/H
H	4-OH	3-	1H-テトラゾール-5-イル	10-OMe	H/H
H	2-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Br	H/H
H	2,6-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Me	H/H
H	H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	10-Cl	Me/H
H	3-OMe	4-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	9-CF ₃	H/H

[0040] [表7]

R ^{1A}	R ^{2A}	W ^A の置換位置	W ^A	R ^{3A}	R ^{4A} /R ^{5A}
H	4-Me	3-	1H-テトラゾール-1-イル	9-CN	Pr/H
Me	H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	9-OH	H/H
Et	H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	10-F	H/H
H	3-Br	4-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	9-SMe	H/H
Allyl	H	4-	1H-イミダゾール-1-イル	8-OMe	H/H
H	H	3-	1H-イミダゾール-1-イル	10-OMe	Me/Me

[0041] <代表化合物 A-400>

[化6]



(式中、 W^A 並びに W^A の置換位置は表8に記載のとおり)

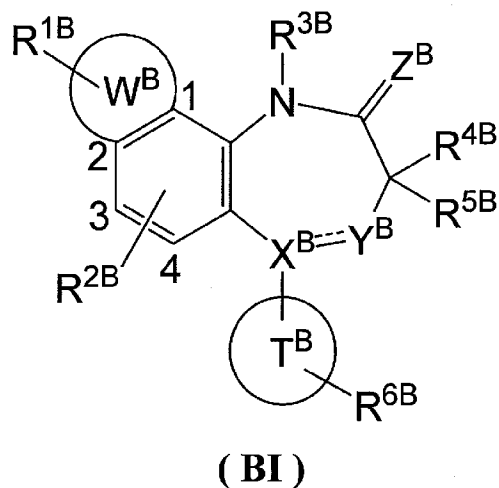
表8において、 W^A の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の3位及び4位は、代表化合物A-400の式中の3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0042] [表8]

W^A の置換位置	W^A
3-	1H-テトラゾール-5-イル
4-	1H-テトラゾール-5-イル
3-	5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール-3イル

[0043] (B-1) 下記の一般式(B1) :

[化7]



(式中、 R^{1B} 及び R^{2B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{4B} 及び R^{5B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェ

ニル基で置換された炭素数 1～3 のアルキル基を表し、

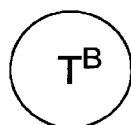
R^{6B} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化8]



は、N、S、O から選択される 1～2 個のヘテロ原子を環構成元素として含んでいてもよく、ベンゼン環の 1 と 2 の位置で縮合している 5～8 員の非芳香族環を表し、

[化9]



は、ベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、ピリミジン環、インドール環、インダゾール環、ベンゾトリアゾール環、ベンズイソキサゾール環、ベンズイミダゾール環及びキノリン環から選択される芳香族環を表し、

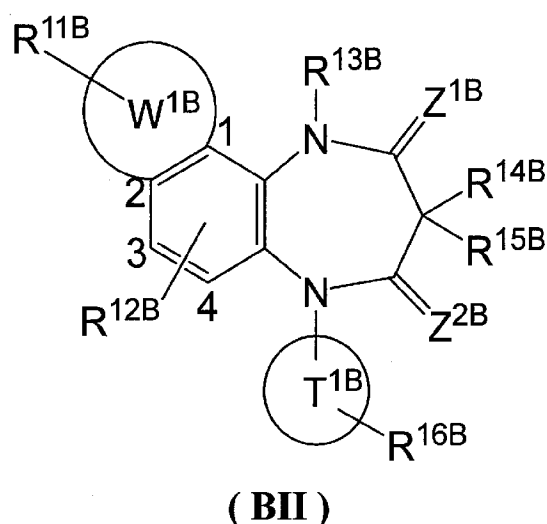
Z^B はO又はSを表し、

そして、 X^B がNのとき、 Y^B はC=O又はC=Sで、かつ実線と波線からなる二重線は単結合を表し

X^B がCのとき、 Y^B はNで、かつ実線と波線からなる二重線は二重結合を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0044] (B-2) 下記の一般式 (B II) :

[化10]



(式中、 R^{11B} 及び R^{12B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はス

ルファモイル基を表し、

R^{13B}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

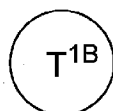
R^{14B}及びR^{15B}は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{16B}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化11]



[化12]

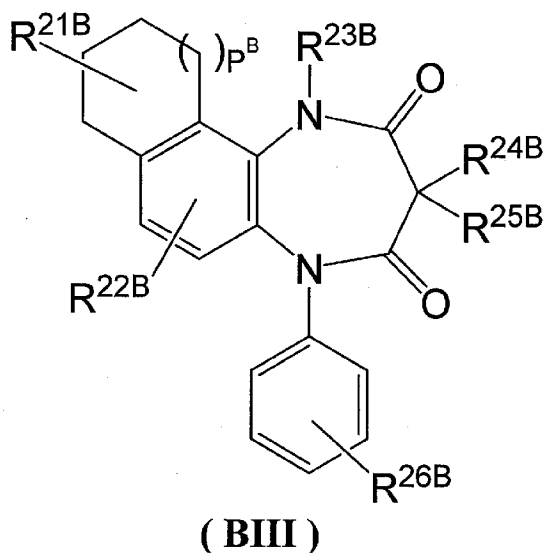


はベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、ピリミジン環、インドール環、インダゾール環、ベンゾトリアゾール環、ベンズイソキサゾール環、ベンズイミダゾール環及びキノリン環から選択される芳香族環を表し、

そして、 Z^{1B} 及び Z^{2B} は同一又は異なってもよくO又はSを表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0045] (B-3) 下記の一般式 (BIII) :

[化13]



(式中、 R^{21B} 及び R^{22B} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシ

ルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{23B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{24B} 及び R^{25B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{26B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

そして、 p^B は0又は1を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0046] 上記一般式 (B I) において、 R^{1B} 、 R^{2B} 、 R^{3B} 、 R^{4B} 、 R^{5B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 、 R^{3B} 及び R^{6B} の炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 、 R^{3B} 、 R^{4B} 、 R^{5B} 及び R^{6B} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は*t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

R^{3B} 、 R^{4B} 及び R^{5B} のフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基としては、ベンジル基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0047] R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又は*t*-ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 、 R^{4B} 、 R^{5B} 及び R^{6B} のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

また、 R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

[0048] R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ基が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} のアルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数1～8）としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキルチオ基としては、メチルチオ基が挙げられる。

R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル基が挙げられる。

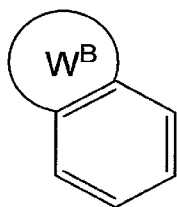
R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} の炭素数1～8のアルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基が挙げられる。

[0049] R^{6B} の置換基を有していてもよいフェニル基において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基等が挙げられる。

R^{6B} の置換基を有していてもよい複素環基において、好ましい複素環基としては、テトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基等が挙げられ、更にオキサジアゾール基でもよい。

R^{6B} の置換基を有していてもよい複素環において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基、オキソ等が挙げられ、更にフェニル基でもよい。

[0050] [化14]



としては、テトラヒドロナフタレン、インダン、インドリン、テトラヒドロキノリン又はテトラヒドロイソキノリン等が挙げられる。

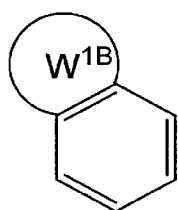
上記一般式 (B I) 中の R^{1B} 、 R^{2B} 及び R^{6B} は、 R^{1B} 、 R^{2B} 、 R^{6B} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0051] 上記で挙げた一般式 (B I) の R^{1B} ～ R^{6B} における炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数1～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、アルコシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数1～8）、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、置換基を有していてもよいフェニル基及び置換基を有していてもよい複素環基等の例示は、上記一般式 (B I I) の R^{11B} ～ R^{16B} 及び上記一般式 (B I I I) の R^{21B} ～ R^{26B} についても同様なものが挙げられる。

[0052] 同じく一般式 (B I I) の R^{16B} 及び一般式 (B I I I) の R^{26B} の置換基

を有していてもよい複素環基について、置換基として挙げられる炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基は、上記の一般式 (B 1) の R^{1B} ～ R^{6B} で例示したものが挙げられる。

[化15]



としては、テトラヒドロナフタレン、インダン、インドリン、テトラヒドロキノリン又はテトラヒドロイソキノリン等が挙げられる。

[0053] 上記一般式 (B 1 1) 中の R^{11B} 、 R^{12B} 及び R^{16B} は、 R^{11B} 、 R^{12B} 、 R^{16B} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

上記一般式 (B 1 1 1) 中の R^{21B} 、 R^{22B} 及び R^{26B} は、 R^{21B} 、 R^{22B} 、 R^{26B} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0054] 上記一般式 (B 1) に包含される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(B-1-1) R^{1B} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基、又は炭素数 2 ～ 8 のアシルアミノ基である (B-1) に記載の化合物。

(B-1-2) R^{2B} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアル

キル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基である(B-1)又は(B-1-1)に記載の化合物。

(B-1-3) R^{3B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である(B-1)又は(B-1-1)若しくは(B-1-2)のいずれかに記載の化合物。

[0055] (B-1-4) R^{4B} 及び R^{5B} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である(B-1)又は(B-1-1)ないし(B-1-3)のいずれかに記載の化合物。

(B-1-5) R^{6B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、又は置換基を有していてもよい複素環基である(B-1)又は(B-1-1)ないし(B-1-4)のいずれかに記載の化合物。

(B-1-6) R^{6B} が環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環である(B-1)又は(B-1-1)ないし(B-1-5)に記載の化合物。

(B-1-7) R^{6B} が炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラゾ

リル基、オキサジアゾリル基、イソキサゾリル基、ピロリル基、ピロリジニル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-6) のいずれかに記載の化合物。

[0056] (B-1-8) R^{6B} が炭素数 1~8 のアルキル基、炭素数 1~8 のアルコキシ基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基及びアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-7) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-9) R^{6B} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-8) のいずれかに記載の化合物。

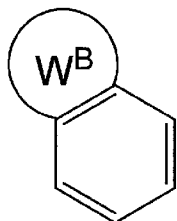
(B-1-10) R^{6B} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-9) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-11) R^{6B} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-9) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-12) R^{6B} がテトラゾールである (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-11) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-13)

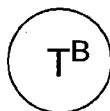
[化16]



がテトラヒドロナフタレン、インダン、インドリン、テトラヒドロキノリン又はテトラヒドロイソキノリンである (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-12) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-14)

[化17]



がベンゼン環である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-13) のいずれかに記載の化合物。

[0057] (B-1-15) X^B が N で、 Y^B が $C=O$ で、実線と破線からなる二重線が、単結合である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-14) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-16) X^B が C で、 Y^B が N で、実線と破線からなる二重線が、二重結合である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-14) のいずれかに記載の化合物。

(B-1-17) Z^B が O である (B-1) 又は (B-1-1) ないし (B-1-16) のいずれかに記載の化合物。

[0058] 上記一般式 (B-1) に包含される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(B-2-1) R^{11B} が水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキ

ルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、又は炭素数2～8のアシルアミノ基である（B-2）に記載の化合物。

（B-2-2） R^{12B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基である（B-2）又は（B-2-1）に記載の化合物。

（B-2-3） R^{13B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である（B-2）又は（B-2-1）若しくは（B-2-2）のいずれかに記載の化合物。

[0059] （B-2-4） R^{14B} 及び R^{15B} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-3）のいずれかに記載の化合物。

（B-2-5） R^{16B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、又は置換基を有していてもよい複素環基である（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-4）のいずれかに記載の化合物。

（B-2-6） R^{16B} が環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環である（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-5）に記載の化合物。

（B-2-7） R^{16B} が炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1

～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、イソキサゾリル基、ピロリル基、ピロリジニル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-6）のいずれかに記載の化合物。

[0060] （B-2-8） R^{16B} が炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基及びアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-7）のいずれかに記載の化合物。

（B-2-9） R^{16B} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-8）のいずれかに記載の化合物。

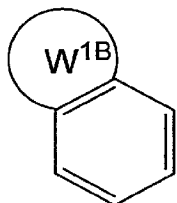
（B-2-10） R^{16B} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は1, 2, 3-トリアゾールである（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-9）のいずれかに記載の化合物。

（B-2-11） R^{16B} が5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである（B-2）又は（B-2-1）ないし（B-2-9）のいずれかに記載の化合物。

(B-2-12) R^{16B} がテトラゾールである(B-2)又は(B-2-1)ないし(B-2-11)のいずれかに記載の化合物。

(B-2-13)

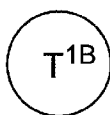
[化18]



がテトラヒドロナフタレン、インダン、インドリン、テトラヒドロキノリン又はテトラヒドロイソキノリンである(B-2)又は(B-2-1)ないし(B-2-12)のいずれかに記載の化合物。

(B-2-14)

[化19]



がベンゼン環である(B-2)又は(B-2-1)ないし(B-2-13)のいずれかに記載の化合物。

[0061] (B-2-15) Z^{1B} 及び Z^{2B} が共にOである(B-2)又は(B-2-1)ないし(B-2-14)のいずれかに記載の化合物。

[0062] 一般式(B-1-1)の化合物としては、次に示す化合物が好ましい。

(B-3-1) R^{21B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、又は炭素数2～8のアシルアミノ基である(B-3)に記載の化合物。

(B-3-2) R^{22B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアル

キル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基である（B-3）又は（B-3-1）に記載の化合物。

（B-3-3） R^{23B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である（B-3）又は（B-3-1）若しくは（B-3-2）のいずれかに記載の化合物。

[0063] （B-3-4） R^{24B} 及び R^{25B} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基である（B-3）又は（B-3-1）ないし（B-3-3）のいずれかに記載の化合物。

（B-3-5） R^{26B} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、又は置換基を有していてもよい複素環基である（B-3）又は（B-3-1）ないし（B-3-4）のいずれかに記載の化合物。

（B-3-6） R^{26B} が環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環である（B-3）又は（B-3-1）ないし（B-3-5）に記載の化合物。

（B-3-7） R^{26B} が炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラゾ

リル基、オキサジアゾリル基、イソキサゾリル基、ピロリル基、ピロリジニル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-6) のいずれかに記載の化合物。

[0064] (B-3-8) R^{26B} が炭素数 1~8 のアルキル基、炭素数 1~8 のアルコキシ基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基及びアミノ基から選択される置換基を有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-7) のいずれかに記載の化合物。

(B-3-9) R^{26B} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-8) のいずれかに記載の化合物。

(B-3-10) R^{26B} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-9) のいずれかに記載の化合物。

(B-3-11) R^{26B} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-10) のいずれかに記載の化合物。

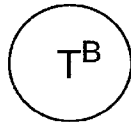
(B-3-12) R^{26B} がテトラゾールである (B-3) 又は (B-3-1) ないし (B-3-11) のいずれかに記載の化合物。

[0065] なお、一般式 (B I) の R^{3B} 、一般式 (B I I) の R^{13B} 及び一般式 (B I I I) の R^{23B} は、アセチル等の炭素数 2~8 のアシル基であってもよい。

また、一般式 (B I) の R^{6B} 、一般式 (B I I) の R^{16B} 及び一般式 (B I I I) の R^{26B} は、*tert*-ブトキシカルボニルアミノ基等の炭素数 3～8 のアルコキシカルボニルアミノ基であってもよい。

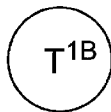
また、一般式 (B I) の

[化20]



及び一般式 (B I I) の

[化21]

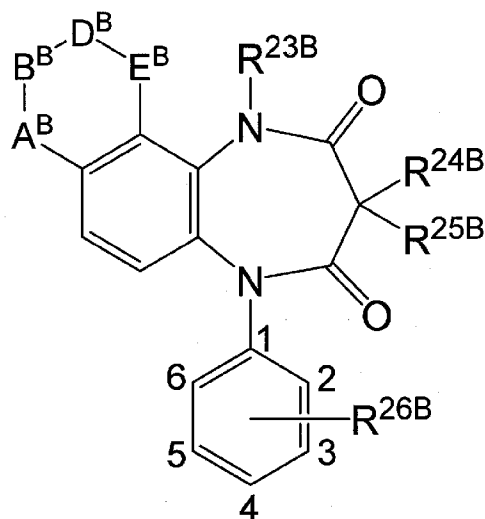


は、2, 3-ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシンであってもよい。

[0066] 一般式 (B I) に包含される代表的化合物を以下に示す。

<代表化合物 B-100>

[化22]



(式中、 $A^B-B^B-DB-E^B$ 、 R^{23B} 、 R^{24B} 、 R^{25B} 及び R^{26B} は表 9～11 記載のとおり)

[0067] [表9]

$A^B-B^B-D^B-E^B$	R^{23B}	R^{24B}/R^{25B}	R^{26B}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CN
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CO ₂ H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CONH ₂
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3,4-OMe
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	Me	H/H	3,4-OMe
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	Et	H/H	3-OH,4-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-NH ₂
$NHCH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-NHMe
$NMeCH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CF ₃
OCH_2CH_2O	H	H/H	3-NHCH ₂ CF ₃
OCH_2CH_2O	Me	H/H	2-OH,3-OH
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	Et	H/H	3,4,5-Me

[0068]

[表10]

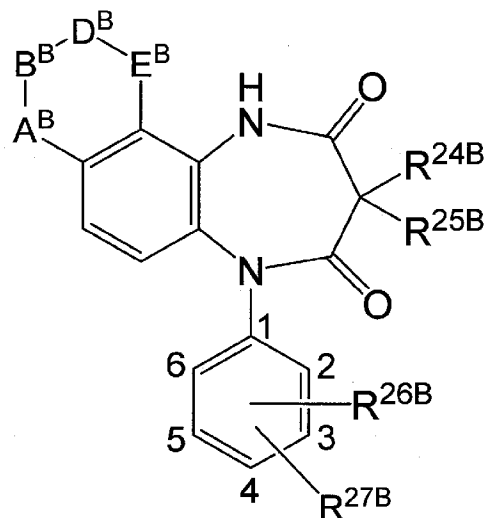
AB-BB-DB-EB	R ^{23B}	R ^{24B} /R ^{25B}	R ^{26B}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	4-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/Me	4-NH ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Pr/H	4-NO ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	4-CN
CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂	Me	CF ₃ /H	4-Ph
CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	Et	H/H	4-CH ₂ OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-CH ₂ OH
NHCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-Ac
NMeCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3,5-OMe
OCH ₂ CH ₂ O	H	H/H	3-OH,4-NH ₂
OCH ₂ CH ₂ O	Me	H/H	3-CH ₂ NH ₂
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂	Et	H/H	3-SO ₂ CH ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	3-iPr
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	3-NMe ₂

[0069] [表11]

AB-BB-DB-EB	R ^{23B}	R ^{24B} /R ^{25B}	R ^{26B}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	3-Ac
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Pr/H	3,4-NH ₂
CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	NHMe
CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	Et	H/H	3-NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-NHAc
NHCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-SO ₂ Me
NMeCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	4-Me
OCH ₂ CH ₂ O	H	H/H	4-iPr
OCH ₂ CH ₂ O	Me	H/H	3-Ph
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂	Et	H/H	3-F, 4-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac	H/H	3-F, 4-OMe
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	4-NHEt

[0070] <代表化合物 B-200>

[化23]



(式中、 $A^B-B^B-D^B-E^B$ 、 R^{24B} 、 R^{25B} 、 R^{26B} 及び R^{27B} は表12
 ~14記載のとおり。表中の位置は R^{26B} の置換位置を表す)

[0071] [表12]

$A^B-B^B-D^B-E^B$	R^{24B}/R^{25B}	位置	R^{26B}	R^{27B}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-1-イル	4-F
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	3	2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル	3-F
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	3	1,2,3-トリアゾール-5-イル	2-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1,2,4-トリアゾール-3-イル	H
$NHCH_2CH_2CH_2$	H/H	3	5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル	H
$NMeCH_2CH_2CH_2$	H/H	4	1H-イミダゾール-1-イル	H
OCH_2CH_2O	H/H	4	1H-イミダゾール-2-イル	H
OCH_2CH_2O	H/H	3	5-シアノ-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	3	1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/H	3	ピラゾール-3-イル	4-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/Me	3	ピラゾール-4-イル	H

[0072]

[表13]

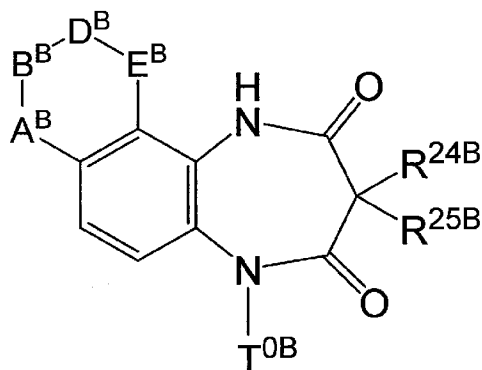
AB-BB-DB-EB	R ^{24B} /R ^{25B}	位置	R ^{26B}	R ^{27B}
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	4-NH ₂
CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂	CF ₃ /H	3	1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	H/H	3	1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	4-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	ピロール-1-イル	3-F
NHCH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	ピロリジン-2-イル	H
NMeCH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	2	1,3-オキサゾール-5-イル	H
OCH ₂ CH ₂ O	H/H	3	1,3-チアゾール-5-イル	H
OCH ₂ CH ₂ O	H/H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂	H/H	3	5-クロロ-1H-イミダゾール-2-イル	4-OH

[0073] [表14]

AB-BB-DB-EB	R ^{24B} /R ^{25B}	位置	R ^{26B}	R ^{27B}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me/H	4	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	4-NH ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me/H	4	5-アミノ-1H-イミダゾール-2-イル	3-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me/H	3	2-エチル-2H-テトラゾール-5-イル	H
C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Pr/H	3	2-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-テトラゾール-5-イル	2,6-F
CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂	H/H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
NH ₂ CH ₂ CH ₂ NH	H/H	3	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	H

[0074] <代表化合物 B-300>

[化24]



(式中、 $A^B-B^B-D^B-E^B$ 、 R^{24B} 、 R^{25B} 及び T^{0B} は表15～17記載のとおり)

[0075] [表15]

$A^B-B^B-D^B-E^B$	R^{24B}/R^{25B}	T^{0B}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-2-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-5-イル
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-2-イル
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	ピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-4-イル
$NHCH_2CH_2CH_2$	Me/H	チオフェン-2-イル
$NMeCH_2CH_2CH_2$	H/H	チオフェン-3-イル
OCH_2CH_2O	H/H	チオフェン-3-イル
OCH_2CH_2O	H/H	5-ヒドロキシピリジン-3-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	5-メトキシピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	F/H	5-アミノピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/Me	5-クロロピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Pr/H	6-クロロピリジン-3-イル

[0076] [表16]

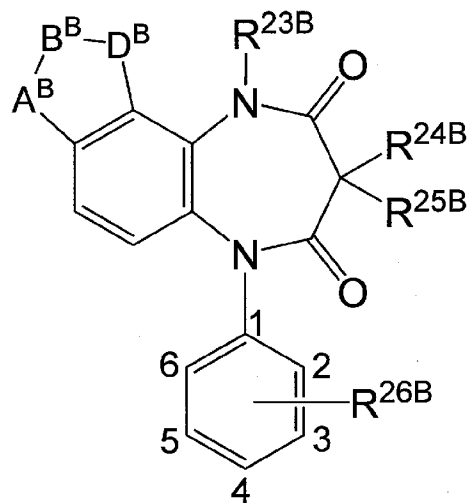
$A^B-B^B-D^B-E^B$	R^{24B}/R^{25B}	T^{0B}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Pr/H	6-クロロピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-6-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-5-イル
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンゾトリアゾール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	1H-インドール-6-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インドール-5-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インドール-4-イル
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	ベンズイソキサゾール-6-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンズイミダゾール-5-イル

[0077] [表17]

$A^B-B^B-D^B-E^B$	R^{24B}/R^{25B}	T^{OB}
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンズイミダゾール-5-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	キノリン-5-イル
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	キノリン-8-イル

[0078] <代表化合物 B-400>

[化25]



(式中、 $A^B-B^B-D^B$ 、 R^{23B} 、 R^{24B} 、 R^{25B} 及び R^{26B} は表18～20記載のとおり)

[0079]

[表18]

$A^B-B^B-D^B$	R^{23B}	R^{24B}/R^{25B}	R^{26B}
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CN
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-OH
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CO ₂ H
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CONH ₂
OCH ₂ O	H	H/H	3,4-OMe
OCH ₂ O	Me	H/H	3,4-OMe
OCH ₂ O	Et	H/H	3-OH,4-F
OCH ₂ O	H	H/H	3-NH ₂
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-NHMe
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-CF ₃
$CH_2CH_2CH_2$	H	H/H	3-NHCH ₂ CF ₃
$CH_2CH_2CH_2$	Me	H/H	2-OH,3-OH
OCH ₂ O	Et	H/H	3,4,5-Me

[0080]

[表19]

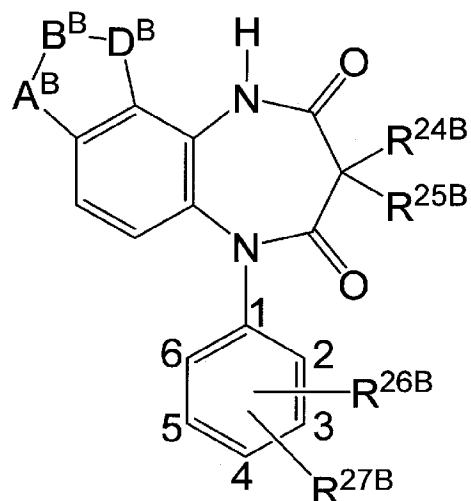
A ^B -B ^B -D ^B	R ^{23B}	R ^{24B} /R ^{25B}	R ^{26B}
OCH ₂ O	H	Me/H	4-OH
OCH ₂ O	H	Me/Me	4-NH ₂
OCH ₂ O	H	Pr/H	4-NO ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	4-CN
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	CF ₃ /H	4-Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	H/H	4-CH ₂ OH
OCH ₂ O	H	H/H	3-CH ₂ OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-Ac
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3,5-OMe
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-OH,4-NH ₂
OCH ₂ O	Me	H/H	3-CH ₂ NH ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	H/H	3-SO ₂ CH ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	3-iPr
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Me/H	3-NMe ₂
OCH ₂ O	H	Me/H	3-Ac
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	Pr/H	3,4-NH ₂

[0081] [表20]

A ^B -B ^B -D ^B	R ^{23B}	R ^{24B} /R ^{25B}	R ^{26B}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	NHMe
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	H/H	3-NHCH ₂ CF ₃
OCH ₂ O	H	H/H	3-NHAc
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	3-SO ₂ Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	4-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H/H	4-iPr
OCH ₂ O	Me	H/H	3-Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	H/H	3-F, 4-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Ac	H/H	3-F, 4-OMe

[0082] <代表化合物 B-500>

[化26]



(式中、 $A^B-B^B-D^B$ 、 R^{24B} 、 R^{25B} 、 R^{26B} 及び R^{27B} は表21～23

記載のとおり。表中の位置は R^{26B} の置換位置を表す。)

[0083] [表21]

$A^B-B^B-D^B$	R^{24B}/R^{25B}	位置	R^{26B}	R^{27B}
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-1-イル	4-F
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル	H
OCH_2O	H/H	3	1,2,3-トリアゾール-5-イル	2-F
OCH_2O	H/H	3	1,2,4-トリアゾール-3-イル	H
OCH_2O	H/H	3	5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル	H
OCH_2O	H/H	4	1H-イミダゾール-1-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	4	1H-イミダゾール-2-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	5-シアノ-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2$	Me/H	3	ピラゾール-3-イル	4-OH

[0084]

[表22]

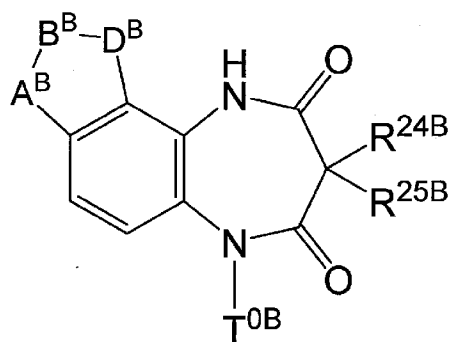
A ^B -B ^B -D ^B	R ^{24B} /R ^{25B}	位置	R ^{26B}	R ^{27B}
OCH ₂ O	Me/Me	3	ピラゾール-4-イル	H
OCH ₂ O	H/H	3	5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	4-NH ₂
OCH ₂ O	CF ₃ /H	3	1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	4-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	ピロール-1-イル	3-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	ピリジン-2-イル	H
OCH ₂ O	H/H	2	1,3-オキサゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	1,3-チアゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	5-クロロ-1H-イミダゾール-2-イル	4-OH
OCH ₂ O	Me/H	4	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	4-NH ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me/H	4	5-アミノ-1H-イミダゾール-2-イル	3-F

[0085] [表23]

A ^B -B ^B -D ^B	R ^{24B} /R ^{25B}	位置	R ^{26B}	R ^{27B}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me/H	3	2-エチル-2H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Pr/H	3	2-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-テトラゾール-5-イル	2,6-F
OCH ₂ O	H/H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	4	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	3	3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル	H

[0086] <代表化合物 B-600>

[化27]



(式中、 $A^B-B^B-D^B$ 、 R^{24B} 、 R^{25B} 及び T^{0B} は表24～26記載のとおり)

[0087] [表24]

$A^B-B^B-D^B$	R^{24B}/R^{25B}	T^{0B}
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリミジン-2-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリミジン-5-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-2-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	キノリン-2-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	キノリン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	ピリジン-3-イル
OCH_2O	H/H	ピリジン-4-イル
OCH_2O	Me/H	チオフェン-2-イル
OCH_2O	H/H	チオフェン-3-イル
OCH_2O	H/H	チオフェン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	5-ヒドロキシピリジン-3-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	5-メトキシピリジン-3-イル
$NHCH_2CH_2$	F/H	5-アミノピリジン-3-イル

[0088] [表25]

$A^B-B^B-D^B$	R^{24B}/R^{25B}	T^{0B}
$CH_2CH_2CH_2$	Me/Me	5-クロロピリジン-3-イル
OCH_2O	Pr/H	6-クロロピリジン-3-イル
OCH_2O	Pr/H	6-クロロピリジン-3-イル
OCH_2O	H/H	1H-インダゾール-6-イル
OCH_2O	H/H	1H-インダゾール-5-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-ベンゾトリアゾール-4-イル
OCH_2O	H/H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H/H	1H-インドール-6-イル

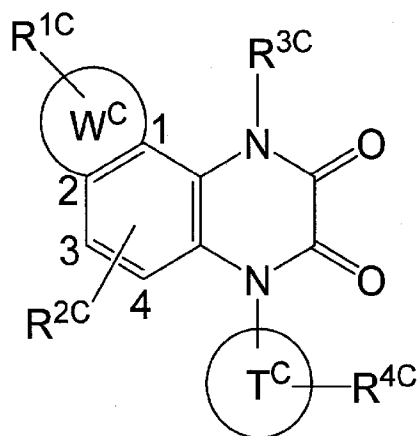
[0089]

[表26]

A ^B -B ^B -D ^B	R ^{24B} /R ^{25B}	T ^{0B}
NHCH ₂ CH ₂	H/H	1H-インドール-5-イル
OCH ₂ O	H/H	1H-インドール-4-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	ベンズイソキサゾール-6-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	1H-ベンズイミダゾール-5-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
OCH ₂ O	H/H	2-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	キノリン-5-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H/H	キノリン-8-イル

[0090] (C-1) 下記の一般式 (CI) :

[化28]



(CI)

(式中、R^{1C}及びR^{2C}は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭

素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3C} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はアラキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）を表し、

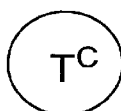
R^{4C} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、アラキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）、ヒドロキシ基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、1～5 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～5 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化29]



はベンゼン環の1と2の位置で縮環し、N、S、及びOから選択されるヘテロ原子を環構成元素として含んでもよい5～8員環を表し、そして

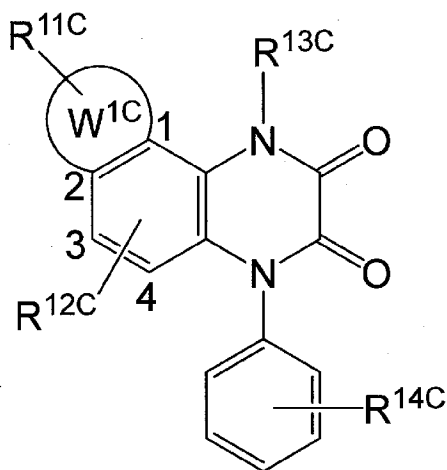
[化30]



はベンゼン環、ナフタレン環、ピリジン環、ピリミジン環、キノリン環、インドール環、インドリン環、ベンズイミダゾール環、インダゾール環、ベンズイソキサゾール環及びベンズトリアゾール環から選択される芳香環を表す。
)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0091] (C-2) 下記の一般式 (C I I) :

[化31]



(CII)

(式中、 R^{11C} 及び R^{12C} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素

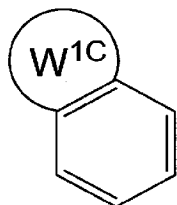
数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{13C} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）を表し、

R^{14C} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、1～5 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～5 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の

炭素数は 1 ～ 8。)、カルバモイル基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルチオ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、そして

[化32]



はナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環を表す。) で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0092] 一般式 (C 1) において、 R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{3C} 及び R^{4C} の炭素数 1 ～ 8 のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{3C} 及び R^{4C} の炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{3C} 、及び R^{4C} の 1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基としては、1 ～ 3 個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は *t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は 2-フルオロエチル基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{3C} 、及び R^{4C} のアラルキル基 (アリアル部分の炭素数が 6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数が 1 ～ 3) としては、ベンジル基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基としては、メトキシ基

、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0093] R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又は*t*-ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブromoエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

R^{4C} の1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基としては、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基等が挙げられる。

[0094] R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。更に置換基（炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン等）を有していてもよいベンゾイルアミノ基が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ基が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基が挙

げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} のアルコシカルボニル基（アルコシ部分の炭素数1～8）としては、メトシカルボニル基、エトシカルボニル基等が挙げられる。

[0095] R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数1～8のアルキルチオ基としては、メチルチオ基が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数1～8のアルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル基が挙げられる。

R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} の炭素数1～8のアルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基が挙げられる。

R^{4C} のヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、ヒドロキシメチル基等が挙げられる。

R^{4C} の置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基としては、置換基として炭素数1～8のアルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、炭素数1～8のアルコシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、ハロゲン原子（例えば、フッ素原子、塩素原子等）及びニトロ基等から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基が挙げられ、好ましくは α -ニトロベンゼンスルホニルアミノ基等が挙げられる。

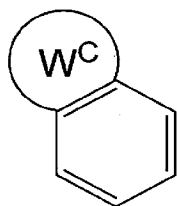
[0096] R^{4C} の置換基を有していてもよいフェニル基において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基等が挙げられる。

R^{4C} の置換基を有していてもよい複素環基において、好ましい複素環基としては、テトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基等が挙げられる。更にオキサジアゾール基が挙げられる。

R^{4C} の置換基を有していてもよい複素環において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチ

ル基等の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基、オキソ等が挙げられる。

[化33]



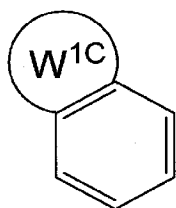
としては、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環等が挙げられる。

上記一般式 (C I) 中の R^{1C} 、 R^{2C} 及び R^{4C} は、 R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{4C} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0097] 上記で挙げた一般式 (C I) の R^{1C} 、 R^{2C} 、 R^{3C} 及び R^{4C} における炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基等の例示は、上記一般式 (C I) の R^{11C} 、 R^{12C} 、 R^{13C} 及び R^{14C} についても同様なものが挙げられる。

[0098] 一般式 (C 1 1) の R^{14C} の置換基を有していてもよい複素環基について、置換基として挙げられる炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基は、上記の一般式 (C 1) の $R^{1C} \sim R^{4C}$ で例示したものが挙げられる。

[化34]



としては、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環等が挙げられる。

また上記一般式 (C 1 1) 中の R^{11C} 、 R^{12C} 及び R^{14C} は、 R^{11C} 、 R^{12C} 、 R^{14C} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0099] 一般式 (C 1) に包含される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(C-1-1) R^{1C} 及び R^{2C} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基又はアミノ基である (C-1) に記載の化合物。

(C-1-2) R^{3C} が水素原子又は炭素数 1 ～ 8 のアルキル基である (C-1) 又は (C-1-1) に記載の化合物。

(C-1-3) R^{4C} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ

基、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基である (C-1) 又は (C-1-1) 若しくは (C-1-2) のいずれかに記載の化合物。

[0100] (C-1-4) R^{4C} が環構成元素として窒素原子を 1～4 個含む 5 又は 6 員環の複素環である (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-3) に記載の化合物。

(C-1-5) R^{4C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択されるものを有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-4) のいずれかに記載の化合物。

(C-1-6) R^{4C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-5) のいずれかに記載の化合物。

(C-1-7) R^{4C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (C-1) 又は (C-1-1

) ないし (C-1-6) のいずれかに記載の化合物。

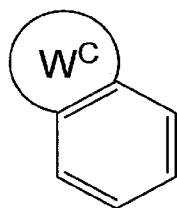
(C-1-8) R^{4C} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-7) のいずれかに記載の化合物。

(C-1-9) R^{4C} がテトラゾールである (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-8) のいずれかに記載の化合物。

(C-1-10) R^{4C} が水素原子、炭素数 1~8 のアルキル基、炭素数 1~8 のアルコキシ基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1~8 のアルキルアミノ基、炭素数 2~8 のジアルキルアミノ基、又は置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、炭素数 1~8 のアルコキシ基、ハロゲン原子及びニトロ基から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基である (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-9) のいずれかに記載の化合物。

[0101] (C-1-11)

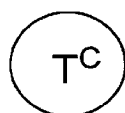
[化35]



が、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環である (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-10) のいずれかに記載の化合物。

(C-1-12)

[化36]



がベンゼン環又はインドール環である (C-1) 又は (C-1-1) ないし (C-1-1-1) のいずれかに記載の化合物。

[0102] 一般式 (C-1) に包含される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(C-2-1) R^{11C} 及び R^{12C} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基又はアミノ基である (C-2) に記載の化合物。

(C-2-2) R^{13C} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基である (C-2) 又は (C-2-1) に記載の化合物。

(C-2-3) R^{14C} が水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいベンゼンスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいフェニル基、又は置換基を有してもよい複素環基である (C-2) 又は (C-2-1) 若しくは (C-2-2) に記載の化合物。

[0103] (C-2-4) R^{14C} が環構成元素として窒素原子を 1～4 個含む 5 又は 6 員環の複素環である (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-3) に記載の化合物。

(C-2-5) R^{14C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭

素数 1～8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択されるものを有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-4) のいずれかに記載の化合物。

(C-2-6) R^{14C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-5) のいずれかに記載の化合物。

(C-2-7) R^{14C} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-6) のいずれかに記載の化合物。

(C-2-8) R^{14C} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-7) のいずれかに記載の化合物。

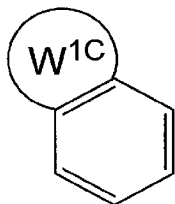
(C-2-9) R^{14C} がテトラゾールである (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-8) のいずれかに記載の化合物。

(C-2-10) R^{14C} が水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、又は置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子及びニトロ基から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基である (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-9) のいずれ

かに記載の化合物。

[0104] (C-2-11)

[化37]



が、ナフタレン環である (C-2) 又は (C-2-1) ないし (C-2-10) のいずれかに記載の化合物。

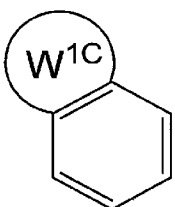
[0105] さらに以下の化合物が挙げられる。

(C-2-12) R^{11C} 及び R^{12C} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基又はアミノ基である (C-2) に記載の化合物。

(C-2-13) R^{13C} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基である (C-2) 又は (C-2-12) に記載の化合物。

(C-2-14)

[化38]



が、ナフタレン環である (C-2) 又は (C-2-12) 若しくは (C-2-13) のいずれかに記載の化合物。

(C-2-15) R^{14C} が $NHSO_2R^C$ (ここで、 R^C は置換基を有していてもよいアリール基又は複素環基を表す。) である (C-2) 又は (C-2

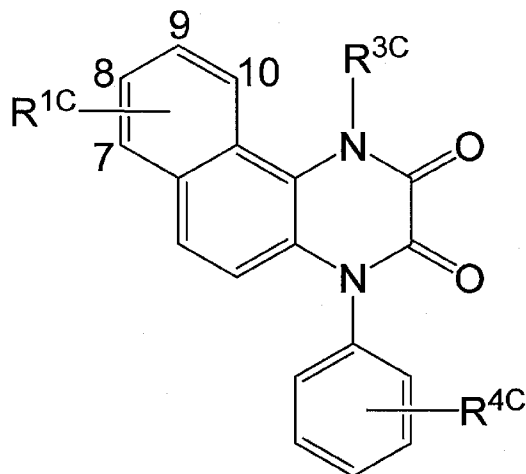
－ 1 2) ないし (C － 2 － 1 4) のいずれかに記載の化合物。

(C － 2 － 1 6) R^C が炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基、アミノ基、ニトロ、ハロゲンから選択される置換基を有していてもよいフェニル、ナフチル、キノリル、ピリジル又はチエニルである (C － 2 － 1 5) に記載の化合物。

[0106] 一般式 (C 1) に包含される代表的化合物を以下に示す。

< 代表化合物 C － 1 0 0 >

[化39]



(式中、 R^{1C} 、 R^{3C} 及び R^{4C} は表 2 7 ～ 2 9 記載のとおり)

[0107]

[表27]

R ^{1c}	R ^{3c}	R ^{4c}
H	H	3-OH
H	H	3-OMe
H	H	4-OH
H	H	4-OMe
H	H	2-OH
H	H	2-OMe
H	H	2,3-OH
H	H	3-OH,4-F
H	H	3,4-OH
H	H	3,4-OMe
H	H	3,4,5-OMe
H	H	3-CN

[0108]

[表28]

R ^{1C}	R ^{3C}	R ^{4C}
H	H	4-CN
H	H	3-CO ₂ H
H	H	3-CO ₂ Me
H	H	3-Br
H	H	3-F
H	H	4-Me
H	H	3-NH ₂
H	H	3-NHSO ₂ Ph
H	H	3-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
H	H	4-NHSO ₂ Ph
H	Me	4-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
H	Et	3-NHEt
H	H	3-CH ₂ OH
H	H	4-CH ₂ OH

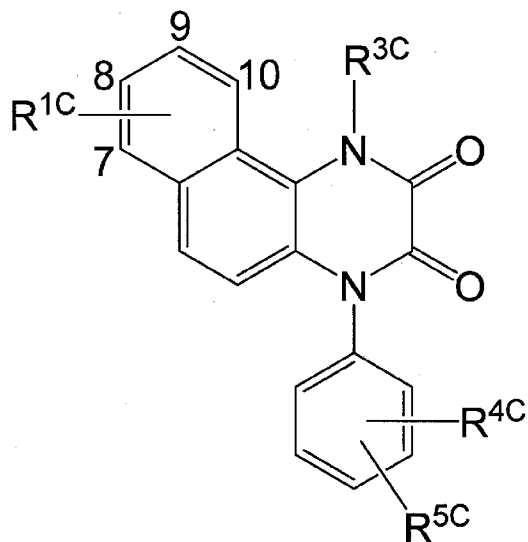
[0109]

[表29]

R^{1C}	R^{3C}	R^{4C}
H	H	3- CF_3
H	H	3-Ph
H	H	3-N(Me) ₂
H	H	3,5-OH
H	H	4-OAc
H	H	2-Me
9-Me	H	3-NH ₂
9-Cl	H	3-NH ₂
8-Me	H	3-NH ₂
8-Cl	H	3-NH ₂

[0110] <代表化合物C-200>

[化40]



(式中、 R^{1C} 、 R^{3C} 、 R^{4C} 及び R^{5C} は、表30～32記載のとおり。表中の R^{4C} の位置は R^{4C} の置換位置を表す。)

[0111]

[表30]

R ^{1C}	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
H	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
8-Me	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
8-Cl	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-F
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-Me
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	5-Br
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Me
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Cl
H	H	3	(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	(5-シアノ-1H-1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H

[0112] [表31]

R ^{1C}	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-OH
H	H	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	Me	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	Et	3	(2-エチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	H	3	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H
H	H	3	4-メチル-(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル	H
H	H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
H	H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
H	H	3	ピロール-2-イル	H
H	H	3	チオフェン-2-イル	H
H	H	3	1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	1H-イミダゾール-4-イル	H

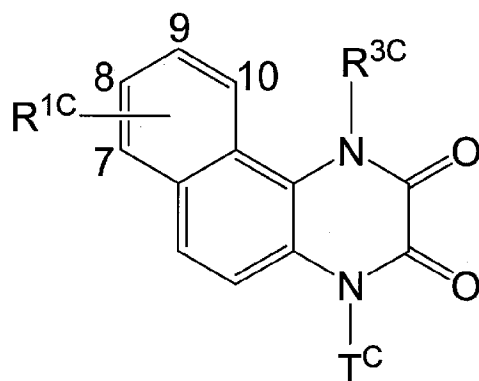
[0113]

[表32]

R ^{1C}	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
H	H	3	ピラゾール-4-イル	H
H	H	3	5-(クロロ)-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	(1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
H	H	3	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H
H	H	3	3-メチル-(1,2,4-オキサジアゾール)-5-イル	H
H	H	3	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
H	H	3	1-テトラゾール-1-イル	H
H	H	3	フェニル	H
H	H	3	ピリジン-3-イル	H
H	H	3	ピリミジン-5-イル	H
H	H	3	2-アミノピリジン-5-イル	H

[0114] <代表化合物C-300>

[化41]

(式中、R^{1C}、R^{3C}及びT^Cは表33及び34記載のとおり)

[0115]

[表33]

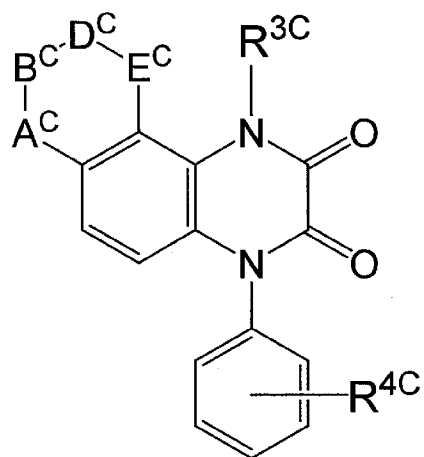
R ^{1c}	R ^{3c}	T ^c
H	H	1H-インドール-6-イル
H	H	1H-インドリン-6-イル
H	H	1H-インドール-4-イル
H	H	1H-インダゾール-6-イル
H	Me	1H-インダゾール-6-イル
H	Et	1H-インダゾール-6-イル
8-Me	H	1H-インダゾール-6-イル
8-Cl	H	1H-インダゾール-6-イル
H	H	1H-インダゾール-4-イル
H	H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
H	H	2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンズイミダゾール-6-イル
H	H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル

[0116] [表34]

R ^{1c}	R ^{3c}	T ^c
H	H	3-メチルベンゾイソキサゾール-6-イル
H	H	ピリジン-4-イル
H	H	3-メトキシピリジン-5-イル
H	H	3-ヒドロキシピリジン-5-イル
H	H	ピリジン-3-イル
H	H	7-ヒドロキシキノリン-3-イル
H	H	ピリミジン-2-イル
H	H	チオフェン-2-イル
H	H	ピリジン-2-イル
H	H	4-メチルピリジン-2-イル
H	H	2-プロモピリジン-5-イル

[0117] <代表化合物C-400>

[化42]



(式中、 $A^C-B^C-D^C-E^C$ 、 R^{3C} 及び R^{4C} は表35～37記載のとおり

)

[0118] [表35]

$A^C-B^C-D^C-E^C$	R^{3C}	R^{4C}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-OMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	4-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	4-OMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	2-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	2-OMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	2,3-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-OH,4-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3,4-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3,4-OMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3,4,5-OMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-CN

[0119]

[表36]

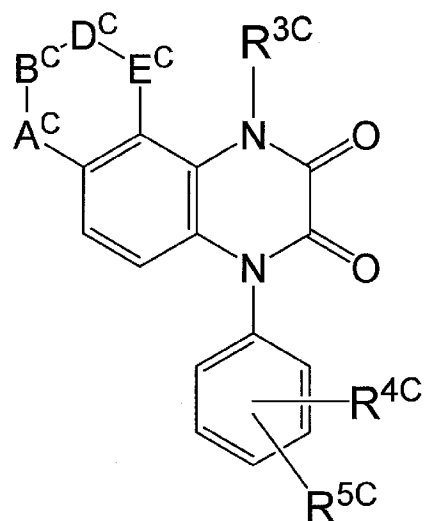
A ^C -B ^C -D ^C -E ^C	R ^{3C}	R ^{4C}
CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	H	4-CN
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-CO ₂ H
CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	H	3-CO ₂ Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-Br
CH ₂ CH ₂ NHCH ₂	H	3-F
CH ₂ CH ₂ OCH ₂	H	4-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-NH ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-NHSO ₂ Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-NHSO ₂ Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	4-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	3-NHEt

[0120] [表37]

A ^C -B ^C -D ^C -E ^C	R ^{3C}	R ^{4C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-CH ₂ OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-NHSO ₂ CH ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-N(Me) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3,5-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-OAc
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	2-Me
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	3-NH ₂

[0121] <代表化合物 C-500>

[化43]



(式中、 $A^C-B^C-D^C-E^C$ 、 R^{3C} 、 R^{4C} 及び R^{5C} は表38～40記載のとおり。表中の R^{4C} の位置は R^{4C} の置換位置を表す。)

[0122] [表38]

$A^C-B^C-D^C-E^C$	R^{3C}	R^{4C} の位置	R^{4C}	R^{5C}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2NHCH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2OCH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-Me
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	5-Br
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Me
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Cl
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3	(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	4	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H

[0123]

[表39]

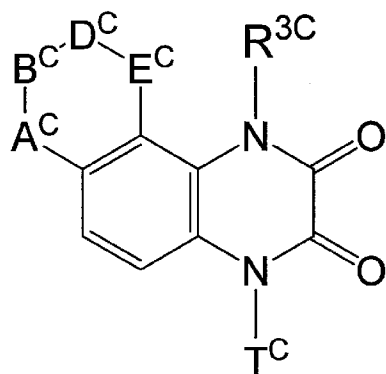
A ^C -B ^C -D ^C -E ^C	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(5-シアノー-1H-1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	3	(2-エチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	H	3	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	4-メチル-(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	ピロール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	チオフェン-2-イル	H

[0124] [表40]

A ^C -B ^C -D ^C -E ^C	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-イミダゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	ピラゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	5-(クロロ)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	3-メチル-(1,2,4-オキサジアゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-テトラゾール-1-イル	H
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	3	フェニル	H
CH ₂ CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	3	ピリミジン-5-イル	H

[0125] <代表化合物C-600>

[化44]



(式中、 $A^C-B^C-D^C-E^C$ 、 R^{3C} 及び T^C は表41及び42記載のとおり)

[0126] [表41]

$A^C-B^C-D^C-E^C$	R^{3C}	T^C
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インドール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インドリン-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インドール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me	1H-インダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Et	1H-インダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	2-(トリフルオロメチル)-1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-メチルベンゾイソキサゾール-6-イル

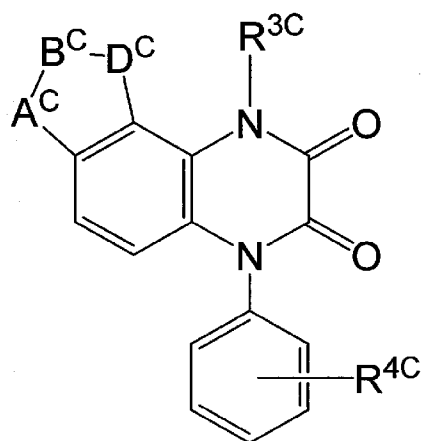
[0127]

[表42]

A ^C -B ^C -D ^C -E ^C	R ^{3C}	T ^C
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	ピリジン-4-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-メトキシピリジン-5-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-ヒドロキシピリジン-5-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	ピリジン-3-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	7-ヒドロキシキノリン-3-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	ピリミジン-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	チオフェン-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	ピリジン-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-メチルピリジン-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	2-ブロモピリジン-5-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	1H-インドール-6-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	1H-インドール-5-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	1H-インドール-4-イル

[0128] <代表化合物C-700>

[化45]

(式中、A^C-B^C-D^C、R^{3C}及びR^{4C}は表43～45記載のとおり)

[0129]

[表43]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	R ^{4C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-OMe
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-OMe
OCH ₂ O	H	2,3-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3,4-OH
NHCH ₂ CH ₂	H	3,4,5-OMe
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-CN

[0130] [表44]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	R ^{4C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-CO ₂ H
OCH ₂ O	H	3-Br
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-Me
CH ₂ NHCH ₂	H	3-NHSO ₂ Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4-NHSO ₂ Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	4-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	3-NHEt

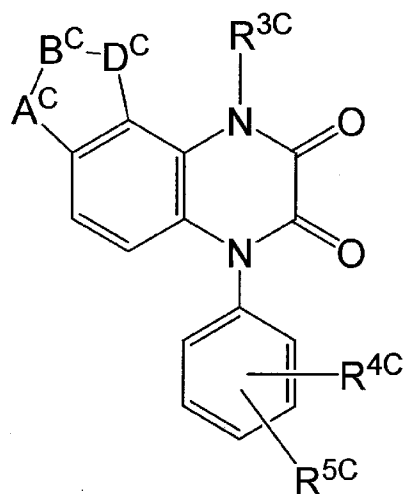
[0131]

[表45]

$A^C-B^C-D^C$	R^{3C}	R^{4C}
$CH_2CH_2CH_2$	H	3-NHSO ₂ CH ₃
$CH_2CH_2CH_2$	H	3-Ph
$CH_2CH_2CH_2$	H	3-N(Me) ₂
CH_2CH_2NH	H	2-Me
$CH_2CH(Me)CH_2$	H	3-NH ₂
$CH_2CH(Me)CH_2$	H	4-NH ₂

[0132] <代表化合物C-800>

[化46]



(式中、 $A^C-B^C-D^C$ 、 R^{3C} 、 R^{4C} 及び R^{5C} は表46～48記載のとおり。表中の R^{4C} の位置は R^{4C} の置換位置を表す。)

[0133]

[表46]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
OCH ₂ O	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	5-Br
CH ₂ NHCH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H

[0134] [表47]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	3	(2-エチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	4-メチル-(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	チオフエン-2-イル	H

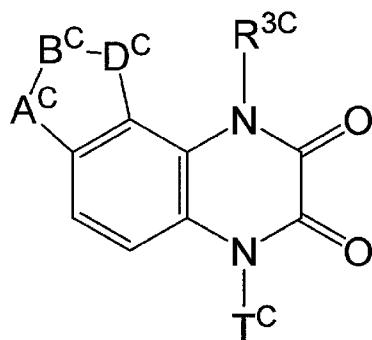
[0135]

[表48]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	R ^{4C} の位置	R ^{4C}	R ^{5C}
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-イミダゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	ピラゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	5-(クロロ)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-テトラゾール-1-イル	H
OCH ₂ O	H	3	フェニル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	ピリジン-3-イル	H
NHCH ₂ CH ₂	H	3	ピリミジン-5-イル	H

[0136] <代表化合物C-900>

[化47]

(式中、A^C-B^C-D^C、R^{3C}及びT^Cは表49及び表50記載のとおり)

[0137] [表49]

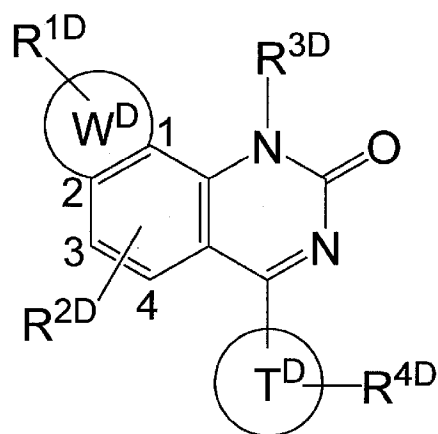
A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	T ^C
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1H-インドール-6-イル
OCH ₂ O	H	1H-インドリン-6-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	1H-インダゾール-6-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	1H-インダゾール-6-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1H-インダゾール-4-イル
CH ₂ NHCH ₂	H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3-メチルベンゾイソキサゾール-6-イル

[0138] [表50]

A ^C -B ^C -D ^C	R ^{3C}	T ^C
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	ピリジン-4-イル
CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	チオフェン-2-イル
CH ₂ NHCH ₂	H	4-メチルピリジン-2-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	1H-インドール-6-イル

[0139] (D-1) 下記の一般式 (DI) :

[化48]



(DI)

(式中、 R^{1D} 及び R^{2D} は同一又は異なっていてもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリール部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコ

キシ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3D} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）を表し、

R^{4D} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化49]



はベンゼン環の1と2の位置で縮環し、1又は2個の窒素原子を環構成元素

として含んでいてもよい5～8員環を表し、そして

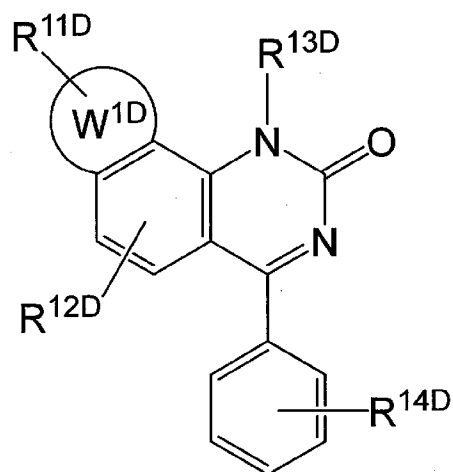
[化50]



はベンゼン環、ナフタレン環、ピリジン環、ピリミジン環、キノリン環、インドール環、インドリン環、ベンズイミダゾール環、ピラゾール環、インダゾール環、ベンズイソキサゾール環及びベンゾトリアゾール環から選択される芳香環を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0140] (D-2) 下記の一般式 (D I I) :

[化51]



(DII)

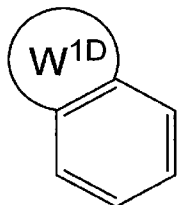
(式中、 R^{11D} 及び R^{12D} は同一又は異なっていてもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基(アリール部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3)、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基

、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{13D} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はアラキル基（アリール部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）を表し、

R^{14D} は炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、アラキル基（アリール部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）、ヒドロキシ基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、1～5 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～5 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、そして、

[化52]



はナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0141] 一般式 (D 1) において、 R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{3D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{3D} 及び R^{4D} の炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{3D} 、及び R^{4D} の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は*t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{3D} 、及び R^{4D} のアラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）としては、ベンジル基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0142] R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8

のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又は t -ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブromoエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

R^{4D} の1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基としては、2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ基等が挙げられる。

[0143] R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} のアルコシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数1～8）としては、メトシカルボニル基、エトシカルボニル基等が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキルチオ基としては、メチルチオ基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキルスルフィニル基としては、

メチルスルフィニル基が挙げられる。

R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} の炭素数1～8のアルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基が挙げられる。

R^{4D} のヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、ヒドロキシメチル基等が挙げられる。

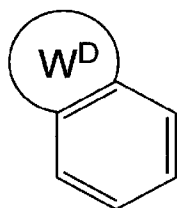
[0144] R^{4D} の置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基としては、置換基として炭素数1～8のアルキル基（例えば、メチル基、エチル基等）、炭素数1～8のアルコキシ基（例えば、メトキシ基、エトキシ基等）、ハロゲン原子（例えば、フッ素原子、塩素原子等）及びニトロ基等から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基が挙げられ、好ましくは α -ニトロベンゼンスルホニルアミノ基等が挙げられる。

R^{4D} の置換基を有していてもよいフェニル基において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基等が挙げられる。

R^{4D} の置換基を有していてもよい複素環基において、好ましい複素環基としては、テトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基等が挙げられる。

R^{4D} の置換基を有していてもよい複素環において、好ましい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基、オキソ等が挙げられる。

[化53]



としては、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環等が挙

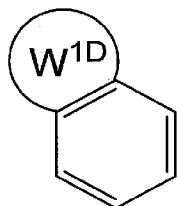
げられる。

一般式 (D I) 中の R^{1D} 、 R^{2D} 及び R^{4D} は、 R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{4D} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0145] 上記で挙げた一般式 (D I) の R^{1D} 、 R^{2D} 、 R^{3D} 及び R^{4D} における炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が 6～10 で、アルキレン部分の炭素数が 1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、1～5 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～5 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。））、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基等の例示は、上記一般式 (D I I) の R^{11D} 、 R^{12D} 、 R^{13D} 及び R^{14D} についても同様なものが挙げられる。

[0146] 一般式 (D I I) の R^{14D} の置換基を有していてもよい複素環基について、置換基として挙げられる炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基は、上記の一般式 (D I) の R^{1D} ～ R^{4D} で例示したものが挙げられる。

[化54]



としては、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環等が挙げられる。

上記一般式 (D 1 1) 中の R^{11D} 、 R^{12D} 及び R^{14D} は、 R^{11D} 、 R^{12D} 、 R^{14D} が置換している環に、同一又は異なったものが複数個存在していてもよい。

[0147] 一般式 (D 1) で表される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(D-1-1) R^{1D} 及び R^{2D} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基又はアミノ基である (D-1) に記載の化合物。

(D-1-2) R^{3D} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基である (D-1) 又は (D-1-1) に記載の化合物。

(D-1-3) R^{4D} が水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基である (D-1) 又は (D-1-1) 若しくは (D-1-2) のいずれかに記載の化合物。

[0148] (D-1-4) R^{4D} が環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環である(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-3)に記載の化合物。

(D-1-5) R^{4D} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択されるものを有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-4)のいずれかに記載の化合物。

(D-1-6) R^{4D} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-7)のいずれかに記載の化合物。

(D-1-7) R^{4D} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は1, 2, 3-トリアゾールである(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-6)のいずれかに記載の化合物。

(D-1-8) R^{4D} が5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-7)のいずれかに記載の化合物。

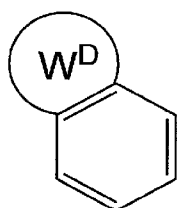
(D-1-9) R^{4D} がテトラゾールである(D-1)又は(D-1-1)ないし(D-1-8)のいずれかに記載の化合物。

(D-1-10) R^{4D} が炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲ

ン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、又は置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子及びニトロ基から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基である (D-1) 又は (D-1-1) ないし (D-1-9) のいずれかに記載の化合物。

[0149] (D-1-11)

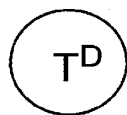
[化55]



が、ナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環である (D-1) 又は (D-1-1) ないし (D-1-10) のいずれかに記載の化合物。

(D-1-12)

[化56]



がベンゼン環又はインドール環である (D-1) 又は (D-1-1) ないし (D-1-11) のいずれかに記載の化合物。

[0150] 一般式 (D-1) で表される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(D-2-1) R^{11D} 及び R^{12D} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル

基、ニトロ基、シアノ基又はアミノ基である (D-2) に記載の化合物。

(D-2-2) R^{13D} が水素原子である (D-2) 又は (D-2-1) に記載の化合物。

(D-2-3) R^{14D} が炭素数 1~8 のアルコキシ基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1~8 のアルキルアミノ基、炭素数 2~8 のジアルキルアミノ基、炭素数 1~8 のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基である (D-2) 又は (D-2-1) 若しくは (D-2-2) のいずれかに記載の化合物。

[0151] (D-2-4) R^{14D} が環構成元素として窒素原子を 1~4 個含む 5 又は 6 員環の複素環である (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-3) に記載の化合物。

(D-2-5) R^{14D} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、炭素数 1~8 のアルコキシ基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1~8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2~8 のジアルキルアミノ基から選択されるものを有していてもよいテトラゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基又はチアゾリル基である (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-4) のいずれかに記載の化合物。

(D-2-6) R^{14D} が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (D-2) 又は (

D-2-1) ないし (D-2-5) のいずれかに記載の化合物。

(D-2-7) R^{14D} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-6) のいずれかに記載の化合物。

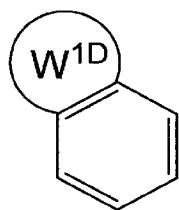
(D-2-8) R^{14D} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-7) のいずれかに記載の化合物。

(D-2-9) R^{14D} がテトラゾールである (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-8) のいずれかに記載の化合物。

(D-2-10) R^{14D} が炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 個のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ヒドロキシル基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、又は置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子及びニトロ基から選択されるものを有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基である (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-9) のいずれかに記載の化合物。

(D-2-11)

[化57]

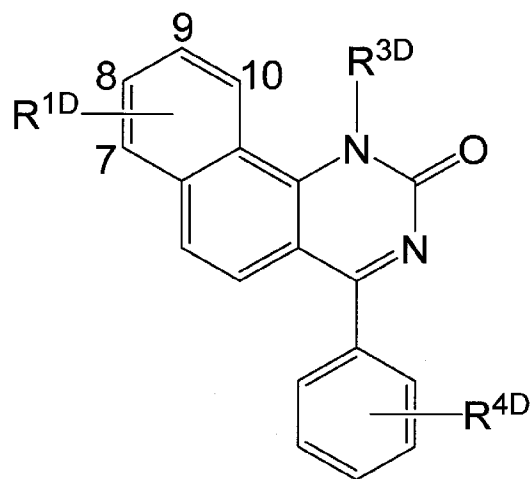


が、ナフタレン環である (D-2) 又は (D-2-1) ないし (D-2-10) のいずれかに記載の化合物。

[0152] 一般式 (D1) に包含される代表的化合物を以下に示す。

<代表化合物D-100>

[化58]



(式中、R^{1D}、R^{3D}及びR^{4D}は表51記載のとおり)

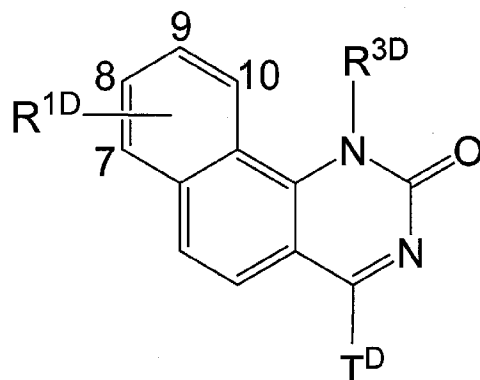
[0153]

[表51]

R ^{1D}	R ^{3D}	R ^{4D}
H	H	3-OH
8-Me	H	3-OMe
8-Cl	H	4-OH
9-Me	H	3,4-OH
9-Cl	H	3-CN
H	H	4-CN
H	H	3-CO ₂ H
H	H	3-NH ₂
H	H	3-NHMe
H	Me	3-NHMe
H	Et	3-NHEt
H	H	3-NHCH ₂ CF ₃
H	H	3-NHSO ₂ Ph
H	H	3-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
H	H	1H-テトラゾール-5-イル
H	H	1H-テトラゾール-1-イル
H	H	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル
H	H	1,3-オキサゾール-2-イル
H	H	1-Hイミダゾール-2-イル
H	H	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル

[0154] <代表化合物D-200>

[化59]

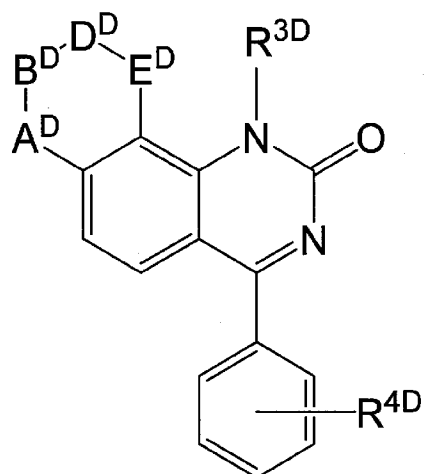
(式中、 R^{1D} 、 R^{3D} 及び T^D は表52記載のとおり)

[0155] [表52]

R^{1D}	R^{3D}	T^D
H	H	1H-インドール-6-イル
8-Me	H	1H-インドール-4-イル
8-Cl	H	1H-インダゾール-6-イル
9-Me	H	1H-インダゾール-4-イル
9-Cl	H	1H-インドリン-6-イル
H	Me	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
H	Et	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
H	H	3-メチルベンズイソキサゾール-6-イル
H	H	ピリジン-3-イル
H	H	1H-ピラゾール-4-イル
H	H	ピリジン-2-イル
H	H	4-メチルピリジン-2-イル
H	H	2-プロモピリジン-5-イル

[0156] <代表化合物D-300>

[化60]



(式中、A^D-B^D-D^D-E^D、R^{3D}及びR^{4D}は表53記載のとおり)

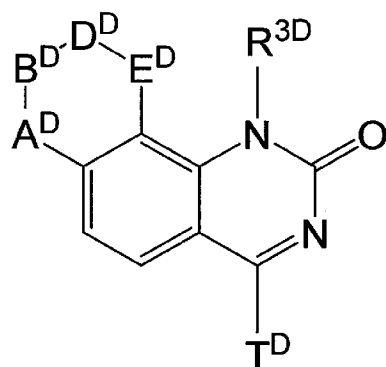
[0157]

[表53]

$A^D-B^D-D^D-E^D$	R^{3D}	R^{4D}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-OH
$CH_2CH_2CH_2$	H	3-OMe
$CH_2CH_2(CH_2)_2CH_2$	H	4-OH
$CH_2CH_2(CH_2)_3CH_2$	H	3,4-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-CN
$CH_2CH_2NHCH_2$	H	4-CN
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-CO ₂ H
$CH_2CH_2NHCH_2$	H	3-NH ₂
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-NHMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me	3-NHMe
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Et	3-NHEt
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-NHCH ₂ CF ₃
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-NHSO ₂ Ph
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-NHSO ₂ (2-NO ₂)Ph
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-テトラゾール-5-イル
$CH_2NHCH_2CH_2$	H	1H-テトラゾール-1-イル
$CH_2CH(Me)CH_2CH_2$	H	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル
$CH_2CH(Me)CH_2CH_2$	H	1,3-オキサゾール-2-イル
$CH_2CH_2CH(Me)CH_2$	H	1H-イミダゾール-2-イル
$CH_2CH_2CH(Me)CH_2$	H	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル

[0158] <代表化合物 D-400>

[化61]

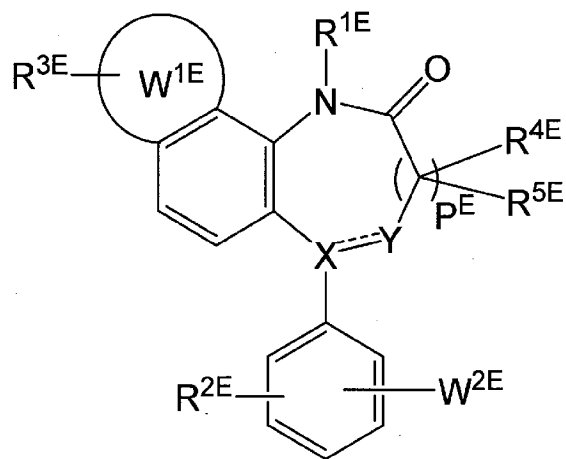
(式中、 $A^D-B^D-D^D-E^D$ 、 R^{3D} 及び T^D は表54記載のとおり)

[0159] [表54]

$A^D-B^D-D^D-E^D$	R^{3D}	T^D
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インドール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2$	H	1H-インドール-4-イル
$CH_2CH_2(CH_2)_2CH_2$	H	1H-インダゾール-6-イル
$CH_2CH_2(CH_2)_3CH_2$	H	1H-インダゾール-4-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me	1H-インドリン-6-イル
$CH_2NHCH_2CH_2$	Et	1H-ベンズイミダゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	1H-ベンゾトリアゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	3-メチルベンズイソキサゾール-6-イル
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H	ピリジン-3-イル
$CH_2N(Me)CH_2CH_2$	H	1H-ピラゾール-4-イル
$CH_2CH(Me)CH_2CH_2$	H	ピリジン-2-イル
$CH_2CH_2CH(Me)CH_2$	H	4-メチルピリジン-2-イル
$CH_2CH_2CH(Me)CH_2$	H	2-ブロモピリジン-5-イル

[0160] (E-1) 下記の一般式(E1) :

[化62]



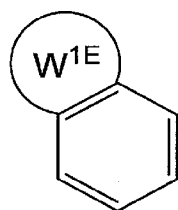
(EI)

(式中、 R^{1E} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{2E} 及び R^{3E} は同一又は異なっているもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{4E} 及び R^{5E} は同一又は異なっているもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

[化63]



はナフタレン又はテトラヒドロナフタレンを表し、

W^{2E} は置換基を有していてもよい複素環を表し、

X^E がNのとき、 Y^E はC=Oで、かつ実線と破線からなる二重線は単結合を表し、

X^E がCのとき、 Y^E はNで、かつ実線と破線からなる二重線は二重結合を表し、

そして、 P^E は、0又は1を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0161] 一般式(E1)において、 R^{1E} 、 R^{2E} 、 R^{3E} 、 R^{4E} 及び R^{5E} の炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

R^{1E} の炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

R^{1E} 、 R^{2E} 、 R^{3E} 、 R^{4E} 及び R^{5E} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又はt-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

R^{1E} 、 R^{4E} 及び R^{5E} のフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基としては、ベンジル基等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキ

シ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、i-ブトキシ基、t-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0162] R^{2E} 及び R^{3E} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又はt-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} のハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基としては、トリフルオロメチルカルボニルアミノ基が挙げられる。

[0163] R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基としては、メチルスルホニルアミノ基が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基が挙げられる。

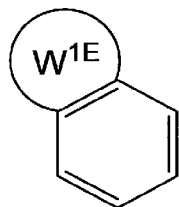
R^{2E} 及び R^{3E} のアルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数1～8）としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルキルチオ基としては、メチルチオ基が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル基が挙げられる。

R^{2E} 及び R^{3E} の炭素数1～8のアルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル基が挙げられる。

[0164] [化64]



としては、ナフタレン又はテトラヒドロナフタレンが挙げられる。

W^{2E} の置換基を有していてもよい複素環としては、環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環を表す。

W^{2E} の置換基を有していてもよい複素環としては、テトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール、イミダゾール、オキサゾール、イソキサゾール、ピロール、チアゾール、ピリジン、ピロリジンが挙げられる。

W^{2E} の置換基を有していてもよい複素環が有していてもよい置換基としては、メチル基、エチル基等の炭素数1～8のアルキル基、トリフルオロメチル基等の1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、フッ素原子等のハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基等が挙げられる。

一般式(E1)中の R^{2E} 及び R^{3E} は、 R^{2E} 、 R^{3E} が置換している環に、同一又は異なったものが1～3個存在していてもよい。

[0165] 一般式(E1)の化合物としては以下に示す化合物が好ましい。

(E-1-1) W^{2E} が環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環である(E-1)に記載の化合物。

(E-1-2) W^{2E} が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-

オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールである (E-1) 又は (E-1-1) に記載の化合物。

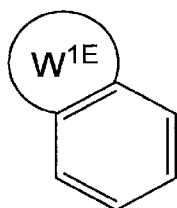
(E-1-3) W^{2E} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールである (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-2) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-4) W^{2E} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールである (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-3) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-5) W^{2E} がテトラゾールである (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-4) のいずれかに記載の化合物。

[0166] (E-1-6)

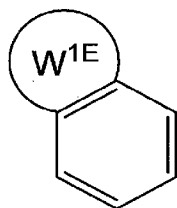
[化65]



がナフタレン又はテトラヒドロナフタレンである (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-5) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-7)

[化66]



がナフタレンである (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-6) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-8) R^{1E} が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-7)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-9) R^{1E} が水素原子である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-8)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-10) R^{4E} が水素原子で、 R^{5E} が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-9)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-11) R^{4E} 及び R^{5E} が共に水素原子である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-10)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-12) R^{2E} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基(アルコキシ部分の炭素数は1～8。)である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-11)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-13) R^{2E} が水素原子である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-12)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-14) R^{3E} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基(アルコキシ部分の炭素数は1～8。)である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-13)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-15) R^{3E} が水素原子である(E-1)又は(E-1-1)ないし(E-1-14)のいずれかに記載の化合物。

(E-1-16) X^E がNで、 Y^E がC=Oで、実線と破線からなる二重線が

、単結合である (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-15) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-17) X^E が C で、 Y^E が N で、実線と破線からなる二重線が、二重結合である (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-15) のいずれかに記載の化合物。

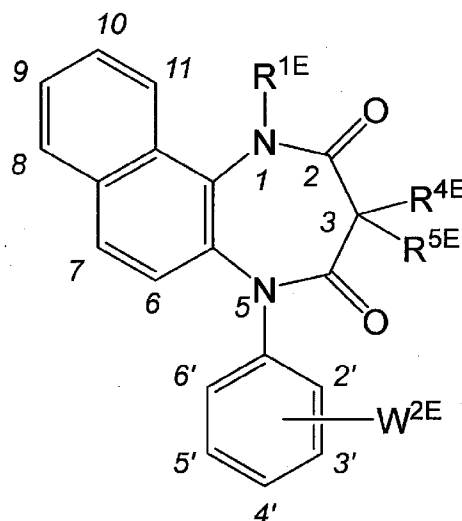
(E-1-18) P^E が 0 又は 1 である (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-17) のいずれかに記載の化合物。

(E-1-19) P^E が 1 である (E-1) 又は (E-1-1) ないし (E-1-18) のいずれかに記載の化合物。

[0167] <代表化合物 E-100>

一般式 (E1) に包含される代表的化合物を以下に示す。

[化67]



(式中、 R^{1E} 、 R^{4E} 、 R^{5E} 及び W^{2E} 並びに W^{2E} の置換位置は表 55～57 に記載のとおり)

表 55～57 において、 W^{2E} の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の 2 位、3 位及び 4 位は、代表化合物 E-100 の式中の 2' 位、3' 位及び 4' 位にそれぞれ対応する。

[0168]

[表55]

R ^{1E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	2-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H/H
H	4-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	Me/H
Bn	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-1-イル	H/H
H	3-	1H-テトラゾール-1-イル	Me/Me
H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	H/H
H	3-	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H/H
H	4-	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H/H

[0169] [表56]

R ^{1E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	2-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-	[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール]-3-イル	H/H
H	3-	[5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-トリアゾール]-3-イル	Et/H
H	3-	[5-フルオロ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	H/H
H	3-	[5-フルオロ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	Me/Me
H	3-	[5-シアノ-1,2,3-トリアゾール]-4-イル	H/H
H	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	4-	1H-イミダゾール-1-イル	Pr/H
H	3-	1H-イミダゾール-2-イル	H/H
H	3-	1H-イミダゾール-4-イル	H/H
H	3-	イミダゾリン-2-イル	H/H

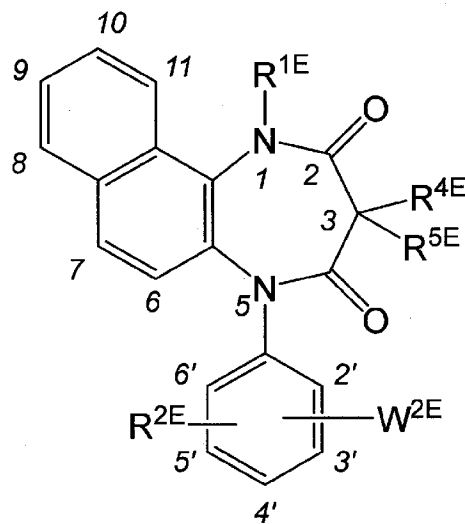
[0170]

[表57]

R ^{1E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	2-	ピラゾール-3-イル	H/H
H	3-	ピラゾール-4-イル	H/H
H	3-	ピラゾール-5-イル	Me/H
H	3-	(1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H/H
H	3-	(1,3,4-オキサジアゾール)-2-イル	H/H
H	3-	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H/H
H	3-	ピロール-1-イル	H/H
H	4-	ピロリジン-2-イル	H/H
Me	4-	ピロリジン-2-イル	Me/H
H	4-	(1,3-オキサゾール)-5-イル	H/H
H	3-	(1,3-オキサゾール)-5-イル	H/H
H	2-	(1,3-チアゾール)-5-イル	H/H

[0171] <代表化合物 E-200>

[化68]



(式中、R^{1E}、R^{2E}、R^{4E}、R^{5E}及びW^{2E}並びにW^{2E}の置換位置は表58及び59に記載のとおり)

表58及び59において、W^{2E}の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の2位、3位及び4位は、代表化合物E-200の式中の2'位、3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0172] [表58]

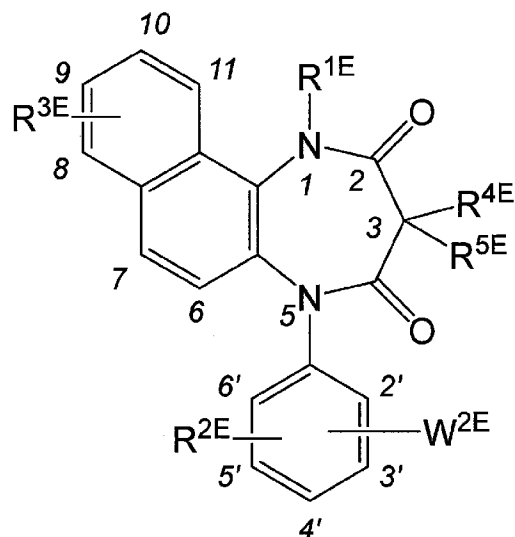
R ^{1E}	R ^{2E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	4-OH	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-OMe	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
Me	2-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	2,6-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-F	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H
H	4-Br	3-	1H-テトラゾール-5-イル	Et/H
H	3-OMe	4-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H/H
H	4-Me	3-	1H-テトラゾール-5-イル	H/H

[0173] [表59]

R ^{1E}	R ^{2E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	4-Cl	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	Me/H
H	4-CF ₃	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	H/H
H	3-SMe	4-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	H/H
H	3-SO ₂ Me	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	3-NHSO ₂ Me	4-	1H-イミダゾール-1-イル	H/H
H	4-OMe	3-	1H-イミダゾール-4-イル	H/H
H	4-F	2-	ピラゾール-3-イル	H/H

[0174] <代表化合物 E-300>

[化69]



(式中、 R^{1E} 、 R^{2E} 、 R^{3E} 、 R^{4E} 、 R^{5E} 及び W^{2E} 並びに W^{2E} の置換位置は表60及び61に記載のとおり)

表60及び61において、 W^{2E} の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の3位及び4位は、代表化合物E-300の式中の3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0175] [表60]

R^{1E}	R^{2E}	W^{2E} の置換位置	W^{2E}	R^{3E}	R^{4E}/R^{5E}
H	H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Br	H/H
H	4-OMe	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Cl	H/H
H	4-OH	3-	1H-テトラゾール-5-イル	10-OMe	H/H
H	2-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Br	H/H
H	2,6-Cl	3-	1H-テトラゾール-5-イル	9-Me	H/H
H	H	3-	1H-テトラゾール-5-イル	10-Cl	Me/H
H	3-OMe	4-	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	9-CF ₃	H/H

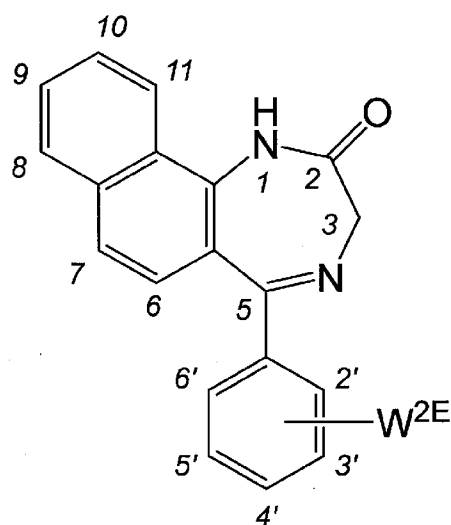
[0176]

[表61]

R ^{1E}	R ^{2E}	W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}	R ^{3E}	R ^{4E} /R ^{5E}
H	4-Me	3-	1H-テトラゾール-1-イル	9-CN	Pr/H
Me	H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	9-OH	H/H
Et	H	3-	(1,2,3-トリアゾール)-5-イル	10-F	H/H
H	3-Br	4-	(1,2,4-トリアゾール)-1-イル	9-SMe	H/H
Allyl	H	4-	1H-ミダゾール-1-イル	8-OMe	H/H
H	H	3-	1H-ミダゾール-1-イル	10-OMe	Me/Me

[0177] <代表化合物 E-400>

[化70]



(式中、W^{2E}並びにW^{2E}の置換位置は表62に記載のとおり)

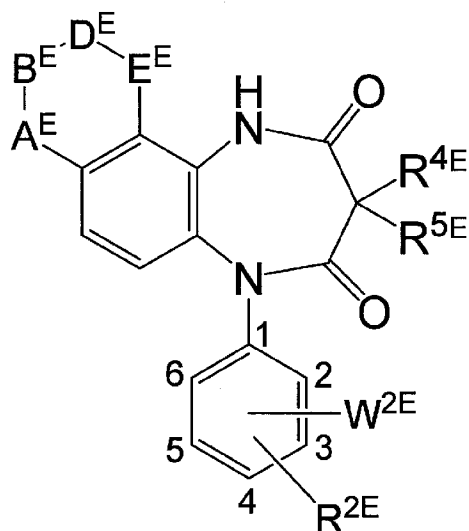
表62において、W^{2E}の置換位置は、ベンゼン環上の置換位置を示す。すなわち、表中の3位及び4位は、代表化合物E-400の式中の3'位及び4'位にそれぞれ対応する。

[0178] [表62]

W ^{2E} の置換位置	W ^{2E}
3-	1H-テトラゾール-5-イル
4-	1H-テトラゾール-5-イル
3-	5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3イル

[0179] <代表化合物E-500>

[化71]

(式中、 $A^E-B^E-D^E-E^E$ 、 R^{4E}/R^{5E} 、 W^{2E} 及び R^{2E} は表63～65記載のとおり。表中の位置は W^{2E} の置換位置を表す)

[0180] [表63]

$A^E-B^E-D^E-E^E$	R^{4E}/R^{5E}	位置	W^{2E}	R^{2E}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1H-テトラゾール-1-イル	4-F
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	3	2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル	3-F
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	3	1,2,3-トリアゾール-5-イル	2-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	1,2,4-トリアゾール-3-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	3	1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル	H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/H	3	ピラゾール-3-イル	4-OH
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/Me	3	ピラゾール-4-イル	H

[0181]

[表64]

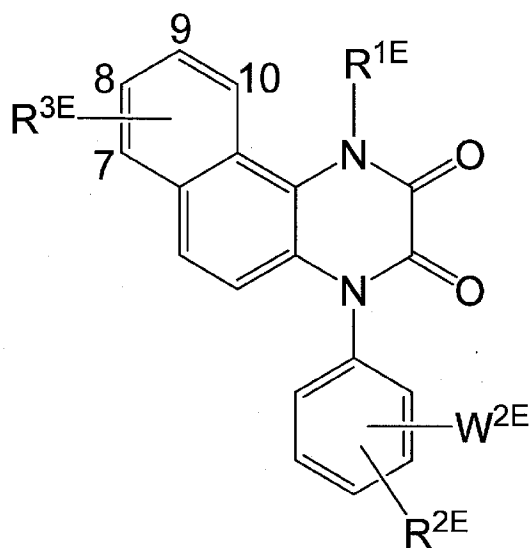
$A^E-B^E-D^E-E^E$	R^{4E}/R^{5E}	位置	W^{2E}	R^{2E}
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	3	5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	4-NH ₂
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	CF ₃ /H	3	1,2,4-オキサジアゾール-3-イル	H
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	3	1,3,4-オキサジアゾール-2-イル	4-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	4	ピロール-1-イル	3-F
$C(CH_3)_2CH_2CH_2C(CH_3)_2$	H/H	3	5-クロロ-1H-イミダゾール-2-イル	4-OH

[0182] [表65]

$A^E-B^E-D^E-E^E$	R^{4E}/R^{5E}	位置	W^{2E}	R^{2E}
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/H	4	5-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	4-NH ₂
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/H	4	5-アミノ-1H-イミダゾール-2-イル	3-F
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	Me/H	3	2-エチル-2H-テトラゾール-5-イル	H
$C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_2$	Pr/H	3	2-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-テトラゾール-5-イル	2,6-F
$CH_2C(CH_3)_2CH_2CH_2$	H/H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
$CH_2CH_2C(CH_3)_2CH_2$	H/H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
$CH_2CH_2CH_2CH_2$	H/H	4	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H

[0183] <代表化合物 E-600>

[化72]



(式中、 R^{3E} 、 R^{1E} 、 W^{2E} 及び R^{2E} は、表66～68記載のとおり。表中

のW^{2E}の位置はベンゼン環上のW^{2E}の置換位置を表す。)

[0184] [表66]

R ^{3E}	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
H	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
8-Me	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
8-Cl	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-F
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-Me
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	5-Br
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Me
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Cl
H	H	3	(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	(5-シアノ-1H-1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H

[0185] [表67]

R ^{3E}	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
H	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-OH
H	H	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	Me	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	Et	3	(2-エチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
H	H	3	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H
H	H	3	4-メチル-(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
H	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル	H
H	H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
H	H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
H	H	3	ピロール-2-イル	H
H	H	3	チオフェン-2-イル	H
H	H	3	1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	1H-イミダゾール-4-イル	H

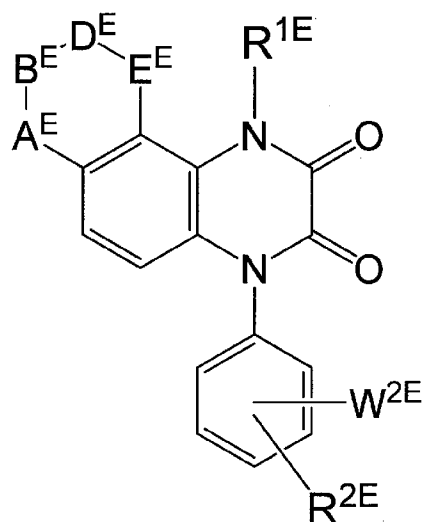
[0186]

[表68]

R ^{3E}	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
H	H	3	ピラゾール-4-イル	H
H	H	3	5-(クロロ)-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
H	H	3	(1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
H	H	3	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H
H	H	3	3-メチル-(1,2,4-オキサジアゾール)-5-イル	H
H	H	3	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
H	H	3	1-テトラゾール-1-イル	H
H	H	3	ピリジン-3-イル	H
H	H	3	ピリミジン-5-イル	H
H	H	3	2-アミノピリジン-5-イル	H

[0187] <代表化合物 E-700>

[化73]



(式中、A^E-B^E-D^E-E^E、R^{1E}、W^{2E}及びR^{2E}は表69～71記載のとおり。

表中のW^{2E}の位置はベンゼン環上のW^{2E}の置換位置を表す。)

[0188]

[表69]

A ^E -B ^E -D ^E -E ^E	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ OCH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-F
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	4-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	5-Br
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Me
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	(5-オキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H

[0189] [表70]

A ^E -B ^E -D ^E -E ^E	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(5-シアノ-1H-1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-テトラゾール-5-イル	6-OH
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	3	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	Et	3	(2-エチル-2H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	H	3	(1-メチル-1H-テトラゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	4-メチル-(5-チオキソ-1,2,4-オキサジアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-オキサゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1,3-チアゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	ピロール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	チオフエン-2-イル	H

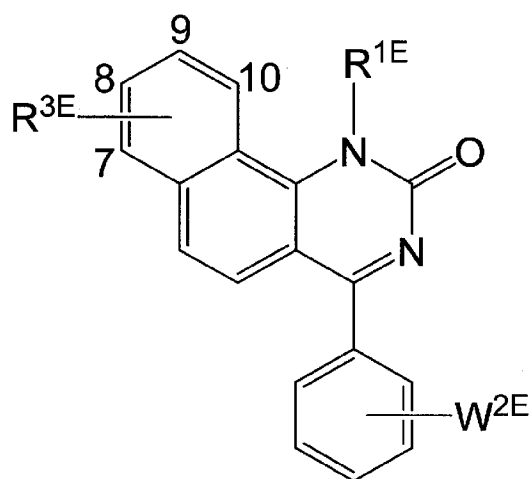
[0190]

[表71]

A ^E -B ^E -D ^E -E ^E	R ^{1E}	W ^{2E} の位置	W ^{2E}	R ^{2E}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1H-イミダゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	ピラゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	5-(クロロ)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	5-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール-2-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(1,2,3-トリアゾール)-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	3-メチル-(1,2,4-オキサジアゾール)-5-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	4	3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	3	1-テトラゾール-1-イル	H
CH ₂ CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	3	ピリミジン-5-イル	H

[0191] <代表化合物 E-800>

[化74]

(式中、R^{3E}、R^{1E}及びW^{2E}は表72記載のとおり)

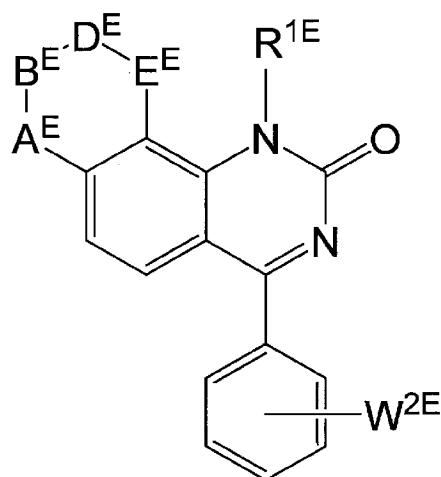
[0192]

[表72]

R ^{3E}	R ^{1E}	W ^{2E}
H	H	1H-テトラゾール-5-イル
H	H	1H-テトラゾール-1-イル
H	H	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル
H	H	1,3-オキサゾール-2-イル
H	H	1H-イミダゾール-2-イル
H	H	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル

[0193] <代表化合物 E-900>

[化75]

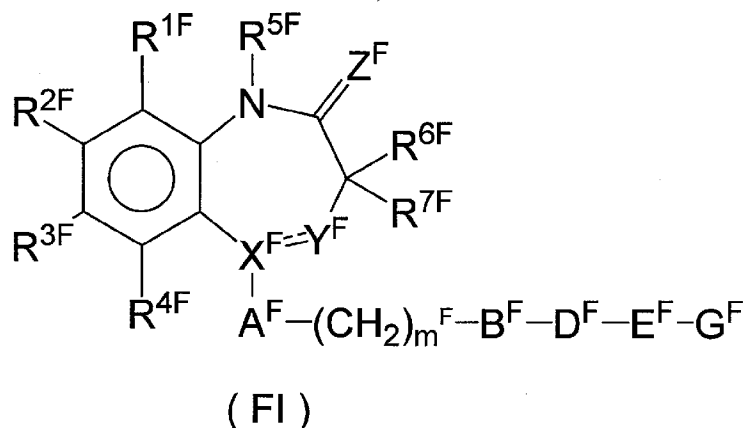
(式中、A^E-B^E-D^E-E^E、R^{1E}及びW^{2E}は表73記載のとおり)

[0194] [表73]

A ^E -B ^E -D ^E -E ^E	R ^{1E}	W ^{2E}
CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	1H-テトラゾール-5-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	(2-メチル-2H-テトラゾール)-5-イル
CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₂	H	1,3-オキサゾール-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	1H-イミダゾール-2-イル
CH ₂ CH ₂ CH(Me)CH ₂	H	(1,2,4-トリアゾール)-3-イル

[0195] (F-1) 次の一般式 (FI) :

[化76]



(式中、 R^{1F} 及び R^{2F} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表すか、又は

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環又はテトラヒドロイソキノリン環から選択される縮合環を形成してもよく、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子からなる環には、1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、

1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3F} 及び R^{4F} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{5F} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{6F} 及び R^{7F} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基又はアミノ基を表し、

X^F はC、CH又はNを表し、

Y^F はN、NH又はC(=O)を表し、

但し、 X^F がNのとき、 Y^F はN、NHでなく、

また、 X^F がC、CHのとき、 Y^F はC(=O)でなく、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

Z^F は酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^F は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、フェニル基又はピリジル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、ピリミジン環、ナフタレン環、キノリン環、若しくはインドール環を表すか、又は結合手を表し、

B^F はN(R^{8F})C(=O)、NHCONH、CON(R^{9F})、NHC(=S)NH、N(R^{10F})SO₂、SO₂N(R^{11F})又はOSO₂を表し、

ここで、 R^{8F} 、 R^{9F} 、 R^{10F} 及び R^{11F} は、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

D^F は、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよく、更に二重結合を有していてもよい炭素数1～6のアルキレン鎖、又は結合手を表し、

E^F は、O、S、NR^{12F}、又は結合手を表し、

ここで、 R^{12F} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基、又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

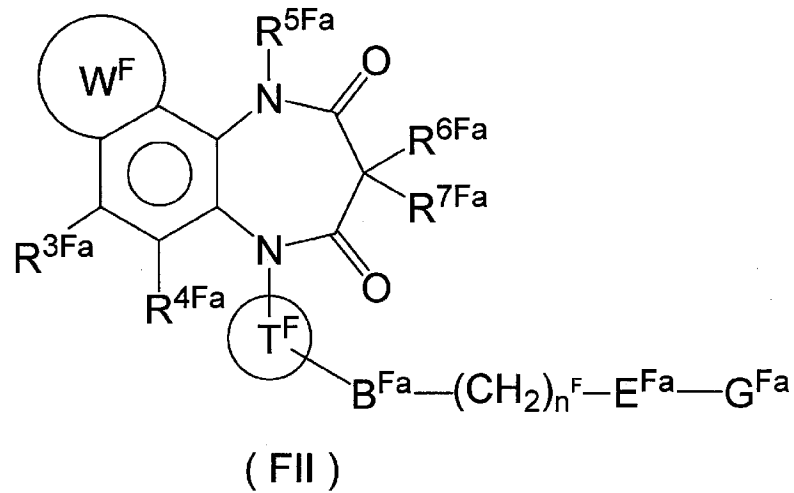
G^F は、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、置換基を有していてもよいイミダゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基、又は置換基を有していてもよいチアゾリル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンを表し、

そして、 m^F は0～5の整数を表す。

但し、 R^{1F} と R^{2F} が一緒になって環を形成しない場合で、 X^F がC、 Y^F がNで、実線と破線からなる二重線が二重結合で、 Z^F が酸素原子で、 A^F がベンゼン環で、 m^F が0で、 B^F がC(=O)NHで、 E^F が結合手で G^F がフェニル基の場合を除く。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

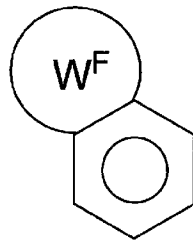
[0196] (F-2) 下記の一般式 (FII) :

[化77]



(式中、

[化78]



は、ナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環又はテトラヒドロイソキノリン環を表し、

そしてこれらの環は1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アル

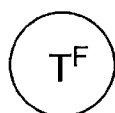
コキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。)、又はアラルキル基(アリアル部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8)から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3Fa} 及び R^{4Fa} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基(アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。)、又はアラルキル基(アリアル部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8)を表し、

R^{5Fa} は水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、水酸基で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基又はアラルキル基(アリアル部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8)を表し、

R^{6Fa} 及び R^{7Fa} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、又はアミノ基を表し、

[化79]



は、置換基として、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 の

アルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、フェニル基、又はピリジル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有しているベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、ピリミジン環、ナフタレン環、キノリン環、又はインドール環を表し、

B^{Fa} は $N(R^{8Fa})C(=O)$ 、 $NHCONH$ 、 $CON(R^{9Fa})$ 、 $NHC(=S)NH$ 、 $N(R^{10Fa})SO_2$ 、 $SO_2N(R^{11Fa})$ 、又は OSO_2 を表し、

ここで、 R^{8Fa} 、 R^{9Fa} 、 R^{10Fa} 及び R^{11Fa} は、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

E^{Fa} は、O、S、 NR^{12Fa} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{12Fa} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

G^{Fa} は、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、

炭素数 1 ～ 6 のアルキルスルホニル基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、置換基を有していてもよいイミダゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基、又は置換基を有していてもよいチアゾリル基から選択される同一又は異なる置換基を 1 ～ 4 個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンを表し、

そして、 n^F は 0 ～ 5 の整数を表す。）で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0197] 次に本発明を詳細に説明する。

本明細書において、

炭素数 1 ～ 8 のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

炭素数 3 ～ 8 のシクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロヘキシル基等が挙げられる。

炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0198] 1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基としては、1 ～ 3 個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は *t*-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基又は 2-フルオロエチル

基等が挙げられる。

1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又は t -ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

[0199] 炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基等が挙げられる。

[0200] アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）としては、メトキシカルボニル基等が挙げられる。

アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）としては、ベンジル基等が挙げられる。

水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、2-ヒドロキシエチル基等が挙げられる。

[0201] 炭素数1～6のアルキルスルフィニル基としては、メタンスルフィニル基等が挙げられる。

炭素数1～6のアルキルチオ基としては、メチルチオ基等が挙げられる。

炭素数1～6のアルキルスルホニル基としては、メタンスルホニル基等が挙げられる。

[0202] 置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジ

ル基、置換基を有していてもよいイミダゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基及び置換基を有していてもよいチアゾリル基が有していてもよい置換基としては、ハロゲン原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基等が挙げられる。

[0203] 上記一般式 (F 1) の化合物としては、次に示す化合物が好ましい。

(F-1-1)

R^{1F} 及び R^{2F} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8）である上記 (F-1) で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0204] (F-1-2)

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒に becoming ナフタレン環、又はテトラヒドロナフタレン環を形成し、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子から形成されるベンゼン環又はシクロヘキセン環は、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の

炭素数は 1 ～ 8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8）から選択される 1 ～ 4 個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよい上記（F - 1）又は（F - 1 - 1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

（F - 1 - 3）

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環を形成し、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子から形成されるベンゼン環は、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基から選択される 1 ～ 4 個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよい上記（F - 1）又は（F - 1 - 1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

（F - 1 - 4）

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環、又はテトラヒドロナフタレン環を形成する上記（F - 1）又は（F - 1 - 1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0205] （F - 1 - 5）

R^{3F} 及び R^{4F} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8）である、

上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-4) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-6)

R^{5F}が水素原子、炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）である、

(F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-5) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-7)

R^{5F}が水素原子である上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-6) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-8)

R^{6F}及びR^{7F}が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基である上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-7) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-9)

R^{6F}及びR^{7F}が共に水素原子である上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-8) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0206] (F-1-10)

R^{3F}、R^{4F}、R^{5F}、R^{6F}及びR^{7F}が水素原子である上記 (F-1) 又は (

F-1-1) ないし (F-1-9) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0207] (F-1-11)

X^FがNで、Y^FがC(=O)で、実線と破線からなる二重線が、単結合である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-10)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-12)

X^FがCで、Y^FがNで、実線と破線からなる二重線が、二重結合である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-11)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-13)

Z^Fが酸素原子である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-12)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0208] (F-1-14)

A^Fが置換基として炭素数1~8のアルキル基、炭素数2~8のアルケニル基、炭素数1~8のアルコキシ基、1~3のハロゲン原子で置換された炭素数1~8のアルキル基、1~3のハロゲン原子で置換された炭素数1~8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1~8のアルキルアミノ基、炭素数2~8のジアルキルアミノ基、アラルキル基(アリール部分の炭素数は、6~10で、アルキレン部分の炭素数は1~8)、フェニル基又はピリジル基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1~4個有していてもフェニル基、又はピリジル基である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-13)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬

学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-15)

A^Fが置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、又はアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもフェニル基である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-14)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0209] (F-1-16)

A^Fがフェニル基、又はピリジル基である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-15)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-17)

A^Fが結合手である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-16)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0210] (F-1-18)

B^FがNHC(=O)、NHCONH、CONH、NHC(=S)NH、NHSO₂、SO₂NH又はOSO₂である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-17)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-19)

B^FがNHC(=O)、NHCONH又はNHSO₂である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-18)のいずれかに記載の化合物、前

記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0211] (F-1-20)

B^FがNHC(=O)又はNH₂SO₂である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-19)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-21)

B^FがNHC(=O)である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-20)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-22)

D^Fが、置換基として炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有していてもよく、更に二重結合を有していてもよい炭素数1～6のアルキレン鎖である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-21)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-23)

D^Fが結合手である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-22)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0212] (F-1-24)

D^Fが置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有している上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-23)のいずれかに記

載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-25)

D^Fが置換基として炭素数1～3のアルキル基、炭素数2～3のアルケニル基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～4個有している上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-24)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-26)

E^Fが結合手である上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-25)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0213] (F-1-27)

G^Fが置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有しているよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンである上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-26)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-28)

G^Fが置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンである上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-27)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0214] (F-1-29)

G^Fが置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼン又はピリジンである上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-28)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0215] (F-1-30)

G^Fが置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンである上記(F-1)又は(F-

1-1) ないし (F-1-29) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0216] (F-1-31)

m^F が 0 である上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-30) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0217] (F-1-32)

A^F がベンゼン環であり、 m^F が 0 であり、 B^F が $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ であり、 D^F が炭素数 1~3 のアルキル基又は結合手であり、 E^F が結合手であり、 G^F が置換基として炭素数 1~8 のアルキル基、1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を 1~4 個有していてもよいベンゼンである上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-31) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0218] (F-1-33)

A^F がベンゼン環であり、 m^F が 0 であり、 B^F が $NHC(=O)$ であり、 D^F が結合手であり、 E^F が結合手であり、 G^F が置換基として 1~3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1~8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を 1~4 個有していてもよいベンゼンである上記 (F-1) 又は (F-1-1) ないし (F-1-32) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-1-34)

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環を形成し、 R^{3F} 、 R^{4F} 、 R^{5F} 、 R^{6F} 及び R^{7F} は水素原子を表し、 X^F が N で、 Y^F が $C(=O)$ で、実線と破線からなる二重線が単結合

を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F はOを表し、 B^F は $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ を表し、 D^F は炭素数1～3のアルキル基又は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンである上記(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-33)の何れか1に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

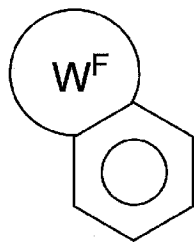
(F-1-35)

上記の一般式(F-1)において、 R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{3F} 、 R^{4F} 、 R^{5F} 、 R^{6F} 及び R^{7F} は水素原子を表し、 X^F がNで、 Y^F が $C(=O)$ で、実線と破線からなる二重線が単結合を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F はOを表し、 B^F は $NHC(=O)$ を表し、 D^F は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンである(F-1)又は(F-1-1)ないし(F-1-34)の何れか1に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0219] 上記一般式(F-1)の本発明化合物としては、次に示す化合物が好ましい。

(F-2-1)

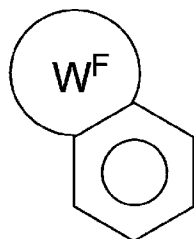
[化80]



が、置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8）から選択される 1～4 個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよいナフタレン環又はテトラヒドロナフタレン環である上記（F-2）で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

（F-2-2）

[化81]



が、置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基から選択される 1～

4個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよいナフタレン環である上記（F-2）又は（F-2-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0220] (F-2-3)

R^{3Fa} 及び R^{4Fa} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）である上記（F-2）又は（F-2-1）ないし（F-2-2）のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-4)

R^{5Fa} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）である上記（F-2）又は（F-2-1）ないし（F-2-3）のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-5)

R^{5Fa} が水素原子である上記（F-2）又は（F-2-1）ないし（F-2-4）のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-6)

R^{6Fa} 及び R^{7Fa} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭

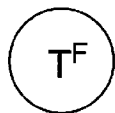
素数 1～8 のアルコキシ基である上記 (F-2) 又は (F-2-1) ないし (F-2-5) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-7)

R^{6Fa} 及び R^{7Fa} が共に水素原子である上記 (F-2) 又は (F-2-1) ないし (F-2-6) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0221] (F-2-8)

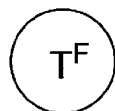
[化82]



が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8）、フェニル基又はピリジル基から選択される同一又は異なっているいてもよい置換基を 1～4 個有していてもフェニル基、又はピリジル基である上記 (F-2) 又は (F-2-1)～(F-2-7) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-9)

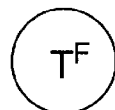
[化83]



が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、又はアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有しているフェニル基である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-8)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-10)

[化84]



が結合手である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-9)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0222] (F-2-11)

B^{Fa}がNHC(=O)、NHCONH、CONH、NHC(=S)NH、NH₂SO₂、SO₂NH又はOSO₂である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-10)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-12)

B^{Fa}がNHC(=O)、NHCONH又はNH₂SO₂である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-11)のいずれかに記載の化合物、前記化

化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-13)

E^{Fa}が結合手である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-12)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0223] (F-2-14)

G^{Fa}が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンである上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-13)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(F-2-15)

G^{Fa}が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミ

ノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンである上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-14)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0224] (F-2-16)

n^F が0である上記(F-2)又は(F-2-1)～(F-2-15)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0225] 上記の一般式(F-1)において、 R^{F1} と R^{F2} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環又はテトラヒドロナフタレン環から選択される縮合環を形成していることが好ましく、ナフタレン環を形成していることが特に好ましい。

[0226] 上記の一般式(F-1)において、 R^{F3} 、 R^{F4} 、 R^{F5} 、 R^{F6} 及び R^{F7} は水素原子を表していることが好ましい。

[0227] 上記の一般式(F-1)において、 X^F がNで、 Y^F がC(=O)で、実線と破線からなる二重線が単結合であることが好ましい。

[0228] 上記の一般式(F-1)において、 Z^F が酸素原子であることが好ましい。

[0229] 上記の一般式(F-1)において、 A^F はベンゼン環又はピリジン環を表していることが好ましく、ベンゼン環を表していることが特に好ましい。

[0230] 上記の一般式(F-1)において、 m^F は0ないし4を表していることが好ましく、0を表していることが特に好ましい。

[0231] 上記の一般式(F-1)において、 B^F はN(R^{8F})C(=O)又はN(R^{10F})SO₂を表していることが好ましく、このとき、 R^{8F} と R^{10F} は水素原子を表していることがより好ましい。また、上記の一般式(F-1)において、 B^F はNHC(=O)を表していることが特に好ましい。

- [0232] 上記の一般式 (F I) において、 D^F は置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基から選択される同一又は異なっているよい置換基を 1～4 個有している又は又は結合手であることを表していることが好ましく、炭素数 1～3 のアルキル基、炭素数 2～3 のアルケニル基から選択される同一又は異なっているよい置換基を 1～4 個有している又は又は結合手であることを表していることがより好ましく、結合手を表していることが特に好ましい。
- [0233] 上記の一般式 (F I) において、 E^F は、O、又は結合手を表していることが好ましく、結合手を表していることが特に好ましい。
- [0234] 上記の一般式 (F I) において、 G^F は、置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、アミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 1～6 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～6 のアルキルチオ基、炭素数 1～6 のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を 1～4 個有しているよい、ベンゼン又はピリジンを表していることが好ましく、 G^F は、置換基として 1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を 1～4 個有しているよい、ベンゼンを表していることが特に好ましい。
- [0235] 上記の一般式 (F I) において、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F は 0 を表し、 B^F は $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ を表し、 D^F は炭素数 1～3 のアルキル基又は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を 1～4 個有しているよいベンゼンを表していることが特に好ましい。
- [0236] 上記の一般式 (F I) において、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F は 0 を表し、 B^F は $NHC(=O)$ を表し、 D^F は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G

F は置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンを表していることが特に好ましい。

[0237] 上記の一般式 (F I) において、 R^{F1} と R^{F2} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{F3} 、 R^{F4} 、 R^{F5} 、 R^{F6} 及び R^{F7} は水素原子を表し、 X^F がNで、 Y^F がC(=O)で、実線と破線からなる二重線が単結合を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F はOを表し、 B^F はNHC(=O)又はNH SO_2 を表し、 D^F は炭素数1～3のアルキル基又は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンを表していることがさらに好ましい。

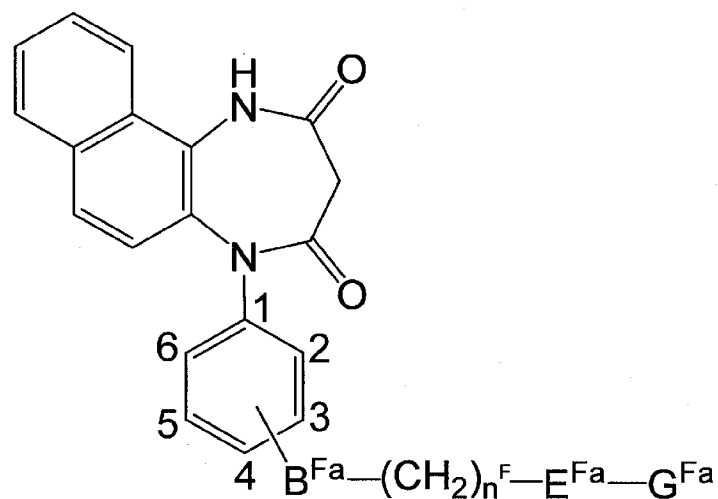
[0238] 上記の一般式 (F I) において、 R^{F1} と R^{F2} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{F3} 、 R^{F4} 、 R^{F5} 、 R^{F6} 及び R^{F7} は水素原子を表し、 X^F がNで、 Y^F がC(=O)で、実線と破線からなる二重線が単結合を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F はOを表し、 B^F はNHC(=O)を表し、 D^F は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンを表していることが特に好ましい。

[0239] 一般式 (F I) 及び／又は (F I I) に包含される代表的化合物を以下に示す。

[0240] <代表化合物例 F-100>

[0241]

[化85]



[0242] (式中、 B^{Fa} (置換位置)、 n^F 、 E^{Fa} 及び G^{Fa} は表74～83に記載のとおり)

[0243] [表74]

B^{Fa} (置換位置)	n^F	E^{Fa}	G^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-CF ₃)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-Br)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(4-CF ₃)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,6-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,6-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-Cl)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	Phenyl
NHC(=S)NH(4)	0	結合手	Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,3-OMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,5-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,5-Br)Phenyl

[0244]

[表75]

B ^F a (置換位置)	n ^F	E ^F a	G ^F a
NHCO(4)	0	結合手	(2,4-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,3-OH)Phenyl
NHC(=O)NH(4)	0	結合手	Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2,6-Cl)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-OMe)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-OH)Phenyl
NHC(=S)NH(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-CF ₃)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-CF ₃)Phenyl
NHC(=O)NH(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,3-OMe)Phenyl
NHCO(4)	2	結合手	Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	3-indolyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,3-OH)Phenyl
NHCO(4)	1	0	Phenyl

[0245] [表76]

B ^F a (置換位置)	n ^F	E ^F a	G ^F a
NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl,4-OMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(1-Me)imidazol 2-yl
NHCO(4)	1	結合手	(2,4-Cl)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl,4-OH)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	pyridin 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	Benzimidazol 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Br)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(2-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	quinoxalin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(5-Me) thiophen 2-yl
NHCO(3)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,4,6-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Et)Phenyl
NHC(=S)NH(4)	0	結合手	(2-Me)Phenyl

[0246]

[表77]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	(4-NMe ₂)Phenyl
NHCO(4)	1	O	(2,4-Cl)Phenyl
NHCO(4)	1	O	(2-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Ac)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-tBu)Phenyl
NHCO(3)	0	結合手	(2-I)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(1-Me) piperidin 4-yl
NHCO(4)	0	結合手	benzofuran 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(1-Me) indol 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-allyl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-nPr)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-iPrO)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	3-Me thiophen 2-yl
NHCO(4)	1	O	(2-Me,3-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-CF ₃ ,4-F)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,4-F)Phenyl

[0247] [表78]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,4-F)Phenyl
NHCO(3)	1	結合手	(2-I)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-NMe ₂)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,4-I)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-F)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,4-I)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-F)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-F)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-NMe ₂)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Me)Phenyl
NHCO(4)	2	結合手	(2-Me)Phenyl
CONH(4)	0	結合手	Phenyl
CONH(4)	1	結合手	Phenyl
NHCO(4)	2	結合手	(2-Cl)Phenyl
CONH(4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0248]

[表79]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
CONH(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(5-Br,2,3-methylenedioxy)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-Br)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Br)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-OMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-CF ₃)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-CF ₃)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,5-SMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-SMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-SMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,6-Et)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-SO ₂ Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Et)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-S(=O)Me)Phenyl

[0249] [表80]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,5-S(=O)Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-S(=O)Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-Cl) pyridin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,3-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-Me) pyridin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,3-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(3-OH) pyridin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(3-Vinyl) pyridin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Et) pyridin 2-yl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(3-Br)Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(3-OMe)Phenyl
NHSO ₂ (3)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NMeSO ₂ (3)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NHSO ₂ (3)	0	結合手	naphthalen 2-yl

[0250]

[表81]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHSO ₂ (3)	0	結合手	naphthalen 1-yl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	Cyclohexyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	pyridin 3-yl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(4-iPr)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	thiophen 2-yl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	naphthalen 2-yl
NBnSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	0	結合手	(3-Br)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
N(CH ₂ CH ₂ OH)SO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(3-Br)Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-CF ₃)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Br)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Me)Phenyl

[0251] [表82]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NHSO ₂ (4)	2	結合手	Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(4-Cl)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-CF ₃)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Et)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2,3-Me)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	2	結合手	(2-Cl)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-NH ₂)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-NMe ₂)Phenyl

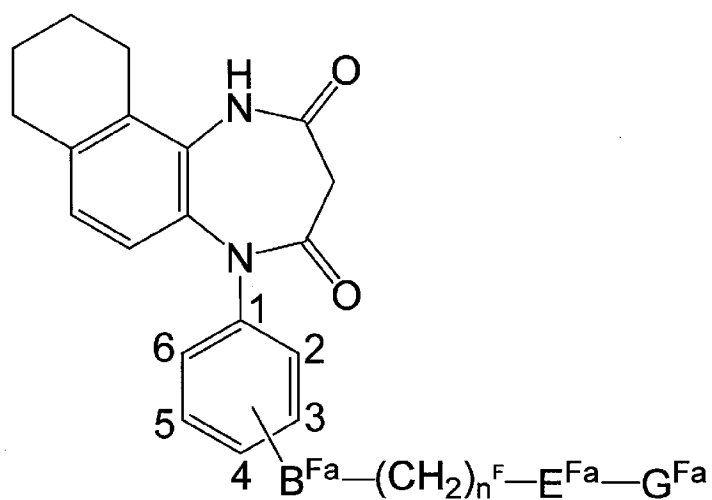
[0252]

[表83]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	pyridin 4-yl
NHCO(4)	1	O	pyridin 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	pyridin 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Me) pyridin 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 3-yl
NHCO(4)	1	O	pyridin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(4-CF ₃) pyridin 3-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-iPr) Phenyl

[0253] <代表化合物例 F-200>

[0254] [化86]



[0255] (式中、B^{Fa}(置換位置)、n^F、E^{Fa}及びG^{Fa}は表84及び85に記載のとおり)

[0256]

[表84]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	Cyclohexyl
NHCO(4)	0	結合手	(6-Me) pyridin-2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Me) pyridin-3-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OMe,3-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Cl)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,3-Me)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	(1-Me) pyrrol 2-yl
NHCO(4)	1	結合手	(2-tBu)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Isopropenyl) phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-iPr)Phenyl
NHCO(4)	1	結合手	morpholin 2-yl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl

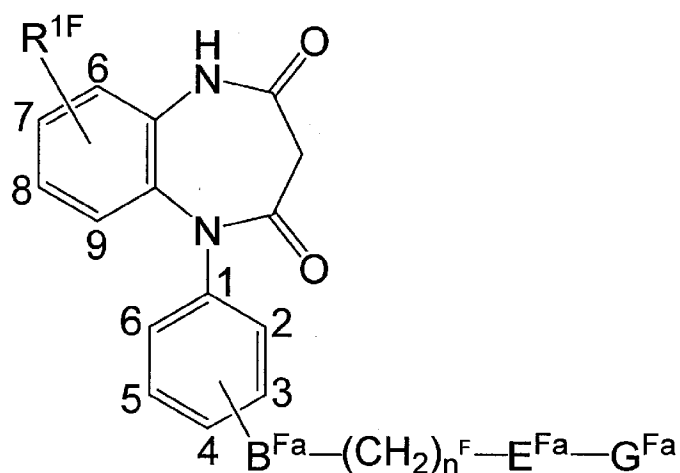
[0257] [表85]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
SO ₂ NH(4)	0	結合手	Phenyl
OSO ₂ (4)	0	結合手	(3-Br)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(3-Br)Phenyl
NHSO ₂ (4)	0	結合手	(3-OMe)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2,3-Cl)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2,6-Cl)Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-I)Phenyl
NMeSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0258] <代表化合物例 F - 3 0 0 >

[0259]

[化87]



[0260] (式中、 R^{1F} 、 B^{Fa} (置換位置)、 n^F 、 E^{Fa} 及び G^{Fa} は表86に記載の通り)

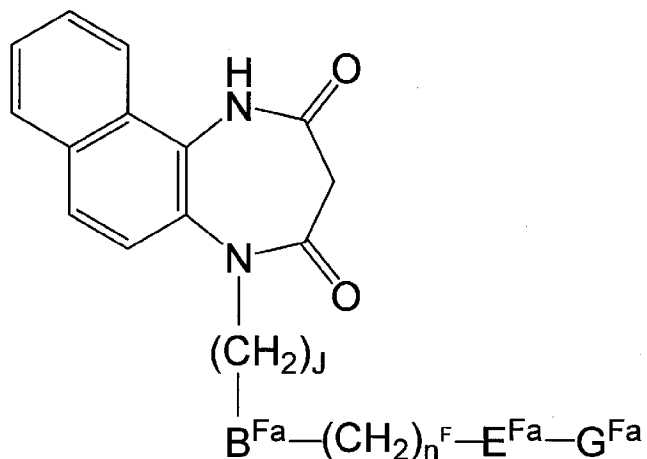
[0261] [表86]

R^1	B^{Fa} (置換位置)	n^F	E^{Fa}	G^{Fa}
7-OMe	NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
7-OH	NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
6-Me	NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
6,7-Me	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
6-Et	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
7-Ph	NHCO(4)	0	結合手	(2-Isopropyl))Phenyl
7-(Pyridin-3yl)	NHCO(4)	0	結合手	(2-Isopropyl))Phenyl
7-(Pyridin-2yl)	NHCO(4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
7-Cl	NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
7-Br	NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
7-CF ₃	NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
H	NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
6-Me,7-Br	NHSO ₂ (4)	0	結合手	(2-Isopropyl)Phenyl
7-OMe	NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
7-OH	NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
6-Me	NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0262] <代表化合物例 F-400>

[0263]

[化88]

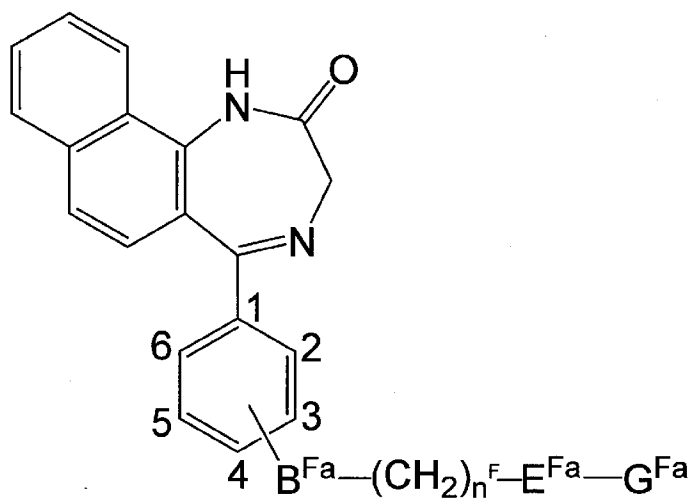
[0264] (式中、 B^{Fa} (置換位置)、 n^{F} 、 E^{Fa} 及び G^{Fa} は表87に記載のとおり)

[0265] [表87]

B^{Fa} (置換位置)	n^{F}	E^{Fa}	G^{Fa}
NHCO	0	結合手	(2-Cl,3-OMe)Phenyl
NHCO	0	結合手	(2-I)Phenyl
NHSO ₂	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
NHSO ₂	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0266] <代表化合物例 F-500>

[0267] [化89]

[0268] (式中、 B^{Fa} (置換位置)、 n^{F} 、 E^{Fa} 及び G^{Fa} は表88に記載のとおり)

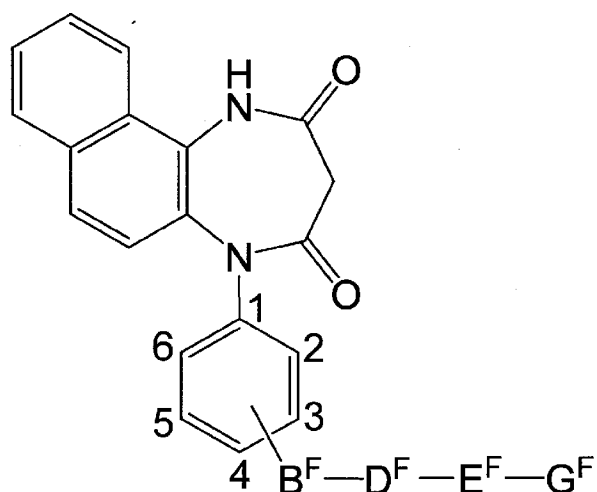
[0269]

[表88]

B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,3-OMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,3-OH)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-tBu)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,6-OMe)Phenyl
NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl,6-OH)Phenyl
NHSO ₂ (3)	0	結合手	Phenyl
NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0270] <代表化合物例 F-600>

[0271] [化90]

[0272] (式中、B^F(置換位置)、D^F、E^F及びG^Fは表89に記載のとおり)

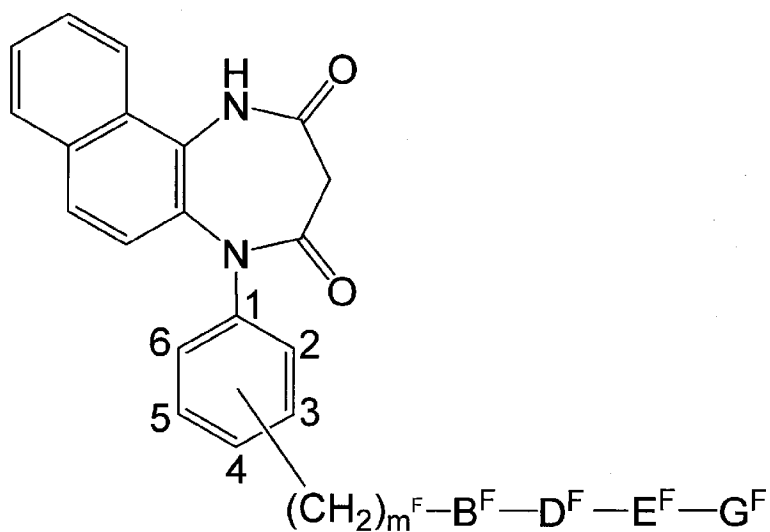
[0273] [表89]

B ^F (置換位置)	D ^F	E ^F	G ^F
NHCO(4)	C(Me)H	結合手	Phenyl
NHCO(4)	C(Me) ₂	結合手	Phenyl
NHCO(4)	CH=CH	結合手	Phenyl
NHCO(4)	C(Me)H	0	Phenyl
NHCO(4)	C(Me) ₂	0	Phenyl
NHCO(4)	CH=CH	結合手	(2-Me)Phenyl
NHCO(4)	CH=CH	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0274] <代表化合物例 F-700>

[0275]

[化91]

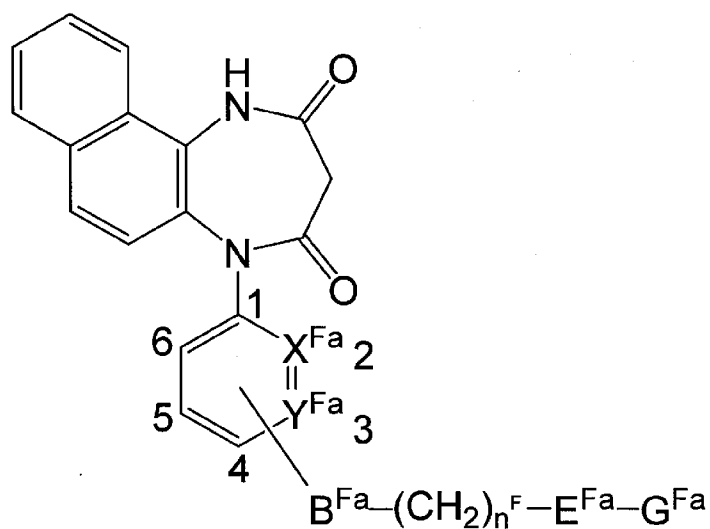
[0276] (式中、 m^F (置換位置)、 B^F 、 D^F 、 E^F 及び G^F は表90に記載のとおり)

[0277] [表90]

m^F (置換位置)	B^F	D^F	E^F	G^F
1(4)	NHCO	結合手	結合手	Phenyl
1(4)	NHCO	結合手	結合手	(2-Cl)Phenyl
1(4)	NHSO ₂	CH ₂	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0278] <代表化合物例F-800>

[0279] [化92]

[0280] (式中、 X^{Fa} 、 Y^{Fa} 、 B^{Fa} (置換位置)、 n^F 、 E^{Fa} 及び G^{Fa} は表91に記

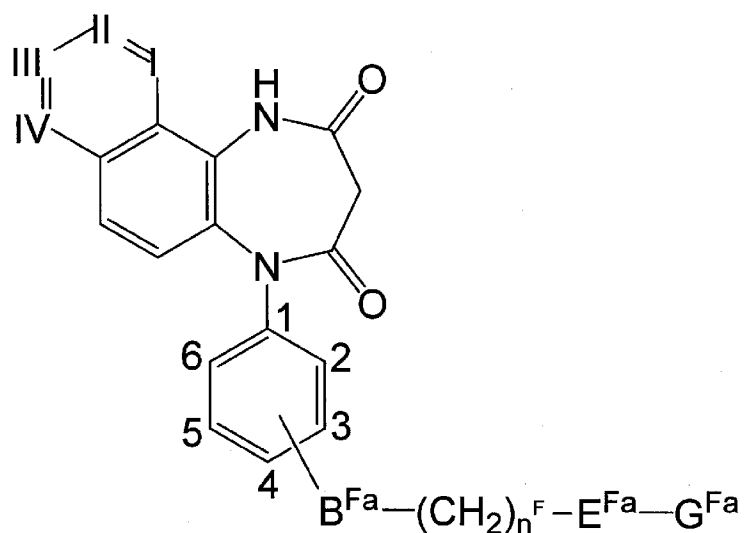
載のとおり)

[0281] [表91]

X ^{Fa}	Y ^{Fa}	B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
CH	C-F	NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
CH	C-OH	NHCO(4)	0	結合手	(2,3-Me)Phenyl
CH	C-F	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	Phenyl
N	CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
CH	N	NHC(=O)NH(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Me)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
CH	N	NHCO(3)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
CH	N	NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
CH	N	NHCO(4)	0	結合手	(2-Me) pyridin 2-yl
CH	C-OMe	NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl
CH	C-OH	NHSO ₂ (4)	1	結合手	(2-Cl)Phenyl

[0282] <代表化合物例 F-900>

[0283] [化93]



[0284] (式中、I=II-III=IV、B^{Fa}(置換位置)、n^F、E^{Fa}及びG^{Fa}は表92に記載のとおり)

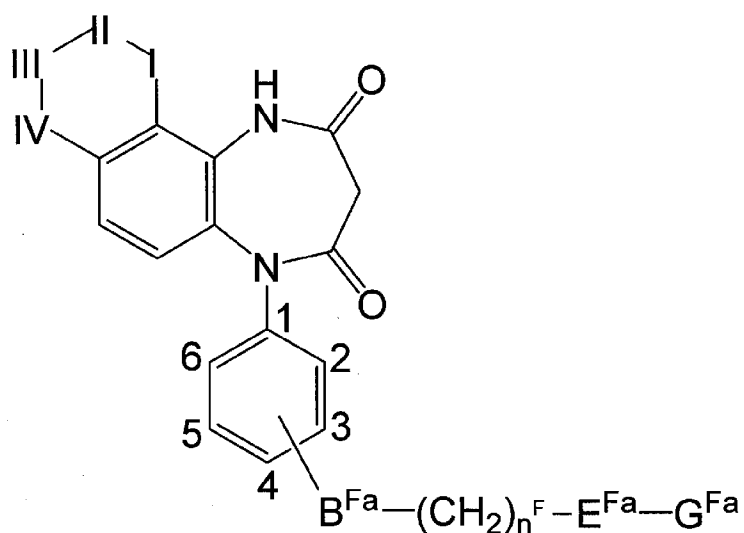
[0285]

[表92]

I=II-III=IV	B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH=N-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH=CH-N=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH=CH-CH=N	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	1	0	Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(3)	0	結合手	(2-I)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHC(=O)NH(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	1	0	(2-OH,6-Me)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(3)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
N=CH-CH=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-Me) pyridin 2-yl
CH=CH-N=CH	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 3-yl

[0286] <代表化合物例 F-1000>

[0287] [化94]



[0288] (式中、I-II-III-IV、B^{Fa}(置換位置)、n^F、E^{Fa}及びG^{Fa}は
は表93に記載のとおり)

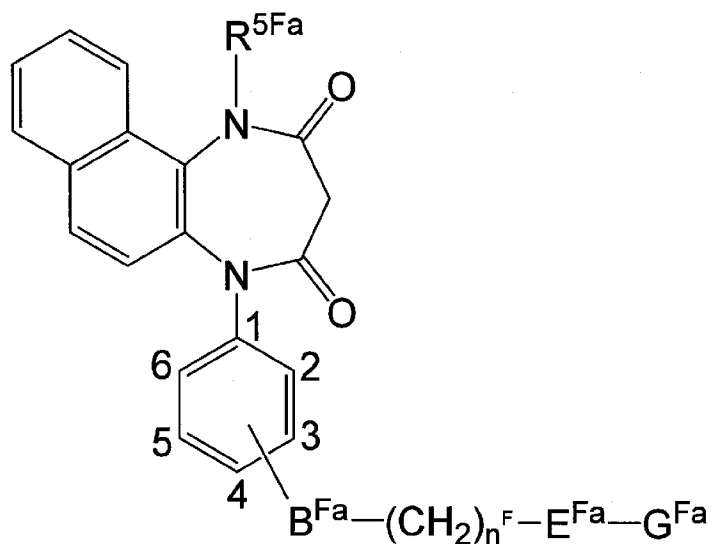
[0289]

[表93]

I-II-III-IV	B ^{Fa} (置換位置)	n ^F	E ^{Fa}	G ^{Fa}
NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH ₂ -NH-CH ₂ -CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -NH	NHCO(4)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	1	O	Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(3)	0	結合手	(2-I)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 3-yl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHC(=O)NH(4)	0	結合手	(2-OH)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	1	O	(2-OH,6-Me)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(3)	0	結合手	(2-OH,6-Cl)Phenyl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	1	結合手	(2-Cl) pyridin 2-yl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-Me) pyridin 2-yl
CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂	NHCO(4)	0	結合手	(2-Cl) pyridin 3-yl

[0290] <代表化合物例 F-1100>

[0291] [化95]



[0292] (式中、R^{5Fa}、B^{Fa}(置換位置)、n^F、E^{Fa}及びG^{Fa}は表94に記載のとおり)

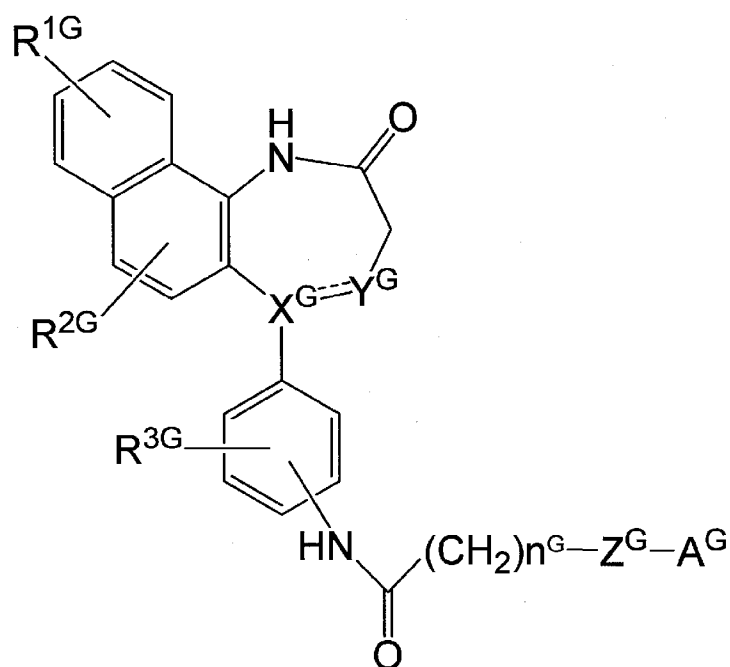
[0293]

[表94]

R^{5Fa}	B^{Fa} (置換位置)	n^F	E^{Fa}	G^{Fa}
Bn	NBnSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
Me	NBnSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl
Et	NBnSO ₂ (4)	0	結合手	(2-NO ₂)Phenyl

[0294] (G-1) 下記一般式 (GI) :

[化96]



(GI)

(式中、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基を表し、

X^G はC又はNを表し、

Y^G はN又はC(=O)を表し、

但し、 X^G がCのとき、 Y^G はNを表し、

また、 X^G がNのとき、 Y^G はC (=O) を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

n^G は0～6の整数を表し、

Z^G はO, S又は結合手を表し、

そして A^G は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、又は $N(R^{4G})(R^{5G})$ から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環、ピリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環を表す。ここで、 R^{4G} 及び R^{5G} は同一又は異なっているもよい炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{4G} と R^{5G} と R^{4G} 及び R^{5G} が結合する窒素原子が一緒になって、環形成原子としてヘテロ原子として更に酸素原子又は硫黄原子を含んでもよい、5～7員環を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0295] 一般式(G I)において、炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

炭素数3～8のシクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロヘキシル基等が挙げられる。

炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0296] 1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、

1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又は t -ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又は t -ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、ヨウ素原子、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

[0297] 炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

[0298] R^{4G} と R^{5G} と R^{4G} 及び R^{5G} が結合する窒素原子が一緒になって、環形成原子としてヘテロ原子として更に酸素原子又は硫黄原子を含んでもよい、5～7員環としては、モルホリン-4-イル、1H-ピロール-1-イル、又はピロリジン-1-イル等が挙げられる。

[0299] 上記の R^{1G} は、同一又は異なる置換基が1～4個存在していてもよい。

上記の R^{2G} は、同一又は異なる置換基を1～2個存在していてもよい。

上記の R^{3G} は、同一又は異なる置換基を1～4個存在していてもよい。

[0300] 一般式(GI)で表される化合物としては、以下の化合物が好ましい。

(G-1-1)

A^G が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1

～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環、ピリジン環、ペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環である上記（G-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0301] (G-1-2)

A^Gが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環又はピリジン環である上記（G-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(G-1-3)

A^Gが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環である上記（G-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(G-1-4)

A^Gが置換基として、N(R^{4G})(R^{5G})（式中、R^{4G}及びR^{5G}は、R^{4G}とR^{5G}とR^{4G}及びR^{5G}が結合する窒素原子と一緒にあって、環形成原子としてヘテロ原子として更に酸素原子又は硫黄原子を含んでもよい、5～7員環

を表す。)を有するピリジン環である上記 (G-1) に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(G-1-5)

A^Gが置換基として、モルホリン-4-イル、1H-ピロール-1-イル、又はピロリジン-1-イルから選択された置換基を有するピリジン環である上記 (G-1) に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0302] (G-1-6)

R^{1G}、R^{2G}及びR^{3G}が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、又はハロゲン原子である上記 (G-1) に記載の化合物又は (G-1-1) ないし (G-1-5) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(G-1-7)

R^{1G}、R^{2G}及びR^{3G}が同一又は異なってもよく水素原子又はハロゲン原子である上記 (G-1) に記載の化合物又は (G-1-1) ないし (G-1-5) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0303] (G-1-8)

n^Gが0である上記 (G-1) に記載の化合物又は (G-1-1) ないし (G-1-7) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物

(G-1-9)

n^Gが1又は2である上記 (G-1) に記載の化合物又は (G-1-1) な

いし (G-1-7) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(G-1-10)

Z^Gが結合手である上記 (G-1) に記載の化合物又は (G-1-1) ないし (G-1-9) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0304] (G-1-11)

R^{1G}、R^{2G}及びR^{3G}が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、又はヒドロキシル基であり、

X^GがNであり、

Y^GがC(=O)であり、

実線と破線からなる二重線が単結合であり、

n^Gが0であり、

Z^Gが結合手であり、

そしてA^Gが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、又はN(R^{4G})(R^{5G})から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～3個有していてもよいベンゼン環若しくはピリジン環であり、ここで、R^{4G}及びR^{5G}が同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基を表すか、又はR^{4G}とR^{5G}とR^{4G}及びR^{5G}が結合する窒素原子が一緒になって、モルホリン環、ピロール環、若しくはピロリジン環を表す、上記 (G-1) に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的

に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0305] (G-1-12)

R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子又はヒドロキシル基であり、

X^G がCであり、

Y^G がNであり、

実線と破線からなる二重線が、二重結合であり、

n^G が0～3の整数であり、

Z^G が結合手であり、

そして、 A^G が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、又はN(R^{4G})(R^{5G})から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～3個有していてもよいベンゼン環、若しくはピリジン環を表し、ここで、 R^{4G} 及び R^{5G} が同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{4G} と R^{5G} と R^{4G} 及び R^{5G} が結合する窒素原子が一緒になって、モルホリン、ピロール環、若しくはピロリジン環を表す、上記(G-1)に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0306] (G-1-13)

X^G とNHC(=O)がフェニル基のパラ位にある上記(G-1)に記載の化合物又は(G-1-1)ないし(G-1-12)のいずれかにに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0307] 上記一般式(G1)で、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} が水素原子であることが好ま

しい。

上記一般式 (G I) で、 X^G が C であり、 Y^G が N であり、実線と破線からなる二重線が二重結合であることが好ましい。

上記一般式 (G I) で、 n^G が 0 であることが好ましい。

上記一般式 (G I) で、 Z^G が結合手であることが好ましい。

[0308] 上記一般式 (G I) で、 A^G が置換基として、N (R^{4G}) (R^{5G}) から選択される同一又は異なってもよい置換基を 1～3 個有していてもよいピリジン環を表し、ここで、 R^{4G} 及び R^{5G} が同一又は異なってもよい炭素数 1～8 のアルキル基を表すことが好ましく、 A^G が置換基として炭素数 1～8 のジアルキルアミノ基を有するピリジン環であることがより好ましく、 A^G が置換基としてジメチルアミノ基を有するピリジン環であることが好適である。

[0309] 上記一般式 (G I) で、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} が水素原子であり、 X^G が C であり、 Y^G が N であり、実線と破線からなる二重線が二重結合であり、 n^G が 0 であり、 Z^G が結合手であり、 A^G が置換基として炭素数 1～8 のジアルキルアミノ基を有するピリジン環であることが好ましく、 A^G が置換基としてジメチルアミノ基を有するピリジン環であることが好適である。

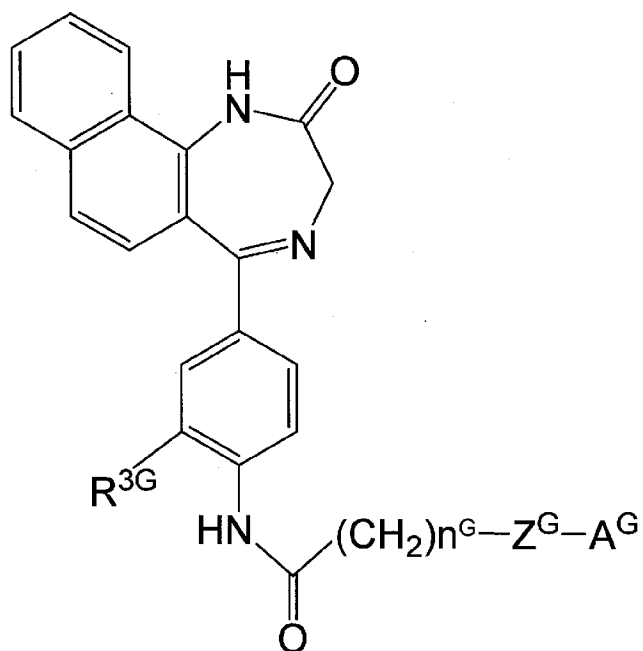
[0310] 上記一般式 (G I) で、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} が水素原子であり、 X^G が N であり、 Y^G が C (=O) であり、実線と破線からなる二重線が単結合であり、 n^G が 0 であり、 Z^G が結合手であり、 A^G が置換基として炭素数 1～8 のジアルキルアミノ基を有するピリジン環であることが好ましく、 A^G が置換基としてジメチルアミノ基を有するピリジン環であることが好適である。

[0311] 一般式 (G I) に包含される代表的化合物を以下に示す。

<代表化合物例 G-100>

[0312]

[化97]

[0313] (式中、 R^{3G} 、 A^G 、 Z^G 及び n^G は表95及び96に記載のとおり)

[0314] [表95]

R^{3G}	n^G	Z^G	A^G
H	2	Bond	Pyridin 2-yl
H	0	Bond	(2-Et, 3-OH)Phenyl
H	0	Bond	(2-Et)Pyridin 3-yl
H	0	Bond	(2-Et, 6-OH)Phenyl
H	0	Bond	(3-Et)Pyridin 2-yl
H	1	O	Pyridin 2-yl
H	1	Bond	(2-OMe)Phenyl
H	2	Bond	Pyridin 3-yl
H	2	Bond	Phenyl
H	2	Bond	Cyclohexyl
H	1	Bond	Pyridin 2-yl

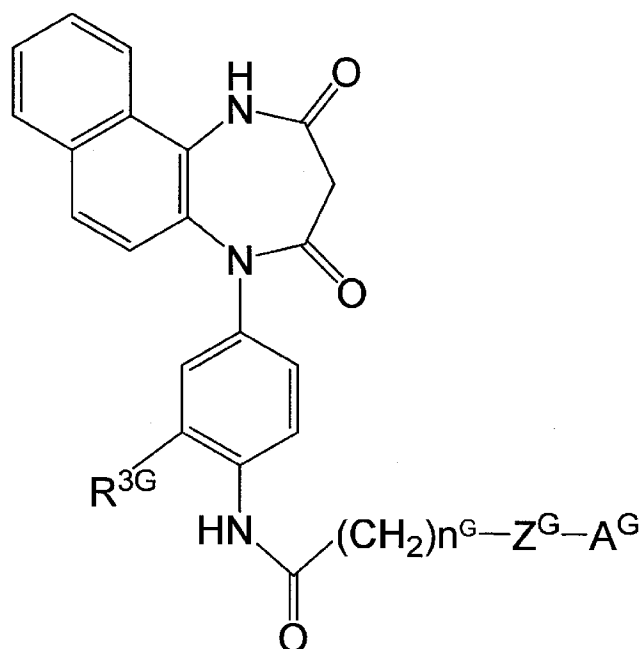
[0315]

[表96]

R^{3G}	n^G	Z^G	A^G
H	1	Bond	Pyridin 3-yl
H	1	Bond	Pyridin 4-yl
H	3	Bond	Pyridin 2-yl
H	1	Bond	(2-NMe ₂)Phenyl
OH	1	O	Pyridin 2-yl
OMe	2	O	Pyridin 2-yl
CN	2	Bond	Pyridin 2-yl
Me	2	Bond	Pyridin 2-yl
CF ₃	1	Bond	Pyridin 2-yl
F	2	Bond	Pyridin 2-yl
H	0	Bond	(2-NMe ₂) pyridin 3-yl
F	2	Bond	Phenyl

[0316] <代表化合物例 G-200>

[0317] [化98]

[0318] (式中、 R^{3G} 、 A^G 、 Z^G 及び n^G は表97及び98に記載のとおり)

[0319]

[表97]

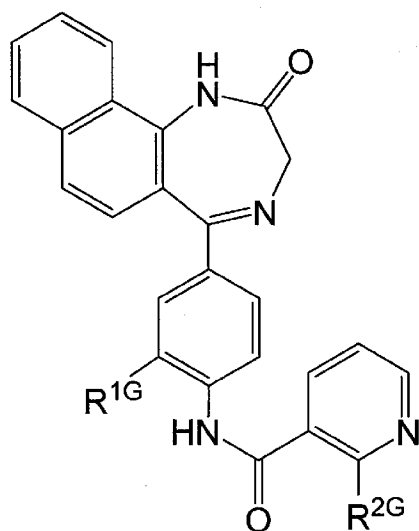
R ^{3G}	n ^G	Z ^G	A ^G
H	2	Bond	Pyridin 3-yl
H	2	Bond	Pyridin 4-yl
F	0	Bond	(2- t Bu) phenyl
H	2	Bond	Pyridin 2-yl
H	0	Bond	(2-NMe ₂) pyridin 3-yl
H	2	Bond	Cyclohexyl
H	1	Bond	Pyridin 2-yl
H	1	Bond	Pyridin 3-yl

[0320] [表98]

R ^{3G}	n ^G	Z ^G	A ^G
H	1	Bond	Pyridin 4-yl
H	3	Bond	Pyridin 2-yl
H	1	Bond	(2-NMe ₂)Phenyl
OH	1	O	Pyridin 2-yl
OMe	2	O	Pyridin 2-yl
CN	2	Bond	Pyridin 2-yl
Me	2	Bond	Pyridin 2-yl
CF ₃	1	Bond	Pyridin 2-yl
F	2	Bond	Pyridin 2-yl
F	2	Bond	Phenyl

[0321] <代表化合物例 G-300>

[0322] [化99]



[0323] (式中、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び塩は表99及び100に記載のとおり)

[0324] [表99]

R^{1G}	R^{2G}	塩
H	NMe ₂	2HCl
H	NMe ₂	2MsOH
H	1H-pyrrol-1-yl	2HCl
H	morpholin-4-yl	2HCl
H	pyrrolidin-1-yl	2HCl
H	iPr	2HCl
H	iPrNH	2HCl
F	NMe ₂	
OH	NMe ₂	
F	1H-pyrrol-1-yl	
OH	morpholin-4-yl	

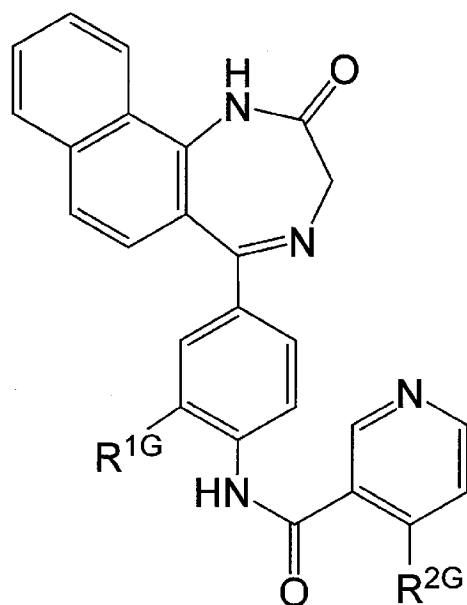
[0325] [表100]

R^{1G}	R^{2G}	塩
F	pyrrolidin-1-yl	
OH	iPr	
F	iPrNH	
H	NEt ₂	
H	NHEt	
F	NHMe	
Me	1H-pyrrol-1-yl	
Me	morpholin-4-yl	
Me	pyrrolidin-1-yl	

[0326] <代表化合物例G-400>

[0327]

[化100]

[0328] (式中、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び塩は表101に記載のとおり)

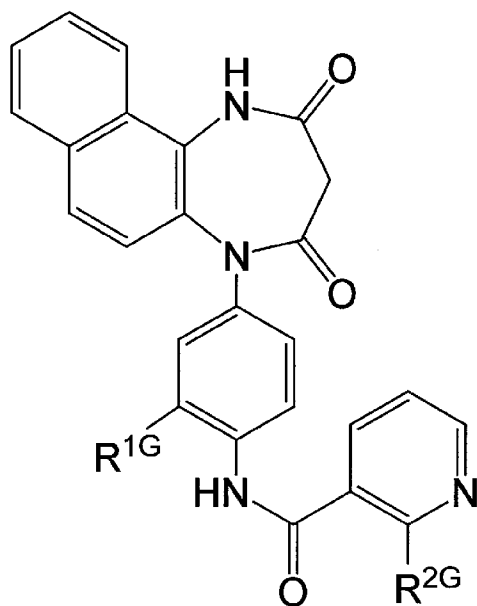
[0329] [表101]

R^{1G}	R^{2G}	塩
H	NMe_2	2HCl
H	1H-pyrrol-1-yl	
H	morpholin-4-yl	
H	pyrrolidin-1-yl	
H	iPr	
H	iPrNH	
F	NMe_2	

[0330] <代表化合物例G-500>

[0331]

[化101]

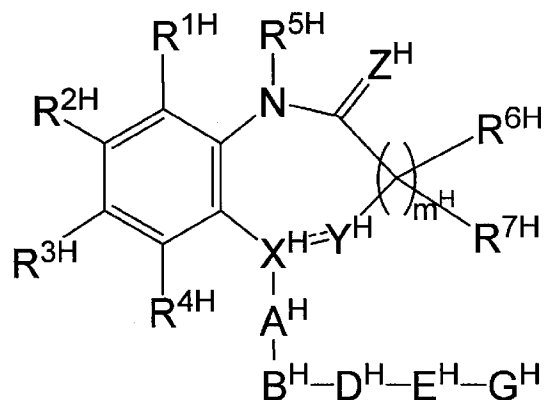
[0332] (式中、R¹G、R²G及び塩は表102に記載のとおり)

[0333] [表102]

R ¹ G	R ² G	塩
H	NMe ₂	HCl
H	morpholin-4-yl	HCl
H	pyrrolidin-1-yl	
H	iPr	
H	iPrNH	
F	NMe ₂	
OH	NMe ₂	
F	1H-pyrrol-1-yl	
OH	morpholin-4-yl	
F	pyrrolidin-1-yl	
OH	iPr	
F	iPrNH	
H	NEt ₂	
H	NHEt	
F	NHMe	
Me	1H-pyrrol-1-yl	
Me	morpholin-4-yl	

[0334] (H-1) 次の一般式 (HI) :

[化102]



(HI)

(式中、 R^{1H} 及び R^{2H} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）を表すか、又は

R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環及びテトラヒドロイソキノリン環から選択される縮合環を形成してもよく、そして R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、 R^{1H} と R^{2H} がそれぞれ結合している炭素原子からなる環には、1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロ

アルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）及びアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8。）から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3H} 及び R^{4H} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8。）を表し、

R^{5H} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、水酸基で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8。）を表し、

R^{6H} 及び R^{7H} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基又はアミノ基を表し、

X^H は C 又は N を表し、

Y^H はN又はC (=O) を表し、

但し、 X^H がCのとき、 Y^H はNを表し、

また、 X^H がNのとき、 Y^H はC (=O) を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

Z^H はO, S 又はNHを表し、

A^H は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、ピラゾール環、イミダゾール環、キノリン環、ベンズイミダゾール環、又はインダン環を表し、

B^H はO, S, NR^{8H} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{8H} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

D^H は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、テトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソキサゾール環、ピラゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

E^H は $-(CR^{9H}R^{10H})_nH-T-$ を表し、

ここで、 R^{9H} 及び R^{10H} は、同一又は異なっていてもよく、水素原子、ヒドロキシ基又は炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{9H} と R^{10H} が一緒になってエチレン鎖を形成してもよく、

n^H は0～8の整数を表し、

T^H はO, S, NR^{11H} 又は結合手を表し、

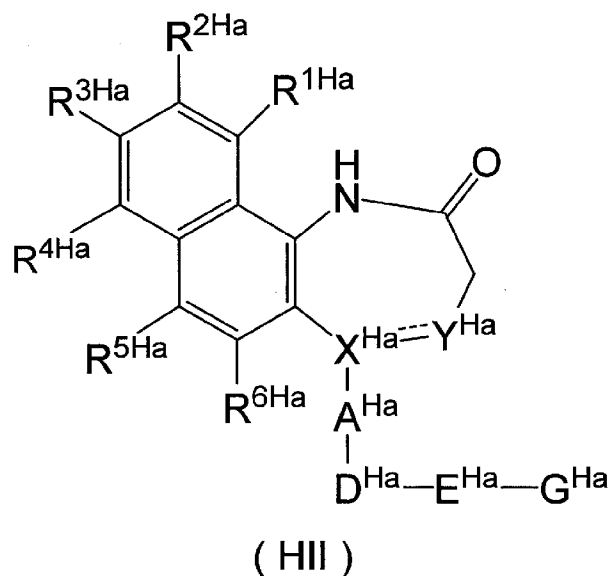
ここで、 R^{11H} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

G^H は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なっていてもよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、チオフェン環、フラン環、チアゾール環、オキサゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、ナフタレン環、キノリン環、キナゾリン環、インドール環、インドリン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

そして、 m^H は0～2の整数を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0335] (H-2) 下記の一般式(H I I) :

[化103]



[0336] (式中、 R^{1Ha} 、 R^{2Ha} 、 R^{3Ha} 、 R^{4Ha} 、 R^{5Ha} 及び R^{6Ha} は同一又は異な
 ってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシク
 ロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基
 、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3の
 ハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒ
 ドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルア
 ミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ
 基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（
 アルコキシ部分の炭素数は1～8。））、置換基を有していてもよいフェニル
 基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基（アリー
 ル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）を表
 し、

X^{Ha} はC又はNを表し、

Y^{Ha} はN又はC(=O)を表し、

但し、 X^{Ha} がCのとき、 Y^{Ha} はNを表し、

また、 X^{Ha} がNのとき、 Y^{Ha} はC(=O)を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

A^{Ha} は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、ピラゾール環、イミダゾール環、キノリン環、ベンズイミダゾール環、又はインダン環を表し、

D^{Ha} は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、テトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソキサゾール環、ピラゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環、又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

E^{Ha} は $-(CR^{9Ha}R^{10Ha})_p-T^{Ha}-$ を表し、

ここで、 R^{9Ha} 及び R^{10Ha} は、同一又は異なり水素原子、ヒドロキシル基又は炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{9Ha} と R^{10Ha} が一緒になってエチレン鎖を形成してもよく、

p は0～8の整数を表し、

T^{Ha} はO, S, NR^{11Ha} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{11Ha} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

G^{Ha} は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアル

ケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基、及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～5個有しているベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、チオフェン環、フラン環、チアゾール環、オキサゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、ナフタレン環、キノリン環、キナゾリン環、インドール環、インドリン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環、又は5～8員のシクロアルキル環を表す。)で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0337] 次に本発明を詳細に説明する。

本明細書において、炭素数1～8のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、*i*-ブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基又はヘキシル基等が挙げられる。

5～8員のシクロアルキル環としては、シクロペンチル環、シクロヘキシル環等が挙げられる。

炭素数3～8のシクロアルキル基としては、シクロプロピル基、シクロヘキシル基等が挙げられる。

炭素数2～8のアルケニル基としては、アリル基等が挙げられる。

炭素数1～8のアルコキシ基としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、*i*-ブトキシ基、*t*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基又はヘキシルオキシ基等が挙げられる。

[0338] 1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基又

はｔ-ブチル基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメチル基、クロロメチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基又は2-フルオロエチル基等が挙げられる。

1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基としては、1～3個のフッ素原子、塩素原子若しくは臭素原子等のハロゲン原子により置換されたメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基又はｔ-ブトキシ基等が挙げられ、好ましくはトリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、2-ブロモエトキシ基又は2-フルオロエトキシ基等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、又は臭素原子等が挙げられる。

[0339] 炭素数1～8のアルキルアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基等が挙げられる。

炭素数2～8のジアルキルアミノ基としては、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が挙げられる。

炭素数2～8のアシルアミノ基としては、アセチルアミノ基が挙げられる。

[0340] 炭素数2～8のアシル基としては、アセチル基等が挙げられる。

アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）としては、メトキシカルボニル基等が挙げられる。

アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）としては、ベンジル基等が挙げられる。

水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基としては、2-ヒドロキシエチル基等が挙げられる。

[0341] 置換基を有していてもよいフェニル基及び置換基を有していてもよいピリジル基が有していてもよい置換基としては、ハロゲン原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数

1～8のアルコキシ基等が挙げられる。

上記一般式 (H I) , (H I I) の E^H , E^{Ha} 中、「 R^{9Ha} と R^{10Ha} が一緒になってエチレン鎖を形成してもよく」とあるが、これは E^H , E^{Ha} 中に二重結合を有してもよいことを意味する。

[0342] 上記一般式 (H I) で表される本発明化合物としては、次に示す化合物が好ましい。

[0343] (H-1-1)

m^H が 1 である上記 (H-1) で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-2)

R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にあってナフタレン環を形成し、前記ナフタレン環は、1～4個の同一又は異なってもよい炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 3～8 のシクロアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択される置換基で置換されていてもよい上記 (H-1) 又は (H-1-1) に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-3)

R^{3H} 及び R^{4H} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミ

ノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-2)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-4)

R^{5H}が水素原子である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-3)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-5)

R^{6H}及びR^{7H}が水素原子である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-4)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0344] (H-1-6)

X^HがNで、Y^HがC(=O)である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-5)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-7)

Z^HがOである上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-6)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0345] (H-1-8)

A^Hが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキル

アミノ基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～4個有しているよいベンゼン環、又はピリジン環である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-7)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-9)

D^Hが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～4個有しているよいテトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、又はピペリジン環である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-8)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-10)

B^Hが結合手である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-9)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-11)

D^Hが窒素原子を介してAと結合している上記(H-1-10)に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-1-12)

E^Hが1～5の炭素原子を有するアルキレン鎖である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-11)のいずれかに記載の化合物、前記化合

物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0346] (H-1-13)

G^Hが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基、及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～5個有しているベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、又は5～7員のシクロアルキル環である上記(H-1)又は(H-1-1)ないし(H-1-12)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0347] (H-1-14)

R^{1H}とR^{2H}が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒になっているナフタレン環又はインダン環を形成し、

そして前記ナフタレン環又はインダン環には、1～4個の同一又は異なっている炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、及びアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）から選択される置換基で置換さ

れていてもよく、

R^{3H} 及び R^{4H} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）であり、

R^{5H} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）であり、

R^{6H} 及び R^{7H} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基又はアミノ基であり、

X^H がNであり、

Y^H がC(=O)であり、

実線と破線からなる二重線が、単結合であり、

Z^H がOであり、

A^H が、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキ

ルアミノ基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環又はピリジン環であり、Bが結合手であり、

D^Hが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～2個有していてもよいテトラゾール環又はイミダゾール環であり、

D^HはD^Hの窒素原子を介してA^Hと結合し、D^Hの炭素原子を介してE^Hと結合しており、

E^Hが $-(CR^{9H}R^{10H})_n-$ であり、

ここで、R^{9H}及びR^{10H}は、同一又は異なっているよく、水素原子、ヒドロキシル基又は炭素数1～8のアルキル基であり、

nが1～8の整数であり、

G^Hが置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基、及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なっているよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環であり、

そして、mが1である上記(H-1)に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0348] (H-1-15)

R^{1H}とR^{2H}が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒に becoming ナフタレン環又はインダン環を形成し、

R^{3H} 及び R^{4H} が水素原子であり

R^{5H} が水素原子であり、

R^{6H} 及び R^{7H} が水素原子であり、

X^H がNであり、

Y^H がC (=O) であり、

実線と破線からなる二重線が単結合であり、

Z^H がOであり、

A^H が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有しているベンゼン環であり、

B^H が結合手であり、

D^H が置換基として、炭素数1～8のアルキル基又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基を1～2個有している良テトラゾール環又はイミダゾール環であり、

D^H が D^H の窒素原子を介して A^H と結合し、 D^H の炭素原子を介して E^H と結合し、

E^H が $-(CR^{9H}R^{10H})_n-$ であり、

ここで、 R^{9H} 及び R^{10H} は、同一又は異なり水素原子、又は炭素数1～8のアルキル基であり、

n が1～4の整数であり、

G^H が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基及びカルバモイル基から選

択される同一又は異なっているいてもよい置換基を 1 ～ 5 個有しているてもよいベンゼン環であり、

そして、 m^H が 1 である上記 (H-1) に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0349] (H-1-16)

R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にな
ってナフタレン環又はインダン環を形成し、

R^{3H} 及び R^{4H} が水素原子であり

R^{5H} が水素原子であり、

R^{6H} 及び R^{7H} が水素原子であり、

X^H がNであり、

Y^H がC (=O) であり、

実線と破線からなる二重線が単結合であり、

Z^H がOであり、

A^H が置換基として、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基及び炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているてもよい置換基を 1 ～ 4 個有しているてもよいベンゼン環であり、

B^H が結合手であり、

D^H が置換基として、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基又は 1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基を 1 ～ 2 個有しているてもよいイミダゾール環であり、

D^H がイミダゾール環の 2 位で A^H と結合し、イミダゾールの窒素原子を介して E^H と結合し、

E^H が $-(CR^{9H}R^{10H})_n-$ であり、

ここで、 R^{9H} 及び R^{10H} は、同一又は異なり水素原子、又は炭素数1～8のアルキル基であり、

n が1～4の整数であり、

G^H が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基及びカルバモイル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環であり、

そして、 m^H が1である上記（H-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0350] （H-2-1）

R^{1Ha} 、 R^{2Ha} 、 R^{3Ha} 、 R^{4Ha} 、 R^{5Ha} 、 R^{6Ha} が、同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、又はヒドロキシル基である上記（H-2）で表される化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

（H-2-2）

X^{Ha} がNで、 Y^{Ha} がC(=O)である上記（H-2）又は（H-2-1）に記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

（H-2-3）

A^{Ha} が、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換され

た炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を 1～4 個有しているベンゼン環、又はピリジン環である上記 (H-2) 又は (H-2-1) ないし (H-2-2) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-2-4)

A^{H^a}が、置換基として、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、及びアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を 1～4 個有しているベンゼン環である上記 (H-2) 又は (H-2-1) ないし (H-2-3) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0351] (H-2-4)

D^{H^a}が置換基として、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を 1～4 個有しているテトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、又はピペリジン環である上記 (H-2) 又は (H-2-1) ないし (H-2-3) のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に

許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-2-5)

D^{Ha}がテトラゾール環である上記(H-2)又は(H-2-1)ないし(H-2-4)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-2-6)

D^{Ha}が窒素原子を介してA^{Ha}と結合している上記(H-2)又は(H-2-1)ないし(H-2-5)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

(H-2-7)

E^{Ha}が1～5の炭素原子を有するアルキレン鎖である上記(H-2)又は(H-2-1)ないし(H-2-6)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物。

[0352] (H-2-8)

G^{Ha}が置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基、及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、又は5～7員のシクロアルキル環である上記(H-2)又は(H-2-1)ないし(H-2-7)のいずれかに記載の化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又

はその水和物若しくは溶媒和物。

[0353] 上記一般式 (H I) で、 A^H が置換基を有していてもよいベンゼン環で、 B^H が結合手の場合、 X^H と D^H はベンゼン環のパラ位にあることが好ましい。

また、上記一般式 (H I) で、 A^H が置換基を有していてもよいピリジン環で、 B^H が結合手の場合、ピリジン環の3位で X^H と結合し、ピリジン環の6位で D^H と結合することが好ましい。

また上記一般式 (H I I) で、 A^{Ha} が置換基を有していてもよいベンゼン環の場合、 X^{Ha} と D^{Ha} はベンゼン環のパラ位にあることが好ましい。

また、上記一般式 (H I I) で、 A^{Ha} が置換基を有していてもよいピリジン環の場合、ピリジン環の3位で X^{Ha} と結合し、ピリジン環の6位で D^{Ha} と結合することが好ましい。

[0354] 上記の一般式 (H I) において、 R^{H1} と R^{H2} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環から選択される縮合環を形成していることが好ましく、ナフタレン環を形成していることが特に好ましい。

[0355] 上記の一般式 (H I) において、 R^{H3} 、 R^{H4} 、 R^{H5} 、 R^{H6} 及び R^{H7} は水素原子を表していることが好ましい。

[0356] 上記の一般式 (H I) において、 X^H はNを表し、 Y^H はC (=O) を表し、実線と破線からなる二重線は、単結合を表し、 Z^H はOを表していることが好ましい。

[0357] 上記の一般式 (H I) において、 A^H はベンゼン環又はピリジン環を表していることが好ましく、ベンゼン環を表していることが特に好ましい。

[0358] 上記の一般式 (H I) において、 B^H は結合手を表していることが好ましい。

[0359] 上記の一般式 (H I) において、 D^H はテトラゾール環又はイミダゾール環を表していることが好ましい。

[0360] 上記の一般式 (H I) において、 E^H は $-(CR^{9H}R^{10H})_nH-T-$ を表し、

ここで、 R^{9H} 及び R^{10H} は、水素原子を表し、 n^H は0～4の整数を表し、 T^H は結合手を表していることが好ましく、この内、 n^H が1又は2の整数を表していることがさらに好ましい。

[0361] 上記の一般式 (H I) において、 G^H は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環又はチオフェン環を表していることが好ましく、

G^H は置換基として、炭素数1～4のアルキル基、炭素数1～4のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基及び炭素数2～4のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環又はチオフェン環を表していることがさらに好ましく、

G^H は置換基として、メチル基、メトキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基及びジメチルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環を表していることが特に好ましい。

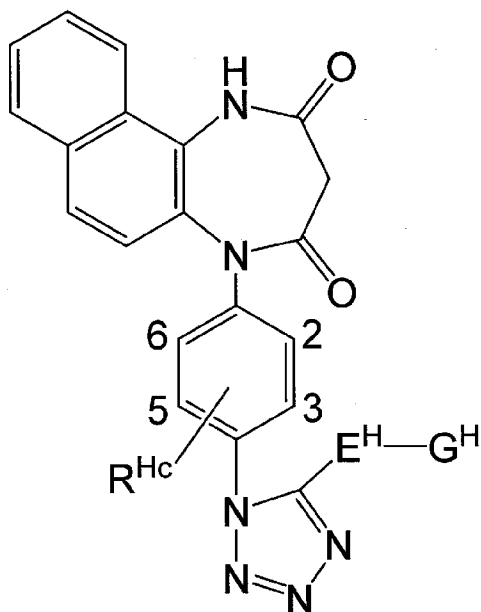
[0362] 上記の一般式 (H I) において、 R^{H1} と R^{H2} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環又はインダン環から選択される縮合環を形成し、 R^{H3} 、 R^{H4} 、 R^{H5} 、 R^{H6} 及び R^{H7} は水素原子を表し、 X^H はNを表し、 Y^H はC(=O)を表し、実線と破線からなる二重線は、単結合を表し、 Z^H はOを表し、 A^H はベンゼン環又はピリジン環を表し、 B^H は結合手を表し、 D^H はテトラゾール環又はイミダゾール環を表し、 E^H は— $(C R^{9H} R^{10H})_n - T -$ を表し、 R^{9H} 及び R^{10H} は、水素原子、 n^H は0～4の整数を及び T^H は結合手を表し、 G^H は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なっているもよい置換基を1～5個有しているもよいベンゼン環又はチオフェン環を表していることが好ましい。

[0363] 上記の一般式 (H I) において、 R^{H1} と R^{H2} が一緒になって、それらが結

合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{H3} 、 R^{H4} 、 R^{H5} 、 R^{H6} 及び R^{H7} は水素原子を表し、 X^H はNを表し、 Y^H はC(=O)を表し、実線と破線からなる二重線は、単結合を表し、 Z^H はOを表し、 A^H はベンゼン環を表し、 B^H は結合手を表し、 D^H はテトラゾール環又はイミダゾール環を表し、 E^H は $-(CR^{9H}R^{10H})_n-T-$ を表し、 R^{9H} 及び R^{10H} は、水素原子、 n^H は1又は2の整数、 T^H は結合手を表し、 G^H は置換基として、メチル基、メトキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基及ジメチルアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を1～5個有しているベンゼン環を表していることが特に好ましい。

[0364] <代表化合物例H-100>

[化104]



[0365] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表103～105に記載のとおり)

[0366]

[表103]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OH)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂	Imidazol 1-yl

[0367] [表104]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Imidazol 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	NH-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -NH	Phenyl
H	CH ₂ -O	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe)Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrimidin 2-yl

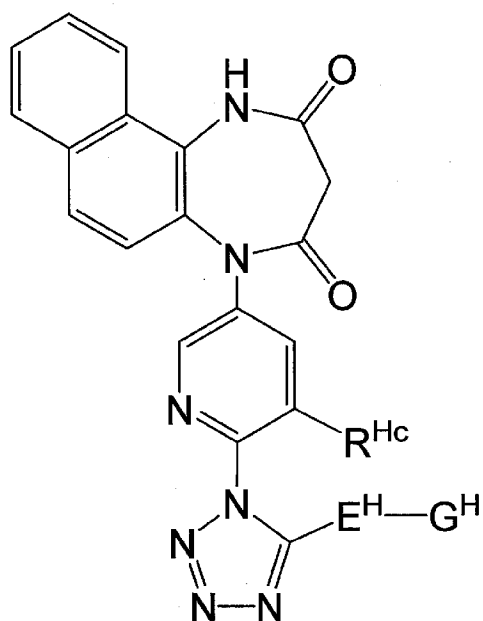
[0368]

[表105]

R^{Hc}	E^H	G^H
H	CH_2-CH_2	Pyrazine 2-yl
H	CH_2-CH_2	Pyridazin 3-yl
H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 3-yl
3-F	$CH(Me)$	(2-OMe)Phenyl
3-Me	CH_2-CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Phenyl
3, 5-F	CH_2	Pyridin 4-yl
3-NH ₂	CH_2	Phenyl
3, 6-F	CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CN	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CF ₃	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0369] <代表化合物例H-200>

[0370] [化105]

[0371] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表106～108に記載のとおり)

[0372]

[表106]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OH)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl

[0373] [表107]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe)Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrimidin 2-yl

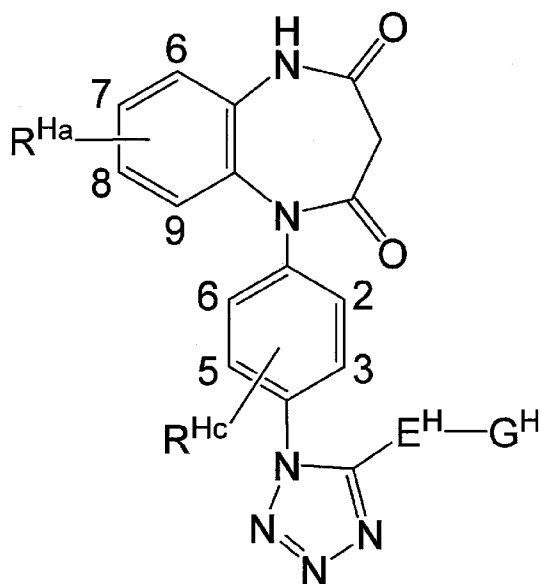
[0374]

[表108]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrazine 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridazin 3-yl
H	CH ₂ -C (Me) ₂	Pyridin 3-yl
F	CH (Me)	(2-OMe)Phenyl
Me	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
OMe	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
F	CH ₂	Pyridin 4-yl
Me	CH ₂	Phenyl
OMe	CH ₂	Pyridin 3-yl
F	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
CN	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
F	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl

[0375] <代表化合物例H-300>

[0376] [化106]



[0377] (式中、 R^{Ha} 、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表109～111に記載のとおり)

[0378]

[表109]

$R^{H a}$	$R^{H c}$	E^H	G^H
7-OMe	H	CH_2	(2-OMe)Phenyl
6-OMe	H	CH_2	(2-OH)Phenyl
6, 7-OMe	H	CH_2-CH_2	Pyridin 3-yl
7-Me	H	CH_2-CH_2	Phenyl
7-Et	H	CH_2	Pyridin 4-yl
7-Pr	H	CH_2	Phenyl
7-iPr	H	CH_2	Pyridin 3-yl
7-tBu	H	CH_2-CH_2	Cyclohexyl
7-CN	H	CH_2-CH_2	Pyridin 4-yl
7-CF ₃	H	CH_2	Pyridin 2-yl
7-OCF ₃	H	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0379] [表110]

$R^{H a}$	$R^{H c}$	E^H	G^H
7, 8-OMe	H	CH_2	Imidazole 1-yl
6, 7-Me	H	CH_2-CH_2	Imidazole 1-yl
6, 7-Cl	H	CH_2-CH_2	(2-OMe)Phenyl
7, 8-Me	H	CH_2	(2-OMe)Phenyl
7, 8-Et	H	$CH_2-CH_2-CH_2$	Phenyl
7-Cl	H	CH_2	(6-F) Pyridin 2-yl
6-OMe	H	CH_2-CH_2	(6-F) Pyridin 2-yl
6, 7-OMe	H	$C(Me)_2$	(2-OMe)Phenyl
7-Me	H	$C(Me)-CH_2$	Pyridin 2-yl
7-Et	H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 2-yl
7-Pr	H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 3-yl

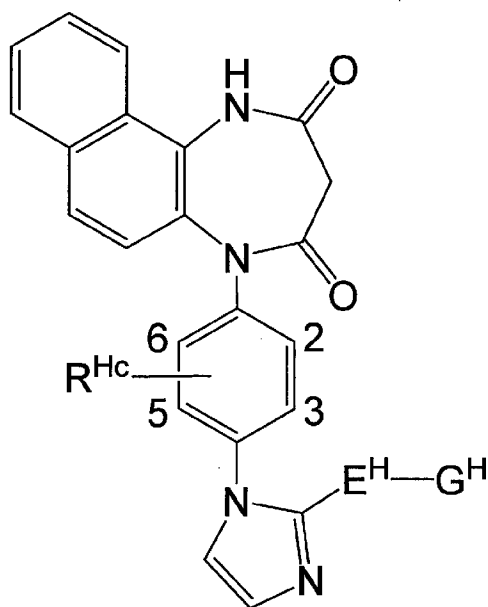
[0380]

[表111]

R^{Ha}	R^{Hc}	E^{H}	G^H
7-iPr	3-F	CH(Me)	(2-OMe)Phenyl
7-tBu	3-Me	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
7-CN	3-OMe	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
7-CF ₃	3, 5-F	CH ₂	Pyridin 4-yl
7-OCF ₃	3-NH ₂	CH ₂	Phenyl
7, 8-OMe	3, 6-F	CH ₂	Pyridin 3-yl
6, 7-Me	3-OMe	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
6, 7-Et	3-CN	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
7, 8-Me	3-CF ₃	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl

[0381] <代表化合物例H-400>

[0382] [化107]

[0383] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表112～114に記載のとおり)

[0384]

[表112]

R ^{hc}	E ^h	G ^h
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OH)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-CF ₃)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-F)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl

[0385] [表113]

R ^{hc}	E ^h	G ^h
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(4-SO ₂ Me) Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	(4-F) Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	(4-CF ₃)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	(4-CONH ₂)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe)Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrimidin 2-yl

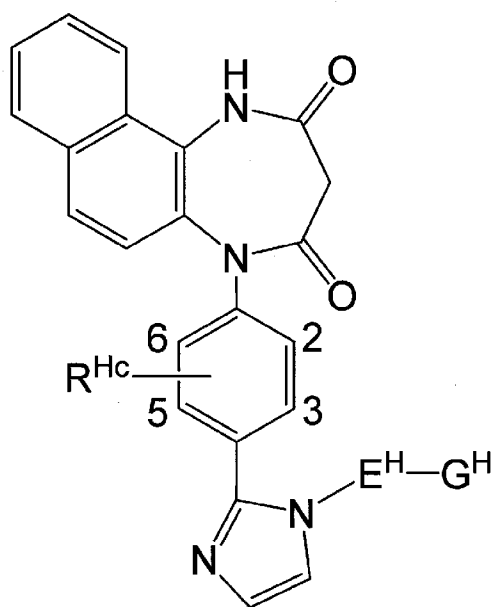
[0386]

[表114]

R^{Hc}	E^H	G^H
H	CH_2-CH_2	Pyrazin 2-yl
H	CH_2-CH_2	Pyridazin 3-yl
H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 3-yl
3-F	$CH(Me)$	(2-OMe)Phenyl
3-Me	CH_2-CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Phenyl
3, 5-F	CH_2	Pyridin 4-yl
3-NH ₂	CH_2	Phenyl
3, 6-F	CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CN	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CF ₃	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0387] <代表化合物例H-500>

[0388] [化108]

[0389] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表115～117に記載のとおり)

[0390]

[表115]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OH)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl

[0391] [表116]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe)Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrimidin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrazin 2-yl

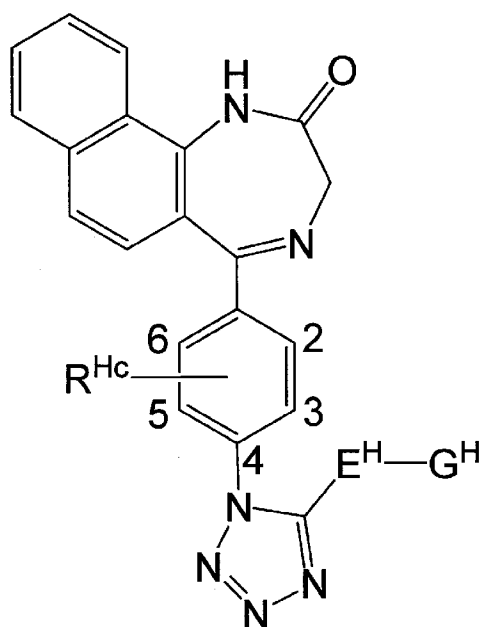
[0392]

[表117]

R^{Hc}	E^H	G^H
H	CH_2-CH_2	Pyridazin 3-yl
H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 3-yl
3-F	$CH(Me)$	(2-OMe)Phenyl
3-Me	CH_2-CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Phenyl
3,5-F	CH_2	Pyridin 4-yl
3-NH ₂	CH_2	Phenyl
3,6-F	CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CN	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CF ₃	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0393] <代表化合物例H-600>

[0394] [化109]

[0395] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表118～120に記載のとおり)

[0396]

[表118]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OH)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂	Imidazol 1-yl

[0397] [表119]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Imidazol 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe)Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe)Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 3-yl
3-F	CH(Me)	(2-OMe)Phenyl
3-Me	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl

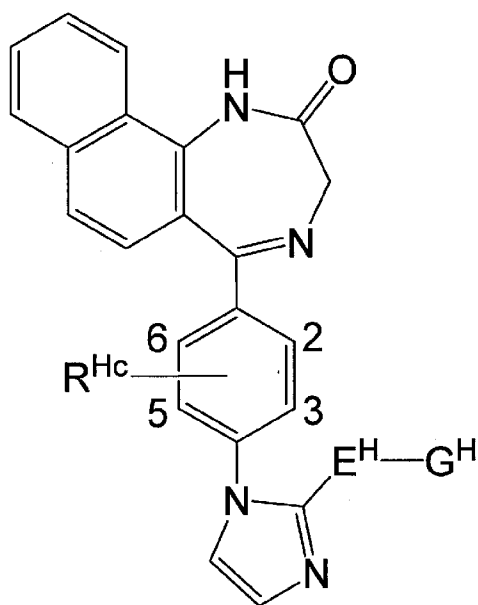
[0398]

[表120]

R^{Hc}	E^H	G^H
3-OMe	CH_2-CH_2	Phenyl
3, 5-F	CH_2	Pyridin 4-yl
3-NH ₂	CH_2	Phenyl
3, 6-F	CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CN	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CF ₃	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0399] <代表化合物例H-700>

[0400] [化110]

[0401] (式中、 R^{Hc} 、 E^H 及び G^H は表121～123に記載のとおり)

[0402]

[表121]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe) Phenyl
H	CH ₂	(2-OH) Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	Pyridin 3-yl
H	CH ₂	Cyclohexyl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 4-yl
H	CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyridin 2-yl

[0403] [表122]

R ^{Hc}	E ^H	G ^H
H	CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Imidazole 1-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(2-OMe) Phenyl
H	CH ₂	(2-OMe) Phenyl
H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	Phenyl
H	CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	(6-F) Pyridin 2-yl
H	C(Me) ₂	(2-OMe) Phenyl
H	C(Me)-CH ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -C(Me) ₂	Pyridin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrimidin 2-yl
H	CH ₂ -CH ₂	Pyrazin 2-yl

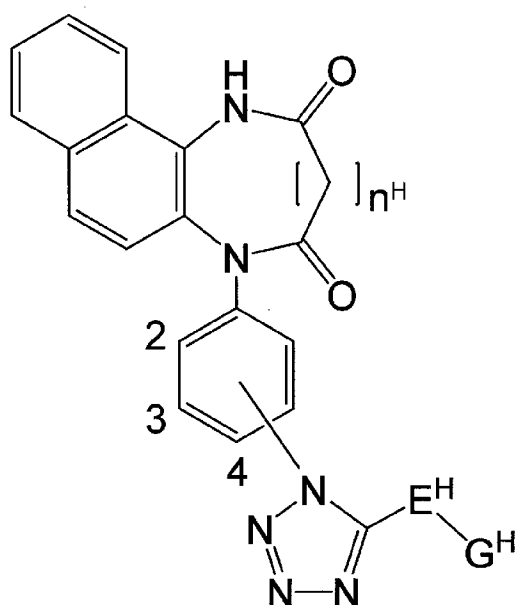
[0404]

[表123]

R^{Hc}	E^H	G^H
H	CH_2-CH_2	Pyridazin 3-yl
H	$CH_2-C(Me)_2$	Pyridin 3-yl
3-F	$CH(Me)$	(2-OMe)Phenyl
3-Me	CH_2-CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Phenyl
3, 5-F	CH_2	Pyridin 4-yl
3-NH ₂	CH_2	Phenyl
3, 6-F	CH_2	Pyridin 3-yl
3-OMe	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CN	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl
3-CF ₃	CH_2-CH_2	Pyridin 2-yl

[0405] <代表化合物例H-800>

[0406] [化111]



[0407] (式中、テトラゾール環の置換位置、 E^H-G^H 、 n^H 及び塩は表124に記載のとおり)

[0408]

[表124]

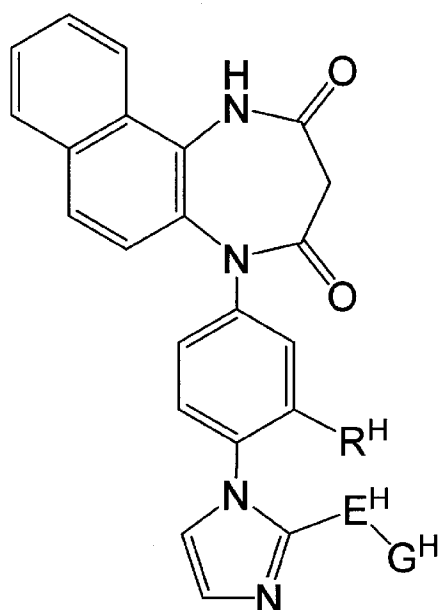
テトラゾール 環の置換位置	$E^H - G^H$	n^H	塩
3	$CH_2CH_2(2-Py)$	0	
4	$CH_2CH_2(6-methylpyridin-2-yl)$	1	
4	$CH_2CH_2(3-CN)Ph$	1	
4	$CH_2CH_2(3-CONH_2)Ph$	1	
4	$CH_2CH_2(2-methoxypyridin-3-yl)$	1	
4	$CH_2(2-NMe_2)Ph$	1	MsOH
4	$CH_2C(Me)_2(2-Py)$	1	HCl
4	$CH_2CH_2(3-methoxypyridin-2-yl)$	1	HCl
3	$CH_2CH_2CH_2(6-methylpyridin-2-yl)$	1	
3	$CH_2CH_2CH_2(3-CN)Ph$	1	
3	$CH_2CH_2CH_2(3-CONH_2)Ph$	1	
3	$CH_2CH_2CH_2(2-methoxypyridin-3-yl)$	1	
3	$CH_2CH_2(2-NMe_2)Ph$	1	
3	$CH_2CH_2C(Me)_2(2-Py)$	0	
3	$CH_2CH_2CH_2(3-methoxypyridin-2-yl)$	0	

[0409] <代表化合物例 H-900>

ナフタレン型

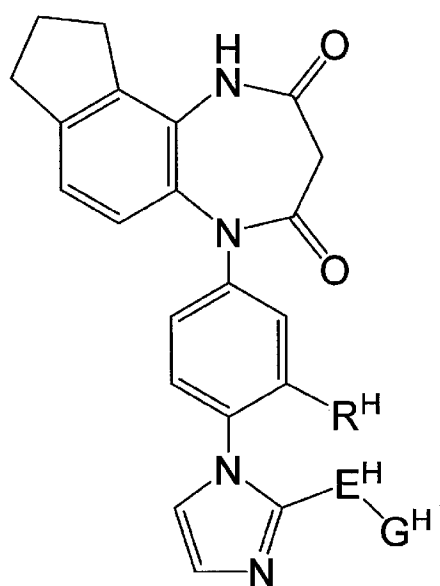
[0410]

[化112]



[0411] インダン型

[0412] [化113]

[0413] (式中、 E^H-G^H 、 R^H 及び塩は表125及び126に記載のとおり)

[0414]

[表125]

ナフタレン型 or イ ンダン型	E^H-G^H	R^H	塩
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-OMe)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-CF_3)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2, 6-Me)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-CF_3)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-CN)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-CONH_2)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-CN)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-CONH_2)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-CN)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-CONH_2)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-CONH_2)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-SO_2Me)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-OMe, 2-F)Ph$	H	HCl

[0415]

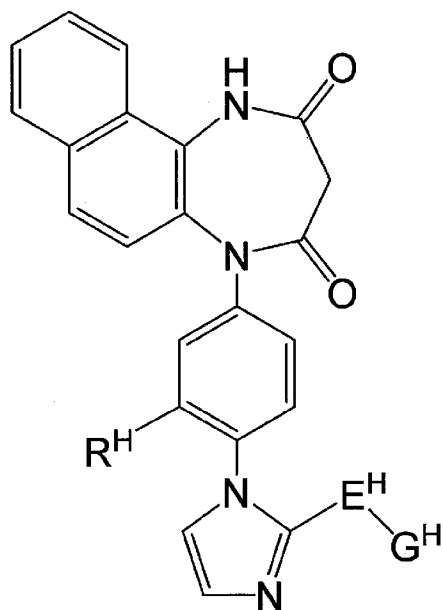
[表126]

ナフタレン型 or インダン型	E^H-G^H	R^H	塩
インダン型	$CH_2CH_2(3-OMe, 2-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-thienyl)$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-furanyl)$	H	HCl
インダン型	$CH_2CH_2(2-F)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-Pyridyl)$	H	2HCl
インダン型	$CH_2CH_2(3-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-OMe, 3-F)Ph$	H	HCl
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-F)Ph$	F	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-OMe)Ph$	OH	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-F)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2-F)Ph$	F	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-CF_3)Ph$	OH	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(2, 6-Me)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-CF_3)Ph$	F	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	OH	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	H	
ナフタレン型	$CH_2CH_2(4-CN)Ph$	F	
インダン型	$CH_2CH_2(2, 6-Me)Ph$	H	
インダン型	$CH_2CH_2(3-CF_3)Ph$	F	
インダン型	$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	OH	
インダン型	$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	H	
インダン型	$CH_2CH_2(4-CN)Ph$	F	

[0416] <代表化合物例H-1000>

[0417]

[化114]



[0418] (式中、E^H-G^H、R^H及び塩は表127に記載のとおり)

[0419]

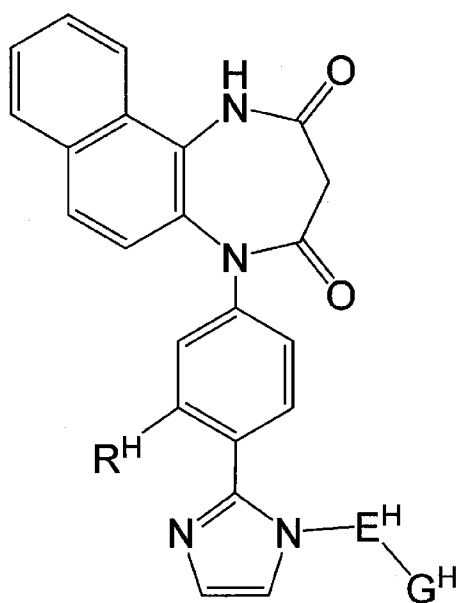
[表127]

E^H-G^H	R^H
bond-Ph	H
bond-(2-OMe)Ph	H
CH_2OPh	H
NH-(2-OMe)Ph	H
NH-Ph	H
CH_2SPh	F
CH_2NHPh	OH
bond-(2-F)Ph	F
bond-(2CF ₃)Ph	OH
bond-(2Cl)Ph	F
bond-(2-Me)Ph	OH
bond-(2, 6-Me)Ph	F
bond-(2, 6-F)Ph	OH
bond-(2-OH)Ph	F
$CH_2O(2-F)Ph$	OH
NH-(2, 6-Me)Ph	F
NH-(2CF ₃)Ph	OH
bond-(3-F)Ph	F

[0420] <代表化合物例 H-1100>

[0421]

[化115]



[0422] (式中、 $\text{E}^{\text{H}}-\text{G}^{\text{H}}$ 、 R^{H} 及び塩は表128に記載のとおり)

[0423]

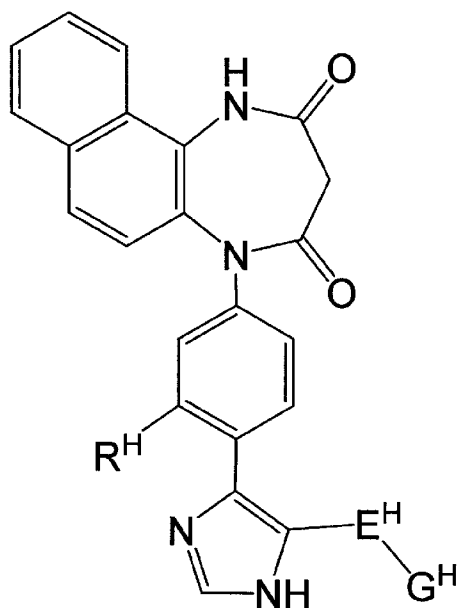
[表128]

E^H-G^H	R^H	塩
CH_2CH_2Ph	H	HCl
$CH_2(4-Cl)Ph$	H	HCl
$CH_2(2-OMe)Ph$	H	
$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	H	
$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	H	HCl
$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	H	
$CH_2(2, 4, 6-Me)Ph$	H	HCl
$CH_2(2-CF_3)Ph$	H	HCl
$CH_2(2-CN)Ph$	H	
$CH_2(2-CONH_2)Ph$	H	
$CH_2(2-NH_2)Ph$	H	
CH_2CH_2Ph	OMe	
CH_2CH_2Ph	OH	
$CH_2(3-CN)Ph$	H	
$CH_2(3-CONH_2)Ph$	H	
$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-F)Ph$	H	
$CH_2CH_2(2-F)Ph$	F	
$CH_2CH_2(2-F)Ph$	H	

[0424] <代表化合物例 H-1200>

[0425]

[化116]

[0426] (式中、 E^H-G^H 、 R^H 及び塩は表129に記載のとおり)

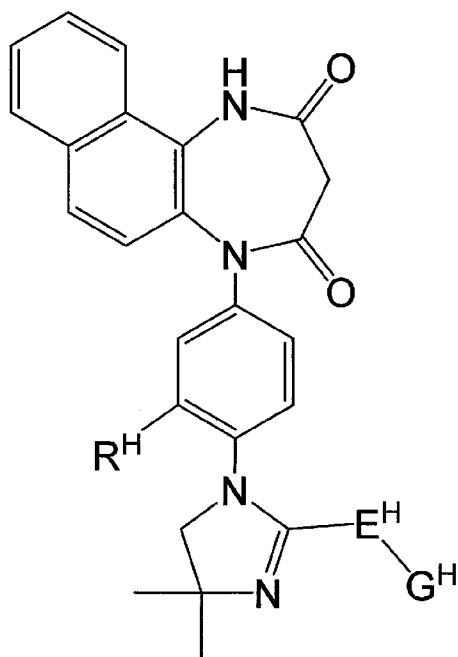
[0427] [表129]

E^H-G^H	R^H	塩
bond-Ph	H	HCl
CH_2CH_2Ph	H	HCl
$CH_2CH_2(2-F)Ph$	H	
$CH_2CH_2(3-F)Ph$	F	
$CH_2CH_2(2-OMe)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	F	
$CH_2CH_2(2-OH)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	F	

[0428] <代表化合物例H-1300>

[0429]

[化117]

[0430] (式中、 E^H-G^H 、 R^H 及び塩は表130に記載のとおり)

[0431] [表130]

E^H-G^H	R^H	塩
CH_2CH_2Ph	H	HCl
$CH_2CH_2(2-F)Ph$	H	
$CH_2CH_2(3-F)Ph$	F	
$CH_2CH_2(2-OMe)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-OMe)Ph$	F	
$CH_2CH_2(2-OH)Ph$	F	
$CH_2CH_2(3-OH)Ph$	F	

[0432] 上記の一般式 (A I) 及び (A I I) で表される化合物は国際公開 2010/093061 に開示されており、一般式 (B I) ないし (B I I I) で表される化合物は国際公開 2012/008478 に開示されており、一般式 (C I) 及び (C I I) で表される化合物は国際公開 2012/014910 に開示されており、一般式 (D I) 及び (D I I) で表される化合物は国際公開 2012/017876 に開示されているので、これらの国際公開

を参照することにより、これらの化合物をいずれも容易に入手することができる。これらの国際公開の開示の全てを参照により本明細書の開示として含める。

また、一般式 (A 1) の一部 (例えば実施例化合物 A 2 0 及び A 2 1) は、国際公開 2 0 1 0 / 0 9 3 0 6 1 に開示されていないが、国際公開 2 0 0 8 / 0 2 3 8 4 7 及び国際公開 2 0 1 0 / 0 9 3 0 6 1 に記載の合成スキームの (方法 3) 若しくは国際公開 2 0 1 2 / 0 1 7 8 7 6 の (合成方法 2) 段落 [0 0 5 4] ないし [0 0 6 0] を参照することにより、これらの化合物をいずれも容易に入手することができる。これらの国際公開の開示の全てを参照により本明細書の開示として含める。

[0433] なお、上記一般式 (E 1) で表される化合物は、上記一般式 (A 1) ないし (D 1 1) で表される化合物の一部に該当するため、国際公開 2 0 0 8 / 0 2 3 8 4 7、国際公開 2 0 1 0 / 0 9 3 0 6 1、国際公開 2 0 1 2 / 0 0 8 4 7 8、国際公開 2 0 1 2 / 0 1 4 9 1 0 及び国際公開 2 0 1 2 / 0 1 7 8 7 6 の国際公開を参照することにより、これらの化合物をいずれも容易に入手することができる。

[0434] また、上記一般式 (F 1) 及び (F 1 1) で表される化合物は国際公開 2 0 1 3 / 1 0 5 6 0 8 に開示されており、一般式 (G 1) で表される化合物は国際公開 2 0 1 5 / 0 0 5 4 6 7 に開示されているので、これらの国際公開を参照することにより、これらの化合物をいずれも容易に入手することができる。これらの国際公開の開示の全てを参照により本明細書の開示として含める。

[0435] また、上記一般式 (H 1) 及び (H 1 1) で表される化合物は国際公開 2 0 1 5 / 0 0 5 4 6 8 に開示されているので、これらの国際公開を参照することにより、これらの化合物をいずれも容易に入手することができる。これらの国際公開の開示の全てを参照により本明細書の開示として含める。

[0436] また、上記国際公開 2 0 1 0 / 0 9 3 0 6 1、国際公開 2 0 1 2 / 0 0 8 4 7 8、国際公開 2 0 1 2 / 0 1 4 9 1 0、国際公開 2 0 1 2 / 0 1 7 8 7

6、国際公開2013/105608、国際公開2015/005467及び国際公開2015/005468には、上記一般式(A1)から(H11)で表される化合物が、P2X4受容体拮抗作用を有する旨の記載がある。

[0437] なお、上記一般式(A1)ないし(H11)で表される化合物に包含される好適な化合物又はその薬学的に許容される塩の具体例を以下に示すが、本発明の医薬の有効成分に利用可能な化合物又はその薬学的に許容される塩はこれらに限定されることはない。

(化合物A1) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン；

(化合物A2) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩；

(化合物A3) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン カリウム塩；

(化合物A4) 5-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン；

(化合物A5) 5-[4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩；

(化合物A6) 1-メチル-5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン；

(化合物A7) 1,3-ジメチル-5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン；

(化合物A 8) 5-[2-クロロ-5-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 9) 5-[2-クロロ-5-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物A 10) 5-[2-メチル-5-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

[0438] (化合物A 11) 5-[2-メチル-5-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物A 12) 5-[2-ブロモ-5-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 13) 5-[3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 14) 5-[3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 15) 5-[3-(5-オキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 16) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A 17) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オ

キサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物A18) 5-[3-(オキサゾール-2-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 及び

(化合物A19) 5-[3-(1H-ピラゾール-4-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物A20) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン;

[0439] (化合物A21) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン ナトリウム塩;

(化合物A22) 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 及び

(化合物A23) 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩。

[0440] (化合物B1) 5-(3-シアノフェニル)-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物B2) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物B3) 5-(3-ヒドロキシフェニル)-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H

, 5 H) - ジオン ;

(化合物 B 4) 5 - (3 - シアノフェニル) - 5, 8, 9, 10 - テトラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ;

(化合物 B 5) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 5, 8, 9, 10 - テトラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(化合物 B 6) 5 - [3 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 5, 8, 9, 10 - テトラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ;

(化合物 B 7) 5 - [3 - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 5, 8, 9, 10 - テトラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ;

(化合物 B 8) 5 - (3 - t e r t - ブトキシカルボニルアミノフェニル) - 1, 5, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 - ジオン ;

(化合物 B 9) 5 - (3 - アミノフェニル) - 1, 5, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 - ジオン 塩酸塩 ;

(化合物 B 10) 5 - [3 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1, 5, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 - ジオン ;

[0441] (化合物 B 11) 5 - [3 - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1, 5, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 - ジオン ;

(化合物 B 12) 5 - (4 - アミノフェニル) - 1, 5, 8, 9, 10, 11 - ヘキサヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 - ジオン ;

(化合物B 1 3) 5-(4-メチルアミノフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン 塩酸塩;

(化合物B 1 4) 5-(2, 3-ジヒドロベンゾ[1, 4]ジオキシ-6-イル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 1 5) 5-(4-メトキシフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 1 6) 5-(4-ヒドロキシフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 1 7) 5-[4-(イソプロピルカルボニルアミノ)フェニル]-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 1 8) 5-(3-カルバモイルフェニル)-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ[6, 7-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 1 9) 1-アセチル-5-[3-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ[6, 7-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(化合物B 2 0) 5-[3-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ[6, 7-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン; 及び

[0442] (化合物B 2 1) 5-[3-(5-フェニル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ[6, 7-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン。

[0443] (化合物C 1) 4-(3-シアノフェニル)-1,4-ジヒドロベンゾ
[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 2) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]
-1,4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン ナトリ
ウム塩;

(化合物C 3) 4-(3-メトキシフェニル)-1,4-ジヒドロベン
ゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 4) 4-(3-ヒドロキシフェニル)-1,4-ジヒドロベ
ンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン ナトリウム塩;

(化合物C 5) 5-(3-メトキシフェニル)-1,4,7,8,9,
10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 6) 5-(3-ヒドロキシフェニル)-1,4,7,8,9,
10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 7) 4-(3-アミノフェニル)-1,4,7,8,9,1
0-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩酸塩;

(化合物C 8) 4-(1H-インドール-4-イル)-1,4,7,8,
9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 9) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,
10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-4(1H)-イル)フェニ
ル]-2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(化合物C 10) 4-(3-メチルアミノフェニル)-1,4,7,8,
9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩
酸塩;

[0444] (化合物C 11) 1-メチル-4-(3-メチルアミノフェニル)-1
,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-
ジオン 塩酸塩;

(化合物C 12) 4-(3-フルオロフェニル)-1,4-ジヒドロベ
ンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(化合物C 1 3) 4 - (3 - アミノフェニル) - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン 塩酸塩 ;

(化合物C 1 4) 4 - [3 - [(2 - ヨードフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ;

(化合物C 1 5) 4 - [3 - (5 - メチル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ;

(化合物C 1 6) 4 - [3 - (3 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イル) フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ;

(化合物C 1 7) 4 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ナトリウム塩 ;

(化合物C 1 8) 4 - (4 - アミノフェニル) - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン 塩酸塩 ;

(化合物C 1 9) N - [4 - (2, 3 - ジオキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 4 (1 H) - イル) フェニル] - 2 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(化合物C 2 0) 4 - [4 - (5 - メチル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ;

[0445] (化合物C 2 1) 4 - [3 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] - 2, 3, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾ [f] キノキサリン - 2, 3 - ジオン ;

(化合物C 2 2) N - [3 - (2, 3 - ジオキソ - 2, 3, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾ [f] キノキサリン - 4 - イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド ;

(化合物C 2 3) 3 - ブロモ - N - [3 - (2, 3 - ジオキソ - 2, 3

， 7， 8， 9， 10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]ベンゼンスルホンアミド；

(化合物C24) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]-1-ナフタレンスルホンアミド；

(化合物C25) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]-2-ナフタレンスルホンアミド；

(化合物C26) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]-2-チオフェンスルホンアミド；

(化合物C27) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]-3-ピリジンスルホンアミド 塩酸塩；

(化合物C28) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル)フェニル]-8-キノリンスルホンアミド 塩酸塩；及び

(化合物C29) 4-[3-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]-2,3,7,8,9,10-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン。

[0446] (化合物D1) 4-(3-シアノフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン；

(化合物D2) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン ナトリウム塩；

(化合物D3) 4-(3-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン；

(化合物D4) 4-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン ナトリウム塩；

(化合物D5) 4-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン;

(化合物D6) 4-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン ナトリウム塩;

(化合物D7) 4-(3-アミノフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン 塩酸塩;及び

(化合物D8) N-[3-(2-オキソ-1,2-ジヒドロベンゾ[h]キナゾリン-4-イル)フェニル]ベンゼンスルホンアミド。

[0447] (化合物E1) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン;

(化合物E2) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物E3) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン カリウム塩;

(化合物E4) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン;

(化合物E5) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩;

(化合物E6) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-2-オン;

(化合物E7) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-

2-オン ナトリウム塩；

(化合物E 8) 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン；

(化合物E 9) 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩；

(化合物E 10) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン；

[0448] (化合物E 11) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩；

(化合物E 12) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2, 3-ジオン；

(化合物E 13) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2, 3-ジオン ナトリウム塩；

(化合物E 14) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン；及び

(化合物E 15) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン ナトリウム塩。

[0449] (化合物F 1) 5-(4-ベンゾイルアミノフェニル)-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン；

(化合物F 2) 5-[4-[2-(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノフェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン；

(化合物F 3) 5-[4-(3-ブロモベンゾイル)アミノフェニル]

ー1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 4) 5 - [4 - [4 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 5) 5 - [4 - (2-メチルベンゾイル) アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 6) 5 - [4 - (2, 6-ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 7) 5 - [4 - (2, 6-ジクロロベンゾイル) アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 8) 5 - [4 - (3-クロロベンゾイル) アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 9) 5 [4 - (2-フェニルアセチルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 10) 1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -3-フェニルチオ尿素 ;

[0450] (化合物 F 11) 5 - [4 - (2, 3-ジメトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 12) 5 - [4 - (2-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H,

5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3) 5 - [4 - [(2 -クロロフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4) 5 - [4 - (2 , 3 -ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 5) 5 - [4 - (2 , 5 -ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 6) 5 - [4 - (5 -ブromo - 2 -クロロベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 7) 5 - [4 - (2 , 4 -ジクロロベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 8) 5 - [4 - (2 -ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 9) 5 - [4 - (2 , 3 -ジヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 0) 1 - [4 - (2 , 4 -ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 -テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 -イル) フェニル] - 3 -フェニル尿素 ;

[0451] (化合物 F 2 1) 5 - [4 - [(2 , 6 -ジクロロフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 2 , 4 (3 H , 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 2) 5- [4- [(2-メトキシフェニルアセチル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 3) 5- [4- [(2-ヒドロキシフェニルアセチル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 4) 1- (2-クロロフェニル) -3- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] チオ尿素 ;

(化合物 F 2 5) 5- [4- [3- (トリフルオロメチル) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 6) 5- [4- [2- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] アセチルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 7) 1- (2-クロロフェニル) -3- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] 尿素 ;

(化合物 F 2 8) 5- [4- [(2-フェニルプロピオニル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 9) 5- [4- (2-クロロ-3-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 3 0) 5- [4- (3-フェニルプロピオニルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

[0452] (化合物 F 3 1) 5- [4- [(1H-インドール-3-カルボニル)

アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 2) 5 - [4 - (2 - クロロ - 3 - ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 3) 5 - [4 - [(2 - メチル - 2 - フェニルプロピオニル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 4) 5 - [4 - (2 - フェノキシアセチルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 5) 5 - [4 - [2 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 6) 5 - [4 - [(1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボニル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 7) 5 - [4 - [2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 8) 5 - [4 - [2 - (2 - クロロ - 4 - ヒドロキシフェニル) アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 3 9) 5 - [4 - (3 - フェニルプロペニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 0) 5 - [4 - [(3 - ピリジルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H

, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

[0453] (化合物 F 4 1) 5 - [4 - (1 H - ベンズイミダゾール - 2 - カルボニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 2) 1 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 7 - メトキシ - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 3) 5 - [4 - [(ベンゾイルアミノ) メチル] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 4) 5 - [4 - [(2 - クロロベンゾイルアミノ) メチル] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 5) 1 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 7 - ヒドロキシ - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 6) 5 - [4 - (2 - クロロベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 7) 5 - [4 - (2 - ブロモベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 8) 5 - [4 - (2 - ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 4 9) 5 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) - 3 - フルオロフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 5 0) 5-[4-[2-(2-メチルフェニル)アセチルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

[0454] (化合物 F 5 1) 5-[4-[(キノキサリン-2-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 2) 5-[4-[(5-メチルチオフェン-2-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 3) 5-[3-[(2-クロロフェニルアセチル)アミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 4) 5-[4-[(2, 4, 6-トリメチルベンゾイル)アミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 5) 5-[4-(シクロヘキシルカルボニルアミノ)フェニル]-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 6) 1-[4-(2, 3-ジメチルベンゾイル)アミノフェニル]-6-メチル-1H-1, 5-ベンゾジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 7) 5-[4-[(2-エチルベンゾイル)アミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 8) 5-[4-[(6-メチルピリジン-2-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 5 9) 5-[4-[(2-メチルピリジン-3-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 0) 1-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]-3-(2-メチルフェニル)チオ尿素;

[0455] (化合物 F 6 1) 5-[4-(2-メトキシ-3-メチルベンゾイル)アミノフェニル]-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 2) 5-[4-(2, 3-ジクロロベンゾイル)アミノフェニル]-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 3) 5-[4-(2, 3-ジメチルベンゾイルアミノ)-3-ヒドロキシフェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 4) 5-[4-(2-クロロ-3-メトキシベンゾイルアミノ)フェニル]-1, 3-ジヒドロナフト[1, 2-e]-1, 4-ジアゼピン-2-オン;

(化合物 F 6 5) 5-[4-[(4-ジメチルアミノベンゾイル)アミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 6) 5-[4-[2-(2, 4-ジクロロフェノキシ)アセチルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物 F 6 7) 5-[4-[2-(2-メチルフェノキシ)アセチルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-

2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 6 8) N - [4 - (2, 4 -ジオキソ - 1, 2, 3, 4 -テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) ブチル] - 2 - クロロ - 3 - メトキシベンズアミド ;

(化合物 F 6 9) 5 - [4 - (2 - クロロ - 3 - ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1, 3 - ジヒドロナフト [1, 2 - e] - 1, 4 - ジアゼピン - 2 - オン ;

(化合物 F 7 0) 5 - [4 - (2 - アセチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

[0456] (化合物 F 7 1) 5 - [4 - (2 - t e r t - ブチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 2) 5 - [2 - (2 - ヨードベンゾイル) アミノエチル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 3) 5 - [3 - [(2 - ヨードベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 4) 6, 7 - ジメチル - 1 - [4 - (2 - ヨードベンゾイル) アミノフェニル] - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 5) 5 - [4 - [(1 - メチルピペリジン - 4 - イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(化合物 F 7 6) 5 [4 - [(ベンゾフラン - 2 - イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 7) 5 - [4 - [(1 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 8) 5 - [4 - (2 - プロペニルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 7 9) 5 - [4 - (2 - プロピルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 0) 5 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

[0457] (化合物 F 8 1) 5 - [4 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メチルベンゾイル) アミノフェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 2) 5 - [4 - [(2 - イソプロポキシベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 3) 5 - [4 - [(3 - メチルチオフェン - 2 - イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 4) 5 - [4 - (2 - フェノキシプロピオニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 5) 5 - [4 - [2 - (4 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ) アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 6) 5 - [4 - [(4 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 7) 5 - [4 - (4 - フルオロ - 2 - メトキシベンゾイル) アミノフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 8) 5 - [4 - (4 - フルオロ - 2 - ヒドロオキシベンゾイル) アミノフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 8 9) 5 - [3 - [(2 - ヨードフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 0) 5 - [4 - (2 - メチル - 2 - フェノキシプロピオニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

[0458] (化合物 F 9 1) 5 - [4 - (2 - t e r t - ブチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1, 3 - ジヒドロナフト [1, 2 - e] - 1, 4 - ジアゼピン - 2 - オン ;

(化合物 F 9 2) 5 - [4 - [(3 - ジメチルアミノベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 3) 5 - [4 - (4 - ヨード - 2 - メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 4) 5 - [4 - (6 - フルオロ - 2 - メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 5) 5 - [4 - (2 - ヒドロキシ - 4 - ヨードベンゾイル

アミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 6) 5 - [4 - (6 - フルオロ - 2 - ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 7) 5 - [4 - (2 - フルオロベンゾイル) アミノフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 8) 5 - [4 - [(2 - ジメチルアミノベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 9 9) 5 - [4 - (2 - メトキシ - 6 - メチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 1 0 0) 5 - [4 - (2 - ヒドロキシ - 6 - メチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

[0459] (化合物 F 1 0 1) 5 - [4 - [3 - (2 - メチルフェニル) プロピオンイルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 1 0 2) 5 - (4 - フェニルカルバモイルフェニル) - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 1 0 3) 5 - (4 - ベンジルカルバモイルフェニル) - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(化合物 F 1 0 4) 5 - [4 - [3 - (2 - メチルフェニル) プロピオンイルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

ン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 0 5) 5 - [4 - [3 - (2 -クロロフェニル) プロピオニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 0 6) 5 - [4 - (2 -ヨードベンゾイル) アミノフェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 0 7) 5 - [4 - [(1 -メチル-1 H-ピロール-2 -イルアセチル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 0 8) 5 - [4 - (2 -クロロベンジル) カルバモイルフェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 0 9) 5 - [4 - [3 - (2 -クロロフェニル) プロペニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 1 0) 5 - [4 - (2 -クロロフェニル) カルバモイルフェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

[0460] (化合物 F 1 1 1) 5 - [4 - (6 -ブロモ-2, 3 -メチレンジオキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 1 2) 5 - [4 - (6 -ブロモ-2 -メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物 F 1 1 3) 5 - [4 - [(2 -t e r t -ブチルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロ

ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 4) 5 - [2 - (2-ヨードベンゾイル) アミノピリジン-5-イル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 5) 5 - [4 - (6-ブロモ-2-ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 6) 5 - [4 - (6-クロロ-2-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 7) 5 - [4 - (2-ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H- [1, 4] ジアゼピノ [2, 3-h] キノリン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 8) 5 - [4 - (6-クロロ-2-ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 1 9) 5 - [4 - (2-ヒドロキシ-6-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 0) 5 - [4 - [2-メトキシ-6- (トリフルオロメチル) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

[0461] (化合物 F 1 2 1) 5 - [4 - [2-ヒドロキシ-6- (トリフルオロメチル) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 2) 5 - [4 - [(2-イソプロペニルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナ

フト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 3) 5 - [4 - [(2-イソプロピルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 4) 5 - [4 - [2-クロロ-5-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 5) 5 - [4 - [2-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 6) 5 - [4 - [3-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 7) 5 - [4 - [2-エチル-6-メトキシベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 8) 5 - [4 - (3-メタンスルホニルベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 2 9) 6-エチル-1-[4-(2-ヨードベンゾイル) アミノフェニル] -1 H-1, 5-ベンゾジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 0) 5 - [4 - [2-エチル-6-ヒドロキシベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

[0462] (化合物 F 1 3 1) 5 - [4 - (3-メタンスルフィニルベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2

, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 2) 5 - [4 - (2 -クロロ - 5 -メタンスルフィニル
ベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジ
アゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 3) 5 - [4 - (2 -メタンスルフィニルベンゾイルア
ミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2
, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 4) 5 - [4 - [[2 - (4 -モルホリニル) アセチル
] アミノ] フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒド
ロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジ
オン 塩酸塩 ;

(化合物 F 1 3 5) 5 - [4 - (2 -クロロ - 6 -メトキシベンゾイル
アミノ) フェニル] - 1, 3 -ジヒドロナフト [1, 2 - e] - 1, 4 -ジ
アゼピン - 2 -オン ;

(化合物 F 1 3 6) 5 - [4 - [[(3 -クロロピリジン - 2 -イル)
カルボニル] アミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 - b] [1, 4]
ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 7) 5 - [4 - (2 -クロロ - 6 -ヒドロキシベンゾイ
ルアミノ) フェニル] - 1, 3 -ジヒドロナフト [1, 2 - e] - 1, 4 -
ジアゼピン - 2 -オン ;

(化合物 F 1 3 8) 5 - [4 - (3 -クロロ - 2 -メトキシベンゾイル
アミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン -
2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 3 9) 5 - [4 - [(3 -メチルピリジン - 2 -イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジア
ゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4 0) 5 - [4 - [[(3 -クロロピリジン - 2 -イル)
カルボニル] アミノ] フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -

オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

[0463] (化合物 F 1 4 1) 5 - [4 - (3-クロロ-2-ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4 2) 5 - [4 - [(3-ヒドロキシピリジン-2-イル) カルボニル] アミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4 3) 5 - [4 - [(3-ビニルピリジン-2-イル) カルボニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4 4) 5 - [4 - [(3-エチルピリジン-2-イル) カルボニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 1 4 5) N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 4 6) N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 4 7) 3-ブロモ-N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 4 8) N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -3-メトキシベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 4 9) N - [3 - (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ベン

ゼンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 0) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-ニトロベンゼンスルホンアミド；

[0464] (化合物F 1 5 1) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロ-ナフト [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-ニトロ-ベンゼンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 2) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロ-ナフト [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-メチル-2-ニトロベンゼンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 3) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-メチル-2-ニトロベンゼンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 4) 4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) -N-フェニルベンゼンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 5) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] - [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-ナフタレンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 6) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] - [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -1-ナフタレンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 7) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] シクロヘキサンスルホンアミド；

(化合物F 1 5 8) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] シクロヘキサンスルホンアミド；

ル] - 3 - ピリジンスルホンアミド 塩酸塩 ;

(化合物 F 1 5 9) N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 4 - イソプロピルベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 0) N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] フェニルメタンスルホンアミド ;

[0465] (化合物 F 1 6 1) N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 3 - ピリジンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 2) N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 2 - ナフタレンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 3) 4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 - オクタヒドロナフト - [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル 3 - ブロモベンゼンスルホネート ;

(化合物 F 1 6 4) N - ベンジル - N - [4 - (1 - ベンジル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 2 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 5) N - ベンジル - N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 2 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 6) 3 - ブロモ - N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト [1 , 2 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - N - メチルベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 7) N - [4 - (2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフト - [1 , 2 - b] [1 , 4] - ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - N - メチル - 2 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 6 8) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N- (2-ヒドロキシエチル) -2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 6 9) N- [4- (7-クロロ-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 0) N- [4- (7-ブロモ-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

[0466] (化合物 F 1 7 1) N- [4- [(2, 4-ジオキソ-7- (トリフルオロメチル) -2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル)] フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 2) N- [4- (2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 3) 1- (2-クロロフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 4) 1- (3-ブロモフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 5) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-トリフルオロメチルベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 6) N- [4- (7-ブロモ-6-メチル-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 7) 1 - (2 - クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 8) 3 - ブロモ - N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 7 9) N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 3 - メトキシベンゼンスルホンアミド;

(化合物 F 1 8 0) 1 - (2 - ブロモフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

[0467] (化合物 F 1 8 1) N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 1 - (2 - メチルフェニル) メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 8 2) N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 1 - (2 - ニトロフェニル) メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 8 3) N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 2 - フェニルエタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 8 4) 1 - (2, 3 - ジクロロフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(化合物 F 1 8 5) 1 - (2 - クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソー 7 - メトキシ - 1 H - ベンゾ [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼ

ピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 8 6) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-7-ヒドロキシ-1H-ベンゾ [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 8 7) 1 - (4-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 8 8) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) ベンジル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 8 9) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) -2-メトキシフェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 9 0) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) -2-ヒドロキシフェニル] メタンスルホンアミド ;

[0468] (化合物 F 1 9 1) 1 - (2, 6-ジクロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 9 2) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-6-メチル-1H-ベンゾ [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物 F 1 9 3) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) プロピル] メタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 4) 1 - (2 - クロロフェニル) - N - [2 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) エチル] メタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 5) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 1 - (2 - ヨードフェニル) メタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 6) 1 - (2 - クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 7) 1 - (2 - クロロフェニル) - N - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジハイドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - e] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 8) 1 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] フェニル - N - メチルメタンスルホンアミド ;

(化合物F 1 9 9) 1 - (2 - エチルフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] フェニル - N - メチルメタンスルホンアミド ;

(化合物F 2 0 0) 1 - (2, 3 - ジメチルフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] フェニル - N - メチルメタンスルホンアミド ;

[0469] (化合物F 2 0 1) 2 - (2 - クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4

] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルエタンスルホンアミド;

(化合物 F 202) 1-(2-ニトロフェニル)-N-[4-(2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(化合物 F 203) 1-(2-アミノフェニル)-N-[4-(2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(化合物 F 204) 1-(2-ジメチルアミノフェニル)-N-[4-(2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(化合物 F 205) 5-[4-[(ピリジン-4-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物 F 206) 5-[4-[2-[(ピリジン-3-イル)オキシ]アセチルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物 F 207) 5-[4-[(ピリジン-3-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物 F 208) 5-[4-[(2-メチルピリジン-3-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物 F 209) 5-[4-[(2-クロロピリジン-3-イル)カルボニルアミノ]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジア

ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 1 0) 5 - [4 - [2 - [(ピリジン-2-イル) オキシ
] アセチルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジ
アゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

[0470] (化合物 F 2 1 1) 5 - [4 - [[4 - (トリフルオロメチル) ピリジ
ン-3-イル] カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2 - b
] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 1 2) 5 - [4 - [(2-クロロピリジン-3-イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] - 1 H- [1, 4] ジアゼピノ [2, 3 - f]
イソキノリン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物 F 2 1 3) 5 - [4 - [(2-クロロピリジン-3-イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] - 8, 9, 10, 11-テトラヒドロ-1 H-
[1, 4] ジアゼピノ [2, 3 - f] イソキノリン-2, 4 (3 H, 5 H)
-ジオン ; 及び

(化合物 F 2 1 4) 5 - [4 - [(2-イソプロピルベンゾイル) アミ
ノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2,
4 (3 H, 5 H) -ジオン。

[0471] (化合物 G 1) N - [4 - (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナ
フト [1, 2 - e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] - 3 -
(ピリジン-2-イル) プロピオン酸アミド ;

(化合物 G 2) 2-エチル-3-ヒドロキシ-N - [4 - (2-オキシ
-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2 - e] [1, 4] -ジアゼピン
-5-イル) フェニル] ベンズアミド ;

(化合物 G 3) 2-エチル-N - [4 - (2-オキソ-2, 3-ジヒド
ロ-1 H-ナフト [1, 2 - e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェ
ニル] ニコチンアミド 二塩酸塩 ;

(化合物 G 4) 2-エチル-6-ヒドロキシ-N - [4 - (2-オキシ
-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2 - e] [1, 4] -ジアゼピン

ー5-イル) フェニル] ベンズアミド ;

(化合物G5) 3-エチル-N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] ピコリンアミド 塩酸塩 ;

(化合物G6) N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル]-2-(ピリジン-2-イルオキシ) アセトアミド 塩酸塩 ;

(化合物G7) 2-(2-メトキシフェニル)-N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] アセトアミド ;

(化合物G8) N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]-ジアゼピン-5-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-3-イル) プロピオンアミド 二塩酸塩 ;

(化合物G9) N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル]-3-フェニルプロパンアミド ;

(化合物G10) N-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]-ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-3-イル) プロピオンアミド 塩酸塩 ;

[0472] (化合物G11) N-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]-ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イル) プロピオンアミド 塩酸塩 ;

(化合物G12) 2-tert-ブチル-N-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]-ジアゼピン-5(2H)-イル) 2-フルオロフェニル] ベンズアミド ;

(化合物G13) N-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]-ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-2-イル) プロピオンアミド 塩酸塩 ;

(化合物G14) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2,4-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)フェニル]ニコチンアミド塩酸塩;

(化合物G15) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド;

(化合物G16) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド 二塩酸塩;

(化合物G17)

2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド ニメタンスルホン酸塩;

(化合物G18) N-[4-(2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]-ジアゼピン-5(2H)-イル)フェニル]-2-(モルホリン-4-イル)-ニコチンアミド 塩酸塩;

(化合物G19) N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]-ジアゼピン-5-イル)フェニル]-2-(1H-ピロール-1-イル)ニコチンアミド 二塩酸塩;

(化合物G20) 2-(モルホリン-4-イル)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]-ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド 二塩酸塩;

[0473] (化合物G21) N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]-ジアゼピン-5-イル)フェニル]-2-(ピロリジン-1-イル)ニコチンアミド 二塩酸塩;

(化合物G22) 4-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド二塩酸塩;

(化合物G 2 3) 2-イソプロピル-N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド二塩酸塩; 及び

(化合物G 2 4) 2-(イソプロピルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド二塩酸塩。

[0474] (化合物H 1) 5-[4-[5-(2-メトキシベンジル)-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 2) 5-[4-[5-(2-ヒドロキシベンジル)-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 3) 5-[4-[5-[2-(ピリジン-3-イル)エチル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H 4) 5-[4-(5-フェネチル-1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 5) 5-[4-[5-(ピリジン-4-イルメチル)-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 6) 5-[4-(5-ベンジル-1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 7) 5-[4-[5-(ピリジン-3-イルメチル)-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H 8) 7-メトキシ-1-[4-[5-(2-メトキシベンジ

ル) - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 9) 5 - [6 - [5 - (2-メトキシベンジル) - 1 H-テトラゾール-1-イル] ピリジン-3-イル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 10) 5 - [4 - [5 - (2-シクロヘキシルエチル) - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

[0475] (化合物H 11) 5 - [6 - [5 - (2-ヒドロキシベンジル)] - 1 H-テトラゾール-1-イル] ピリジン-3-イル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 12) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-4-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(化合物H 13) 5 - [4 - [5 - (ピリジン-2-イルメチル) - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 14) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(化合物H 15) 5 - [4 - [5 - [(1 H-イミダゾール-1-イル) メチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 16) 5 - [4 - [5 - [2 - (1 H-イミダゾール-1-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(化合物H 17) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2

－e] [1, 4] ジアゼピン－2 (3H) －オン 二塩酸塩；

(化合物H18) 5－[4－[5－(2－メトキシフェネチル)－1H－テトラゾール－1－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン；

(化合物H19) 5－[4－[5－(2－メトキシベンジル)－1H－テトラゾール－1－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－e] [1, 4] ジアゼピン－2 (3H) －オン；

(化合物H20) 5－[4－[5－(3－フェニルプロピル)－1H－テトラゾール－1－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン；

[0476] (化合物H21) 5－[4－(2－フェネチル－1H－イミダゾール－1－イル) フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン 塩酸塩；

(化合物H22) 5－[4－(1－フェネチル－1H－イミダゾール－2－イル) フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン 塩酸塩；

(化合物H23) 5－[4－[1－(4－クロロベンジル)－1H－イミダゾール－2－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン 塩酸塩；

(化合物H24) 5－[4－[1－(2－メトキシベンジル)－1H－イミダゾール－2－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン；

(化合物H25) 5－[4－[1－(3－メトキシフェネチル)－1H－イミダゾール－2－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン；

(化合物H26) 5－[4－[1－(3－メトキシフェネチル)－1H－イミダゾール－2－イル] フェニル]－1H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3H, 5H) －ジオン 塩酸塩；

(化合物H27) 5-[4-[1-(3-ヒドロキシフェネチル)-1
H-イミダゾール-2-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][
1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(化合物H28) 5-[4-[1-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)
-1H-イミダゾール-2-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-
b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H29) 4-[3-[5-[2-(ピリジン-2-イル)エチ
ル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-ベンゾ[f]キノキサ
リン-2, 3(1H, 4H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H30) 5-[4-[5-[2-(6-メチルピリジン-2-
イルエチル)-1H-テトラゾール-1-イル]-フェニル]-1H-ナフ
ト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン
塩酸塩;

[0477] (化合物H31) 5-[4-[(2-(3-フルオロフェニル)エチル)
-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-
b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H32) 5-[4-[(2-(2-メトキシフェニル)エチル)
-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-
b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H33) 5-[4-[(2-(4-フルオロフェニル)エチル)
-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-
b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H34) 5-[4-[(2-(2-フルオロフェニル)エチル)
-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-
b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H35) 5-[4-[1-[2-(トリフルオロメチル)ベン
ジル]-1H-イミダゾール-2-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,
2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H36) 5-[4-[2-[4-(トリフルオロメチル)フェニルエチル]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H37) 5-[4-[2-(2, 6-ジメチルフェニルエチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H38) 5-[4-[2-[3-(トリフルオロメチル)フェニルエチル]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H39) 5-[4-[5-[2-(ピリジン-2-イル)エチル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン 二塩酸塩;

(化合物H40) 5-[4-(5-フェネチル-1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン;

[0478] (化合物H41) 5-[4-(2-フェネチル-1H-イミダゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン 二塩酸塩;

(化合物H42) 5-[4-[2-(3-メトキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H43) 5-[4-[2-(3-ヒドロキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H44) 3-[2-[1-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5(2H

）－イル）フェニル]－1H－テトラゾール－5－イル]エチル]ベンゾニトリル；

（化合物H45） 3－[2－[1－[4－（2，4－ジオキソ－3，4－ジヒドロ－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－5（2H）－イル）フェニル]－1H－テトラゾール－5－イル]エチル]ベンズアミド；

（化合物H46） 5－[4－[5－[2－（2－メトキシピリジン－3－イル）エチル]－1H－テトラゾール－1－イル]フェニル]－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－2，4（3H，5H）－ジオン；

（化合物H47） 5－[4－[5－[2－（ジメチルアミノ）ベンジル]－1H－テトラゾール－1－イル]フェニル]－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－2，4（3H，5H）－ジオン メシル酸塩；

（化合物H48） 4－[2－[1－[4－（2，4－ジオキソ－3，4－ジヒドロ－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－5（2H）－イル]フェニル]－1H－イミダゾール－2－イル]エチル]ベンゾニトリル；

（化合物H49） 4－[2－[1－[4－（2，4－ジオキソ－3，4－ジヒドロ－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－5（2H）－イル]フェニル]－1H－イミダゾール－2－イル]エチル]ベンズアミド；

（化合物H50） 5－[4－（2－フェニル－1H－イミダゾール－1－イル）フェニル]－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－2，4（3H，5H）－ジオン；

[0479] （化合物H51） 5－[4－[2－（2－メトキシフェニル）－1H－イミダゾール－1－イル]フェニル]－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－2，4（3H，5H）－ジオン；

（化合物H52） 2－[[2－[4－（2，4－ジオキソ－3，4－ジヒドロ－1H－ナフト[1，2－b][1，4]ジアゼピン－5（2H）－

イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] メチル] ベンゾニトリル ;

(化合物 H 5 3) 2 - [[2 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] メチル] ベンズアミド ;

(化合物 H 5 4) 2 - [2 - [1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンゾニトリル ;

(化合物 H 5 5) 2 - [2 - [1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンズアミド ;

(化合物 H 5 6) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンゾニトリル ;

(化合物 H 5 7) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンズアミド ;

(化合物 H 5 8) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2 H) -イル) フェニル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンズアミド 塩酸塩 ;

(化合物 H 5 9) 5 - [4 - [2 - [4 - (メチルスルホニル) フェネチル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2 -

b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H60) 5 - [4 - [2 - (2-フルオロ-3-メトキシフェネチル) -1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

[0480] (化合物H61) 5 - [4 - [2 - (3-メトキシフェネチル) -1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H62) 5 - [4 - [2 - [2 - (チオフェン-3-イル) エチル] -1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H63) 5 - [4 - [1 - (2-アミノベンジル) -1 H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物H64) 5 - [3-メトキシ-4 - (1-フェネチル-1 H-イミダゾール-2-イル) -フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物H65) 5 - [3-ヒドロキシ-4 - (1-フェネチル-1 H-イミダゾール-2-イル) -フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(化合物H66) 5 - [4 - [2 - [2 - (フラン-2-イル) エチル] -1 H-イミダゾール-1-イル] -フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H67) 5 - [4 - [2 - (2-フルオロフェネチル) -1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン ;

(化合物H68) 5-[4-[2-(フェノキシメチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン;

(化合物H69) 5-[4-[5-[2-メチル-2-(ピリジン-2-イル)プロピル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン
塩酸塩;

(化合物H70) 5-[4-[5-[2-(3-メトキシピリジン-2-イル)エチル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

[0481] (化合物H71) 5-[4-[[2-(ピリジン-2-イル)エチル]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 二塩酸塩;

(化合物H72) 5-[4-(5-フェニル-1H-イミダゾール-4-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H73) 5-[4-[(5-フェニルエチル)-1H-イミダゾール-4-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン 塩酸塩;

(化合物H74) 5-[4-(4,4-ジメチル-2-フェネチル-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン
塩酸塩;

(化合物H75) 5-[4-[2-[(2-メトキシフェニル)アミノ]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン;

(化合物H76) 5-[4-[2-(フェニルアミノ)-1H-イミダ

ゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(化合物H77) 5-[4-[1-[(6-メトキシピリジン-2-イル) メチル]-1H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H78) 5-[4-[1-[(6-ヒドロキシピリジン-2-イル) メチル]-1H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H79) 5-[4-[2-(3-フルオロフェネチル) -1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1H, 3H) -ジオン 塩酸塩 ;

(化合物H80) 5-[4-[2-[(フェニルアミノ) メチル]-1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

[0482] (化合物H81) 3-[[2-[4-[2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト [2, 1-b] [1, 4] ジアゼピン-5-(2H)-イル] フェニル] -1H-イミダゾール-1-イル] メチル] ベンゾニトリル ;

(化合物H82) 3-[[2-[4-[2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト [2, 1-b] [1, 4] ジアゼピン-5-(2H)-イル] フェニル] -1H-イミダゾール-1-イル] メチル] ベンズアミド ; 及び

(化合物H83) 5-[4-[(2-(3-フルオロ-2-メトキシフェニル) エチル) -1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン

塩酸塩。

- [0483] 本発明の医薬の有効成分としてより好適な化合物又はその薬学的に許容される塩は、一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物又は薬学的に許容される塩に包含される。より具体的には、5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン カリウム塩; 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン ナトリウム塩; 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン; 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-8, 9, 10, 11-テトラヒドロナフト[2, 1-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5

H) -ジオン ナトリウム塩； 4 - [3 - (1 H-テトラゾール-5 -イル) フェニル] -1, 4 -ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3 -ジオン； 4 - [3 - (1 H-テトラゾール-5 -イル) フェニル] -1, 4 -ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3 -ジオン ナトリウム塩； 4 - [3 - (1 H-テトラゾール-5 -イル) フェニル] -1 H-ベンゾ [h] キナゾリン-2 -オン； 4 - [3 - (1 H-テトラゾール-5 -イル) フェニル] -1 H-ベンゾ [h] キナゾリン-2 -オン ナトリウム塩； 5 - [4 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - (2 -ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - [(2 -エチルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - (2 -tert -ブチルベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - (6 -クロロ-2 -ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 1 - (2 -クロロフェニル) -N - [4 - (2, 4 -ジオキソ-1, 2, 3, 4 -テトラヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-5 -イル) フェニル] メタンスルホンアミド； 5 - [4 - [(2 -イソプロピルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - [5 - (2 -メトキシベンジル) -1 H-テトラゾール-1 -イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - [5 - (2 -ヒドロキシベンジル) -1 H-テトラゾール-1 -イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン； 5 - [4 - (5 -フェネチル-1 H-テトラゾール-1 -イル) フェニル] -1 H-ナ

フト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン
 ; 5 - [6 - [5 - (2-ヒドロキシベンジル)] - 1H-テトラゾール
 -1-イル] ピリジン-3-イル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4
] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン; 5 - [4 - (2-フェネ
 チル-1H-イミダゾール-1-イル) フェニル] - 1H-ナフト [1, 2
 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩;
 5 - [4 - (1-フェネチル-1H-イミダゾール-2-イル) フェニル]
 - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H
) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [1 - (3-メトキシフェネチル) - 1
 H-イミダゾール-2-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1,
 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン; 5 - [4 - [1 -
 (3-ヒドロキシフェネチル) - 1H-イミダゾール-2-イル] フェニル
] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5
 H) -ジオン; 5 - [4 - [(2 - (3-フルオロフェニル) エチル) -
 1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b]
 [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [2 - (2, 6-ジメチルフェニルエチル) - 1H-イミダゾール-1
 -イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-
 2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [2 - (3-メトキ
 シフェネチル) - 1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフ
 ト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン
 塩酸塩; 5 - [4 - [2 - (3-ヒドロキシフェネチル) - 1H-イミダ
 ザール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジ
 アゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [5 - [2
 - (ジメチルアミノ) ベンジル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル
] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5
 H) -ジオン メシル酸塩; 5 - [4 - [2 - (3-メトキシフェネチル
) - 1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 5, 8, 9, 10-テト

ラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [2 - [2 - (チオフェン-3-イル) エチル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [2 - (2-フルオロフェネチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン; 5 - [4 - [2 - (3-フルオロフェネチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン 塩酸塩; 5 - [4 - [(2 - (3-フルオロ-2-メトキシフェニル) エチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩; 2 - (ジメチルアミノ) - N - [4 - (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド; 2 - (ジメチルアミノ) - N - [4 - (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド 二塩酸塩; 及び 2 - (ジメチルアミノ) - N - [4 - (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド ニメタンスルホン酸塩が例示される。もともと、本発明の医薬の有効成分は上記の特定の化合物又はその薬学的に許容される塩に限定されることはない。

[0484] 本発明の医薬の有効成分としてさらに好適な化合物又はその薬学的に許容される塩は、一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物又は薬学的に許容される塩に包含される。より具体的には、5 - [3 - (1 H-テトラゾール-5-イル) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン; 5 - [3 - (1 H-テトラゾール-5-イル) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼ

ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩; 5 - [4 - (2 -ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン; 5 - [4 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン; 2 - (ジメチルアミノ) -N - [4 - (2 -オキソ-2, 3 -ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2 -e] [1, 4] ジアゼピン-5 -イル) フェニル] ニコチンアミド; 及び2 - (ジメチルアミノ) -N - [4 - (2 -オキソ-2, 3 -ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2 -e] [1, 4] ジアゼピン-5 -イル) フェニル] ニコチンアミド 二塩酸塩が例示される。もっとも、本発明の医薬の有効成分は上記の特定の化合物又はその薬学的に許容される塩に限定されることはない。

[0485] 上記の一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物は、シス・トランス異性体や光学活性体、ラセミ体等の立体異性体が存在する場合もあるが、何れも本発明に含まれる。

[0486] また、上記の一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物は、置換基の種類に応じて1個又は2個以上の不斉炭素有する場合があるが、これらの不斉炭素に基づく任意の光学異性体、光学異性体の任意の混合物、ラセミ体、2個以上の不斉炭素に基づくジアステレオ異性体、ジアステレオ異性体の任意の混合物などを本発明の医薬の有効成分として用いてもよい。上記の一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物が二重結合や環状構造を含む場合には幾何異性体が存在する場合があるが、純粋な形態の幾何異性体のほか、それらの任意の割合の混合物を本発明の医薬の有効成分として用いてもよい。

[0487] 本発明の医薬の有効成分としては、上記の一般式 (A I) ないし (H I I) で表される化合物のほか、これらの化合物の酸付加塩又は塩基付加塩を用いてもよい。酸付加塩としては、例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩などの鉱酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、シュウ酸塩、リン

ゴ酸塩などの有機酸塩などを用いることができるが、これらに限定されることはない。塩基付加塩としては、例えば、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、若しくはカルシウム塩などの金属塩、アンモニウム塩、又はトリエチルアミン塩若しくはエタノールアミン塩などの有機アミン塩などを挙げることができるが、これらに限定されることはない。これらの塩のうち、薬学的に許容される塩を本発明の医薬の有効成分として用いることが好ましい。また、遊離形態の化合物又は塩の形態の化合物の任意の水和物又は溶媒和物を本発明の医薬の有効成分として用いてもよい。

[0488] 本発明の医薬は、咳嗽の予防又は治療に用いることができる。好ましくは急性咳嗽、遷延性咳嗽及び慢性咳嗽の予防又は治療に用いることができる。より好ましくは、慢性咳嗽の予防又は治療に用いることができる。さらに本発明の医薬は、慢性咳嗽の原因疾患として挙げられる乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽及びアレルギー性咳嗽などの咳嗽、又は湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽及び喘息による咳嗽などの咳嗽に対して高い有効性を発揮することができる。これらの咳嗽はいずれも本発明の医薬の適用対象となる。もっとも、本発明の医薬の適用対象はこれらに限定されることはない。

[0489] 従来、乾性咳嗽の治療、例えば咳喘息の治療では、狭くなった気管を広げることと、気管の過敏性を抑えることを目的に行われる。用いられる治療薬としては、吸入ステロイド薬及び気管支拡張薬($\beta 2$ 刺激薬等)が挙げられる。

しかしながら、気管支拡張薬である $\beta 2$ 刺激薬は、頻脈、振戦又は低カリウム血症等の副作用を有する場合があるので、高血圧の患者や心疾患のある患者等には慎重に投与する必要がある。

一方、本発明の医薬は、 $\alpha 1$ 受容体、 $\beta 2$ 受容体及びM3受容体へ作用しないことが推察されることから、既存の気管支拡張薬(例えば $\beta 2$ 刺激薬)にある前記副作用への影響がなく、本発明の医薬を前記患者の乾性咳嗽にも積

極的に使用し得ることが期待される。

[0490] 従来、湿性咳嗽の治療、例えば気管支喘息の治療では、気道炎症及び気道狭窄を主なターゲットとすることができる。用いられる治療薬としては、抗炎症作用を有する吸入ステロイド薬が挙げられ、その他に、気管支拡張薬（ $\beta 2$ 刺激薬又はテオフィリン徐放薬等）、又はアレルギー反応を抑える抗アレルギー薬等を患者の状態に応じて、前記吸入ステロイド薬と併用することがある。

上記治療では、気管支拡張薬（ $\beta 2$ 刺激薬）に抗炎症作用がないため、吸入ステロイド薬と併用している。一方、気管支拡張薬（ $\beta 2$ 刺激薬）と本発明の医薬の併用によって、湿性咳嗽を治療し得ることが期待される。

吸入ステロイド薬は、声がれなどの発声障害の副作用を有する場合がある。本発明の医薬にはこれを回避して咳喘息などの乾性咳嗽を治療し得ることが期待されるためである。

すなわち、本発明の医薬は、 $\alpha 1$ 受容体、 $\beta 2$ 受容体及びM3受容体へ作用しないことが推察されることから、既存の気管支拡張薬（例えば $\beta 2$ 刺激薬）にある頻脈、振戦又は低カリウム血症等の副作用を増強させず、高血圧の患者や心疾患のある患者等の湿性咳嗽にも積極的に使用し得ることが期待される。

[0491] 本発明の医薬の有効成分として好適な化合物は、用量依存的かつ強力な鎮咳作用を示す。

例えば、本発明の医薬の有効成分として好適な化合物は、中枢性鎮咳薬であるジヒドロコデインと同等の鎮咳作用を示す。また、前記化合物は、慢性咳嗽のモデル動物である気道炎症モデル動物（例えば、気道炎症モデルマウス）では、低用量（0.3 mg/kg）を投与した場合、クエン酸刺激による咳嗽反射において、LPS刺激によって増加した咳嗽反射のみを抑制し、クエン酸刺激のみによる咳嗽反射（通常のマウスにおけるクエン酸刺激による咳嗽反射の相当量）には影響を及ぼさない。また、前記化合物は、経口投与においてもネブライザーによる局所投与においても薬効を示した。

[0492] また、前記化合物は、慢性咳嗽のモデル動物である気道炎症モデル動物（例えば、抗原としてOVAで感作したモルモット（アレルギー性咳嗽及びアトピー性咳嗽モデル））において、低用量（1.0 mg/kg）を投与した場合、クエン酸刺激による咳嗽反射において、OVA感作によって誘導された好酸球浸潤を伴う気道炎症により増加した咳嗽反射のみを抑制し、クエン酸刺激のみによる咳嗽反射（通常のモルモットにおけるクエン酸刺激による咳嗽反射の相当量）には影響を及ぼさない。

[0493] よって、一つの実施態様として、本発明の医薬の有効成分として好適な化合物は、水溶性、投与溶液の浸透圧、pH、その他の刺激性などに問題がなく、中枢作動性の薬剤に起こり得る生体防御として必要な本来止めてはならない咳も止めてしまう危険性もないため、健常人に比較して慢性咳嗽に罹患しているヒトで、より優れた末梢性鎮咳作用を示す。

[0494] 本発明の医薬は経口投与又は非経口投与に投与することができる。本発明の医薬は、製剤の技術分野における通常の方法に従って、錠剤、顆粒剤、散剤、カプセル剤、懸濁剤、吸入剤、吸入粉末剤、吸入液剤、吸入エアゾール剤、軟膏剤、クリーム剤、ゲル剤、湿布剤、貼付剤、リニメント剤、テープ剤、パップ剤、注射剤、坐薬等の適宜の剤型の医薬として製造することができる。

[0495] これら製剤は、一般的な技術を用いて製造することができるが、例えば、錠剤の場合には、通常の賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、色素などが用いられることができる。賦形剤としては、乳糖、D-マンニトール、結晶セルロース、ブドウ糖などが、崩壊剤としては、デンプン、カルボキシメチルセルロースカルシウム（CMC-Ca）などが、滑沢剤としては、ステアリン酸マグネシウム、タルクなどが、結合剤としては、ヒドロキシプロピルセルロース（HPC）、ゼラチン、ポリビニルピロリドン（PVP）などが挙げられる。

[0496] 注射剤の調整には、溶剤、安定化剤、溶解補助剤、懸濁剤、乳化剤、無痛化剤、緩衝剤、保存剤などが用いられる。これらの製剤用添加物や製剤の調

製方法は当業者が適宜選択できる。

[0497] 非経口投与のための吸入剤としては、エアゾール剤、吸入用粉末剤、吸入用液剤（例えば、吸入用溶液、吸入用懸濁剤等）、又はカプセル状吸入剤が含まれ、前記吸入用液剤は用時に水又は他の適当な媒体に溶解又は懸濁させて使用する形態であってもよい。これらの吸入剤は適当な吸入容器を用いて適用することができ、例えば、吸入用液剤を投与する際には、噴霧器（アトマイザー、ネブライザー）等を、吸入用粉末剤を投与する際には粉末薬剤用吸入投与器等を使用することができる。

[0498] これらの吸入剤は公知の方法に準じて製造される。例えば、一般式（A I）ないし（H I I）で示される化合物を粉末又は液状にして、吸入噴射剤又は担体中に配合し、適当な吸入容器に充填することにより製造される。一般式（A I）ないし（H I I）で示される化合物を粉末化する場合、常法に従って粉末化される。例えば、乳糖、デンプン、ステアリン酸マグネシウム等とともに微粉末にし、均一な混合物にするか、造粒して粉末剤を調製する。また、一般式（A I）ないし（H I I）で示される化合物を液状化する場合、例えば前記化合物を水、生理食塩液又は有機溶剤等の液状担体に溶解すればよい。噴射剤としては、従来公知の噴射剤、例えば、代替フロン、液化ガス噴射剤（例えば、フッ化炭化水素、液化石油、ジエチルエーテル、ジメチルエーテル等）、圧縮ガス（例えば、可溶性ガス（例えば、炭酸ガス、亜酸化窒素ガス等）、不溶性ガス（例えば、窒素ガス等）等が用いられる。

[0499] 吸入剤には、さらに、必要に応じて添加剤を適宜配合してもよい。添加剤としては、一般に使用されている添加剤であれば何でもよく、例えば、固形賦形剤（例えば、白糖、乳糖、ブドウ糖、マンニット、ソルビット、マルトース、セルロース等）、液状賦形剤（例えば、プロピレングリコール等）、結合剤（デンプン、デキストリン、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン、ポリエチレングリコール、白糖等）、滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、タルク、ラウリル硫酸ナトリウム等）、矯味剤（例えば、クエン酸、メントール、グリ

チルリチンアンモニウム塩、グリシン、オレンジ粉末等)、保存剤(例えば、安息香酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウム、メチルパラベン、プロピルパラベン等)、安定化剤(例えば、クエン酸、クエン酸ナトリウム等)、懸濁化剤又は乳化剤(例えば、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、レシチン、トリオレイン酸ソルビタン等)、分散剤(例えば、界面活性剤等)、溶剤(例えば、水等)、等張化剤(例えば、塩化ナトリウム、濃グリセリン等)、pH調節剤(例えば、塩酸、硫酸等)可溶化剤(例えば、エタノール等)、防腐剤(塩化ベンザルコニウム、パラベン等)、着色剤、緩衝化剤(リン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等)、増粘剤(カリボキシビニルポリマー等)、吸収促進剤等が用いられる。例えば、吸入用液剤の場合には、防腐剤、着色剤、緩衝化剤、等張化剤、増粘剤、吸収促進剤などを必要に応じて適宜選択して調製される。また、例えば吸入用粉末剤の場合には、滑沢剤、結合剤、賦形剤、着色剤、防腐剤、吸収促進剤(胆汁酸塩、キトサン等)などを必要に応じて適宜選択して調製される。

[0500] さらに、一般式(A I)ないし(H I I)で示される化合物を徐放性とするため、吸入剤においては生体内分解性重合物を含有していてもよい。生体内分解性重合物とは、脂肪酸エステル重合体又はその共重合体、ポリアクリル酸エステル類、ポリヒドロキシ酪酸類、ポリアルキレンオキサレート類、ポリオルソエステル、ポリカーボネート及びポリアミノ酸類が挙げられ、これらは1種類又はそれ以上混合して使用することができる。また、卵黄レシチン等のリン脂質、キトサン等を用いてもよい。脂肪酸エステル重合体又はその共重合体とは、ポリ乳酸、ポリグリコール酸、ポリクエン酸、ポリリンゴ酸及び乳酸-グリコール酸共重合体が挙げられ、これらは1種類又はそれ以上混合して使用することができる。その他に、ポリ α -シアノアクリル酸エステル、ポリ β -ヒドロキシ酪酸、ポリトリメチレンオキサート、ポリオルソエステル、ポリオルソカーボネート、ポリエチレンカーボネート、ポリ γ -ベンジルーL-グルタミン酸及びポリL-アラニンの1種類又はそれ以上混合も使用することができる。好ましくは、ポリ乳酸、ポリグリコール酸

又は乳酸－グリコール酸共重合体であり、より好ましくは、乳酸－グリコール酸共重合体である。また、乳酸－グリコール酸共重合体等の生体内分解性重合物を用いて薬物を封入したマイクロスフェアやナノスフェアを調製してもよい。

[0501] 軟膏剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつ又はそれ以上の活性物質を基剤に研和、又は溶融させて製造、調製される。軟膏基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高級脂肪酸又は高級脂肪酸エステル（アジピン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、アジピン酸エステル、ミリスチン酸エステル、パルミチン酸エステル、ステアリン酸エステル、オレイン酸エステル等）、ロウ類（ミツロウ、鯨ロウ、セレシン等）、界面活性剤（ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル等）、高級アルコール（セタノール、ステアリルアルコール、セトステアリルアルコール等）、シリコン油（ジメチルポリシロキサン等）、炭化水素類（親水ワセリン、白色ワセリン、精製ラノリン、流動パラフィン等）、グリコール類（エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、マクロゴール等）、植物油（ヒマシ油、オリーブ油、ごま油、テレピン油等）、動物油（ミンク油、卵黄油、スクワラン、スクワレン等）、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独又は2種以上を混合して用いられる。さらに、保湿剤、保存剤、安定化剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでもよい。

[0502] ゲル剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつ又はそれ以上の活性物質を基剤に溶融させて製造、調製される。ゲル基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、低級アルコール（エタノール、イソプロピルアルコール等）、ゲル化剤（カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース等）、中和剤（トリエタノールアミン、ジイソプロパノールアミン等）、界面活性剤（モノステアリン酸ポリエチレングリコ

ール等)、ガム類、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独又は2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

[0503] クリーム剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつ又はそれ以上の活性物質を基剤に溶融又は乳化させて製造、調製される。クリーム基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高級脂肪酸エステル、低級アルコール、炭化水素類、多価アルコール(プロピレングリコール、1,3-ブチレングリコール等)、高級アルコール(2-ヘキシルデカノール、セタノール等)、乳化剤(ポリオキシエチレンアルキルエーテル類、脂肪酸エステル類等)、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独又は2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

[0504] 湿布剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつ又はそれ以上の活性物質を基剤に溶融させ、練合物とし支持体上に展延塗布して製造される。湿布基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、増粘剤(ポリアクリル酸、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、デンプン、ゼラチン、メチルセルロース等)、湿潤剤(尿素、グリセリン、プロピレングリコール等)、充填剤(カオリン、酸化亜鉛、タルク、カルシウム、マグネシウム等)、水、溶解補助剤、粘着付与剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独又は2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

[0505] 貼付剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつ又はそれ以上の活性物質を基剤に溶融させ、支持体上に展延塗布して製造される。貼付剤用基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高分子基剤、油脂、高級脂肪酸、粘着付与剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独又は2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

[0506] リニメント剤は公知又は通常使用されている処方により製造される。例え

ば、ひとつ又はそれ以上の活性物を水、アルコール（エタノール、ポリエチレングリコール等）、高級脂肪酸、グリセリン、セッケン、乳化剤、懸濁化剤等から選ばれるもの単独又は2種以上に溶解、懸濁又は乳化させて製造、調製される。さらに、保存剤、抗酸化剤、着香剤等を含んでいてもよい。

[0507] 本発明の医薬の投与量は特に限定されないが、一般的には、成人に対して、吸入剤、吸入粉末剤、吸入液剤、吸入エアゾール剤により有効成分量として1日あたり約0.01 μ g $\sim$ 100mg、好ましくは0.3 μ g $\sim$ 10mg、軟膏剤、クリーム剤、ゲル剤、湿布剤、貼付剤、リニメント剤、テープ剤、パップ剤により有効成分量として1日あたり約0.01mg $\sim$ 1000mg、注射剤により有効成分量として1日あたり約0.01mg $\sim$ 100mg、経口投与により1日あたり0.01mg $\sim$ 2000mg程度を投与することができる。もっとも、上記の投与量に限定されることはなく、年齢や症状等により増減することができる。

[0508] 本発明の医薬は、各種咳嗽の治療又は予防に有用な他剤と組み合わせて使用することができる。そのような組み合わせの個々の成分は、治療又は予防の期間中、別々の異なる時に又は同時に、分割された又は単一の製剤で投与することができる。したがって、本発明は同時の又は時間が異なる投与の全てを含むと解釈すべきであり、本発明における投与はそのように解釈すべきである。本発明の医薬と上記の各種咳嗽の治療又は予防に有用な他剤との組み合わせの範囲には、原則として上記の各種咳嗽の治療又は予防に有用なかなる医薬製剤との組み合わせも包含される。

[0509] 本発明に係る組み合わせ製剤中の各製剤は、各種の形態を選択することができ、それぞれ上記製剤と同様に製造することができる。また、本発明の医薬と他の各種咳嗽の治療薬又は予防薬を含む合剤の場合にも、常法又は慣用技術に従って、当業者が容易に製造することができる。

上記組み合わせは、本発明の医薬に一つの他の活性物質のみならず、2又はそれ以上の他の活性物質を組み合わせたものを包含する。本発明の医薬と、上記の各種咳嗽の治療薬又は予防薬から選ばれた1、2又はそれ以上の活

性化合物との組み合わせには多くの例が存在する。

[0510] 本発明の医薬と組み合わせる薬剤としては、例えば、ステロイド、 β 2 アゴニスト、ムスカリン受容体拮抗剤、抗ヒスタミン剤、抗アレルギー剤、気管支拡張薬、ロイコトリエン合成阻害剤、プロスタグランジン類、ロイコトリエン受容体拮抗剤、その他の鎮咳薬、及び去痰薬等が挙げられ、中でも、抗ヒスタミン剤、抗アレルギー剤との組み合わせ、及び湿性咳嗽に有用な、ステロイド、 β 2 アゴニスト、又はムスカリン受容体拮抗剤等との組み合わせが好ましい。また、本発明の医薬は漢方薬と組み合わせることができる。

[0511] 前記ステロイドとしては、例えばプロピオン酸クロベタゾール、酢酸ジフロラゾン、フルオシノニド、フランカルボン酸モメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、酪酸プロピオン酸ベタメタゾン、吉草酸ベタメタゾン、ジフルプレドナート、プデソニド、吉草酸ジフルコルトロン、アムシノニド、ハルシノニド、デキサメタゾン、プロピオン酸デキサメタゾン、吉草酸デキサメタゾン、酢酸デキサメタゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、酪酸ヒドロコルチゾン、酪酸プロピオン酸ヒドロコルチゾン、プロピオン酸デプロドン、吉草酸酢酸プレドニゾロン、フルオシノロンアセトニド、プロピオン酸ベクロメタゾン、トリアムシノロンアセトニド、ピバル酸フルメタゾン、プロピオン酸アルクロメタゾン、酪酸クロベタゾン、プレドニゾロン、プロピオン酸ベクロメタゾン、及びフルドロキシコルチド等の外用薬；酢酸コルチゾン、ヒドロコルチゾン、リン酸ヒドロコルチゾンナトリウム、コハク酸ヒドロコルチゾンナトリウム、酢酸フルドロコルチゾン、プレドニゾロン、酢酸プレドニゾロン、コハク酸プレドニゾロンナトリウム、ブチル酢酸プレドニゾロン、リン酸プレドニゾロンナトリウム、酢酸ハロプレドン、メチルプレドニゾロン、酢酸メチルプレドニゾロン、コハク酸メチルプレドニゾロンナトリウム、トリアムシノロン、酢酸トリアムシノロン、トリアムシノロンアセトニド、デキサメタゾン、酢酸デキサメタゾン、リン酸デキサメタゾンナトリウム、パルミチン酸デキサメタゾン、酢酸パラメタゾン、及びベタメタゾン等の内服薬又は注射剤；並びにプロピオン酸ベクロメタゾン、プロピオン酸フ

ルチカゾン、ブデソニド、フルニソリド、トリアムシノロン、ST-126P、シクレソニド、デキサメタゾンパロミチオネート、モメタゾンフランカルボネート、プラステロンスルホネート、デフラザコート、メチルプレドニゾロンスレプタネート、及びメチルプレドニゾロンナトリウムスクシネート等の吸入剤等が挙げられる。

[0512] β 2アゴニストとしては、例えばフォルモテロール、サルメテロール、カルモテロール、インダカテロール、ビランテロール、アルホルモテロール、バンブテロール、イソプロテレノール、ミルベテロール、クレンブテロール、オロダテロール、フェノテロール、サルブタモール、レバルブテロール、プロカテロール、テルブタリン、ピルブテロール、プロカテロール、メタプロテレノール、ビトルテロール、リトドリン、及びアルブテロール等が挙げられる。

[0513] ムスカリン受容体拮抗剤としては、例えばチオトロピウム、イプラトロピウム、フルトロピウム、オキシトロピウム、アクリジニウム、ダロトロピウム、グリコピロレート、及びウメクリジニウム等が挙げられる。

[0514] 抗ヒスタミン剤としては、例えばジフェンヒドラミン、塩酸ジフェニルピラリン、テオクル酸ジフェニルピラリン、フマル酸クレマスチン、ジメンヒドリナート、d-1-マレイン酸クロルフェニラミン、d-マレイン酸クロルフェニラミン、塩酸トリプロリジン、塩酸プロメタジン、酒石酸アリメマジン、塩酸イソチペンジル、塩酸ホモクロルシクリジン、ヒドロキシジン、塩酸シプロヘプタジン、塩酸レボカバスチン、アステミゾール、ベポタスチン、デスロラタジン、TAK-427、ZCR-2060、NIP-530、モメタゾンフロエート、ミゾラスチン、BP-294、アンドラスト、オーラノフィン、アクリバスチン等が挙げられる。

[0515] 抗アレルギー剤としては、例えば、クロモグリク酸ナトリウム、トラニラスト、アンレキサノクス、レピリナスト、イブジラスト、ペミロラストカリウム、ダザノラスト、ネドクロミル、クロモグリカート、及びイスラパファント等の化学伝達物質遊離抑制薬；フマル酸ケトチフェン、塩酸アゼラスチ

ン、オキサトミド、メキタジン、テルフェナジン、フマル酸エメダスチン、塩酸エピナスチン、エバスチン、塩酸セチリジン、塩酸オロパタジン、ロラタジン、及びフェキソフェナジン等のヒスタミン拮抗薬；塩酸オザグレル、及びイミトロダストナトリウム等のトロンボキサン合成酵素阻害剤；セラトロダスト、ラマトロバン、ドミトロバンカルシウム水和物、及びK T-2-962等のトロンボキサン拮抗薬；並びにトシル酸スプラタスト等のTh2サイトカイン阻害薬が挙げられる。

[0516] 気管支拡張薬としては、例えば、アミノフィリン、テオフィリン、ドキシフィリン、シパムフィリン、ジプロフィリン、プロキシフィリン、及びコリンテオフィリン等のキサンチン誘導体；エピネフリン、塩酸エフェドリン、d l-塩酸メチルエフェドリン、塩酸メトキシフェナミン、硫酸イソプロテレノール、塩酸イソプロテレノール、硫酸オルシプレナリン、塩酸クロルブプレナリン、塩酸トリメトキノール、硫酸サルブタモール、硫酸テルブタリン、硫酸ヘキソプレナリン、塩酸ツロブテロール、塩酸プロカテロール、臭化水素酸フェノテロール、フマル酸フォルモテロール、塩酸クレンブテロール、塩酸マブテロール、キシナホ酸サルメテロール、R, R-フォルモテロール、ツロブテロール、塩酸ピルブテロール、塩酸リトドリン、バンブテロール、塩酸ドベキサミン、酒石酸メルアドリン、AR-C68397、レボサルブタモール、KUR-1246、KUL-7211、AR-C89855、及びS-1319等の交感神経刺激剤；並びに臭化イプラトロピウム、臭化フルトロピウム、臭化オキシトロピウム、臭化シメトロピウム、テミベリン、臭化チオトロピウム、及びレバトロペート等の副交感神経遮断薬等が挙げられる。

[0517] ロイコトリエン合成阻害剤としては、例えばオーラノフィン、マレイン酸プログルメタシン、L-674636、A-81834、UPA-780、A-93178、MK-886、REV-5901A、SCH-40120、MK-591、Bay-x-1005、Bay-y-1015、DTI-0026、アムレキサノックス、及びE-6700等が挙げられる。

[0518] プロスタグランジン類としては、例えば、PGE₂EP₁受容体、PGE₂EP₂受容体、PGE₂EP₃受容体、若しくはPGE₂EP₄受容体のアゴニスト又はアンタゴニスト；PGD₂受容体、若しくはCRTH₂受容体のアゴニスト又はアンタゴニスト；PGFFP受容体のアゴニスト又はアンタゴニスト；PG_{II}P受容体のアゴニスト又はアンタゴニスト；並びにTX受容体のアゴニスト又はアンタゴニスト等が挙げられる。

[0519] ロイコトリエン受容体拮抗剤としては、例えばプラシルカスト水和物、モンテルカスト、ザフィルルカスト、セラトロダスト、MCC-847、KCA-757、CS-615、YM-158、L-740515、CP-195494、LM-1484、RS-635、A-93178、S-36496、BII-L-284、及びONO-4057等が挙げられる。

[0520] その他の鎮咳薬としては、例えばリン酸コデイン、リン酸ジヒドロコデイン、オキシメテバノール、臭化水素酸デキストロメトルファン、クエン酸ペントキシベリン、リン酸ジメモルファン、クエン酸オキセラジン、クロペラスチン、リン酸ベンプロペリン、塩酸クロフェダノール、塩酸ホミノベン、ノスカピン、ヒベンズ酸チペミジン、塩酸エブラジノン、及びシャゼンソウエキス等が挙げられる。

[0521] 去痰薬としては、例えばアンモニアウイキョウ精、炭酸水素ナトリウム、ヨウ化カリウム、塩酸ブロムヘキシン、桜皮エキス、カルボシステイン、フドステイン、塩酸アンブロキシソール、塩酸アンブロキシゾール徐放剤、メチルシステイン塩酸塩、アセチルシステイン、塩酸レーエチルシステイン、及びチロキサポール等が挙げられる。

[0522] 本発明は以下の側面を有する。

<1 a>咳嗽の予防又は治療の方法であって、それが必要な対象（例えばヒトを含む哺乳類）に、P₂X₄受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の治療有効量を投与することを含む前記方法；

<2 a>前記咳嗽が、急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽である、<1 a>

に記載の方法；

< 3 a > 前記咳嗽が、慢性咳嗽である、< 2 a > に記載の方法；

< 4 a > 前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 1 a > に記載の方法；

< 5 a > 前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 4 a > に記載の方法；

< 6 a > 前記咳嗽が、湿性咳嗽である、副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽又は喘息による咳嗽である、< 1 a > に記載の方法；

< 7 a > 乾性咳嗽の末梢性鎮咳の方法であって、それが必要な対象（例えばヒトを含む哺乳類）に、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の治療有効量を投与することを含む前記方法；

< 8 a > 乾性咳嗽の末梢性鎮咳に対して選択的である、< 7 a > に記載の方法；

< 9 a > 前記乾性咳嗽が、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 7 a > 又は < 8 a > に記載の方法；

< 10 a > 前記 P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物が、前記一般式 (A I) ないし (H I I) のいずれか 1 つで表される化合物（ここで、前記一般式 (A I) ないし (H I I) のいずれか 1 つで表される化合物の具体例及び好適な例は、本明細書に記載のとおりである）である、< 1 a > ないし < 9 a > のいずれか 1 つに記載の方法；

[0523] < 1 b > 咳嗽の予防又は治療において使用されるための、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

< 2 b > 前記咳嗽が、急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽である、< 1 b > の記載に従って使用されるための、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物

、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜3 b＞前記咳嗽が、慢性咳嗽である、＜2 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜4 b＞前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、＜1 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜5 b＞前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、＜4 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜6 b＞前記咳嗽が、湿性咳嗽である、副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽又は喘息による咳嗽である、＜1 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜7 b＞前記咳嗽の予防又は治療が、乾性咳嗽の末梢性鎮咳である、＜1 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

＜8 b＞乾性咳嗽の末梢性鎮咳に対して選択的である、＜7 b＞の記載に従って使用されるための、P2X4受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその

水和物若しくは溶媒和物；

< 9 b > 前記乾性咳嗽が、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 7 b > 又は < 8 b > の記載に従って使用されるための、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

< 10 b > 前記 P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物が、前記一般式 (A 1) ないし (H 1 1) のいずれか 1 つで表される化合物（ここで、前記一般式 (A 1) ないし (H 1 1) のいずれか 1 つで表される化合物の具体例及び好適な例は、本明細書に記載のとおりである）である、< 1 b > ないし < 9 b > のいずれか 1 つに記載に従って使用されるための、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物；

[0524] < 1 c > 咳嗽の予防又は治療のための医薬を製造するための、P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の使用；

< 2 c > 前記咳嗽が、急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽である、< 1 c > に記載の使用；

< 3 c > 前記咳嗽が、慢性咳嗽である、< 2 c > に記載の使用；

< 4 c > 前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 1 c > に記載の使用；

< 5 c > 前記咳嗽が、乾性咳嗽である、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 4 c > に記載の使用；

< 6 c > 前記咳嗽が、湿性咳嗽である、副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽又は喘息による咳嗽である、< 1 c > に記載の使用；

< 7 c > 乾性咳嗽の末梢性鎮咳薬を製造するための、P 2 X 4 受容体拮抗作

用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物の使用；

< 8 c > 前記乾性咳嗽の末梢性鎮咳薬が、乾性咳嗽の末梢性鎮咳に対して選択的な医薬である、< 7 c > に記載の使用；

< 9 c > 前記乾性咳嗽が、咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、< 7 c > 又は < 8 c > に記載の使用；又は

< 10 c > 前記 P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物が、前記一般式 (A I) ないし (H I I) のいずれか 1 つで表される化合物（ここで、前記一般式 (A I) ないし (H I I) のいずれか 1 つで表される化合物の具体例及び好適な例は、本明細書に記載のとおりである）である、< 1 c > ないし < 9 c > のいずれか 1 つに記載の使用。

- [0525] 1 つの側面として、「乾性咳嗽」は、「湿性咳嗽」に対立する概念である。別の側面として、「末梢性鎮咳」は、「中枢性鎮咳」に対立する概念である。本明細書において、A に対して「選択的」という表現は、A に対する作用効果がその他に対する作用効果よりも相対的に優れていることを含み、また、A に対する作用効果のみを有し、その他に対する作用効果を有しないことを含み得る概念を表す。したがって、本明細書において、「乾性咳嗽の末梢性鎮咳に対して選択的」という表現は、「乾性咳嗽」に対する有効性が「湿性咳嗽」に対する有効性よりも相対的に優れていることを含み、また、「乾性咳嗽」に対する有効性のみを有し、「湿性咳嗽」に対する有効性を有しないことを含み、かつ「末梢性鎮咳」の効果が「中枢性鎮咳」の効果よりも相対的に優れていることを含み、また、「末梢性鎮咳」の効果のみを有し、「中枢性鎮咳」の効果を有しないことを含み得る概念を表す。

実施例

- [0526] 以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例に限定されることはない。

以下の実施例では、P 2 X 4 アンタゴニストとして、5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1,

4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩 (WO 2010/093061、実施例1の化合物のナトリウム塩: 以下「化合物A」と呼ぶ)、5-[4-(2-ヨードベンゾイルアミノ) フェニル]-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン (WO 2013/105608、実施例48の化合物: 以下「化合物B」と呼ぶ)、5-[4-[2-(トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル]-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン (WO 2013/105608、実施例2の化合物: 以下「化合物C」と呼ぶ) 及び2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド 二塩酸塩 (WO 2015/005467、実施例15の化合物: 以下「化合物D」と呼ぶ)、並びに以下に示すその他の化合物を用いた。

[0527] 実施例1

本発明の有効成分である化合物の P2X4 受容体拮抗作用の測定

(試験方法)

本発明の有効成分である化合物の P2X4 受容体拮抗作用を測定した。ATP 受容体 (ヒト P2X4) を 1321N1 細胞に導入し、P2X4 受容体安定発現系として使用した。P2X4 受容体発現細胞を 96 ウェルプレートに播種し、37℃、5%CO₂ 条件下で 24 時間培養してカルシウム測定に使用した。カルシウム蛍光指示薬である Fura-2 AM をカルシウムイメージング用細胞外液に溶解させ、播種した細胞に処置し、室温で 45 分間静置することで細胞内に Fura-2 AM を取り込ませた。測定にはマイクロプレートリーダーである EnVision (PerkinElmer) を使用した。キセノンランプから照射される光を 340 nm 及び 380 nm のフィルターにそれぞれ透過させ、細胞に照射した際に発する 510 nm の蛍光 F₃₄₀ 及び F₃₈₀ を観測し、レシオ値 F₃₄₀/F₃₈₀ の変化を細胞内カルシウム変化の指標とした。測定は、ATP 最終濃度 1 μM になるよう

に各ウェルに添加し、A T P 誘発細胞内カルシウム応答を経時的に観察することで行った。被験物質の阻害活性は被験物質を A T P 添加 1 5 分間前処置することにより測定し、被験物質非存在下の場合との比較により算出した。結果を以下の表 1 3 1 に示す。

[0528] (試験結果)

[0529] [表131]

被験物質	I C 5 0 (μ M)
化合物 A 2 (化合物 A)	0 . 5 3
化合物 A 1 7	0 . 2 7
化合物 A 2 1	0 . 9 1
化合物 A 2 3	0 . 4 9
化合物 B 2	0 . 3 6
化合物 C 2	0 . 5 7
化合物 D 2	0 . 3 3

[0530] 実施例 2

気道炎症による慢性咳嗽モデルマウスの作製

気道炎症による慢性咳嗽モデルマウス（「気道炎症モデルマウス」と称する）を作製した。

気道炎症モデルマウスは、マウスにジエチルエーテル吸入麻酔下で lipopolysaccharide (L P S : $1 \mu\text{g} / 100 \mu\text{L}$) を 1 日 1 回 3 日間連続で点鼻投与することにより作製した。

また、気道炎症モデルマウスに対する薬効評価実験は L P S 最終投与 2 4 時間後に行う。

[0531] 実施例 3

化合物 A の鎮咳作用の確認

化合物 A の鎮咳作用の有無を確認するために、精製水と化合物 A : 0 . 3 、 1 、 3 、 $10 \text{ mg} / \text{kg}$ をそれぞれ経口投与したマウスに投与 1 時間後ネブライザーでクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発し影響を調べた。

なお、本願明細書において何ら処置も投与も行っていないマウスを「処置前マウス」と、処置前マウスに精製水を投与したマウスを「対照群マウス」

と、処置前マウスに実験対象化合物を投与したマウスを「実験群マウス」と称する。

[0532] クエン酸刺激による咳嗽反射の測定は、以下の方法により行った。

このとき、マウスはICR系マウスを用い、クエン酸は0.25Mのクエン酸を用いた。

[0533] (咳嗽反射の測定方法)

咳嗽反射は、無麻酔下のマウス又はモルモットにクエン酸(マウスの場合は0.1Mあるいは0.25M、モルモットの場合は0.25Mあるいは0.5M)を吸入させることにより誘発する。クエン酸は超音波ネブライザー(NE-U17:オムロン)で煙霧質とし、人工呼吸器(SN-480-7:シナノ製作所)で送気することにより吸入させる。煙霧質としたクエン酸の平均粒子径は1-8 μ mで、人工呼吸器による送気は、1回換気量6mL、1分間に30回の速さで行い、吸入時間は3分間とする。

呼吸及び咳嗽反射は、body-plethysmograph法に従い測定する。使用するplethysmographは、プラスチック製の円筒形で、マウス又はモルモットの胴体を入れるシリンダーの部分と頭部より被せるキャップ部分より構成されている(プラスチック製の円筒は、実験動物を収納することができればよく、例えばマウスであれば直径4cm、長さ7cmのものをを用いた)。シリンダー上部には、シリコンチューブにより呼吸流量(TP-602T:日本光電)と接続できるように排気口を開ける。シリンダー内部を密閉するために、動物の頸部にゴム製及びセルロイド製の首輪を取り付け、頭部全体を覆うキャップにより固定する。頭部に取り付けたキャップ部分には、咳嗽誘発物質吸入のための吸入口及び排気口を開ける。また、シリンダーの尾部には実験動物の出し入れが容易になるようにスクリー式の蓋を取り付ける。マウスをシリンダー内に入れ、少なくとも30分以上放置し、実験環境に適応させた後に実験を行う。呼吸の測定は、シリンダー内の実験動物の呼吸による胸部の動きをシリンダー内の容積変化とし、呼吸流量計を介してPowerLab(ML826 PowerLab 2/2

6 : A D I n s t r u m e n t s) により測定用 P C (i d e a p a d 3 0 0 : L e n o v o) に記録することにより行う。咳嗽が誘発されると、実験動物の胸部が激しく動くため、シリンダー内に瞬間的に大きな容積変化が起こり、これが呼吸流量計を介して記録される。この回数を記録することにより咳嗽数の測定を行う。データ解析は、L a b C h a r t v e r s i o n 8 (A D I n s t r u m e n t s) を用いて行う。また、クエン酸を吸入する直前に、15 秒間あたりの呼吸回数を測定する。

[0534] (試験結果)

得られた結果を図 1 及び図 2 に示す。

図 1 の p r e 群は処置前マウスに 0. 25 M のクエン酸刺激を与えた後の咳嗽回数であり、図 1 の p o s t 群は、前記処置前マウスにあらかじめ (クエン酸投与 1 時間前に) 精製水を経口投与した対照群マウスと化合物 A : 0. 3、1、3、10 m g / k g を経口投与した実験群マウスそれぞれに 0. 5 M のクエン酸刺激を与えた後の咳嗽回数を表したものである。

ここで図 2 は、本実施例の結果 (図 1) において、咳嗽回数が増減しなかった場合を 0 %、咳嗽回数が 0 となった場合を 100 %、としたときの抑制率を表したものである。

化合物 A は、用量依存的にクエン酸誘発咳嗽を抑制し、1 m g / k g から有意な抑制作用を示した。

[0535] 実施例 4

ジヒドロコデインの鎮咳作用の測定

また化合物 A とジヒドロコデインとを比較検討するため、対照群マウスと、処置前マウスにジヒドロコデイン 10 m g / k g を経口投与した実験群マウスを、実施例 3 と同様の方法で検討を行った。このとき、マウスは I C R 系マウスを用いた。結果を図 3 に示す。

[0536] (試験結果)

精製水とジヒドロコデインを投与した 1 時間後に、0. 25 M のクエン酸をネブライザーにより咳嗽を惹起させた場合、その咳嗽抑制率は、化合物 A

と同用量のジヒドロコデインにおいて、同等であった。

[0537] 実施例 5

気道炎症モデルマウスを用いた慢性咳嗽に対する化合物 A の効果

気道炎症モデルマウスを用いて慢性咳嗽に対する化合物 A の薬効を調べた結果を図 4 に示す。

[0538] (試験結果)

気道炎症モデルマウスを用いて、実施例 3 と同様の方法で咳嗽反射を誘発させた。

このとき、気道炎症モデルマウスは I C R 系マウスを用いて作製し、クエン酸は 0.1 M クエン酸を用いた。

[0539] 処置前マウス (図 4 中の (a)、(b)、(c) 及び (d) の p r e 1) に 0.1 M クエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発させた場合と比較して、前記処置前マウスに実施例 2 において L P S に替えて生理食塩水を点鼻したマウス (以後、本願明細書において「s h a m 群マウス」と称する、図 4 中の (a) 及び (b)) に 0.1 M クエン酸刺激を与えた場合では咳嗽数の変化は見られなかった (図 4 中の (a) 及び (b) の p r e 2)。

これに対し、前記処置前マウスに実施例 2 の方法で作製した気道炎症モデルマウス (以後、本願明細書において「気道炎症群マウス」と称する、図 4 中の (c) 及び (d)) に 0.1 M クエン酸刺激を与えると咳嗽反応の増加が観察される (図 4 中の (c) 及び (d) の p r e 2)。

この咳嗽刺激に対して過敏な状態の気道炎症群マウスにあらかじめ (クエン酸刺激の 1 時間前に) 化合物 A 0.3 m g / k g を経口投与すると、気道炎症によって増加した咳嗽反応を完全に抑制した (図 4 中の (d) の p o s t) 。一方で、S h a m 群マウスにあらかじめ (クエン酸刺激の 1 時間前に) 化合物 A 0.3 m g / k g を経口投与しても咳嗽数に変化は見られなかった (図 4 中の (b) の p o s t) 。

したがって、0.3 m g / k g の化合物 A は、S h a m 群マウスの検討 (図 4 (b) における p r e 2 と p o s t との比較) において有意な薬効を示

さなかった（ 0.3 mg/kg の化合物Aは実施例3の検討において有意な薬効を示さなかった）。このことから、生体防御に必要な咳（ 0.1 M クエン酸による誘発咳嗽）は抑制せず、気道炎症によって咳嗽反射が過敏となった分のみを抑制することが明らかとなった。これは、必要な咳も全て抑制してしまうジヒドロコデインなどの中枢性鎮咳薬とは異なる特徴であると考えられる。

なお、図4中の（a）及び（c）のpostはそれぞれ、化合物Aとの比較として、Sham群マウスと気道炎症群マウスにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）精製水を投与した対照群の結果を示すものである。

[0540] 実施例6

化合物Aのネブライザーを用いた局所投与による薬効評価

化合物Aを経口投与ではなくネブライザーを用いた局所投与による薬効評価結果を図5及び図6に示す。このとき、マウスはICR系マウスを用いた。ここで図6は、本実施例の結果（図5）において、咳嗽回数が増減しなかった場合を0%、咳嗽回数が0となった場合を100%、としたときの抑制率を表したものである。

[0541] （試験結果）

処置前マウス（図5中のpre群）に対してネブライザーで精製水を吸入させた対照群マウス（図5中の（a）のpost）と、化合物Aをそれぞれ $10\mu\text{g/mL}$ （図5中の（b）のpost）、 $30\mu\text{g/mL}$ （図5中の（c）のpost）及び $100\mu\text{g/mL}$ （図5中の（d）のpost）の濃度で吸入させた実験群マウスに対し、その4分後に 0.25 M クエン酸刺激をネブライザーにて加えて咳嗽を惹起した。

その結果、化合物Aの局所投与により、経口投与と比較してより低用量でより強力かつ速やかに用量依存的な鎮咳作用を示した。

実施例7

（P2X4受容体拮抗作用）

[0542] 本発明化合物のP2X4受容体拮抗作用を測定した。

(試験方法)

実施例 1 と同様の方法で P 2 X 4 受容体拮抗作用を測定し、その結果を表 1 3 2 に示す。

(試験結果)

[0543] [表132]

被験物質	I C 5 0 (μM)
化合物 F 2	0. 7 5
化合物 F 2 0	1. 2 0
化合物 F 4 8 (化合物 B)	0. 3 0
化合物 F 5 7	0. 7 2
化合物 F 7 1	0. 4 0
化合物 F 1 0 6	1. 8 0
化合物 F 1 1 8	1. 1 0
化合物 F 1 7 3	0. 0 6
化合物 F 1 9 6	0. 9 7
化合物 F 1 9 7	0. 4 4
化合物 F 2 0 8	1. 3 0
化合物 F 2 0 9	0. 9 4
化合物 F 2 1 0	1. 4 0
化合物 F 2 1 4	0. 6 2

実施例 8

(P 2 X 4 受容体拮抗作用)

[0544] 本発明化合物の P 2 X 4 受容体拮抗作用を測定した。

(試験方法)

実施例 1 と同様の方法で P 2 X 4 受容体拮抗作用を測定し、その結果を表 1 3 3 に示す。

(試験結果)

[0545] [表133]

試験化合物	阻害作用 I C 5 0 (μM)
化合物 G 1 5	0. 8 8

[0546] 実施例 9

(モルモットにおける化合物Aの鎮咳作用の確認)

化合物Aの鎮咳作用の有無を確認するために、実施例3に記載の(咳嗽反射の測定方法)に従い、精製水及び化合物A: 1、3及び10mg/kgを経口投与したモルモットに投与1時間後ネブライザーでクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発しその影響を調べた。

このとき、モルモットはHartly系モルモットを用い、クエン酸は0.5Mのクエン酸を用いた。

[0547] (試験結果)

得られた結果を図7及び図8に示す。

図7のpre群は何ら処置も投与も行っていないHartly系モルモットに0.5Mのクエン酸刺激を与えた後の咳嗽回数であり、図7のpost群は、前記処置前モルモットにあらかじめ(クエン酸投与1時間前に)精製水と化合物A: 1、3、10mg/kgをそれぞれ経口投与したモルモットに0.5Mのクエン酸刺激を与えた後の咳嗽回数である。

なお、本願明細書において何ら処置も投与も行っていないモルモットを「処置前モルモット」と、処置前モルモットに精製水を投与したモルモットを「対照群モルモット」と、処置前モルモットに実験対象化合物を投与したモルモットを「実験群モルモット」と称する。

また、図8は、本実施例の結果(図7)において、咳嗽回数が増減しなかった場合を0%、咳嗽回数が0となった場合を100%、としたときの抑制率を表したものである。

これらの結果から、化合物Aは、用量依存的にクエン酸誘発咳嗽を抑制し、1mg/kgから有意な抑制作用を示すことが確認されした。

[0548] 実施例10

(モルモットにおける化合物Bの鎮咳作用の確認)

化合物Bの鎮咳作用の有無を確認するために、実施例3に記載の(咳嗽反射の測定方法)に従い、精製水及び化合物B: 1、3、10及び30mg/kgを経口投与したモルモットに投与1時間後ネブライザーでクエン酸刺激を

与え咳嗽反射を誘発しその影響を調べた。

このとき、モルモットはH a r t l y系モルモットを用い、クエン酸は0.5 Mのクエン酸を用いた。

[0549] (試験結果)

得られた結果を図9及び図10に示す。

図9のp r e群は処置前モルモットに0.5 Mのクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発した結果である。また、図9のp o s t群は、前記処置前モルモットにあらかじめ（クエン酸投与1時間前に）精製水及び化合物B：1、3、10及び30 m g / k gを経口投与した対照群モルモット及び実験群モルモットに0.5 Mのクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発した結果である。

図10は、本実施例の結果（図9）において、咳嗽回数が増減しなかった場合を0%、咳嗽回数が0となった場合を100%、としたときの抑制率を表したものである。

この結果、化合物Bは、用量依存的にクエン酸誘発咳嗽を抑制し、1 m g / k gから有意な抑制作用を示した。

[0550] 実施例11

(モルモットO V A感作咳嗽モデルの作製)

外来抗原であるO V Aを吸入することで、好酸球浸潤を伴う気道炎症が誘導されることから、O V Aで感作したモルモットは、アレルギー性咳嗽及びアトピー性咳嗽の症状を呈する。したがって、ヒトでの臨床を反映した病態モデル（抗原誘発性気道炎症モデル動物）として広く使われている。そこで、本願実施例において、本願化合物が前記病態モデルに対しても咳嗽抑制作用を評価した。

[0551] モルモットO V A感作咳嗽モデルは、具体的には以下に示す方法にて作製した。

なお、以下の方法におけるO v a l b u m i n、m e p y r a m i n e m a l e a t eはs a l i n eに溶解して用いる。

事前にクエン酸誘発咳嗽数を測定した後、モルモット1匹当たり0.05%

OVA (Ovalbumin) 200 μ L と Imject Alum (水酸化アルミニウム及び水酸化マグネシウムをそれぞれ 40 mg/mL の濃度で水に懸濁させたものに不活化安定剤を添加したもの) 100 μ L を混和したものを腹腔内投与 (i.p.) する。

上記腹腔内投与後、7、14、21、28 日目に 0.5% OVA を 5 分間吸入させる。なお、吸入 30 分前にショック症状予防の目的で mepyramine maleate (10 mg/kg) を i.p. する。

35 日目に 0.5% ovalbumin を 60 分間吸入させる。なお、吸入 30 分前にショック症状予防の目的で mepyramine maleate (10 mg/kg) を i.p. する。

最終の 0.5% ovalbumin challenge (35 日目) の翌日に実験を行う。

[0552] 実施例 12

(モルモットにおける OVA 感作誘発咳嗽に対する化合物 A の効果)

臨床を反映した病態モデルであるモルモット OVA 感作咳嗽モデルにおける OVA 感作誘発咳嗽に対する化合物 A の薬効を調べた結果を図 11 に示す。

[0553] (試験結果)

モルモット OVA 感作咳嗽モデルを用いて、実施例 9 と同様の方法で 0.25 M クエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発させた。また本実施例において用いたモルモットは、後述する処置前モルモット、sham 群モルモット及び OVA 感作咳嗽群モルモットのいずれも Hartly 系モルモットを用いた。

[0554] 処置前モルモット (図 11 中 (a)、(b)、(c) 及び (d) の pre 1) に 0.25 M クエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発させた場合と比較して、前記処置前モルモットに実施例 11 の方法に従い、OVA に替えて生理食塩水を点鼻したモルモット (以後、本願明細書において「sham 群モルモット」と称する、図 11 中の (a) 及び (b)) に 0.1 M クエン酸刺激を

与えた場合では咳嗽数の変化は見られなかった（図 11 中の（a）及び（b）の p r e 2）。

これに対し、前記処置前モルモットに実施例 11 の方法で作製したモルモット O V A 感作咳嗽モデル（以後、本願明細書において「O V A 感作咳嗽群モルモット」と称する、図 11 中の（c）及び（d））に 0.1 M クエン酸刺激を与えると咳嗽反応の増加が観察される（図 11 中の（c）及び（d）の p r e 2）。

[0555] この咳嗽刺激に対して過敏な状態の前記 O V A 感作咳嗽群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の 1 時間前に）化合物 A を 1 m g / k g にて経口投与すると、気道炎症によって増加した咳嗽反応を完全に抑制した（図 11 中の（d）の p o s t）。一方で、s h a m 群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の 1 時間前に）化合物 A を 1 m g / k g にて経口投与しても咳嗽数に変化は見られなかった（図 11 中の（b）の p o s t）。

なお、図 11 中の（a）及び（c）の p o s t はそれぞれ、化合物 A との比較として、S h a m 群モルモットと O V A 感作咳嗽群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の 1 時間前に）精製水を投与した対照群の結果を示すものである。

[0556] 以上の結果から、臨床を反映した病態モデルにおいても、生体防御に必要な咳（0.25 M クエン酸による誘発咳嗽）は抑制せず、気道炎症によって咳嗽反射が過敏となった分のみを抑制することが明らかとなった。これは、必要な咳も全て抑制してしまうジヒドロコデインなどの中枢性鎮咳薬とは異なる特徴であると考えられる。

[0557] 実施例 13

（モルモットにおける O V A 感作誘発咳嗽に対する化合物 B の効果）

臨床を反映した病態モデルであるモルモット O V A 感作咳嗽モデルにおける O V A 感作誘発咳嗽に対する化合物 B の薬効を調べた結果を図 12 に示す。

[0558] （試験結果）

モルモットOVA感作咳嗽モデルを用いて、実施例10と同様の方法で0.25Mクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発させた。また本実施例において用いたモルモットは、後述する処置前モルモット、sham群モルモット及びOVA感作咳嗽群モルモットのいずれもHartley系モルモットを用いた。

[0559] 処置前モルモット（図12中の（a）、（b）、（c）及び（d）のpre1）に0.25Mクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発させた場合と比較して、sham群モルモット（図12中の（a）及び（b））に0.1Mクエン酸刺激を与えた場合では咳嗽数の変化は見られなかった（図11中の（a）及び（b）のpre2）。

これに対し、OVA感作咳嗽群モルモット（図12中の（c）及び（d））に0.1Mクエン酸刺激を与えると咳嗽反応の増加が観察される（図12中の（c）及び（d）のpre2）。

[0560] この咳嗽刺激に対して過敏な状態の前記OVA感作咳嗽群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）化合物Bを1mg/kgにて経口投与すると、気道炎症によって増加した咳嗽反応を完全に抑制した（図12中の（d）のpost）。一方で、sham群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）化合物Bを1mg/kgにて経口投与しても咳嗽数に変化は見られなかった（図12中の（b）のpost）。

さらに、1mg/kgの化合物Bは実施例10（図10）の検討においては有意な薬効を示していない。

なお、図12中の（a）及び（c）のpostはそれぞれ、化合物Bとの比較として、Sham群モルモットとOVA感作咳嗽群モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）精製水を投与した対照群の結果を示すものである。

[0561] 以上の結果から、臨床を反映した病態モデルにおいても、生体防御に必要な咳（0.25Mクエン酸による誘発咳嗽）は抑制せず、気道炎症によって咳嗽反射が過敏となった分のみを抑制することが明らかとなった。これは、

必要な咳も全て抑制してしまうジヒドロコデインなどの中枢性鎮咳薬とは異なる特徴であると考えられる。

実施例 1 4

(P 2 X 4 受容体拮抗作用)

[0562] 本発明化合物の P 2 X 4 受容体拮抗作用を測定した。

(試験方法)

実施例 1 と同様の方法で P 2 X 4 受容体拮抗作用を測定し、その結果を表 1 3 4 ～表 1 3 6 に示す。

(試験結果)

[0563] [表134]

試験化合物	阻害作用 I C 5 0 (μ M)
化合物 H 1	0 . 0 2 5
化合物 H 2	0 . 0 3 7
化合物 H 4	0 . 0 4 4
化合物 H 1 1	0 . 0 7 7
化合物 H 2 1	0 . 0 7 8

[0564] [表135]

試験化合物	阻害作用 I C 5 0 (μ M)
化合物 H 2 2	0 . 0 9 1
化合物 H 2 5	0 . 0 8 2
化合物 H 2 7	0 . 0 7 8
化合物 H 3 1	0 . 0 5 1
化合物 H 3 7	0 . 0 7 9
化合物 H 4 2	0 . 0 9 2
化合物 H 4 3	0 . 0 5 3
化合物 H 4 7	0 . 0 9 4

[0565]

[表136]

試験化合物	阻害作用 IC ₅₀ (μM)
化合物H 6 1	0. 0 7 4
化合物H 6 2	0. 0 8 8
化合物H 6 7	0. 0 5 3
化合物H 7 9	0. 0 3 9
化合物H 8 3	0. 0 8 7

[0566] 実施例 1 5

(モルモットにおけるクエン酸誘発咳嗽に対する化合物C及び化合物Dの効果)

何ら処置も投与も行っていないHartly系モルモット (処置前モルモット) にクエン酸刺激を与え、咳嗽反射を誘発し、その影響を調べた。クエン酸刺激による咳嗽反射に対する化合物C及び化合物Dの薬効を調べた結果を図 1 3に示す。

[0567] (確認方法)

化合物C及び化合物Dの鎮咳作用の有無を確認するために、処置前モルモットを用いて、実施例 3 に記載の (咳嗽反射の測定方法) に従い、精製水、化合物C : 5 8. 8 m g / k g 及び化合物D : 3 0 m g / k g を経口投与したモルモットに投与1時間後ネブライザーでクエン酸刺激を与え咳嗽反射を誘発しその影響を調べた。処置前クエン酸は 0. 5 M のクエン酸を用いた。

[0568] (試験結果)

得られた結果を図 1 3 に示す。

処置前モルモット (図 1 3 中の (a) ないし (c)) に 0. 5 M クエン酸刺激を与えたときの咳嗽反応 (図 1 3 中の (a) の p r e) と、前記処置前モルモットにあらかじめ (クエン酸刺激の1時間前に) 精製水を経口投与した後に 0. 5 M クエン酸刺激を与えたときの咳嗽反応 (図 1 3 中の (a) の p o s t) とでは、咳嗽数の変化は見られなかった。

これに対して、前記処置前モルモットに 0. 5 M クエン酸刺激を与えたと

きの咳嗽反応（図13中の（b）のpre）と、前記処置前モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）化合物Cを58.8mg/kgにて経口投与した後に0.5Mクエン酸刺激を与えたときの咳嗽反応（図13中の（b）のpost）とでは、咳嗽数を有意に減少させた。実施例12及び13と同様に、気道炎症によって増加した咳嗽反応を完全に抑制することが示された。

また同様に、前記処置前群モルモットに0.5Mクエン酸刺激を与えたときの咳嗽反応（図13中の（c）のpre）と、前記処置前モルモットにあらかじめ（クエン酸刺激の1時間前に）化合物Dを30mg/kgにて経口投与した後に0.5Mクエン酸刺激を与えたときの咳嗽反応（図13中の（c）のpost）とにおいても、咳嗽数を有意に減少させた。化合物Dにおいても、実施例12及び13と同様に、気道炎症によって増加した咳嗽反応を完全に抑制することが示された。

また、図14は、本実施例の結果（図13の（b）及び（c））において、咳嗽回数が増減しなかった場合を0%、咳嗽回数が0となった場合を100%、としたときの抑制率を表したものである。

[0569] 以上の結果から、臨床を反映した病態モデルにおいても、化合物C及び化合物Dは、生体防御に必要な咳（0.5Mクエン酸による誘発咳嗽）は抑制せず、気道炎症によって咳嗽反射が過敏となった分のみを抑制することが明らかとなった。これは、必要な咳も全て抑制してしまうジヒドロコデインなどの中枢性鎮咳薬とは異なる特徴であると考えられる。

[0570] 実施例16

5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩の合成

国際公開2010/093061実施例1に記載の5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオンを、国際公開2012/00

8478に記載の実施例2(2)の方法を参考にすることで表題化合物を得た。

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 3.17 (1H, d, $J=12\text{Hz}$), 3.73 (1H, d, $J=12\text{Hz}$), 7.05 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.19 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.47 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.5–7.7 (4H, m), 7.88 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.93 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.26 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 10.92 (1H, br s)

[0571] 実施例17

5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-2-オン ナトリウム塩の合成

国際公開2008/023847実施例2に記載の方法にて得られた5-(3-ヒドロキシフェニル)-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e]-1,4-ジアゼピン-2-オンを、国際公開2010/093061に記載の合成スキームの(方法3)又は国際公開2012/017876の(合成方法2)段落[0054]ないし[0060]に記載の方法を参考にして、5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-2-オンを得た。5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1,3-ジヒドロ-2H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-2-オンを国際公開2012/008478に記載の実施例2(2)の方法を参考にすることで表題化合物を得た。

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 3.81 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 4.60 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.21 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.4–7.5 (2H, m), 7.6–7.8 (3H, m), 7.9–8.2 (3H, m), 8.3–8.5 (1H, m), 10.85 (1H, br s)

[0572] 実施例 18

5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオン ナトリウム塩の合成

国際公開2013/105608に記載の合成スキームの合成法3(段落[0043])若しくは国際公開2010/093061に記載の合成スキームの(方法3)を参考にして5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオンを得た。5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-2,4(3H,5H)-ジオンを国際公開2012/008478に記載の実施例2(2)の方法を参考にすることで表題化合物を得た。

^1H NMR (DMSO- d_6 , 400MHz) δ : 3.12 (1H, d, $J=12\text{Hz}$), 3.97 (1H, d, $J=12\text{Hz}$), 7.01 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.2-7.4 (2H, m), 7.6-7.7 (4H, m), 7.87 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.22 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 10.89 (1H, br s)

[0573] 実施例 19

本発明の医薬を、カプセル剤として以下のとおり調製することができる。

化合物A、乳糖、コーンスターチ及び低置換度ヒドロキシプロピルセルロースをV型混合機に投入し混合してカプセル処方物を得ることができる。

顆粒 270mg中の組成

化合物A: 100mg, 乳糖: 94mg, コーンスターチ: 40mg, 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース: 21mg及びヒドロキシプロピルセルロース: 15mg

得られたカプセル処方物270mgを3号カプセルに手充填し、カプセル剤を得ることができる。

また、化合物BないしDについても同様にカプセル剤を得ることができる。

[0574] 実施例 20

本発明の医薬を、ネブライザー処方物として以下のとおり調製することができる。

化合物Aを滅菌精製水に溶解して10～100 $\mu\text{g}/\text{mL}$ の溶液とし、これにNaCl溶液：9 mg/mL を加えてネブライザー処方物を調製することができる。

[0575] 実施例 21

(モルモット摘出気管・気管支平滑筋収縮に対する化合物Aの作用)

(試験方法)

動物をurethane (2 g/kg , i.p.)麻酔下、腹部大動脈切開にて瀉血致死させ開胸し、左主気管支組織を摘出した。結合組織、血管等の除去後、それぞれ幅約3 mmのリング標本作製してオルガンバス内に懸垂し、resting tension 1.0 g にて等尺性張力を測定した。各リング標本についてbaseline tensionの安定化後、acetylcholine (ACh: 10^{-3} M)による収縮反応を確認した後、以下の検討を行った。

[0576] ACh誘発収縮筋を用いて副交感神経興奮時の気道収縮をin vitroにて模倣し、その収縮反応に対する化合物Aの作用を観察した。化合物Aの溶媒として、水を用い、 10^{-5} Mを最終濃度として用いた。

(試験結果)

化合物A (10^{-5}M) は、baseline tension及び気管支平滑筋の 10^{-5}M ACh収縮反応（最大収縮の約50%の収縮）に対し影響を及ぼさなかった。得られた結果を図15に示す。

[0577] 実施例 22

(モルモット摘出気管・気管支平滑筋収縮に対する化合物Bの作用)

(試験方法)

動物をurethane (2 g/kg , i.p.)麻酔下、腹部大動脈切開にて瀉血致死させ

開胸し、気管あるいは左主気管支組織を摘出した。結合組織、血管等の除去後、それぞれ幅約3 mmのリング標本を作製してオルガンバス内に懸垂し、resting tension 1.0 gにて等尺性張力を測定した。各リング標本についてbaseline tensionの安定化後、acetylcholine (ACh: 10^{-3} M)による収縮反応を確認した後、以下の検討を行った。

[0578] ACh誘発収縮筋を用いて副交感神経興奮時の気道収縮をin vitroにて模倣し、その収縮反応に対する化合物Bの作用を観察した。化合物Bの溶媒として、0.1% DMSOを最終濃度として用いた。 10^{-5} M AChによる収縮反応（最大収縮の約50%の収縮）が安定化した後に、 10^{-6} M 化合物B (DMSO final 0.1%)で処置した。同様に0.1% DMSOのみで処置した。

(試験結果)

溶媒である0.1% DMSO自体及び化合物B (10^{-6} M)は、気管支平滑筋のACh収縮には影響を与えなかった。得られた結果を図16に示す。

産業上の利用可能性

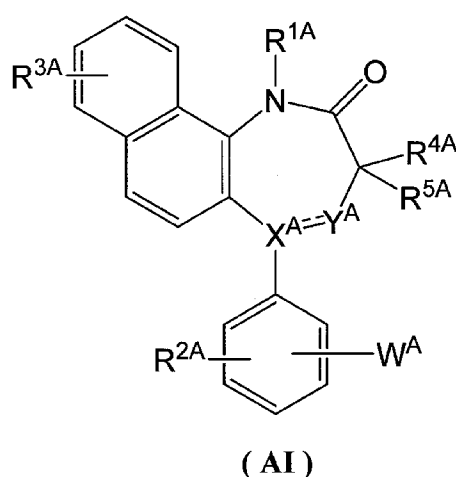
[0579] 本発明の医薬は、咳嗽、好ましくは急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽、より好ましくは慢性咳嗽の予防又は治療のための医薬として有用であり、さらには、例えば慢性咳嗽の原因疾患として挙げられる乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽若しくはアレルギー性咳嗽などの咳嗽、又は湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽若しくは喘息による咳嗽などの咳嗽の予防又は治療において高い有効性が期待される。特に、乾性咳嗽に有用であり、中でも咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽又はアレルギー性咳嗽に有用である。

請求の範囲

[請求項1] P 2 X 4 受容体拮抗作用を有する化合物、前記化合物の互変異性体、立体異性体若しくはその薬学的に許容される塩、又はその水和物若しくは溶媒和物を有効成分として含む、咳嗽の予防又は治療のための医薬。

[請求項2] 前記化合物が次の一般式 (A I) :

[化1]



(式中、R^{1A}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{2A}及びR^{3A}は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキ

シ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{4A} 及び R^{5A} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

W^A は置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環を表し、

そして、 X^A がNのとき、 Y^A はC=Oで、かつ実線と破線からなる二重線は単結合を表し、

X^A がCのとき、 Y^A はNで、かつ実線と破線からなる二重線は二重結合を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項3]

W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールで表される化合物である請求項2に記載の医薬。

[請求項4]

W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は1, 2, 3-トリアゾールで表される化合物である請求項2又は3に記載の医薬。

[請求項5]

W^A が5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールで表される化合物である請求項2ないし4のいずれかに記載の医薬。

[請求項6]

W^A がテトラゾールで表される化合物である請求項2ないし5のい

ずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項7] R^{1A} が水素原子又は炭素数 1 ～ 8 のアルキル基で表される化合物である請求項 2 ないし 6 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項8] R^{1A} が水素原子で表される化合物である請求項 2 ないし 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項9] R^{4A} が水素原子で、 R^{5A} が水素原子又は炭素数 1 ～ 8 のアルキル基で表される化合物である請求項 2 ないし 8 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項10] R^{4A} 及び R^{5A} が共に水素原子で表される化合物である請求項 2 ないし 9 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項11] R^{2A} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。）で表される化合物である請求項 2 ないし 10 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項12] R^{2A} が水素原子で表される化合物である請求項 2 ないし 11 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項13] R^{3A} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。）で表される化合物である請求項 2 ないし 12 のいずれか 1 項に記載の医薬。

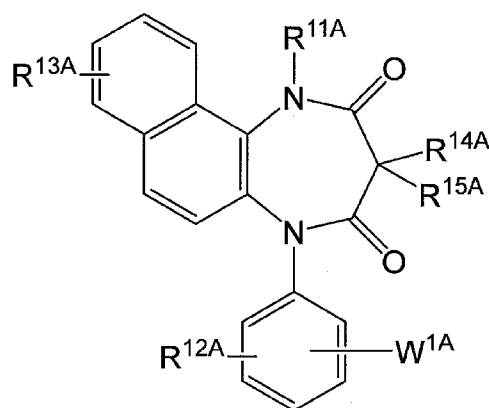
[請求項14] R^{3A} が水素原子で表される化合物である請求項 2 ないし 13 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項15] X^A がNで、 Y^A がC=Oで、実線と破線からなる二重線が、単結合で表される化合物である請求項2ないし14のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項16] X^A がCで、 Y^A がNで、実線と破線からなる二重線が、二重結合で表される化合物である請求項2ないし15のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項17] 前記化合物が次の一般式 (A II) :

[化2]



(AII)

(式中、 R^{11A} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{12A} 及び R^{13A} は同一又は異なっていてもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシル

アミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{14A} 及び R^{15A} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

そして、 W^{1A} は置換基を有していてもよい環構成元素として窒素原子を1～4個含む5又は6員環の複素環を表す。）で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項18] W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール、1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールで表される化合物である請求項17に記載の医薬。

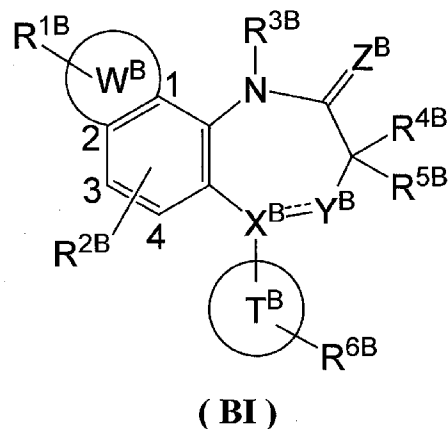
[請求項19] W^A が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は1, 2, 3-トリアゾールで表される化合物である請求項17又は18に記載の医薬。

[請求項20] W^A が5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールで表される化合物である請求項17ないし19のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項21] W^A がテトラゾールで表される化合物である請求項17ないし20のいずれか1項に記載の医薬。

- [請求項22] R^{1A} が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基で表される化合物である請求項17ないし21のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項23] R^{1A} が水素原子で表される化合物である請求項17ないし22のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項24] R^{4A} が水素原子で、 R^{5A} が水素原子又は炭素数1～8のアルキル基で表される化合物である請求項17ないし23のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項25] R^{4A} 及び R^{5A} が共に水素原子で表される化合物である請求項17ないし24のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項26] R^{2A} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）で表される化合物である請求項17ないし25のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項27] R^{2A} が水素原子で表される化合物である請求項17ないし26のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項28] R^{3A} が水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）で表される化合物である請求項17ないし27のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項29] R^{3A} が水素原子で表される化合物である請求項17ないし28のいずれか1項に記載の医薬。
- [請求項30] 前記化合物が次の一般式（B1）：

[化3]



(式中、 R^{1B} 及び R^{2B} は同一又は異なっているもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。））、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{4B} 及び R^{5B} は同一又は異なっているもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8

のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

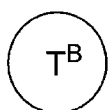
R^{6B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化4]



は、N、S、Oから選択される1～2個のヘテロ原子を環構成元素として含んでいてもよく、ベンゼン環の1と2の位置で縮合している5～8員の非芳香族環を表し、

[化5]



は、ベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、ピリミジン環、インドール環、インダゾール環、ベンゾトリアゾール環、ベ

ンズイソキサゾール環、ベンズイミダゾール環及びキノリン環から選択される芳香族環を表し、

Z^B はO又はSを表し、

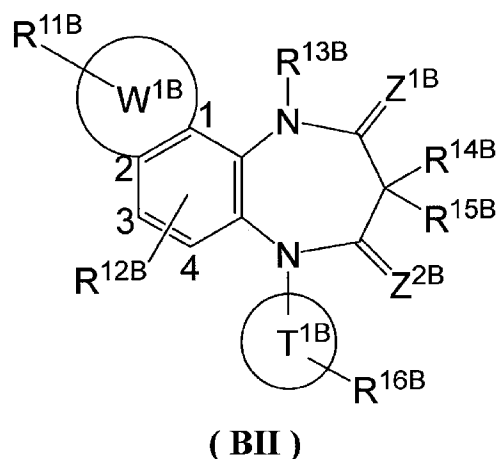
そして、 X^B がNのとき、 Y^B はC=O又はC=Sで、かつ実線と波線からなる二重線は単結合を表し

X^B がCのとき、 Y^B はNで、かつ実線と波線からなる二重線は二重結合を表す。) で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項31]

前記化合物が次の一般式 (B II) :

[化6]



(式中、 R^{11B} 及び R^{12B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基 (アルコキシ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8

のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{13B} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数 1～3 のアルキル基を表し、

R^{14B} 及び R^{15B} は同一又は異なっているが、水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェニル基で置換された炭素数 1～3 のアルキル基を表し、

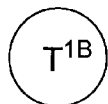
R^{16B} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシルアミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化7]



はN, S, 及びOから選択される1～2個のヘテロ原子を環構成元素として含んでいてもよく、ベンゼン環の1と2の位置で縮合している5～8員の非芳香族環を表し、

[化8]



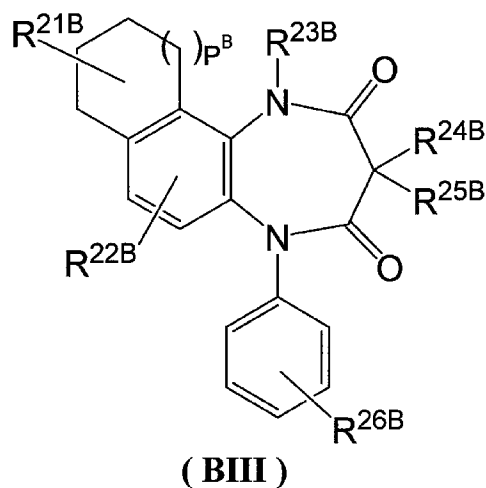
はベンゼン環、ナフタレン環、チオフェン環、ピリジン環、ピリミジン環、インドール環、インダゾール環、ベンゾトリアゾール環、ベンズイソキサゾール環、ベンズイミダゾール環及びキノリン環から選択される芳香族環を表し、

そして、 Z^{1B} 及び Z^{2B} は同一又は異なってもよくO又はSを表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項32]

前記化合物が次の一般式 (B I I I) :

[化9]



(式中、 R^{21B} 及び R^{22B} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シア

ノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{23B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

R^{24B} 及び R^{25B} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はフェニル基で置換された炭素数1～3のアルキル基を表し、

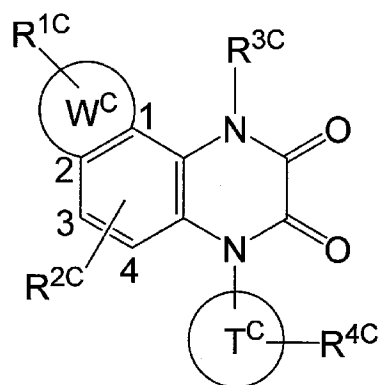
R^{26B} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアル

キルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

そして、 p^B は0又は1を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項33] 前記化合物が次の一般式 (C I) :

[化10]



(CI)

(式中、 R^{1C} 及び R^{2C} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシ基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3C} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）を表し、

R^{4C} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

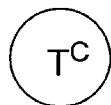
[化11]



はベンゼン環の1と2の位置で縮環し、N、S、及びOから選択されるヘテロ原子を環構成元素として含んでいてもよい5～8員環を表し

、そして

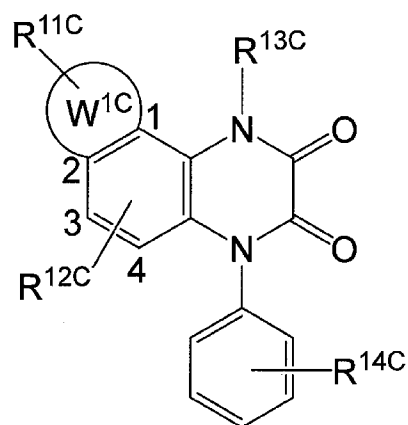
[化12]



はベンゼン環、ナフタレン環、ピリジン環、ピリミジン環、キノリン環、インドール環、インドリン環、ベンズイミダゾール環、インダゾール環、ベンズイソキサゾール環及びベンズトリアゾール環から選択される芳香環を表す。) で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項34] 前記化合物が次の一般式 (CII) :

[化13]



(CII)

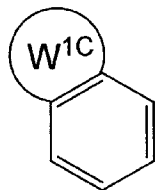
(式中、 R^{11C} 及び R^{12C} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシ

ルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{13C} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）を表し、

R^{14C} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、そして

[化14]



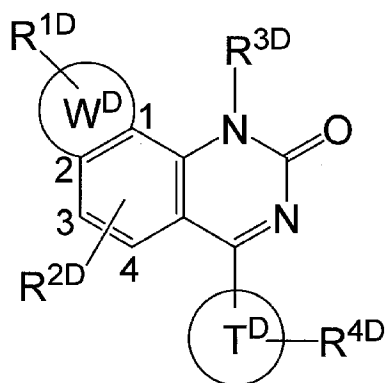
はナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環を表す。

) で表される化合物である請求項 1 に記載の医薬。

[請求項35]

前記化合物が次の一般式 (DI) :

[化15]



(DI)

(式中、 R^{1D} 及び R^{2D} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコ

キシ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{3D} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）を表し、

R^{4D} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有していてもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。)、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有していてもよいフェニル基、又は置換基を有していてもよい複素環基を表し、

[化16]



はベンゼン環の1と2の位置で縮環し、1又は2個の窒素原子を環構成元素として含んでいてもよい5～8員環を表し、そして

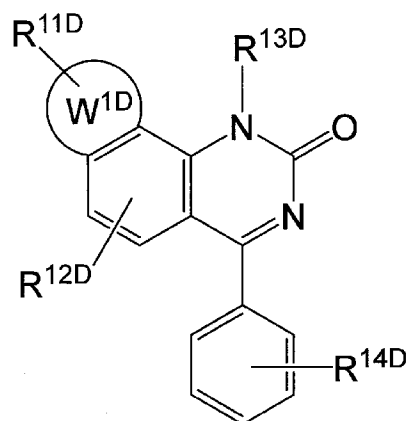
[化17]



はベンゼン環、ナフタレン環、ピリジン環、ピリミジン環、キノリン環、インドール環、インドリン環、ベンズイミダゾール環、ピラゾール環、インダゾール環、ベンズイソキサゾール環及びベンゾトリアゾール環から選択される芳香環を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項36] 前記化合物が次の一般式 (D I I) :

[化18]



(DII)

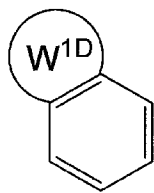
(式中、 R^{11D} 及び R^{12D} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキル

アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{13D}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）を表し、

R^{14D}は炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、アラルキル基（アリール部分の炭素数が6～10で、アルキレン部分の炭素数が1～3）、ヒドロキシル基で置換された炭素数1～8のアルキル基、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、1～5個のハロゲン原子で置換された炭素数1～5のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数2～8のアシルアミノ基、炭素数1～8のアルキルスルホニルアミノ基、置換基を有してもよいベンゼンスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、カルバモイル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数1～8のアルキルスルフィニル基、炭素数1～8のアルキルスルホニル基、スルファモイル基、置換基を有してもよいフェニル基、又は置換基を有してもよい複素環基を表し、そして、

[化19]



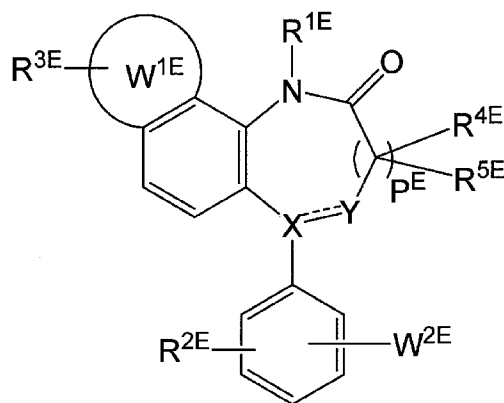
はナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環又はインダン環を表す。

) で表される化合物である請求項 1 に記載の医薬。

[請求項37]

前記化合物が次の一般式 (E I) :

[化20]



(EI)

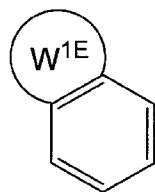
(式中、 R^{1E} は水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数 1～3 のアルキル基を表し、

R^{2E} 及び R^{3E} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2～8 のアシルアミノ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 2～8 のアシル

アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、カルバモイル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 1～8 のアルキルスルフィニル基、炭素数 1～8 のアルキルスルホニル基、又はスルファモイル基を表し、

R^{4E} 及び R^{5E} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基又はフェニル基で置換された炭素数 1～3 のアルキル基を表し、

[化21]



はナフタレン又はテトラヒドロナフタレンを表し、

W^{2E} は置換基を有していてもよい複素環を表し、

X^E が N のとき、 Y^E は $C=O$ で、かつ実線と破線からなる二重線は単結合を表し、

X^E が C のとき、 Y^E は N で、かつ実線と破線からなる二重線は二重結合を表し、

そして、 P^E は、0 又は 1 を表す。) で表される化合物である請求項 1 に記載の医薬。

[請求項38] W^{2E} が環構成元素として窒素原子を 1～4 個含む 5 又は 6 員環の複素環で表される化合物である請求項 37 に記載の医薬。

[請求項39] W^{2E} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基、オキソ基、チオキソ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール、1, 2, 3-トリアゾール

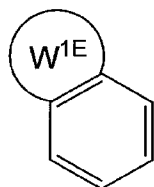
、 1, 2, 4-オキサジアゾール、ピラゾール又はイミダゾールで表される化合物である請求項 37 又は 38 に記載の医薬。

[請求項40] W^{2E} が置換基として炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン原子、シアノ基から選ばれるものを有していてもよいテトラゾール、1, 2, 4-トリアゾール又は 1, 2, 3-トリアゾールで表される化合物である請求項 37 ないし 39 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項41] W^{2E} が 5-オキソ-1, 2, 4-オキサジアゾール又は 5-チオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾールで表される化合物である請求項 37 ないし 40 のいずれか 1 項に記載の医薬。

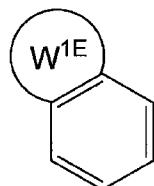
[請求項42] W^{2E} がテトラゾールで表される化合物である請求項 37 ないし 41 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項43] [化22]



がナフタレン又はテトラヒドロナフタレンで表される化合物である請求項 37 ないし 42 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項44] [化23]



がナフタレンで表される化合物である請求項 37 ないし 43 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項45] R^{1E} が水素原子又は炭素数 1～8 のアルキル基で表される化合物である請求項 37 ないし 44 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項46] R^{1E} が水素原子で表される化合物である請求項 37 ないし 45 のい

ずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項47] R^{4E} が水素原子で、 R^{5E} が水素原子又は炭素数 1 ～ 8 のアルキル基で表される化合物である請求項 3 7 ないし 4 6 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項48] R^{4E} 及び R^{5E} が共に水素原子で表される化合物である請求項 3 7 ないし 4 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項49] R^{2E} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。）で表される化合物である請求項 3 7 ないし 4 8 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項50] R^{2E} が水素原子で表される化合物である請求項 3 7 ないし 4 9 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項51] R^{3E} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、カルボキシ基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。）で表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 0 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項52] R^{3E} が水素原子で表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 1 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項53] X^E がNで、 Y^E がC=Oで、実線と破線からなる二重線が、単結合で表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 2 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項54] X^E がCで、 Y^E がNで、実線と破線からなる二重線が、二重結合で

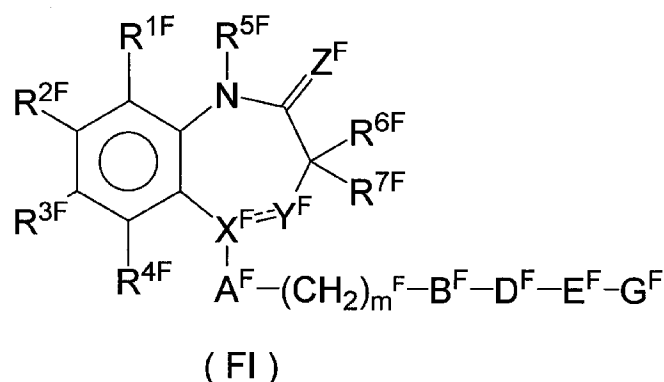
表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 3 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項55] P^F が 0 又は 1 で表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 4 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項56] P^F が 1 で表される化合物である請求項 3 7 ないし 5 5 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項57] 前記化合物が次の一般式 (F I) :

[化24]



(式中、 R^{1F} 及び R^{2F} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 3 ～ 8 のシクロアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1 ～ 8 のアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のジアルキルアミノ基、炭素数 2 ～ 8 のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数 2 ～ 8 のアシル基、アルコキシカルボニル基 (アルコキシ部分の炭素数は 1 ～ 8。)、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基 (アリール部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8) を表すか、又は

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と

一緒になってナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環又はテトラヒドロイソキノリン環から選択される縮合環を形成してもよく、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子からなる環には、1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3F} 及び R^{4F} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{5F} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキ

ル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{6F} 及び R^{7F} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基又はアミノ基を表し、

X^F はC、CH又はNを表し、

Y^F はN、NH又はC(=O)を表し、

但し、 X^F がNのとき、 Y^F はN、NHでなく、

また、 X^F がC、CHのとき、 Y^F はC(=O)でなく、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

Z^F は酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^F は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、フェニル基又はピリジル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、ピリミジン環、ナフタレン環、キノリン環、若しくはインドール環を表すか、又は結合手を表し、

B^F は $N(R^{8F})C(=O)$ 、 $NHCONH$ 、 $CON(R^{9F})$ 、 $NHC(=S)NH$ 、 $N(R^{10F})SO_2$ 、 $SO_2N(R^{11F})$ 又は OSO_2 を表し、

ここで、 R^{8F} 、 R^{9F} 、 R^{10F} 及び R^{11F} は、水素原子、炭素数1～

8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

D^Fは、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよく、更に二重結合を有していてもよい炭素数1～6のアルキレン鎖、又は結合手を表し、

E^Fは、O、S、NR^{12F}、又は結合手を表し、

ここで、R^{12F}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

G^Fは、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシ基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、置換基を有して

いてもよいイミダゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基、又は置換基を有していてもよいチアゾリル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンを表し、

そして、 m^F は0～5の整数を表す。

但し、 R^{1F} と R^{2F} が一緒になって環を形成しない場合で、 X^F がC、 Y^F がNで、実線と破線からなる二重線が二重結合で、 Z^F が酸素原子で、 A^F がベンゼン環で、 m^F が0で、 B^F がC(=O)NHで、 E^F が結合手で G^F がフェニル基の場合を除く。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項58]

R^{1F} 及び R^{2F} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）で表される化合物である請求項57に記載の医薬。

[請求項59]

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環、又はテトラヒドロナフタレン環を形成し、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子から形成されるベンゼン環又はシクロヘキセン環は、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～

8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される1～4個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよい化合物である請求項57に記載の医薬。

[請求項60]

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、そして R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、 R^{1F} と R^{2F} がそれぞれ結合している炭素原子から形成されるベンゼン環は、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、アミノ基から選択される1～4個の同一又は異なってもよい置換基で置換されていてもよい化合物である請求項57に記載の医薬。

[請求項61]

R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環、又はテトラヒドロナフタレン環を形成する化合物である請求項57に記載の医薬。

[請求項62]

R^{3F} 及び R^{4F} が同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）で表される化合物である請求項57

ないし 6 1 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項63] R^{5F} が水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6 ～ 10 で、アルキレン部分の炭素数は 1 ～ 8）で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 2 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項64] R^{5F} が水素原子で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 3 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項65] R^{6F} 及び R^{7F} が同一又は異なってもよく水素原子、炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、又は 1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 4 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項66] R^{6F} 及び R^{7F} が共に水素原子で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 5 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項67] R^{3F} 、 R^{4F} 、 R^{5F} 、 R^{6F} 及び R^{7F} が水素原子で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 6 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項68] X^F が N で、 Y^F が C (=O) で、実線と破線からなる二重線が、単結合で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項69] X^F が C で、 Y^F が N で、実線と破線からなる二重線が、二重結合で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 8 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項70] Z^F が酸素原子で表される化合物である請求項 5 7 ないし 6 9 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項71] A^F が置換基として炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、炭素数 2 ～ 8 のアルケニル基、炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルキル基、1 ～ 3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1 ～ 8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基

、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、フェニル基又はピリジル基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有しているフェニル基、又はピリジル基で表される化合物である請求項57ないし70のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項72] A^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、又はアミノ基から選択される同一又は異なっている置換基を1～4個有しているフェニル基で表される化合物である請求項57ないし71のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項73] A^F がフェニル基、又はピリジル基で表される化合物である請求項57ないし72のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項74] A^F が結合手で表される化合物である請求項57ないし73のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項75] B^F が $NHC(=O)$ 、 $NHCONH$ 、 $CONH$ 、 $NHC(=S)NH$ 、 $NHSO_2$ 、 SO_2NH 又は OSO_2 で表される化合物である請求項57ないし74のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項76] B^F が $NHC(=O)$ 、 $NHCONH$ 又は $NHSO_2$ で表される化合物である請求項57ないし75のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項77] B^F が $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ で表される化合物である請求項57ないし76のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項78] B^F が $NHC(=O)$ で表される化合物である請求項57ないし77のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項79] D^F が、置換基として炭素数1～8のアルキル基、又は1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基から選択される同

一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよく、更に二重結合を有していてもよい炭素数1～6のアルキレン鎖で表される化合物である請求項57ないし78のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項80] D^F が結合手で表される化合物である請求項57ないし79のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項81] D^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有している化合物である請求項57ないし80のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項82] D^F が置換基として炭素数1～3のアルキル基、炭素数2～3のアルケニル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有している化合物である請求項57ないし81のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項83] E^F が結合手で表される化合物である請求項57ないし82のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項84] G^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンで表さ

れる化合物である請求項5 7 ないし8 3のいずれか1 項に記載の医薬。

[請求項85] G^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、又は炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項5 7 ないし8 4のいずれか1 項に記載の医薬。

[請求項86] G^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、アミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルボキシル基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼン又はピリジンで表される化合物である請求項5 7 ないし8 5のいずれか1 項に記載の医薬。

[請求項87] G^F が置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項5 7 ないし8 6のいずれか1 項に記載の医薬。

[請求項88] m^F が0で表される化合物である請求項5 7 ないし8 7のいずれか1 項に記載の医薬。

[請求項89] A^F がベンゼン環であり、 m^F が0であり、 B^F が $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ であり、 D^F が炭素数1～3のアルキル基又は結合手であり、 E^F が結合手であり、 G^F が置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項57ないし88のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項90] A^F がベンゼン環であり、 m^F が0であり、 B^F が $NHC(=O)$ であり、 D^F が結合手であり、 E^F が結合手であり、 G^F が置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項57ないし89のいずれか1項に記載の医薬。

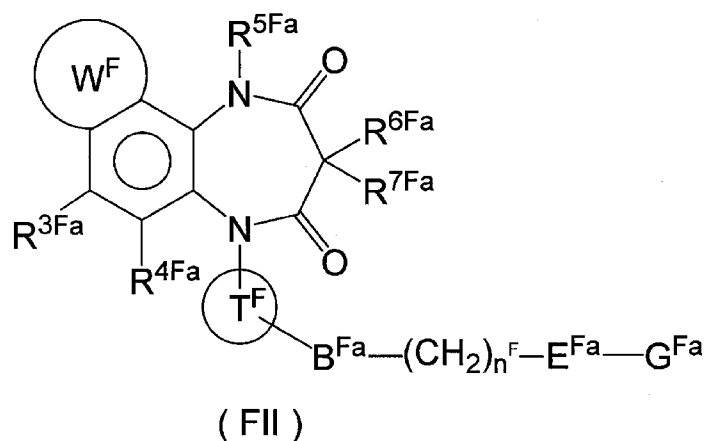
[請求項91] R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{3F} 、 R^{4F} 、 R^{5F} 、 R^{6F} 及び R^{7F} は水素原子を表し、 X^F がNで、 Y^F が $C(=O)$ で、実線と破線からなる二重線が単結合を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベンゼン環を表し、 m^F は0を表し、 B^F は $NHC(=O)$ 又は $NHSO_2$ を表し、 D^F は炭素数1～3のアルキル基又は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項57ないし90のいずれか1項に記載の医薬。

[請求項92] R^{1F} と R^{2F} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環を形成し、 R^{3F} 、 R^{4F} 、 R^{5F} 、 R^{6F} 及び R^{7F} は水素原子を表し、 X^F がNで、 Y^F が $C(=O)$ で、実線と破線からなる二重線が単結合を表し、 Z^F が酸素原子を表し、 A^F はベ

ンゼン環を表し、 m^F は0を表し、 B^F は $NHC(=O)$ を表し、 D^F は結合手を表し、 E^F は結合手を表し、 G^F は置換基として1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいベンゼンで表される化合物である請求項57ないし91のいずれか1項に記載の医薬。

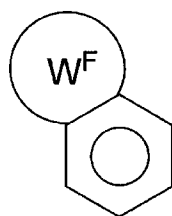
[請求項93] 前記化合物が下記の一般式(FII)：

[化25]



(式中、

[化26]



は、ナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環又はテトラヒドロイソキノリン環を表し、

そしてこれらの環は1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキ

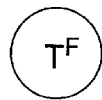
ル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3Fa} 及び R^{4Fa} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{5Fa} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

R^{6Fa} 及び R^{7Fa} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、又はアミノ基を表し、

[化27]



は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、アラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、フェニル基、又はピリジル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、ピリミジン環、ナフタレン環、キノリン環、又はインドール環を表し、

B^{Fa} は $N(R^{8Fa})C(=O)$ 、 $NHCONH$ 、 $CON(R^{9Fa})$ 、 $NHC(=S)NH$ 、 $N(R^{10Fa})SO_2$ 、 $SO_2N(R^{11Fa})$ 、又は OSO_2 を表し、

ここで、 R^{8Fa} 、 R^{9Fa} 、 R^{10Fa} 及び R^{11Fa} は、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

E^{Fa} は、O、S、 NR^{12Fa} 又は結合手を表し、

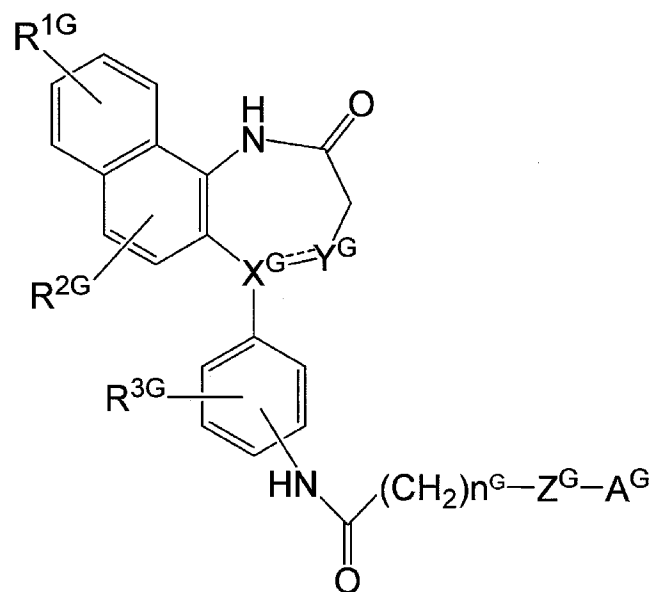
ここで、 R^{12Fa} は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）を表し、

G^{Fa} は、置換基として炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシル基、メチレンジオキシ基、カルボキシ基、炭素数1～6のアルキルスルフィニル基、炭素数1～6のアルキルチオ基、炭素数1～6のアルキルスルホニル基、アラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、置換基を有していてもよいイミダゾリル基、置換基を有していてもよいオキサゾリル基、又は置換基を有していてもよいチアゾリル基から選択される同一又は異なる置換基を1～4個有していてもよいピペラジン、ピペリジン、モルホリン、シクロヘキサン、ベンゼン、ナフタレン、キノリン、キノキサリン、ベンズイミダゾール、チオフェン、イミダゾール、チアゾール、オキサゾール、インドール、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン又はピリミジンを表し、

そして、 n^F は0～5の整数を表す。）で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項94] 前記化合物が次の一般式（G I）：

[化28]



(GI)

(式中、 R^{1G} 、 R^{2G} 及び R^{3G} は同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基又は炭素数2～8のジアルキルアミノ基を表し、

X^G はC又はNを表し、

Y^G はN又はC(=O)を表し、

但し、 X^G がCのとき、 Y^G はNを表し、

また、 X^G がNのとき、 Y^G はC(=O)を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

n^G は0～6の整数を表し、

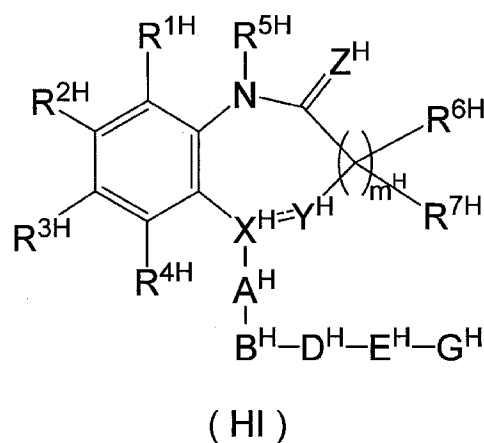
Z^G はO、S又は結合手を表し、

そして A^G は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～

8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、又はN(R^{4G})(R^{5G})から選択される同一又は異なっている置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環を表す。ここで、R^{4G}及びR^{5G}は同一又は異なっている炭素数1～8のアルキル基を表すか、又はR^{4G}とR^{5G}とR^{4G}及びR^{5G}が結合する窒素原子と一緒に、環形成原子としてヘテロ原子として更に酸素原子又は硫黄原子を含んでもよい、5～7員環を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項95] 前記化合物が次の一般式(HI)：

[化29]



(式中、R^{1H}及びR^{2H}は同一又は異なっている水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8の

アシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）を表すか、又は

R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、それらが結合しているベンゼン環と一緒にナフタレン環、キノリン環、イソキノリン環、テトラヒドロナフタレン環、インダン環、テトラヒドロキノリン環及びテトラヒドロイソキノリン環から選択される縮合環を形成してもよく、そして R^{1H} と R^{2H} が一緒になって、 R^{1H} と R^{2H} がそれぞれ結合している炭素原子からなる環には、1～4個の同一又は異なってもよい炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）及びアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）から選択される置換基で置換されていてもよく、

R^{3H} 及び R^{4H} は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基、炭素数

2～8のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は1～8。）、又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）を表し、

R^{5H}は水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、水酸基で置換された炭素数1～8のアルキル基又はアラルキル基（アリール部分の炭素数は、6～10で、アルキレン部分の炭素数は1～8。）を表し、

R^{6H}及びR^{7H}は同一又は異なってもよく、水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基又はアミノ基を表し、

X^HはC又はNを表し、

Y^HはN又はC(=O)を表し、

但し、X^HがCのとき、Y^HはNを表し、

また、X^HがNのとき、Y^HはC(=O)を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

Z^HはO、S又はNHを表し、

A^Hは、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、ピラゾール環、イミダゾール環、キノリン環、ベンズイミダゾール

環、又はインダン環を表し、

B^H はO, S, NR^{8H} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{8H} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

D^H は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基及び炭素数2～8のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～4個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、テトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソキサゾール環、ピラゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

E^H は $-(CR^{9H}R^{10H})_nH-T-$ を表し、

ここで、 R^{9H} 及び R^{10H} は、同一又は異なってもよく、水素原子、ヒドロキシル基又は炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{9H} と R^{10H} が一緒になってエチレン鎖を形成してもよく、

n^H は0～8の整数を表し、

T^H はO, S, NR^{11H} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{11H} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

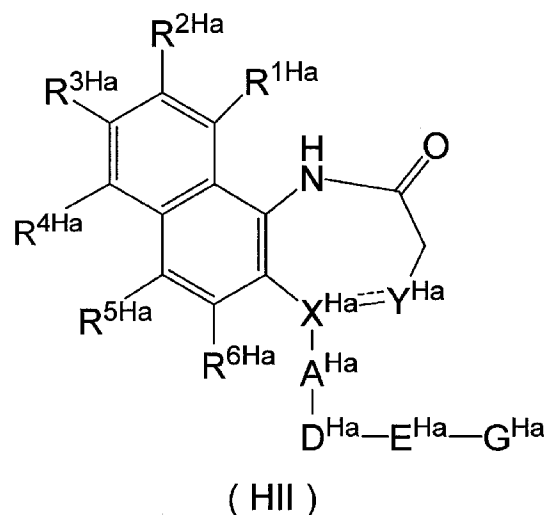
G^H は置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基及びメタン

スルホニル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、チオフェン環、フラン環、チアゾール環、オキサゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、ナフタレン環、キノリン環、キナゾリン環、インドール環、インドリン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

そして、 m^H は0～2の整数を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

【請求項96】 前記化合物が次の一般式（H11）：

[化30]



(式中、R¹Ha、R²Ha、R³Ha、R⁴Ha、R⁵Ha及びR⁶Haは同一又は異なってもよく水素原子、炭素数1～8のアルキル基、炭素数3～8のシクロアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、炭素数2～8のアシルアミノ基、カルボキシル基

、炭素数 2～8 のアシル基、アルコキシカルボニル基（アルコキシ部分の炭素数は 1～8。）、置換基を有していてもよいフェニル基、置換基を有していてもよいピリジル基、若しくはアラルキル基（アリアル部分の炭素数は、6～10 で、アルキレン部分の炭素数は 1～8。）を表し、

X^{Ha} は C 又は N を表し、

Y^{Ha} は N 又は C (=O) を表し、

但し、 X^{Ha} が C のとき、 Y^{Ha} は N を表し、

また、 X^{Ha} が N のとき、 Y^{Ha} は C (=O) を表し、

実線と破線からなる二重線は、単結合又は二重結合を表し、

A^{Ha} は、置換基として、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を 1～4 個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラン環、ピラゾール環、イミダゾール環、キノリン環、ベンズイミダゾール環、又はインダン環を表し、

D^{Ha} は、置換基として、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 2～8 のアルケニル基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルキル基、1～3 のハロゲン原子で置換された炭素数 1～8 のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、及び炭素数 2～8 のジアルキルアミノ基から選択される同一又は異なってもよい置換基を 1～4 個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、チオフェン環、フラ

ン環、テトラゾール環、イミダゾール環、イミダゾリン環、トリアゾール環、チアゾール環、オキサゾール環、イソキサゾール環、ピラゾール環、ピロール環、ピロリジン環、ピペラジン環、ピペリジン環、又は5～8員のシクロアルキル環を表し、

E^{Ha} は $-(C R^{9Ha} R^{10Ha})_p - T^{Ha}-$ を表し、

ここで、 R^{9Ha} 及び R^{10Ha} は、同一又は異なり水素原子、ヒドロキシル基又は炭素数1～8のアルキル基を表すか、又は R^{9Ha} と R^{10Ha} が一緒になってエチレン鎖を形成してもよく、

p は0～8の整数を表し、

T^{Ha} はO, S, NR^{11Ha} 又は結合手を表し、

ここで、 R^{11Ha} は水素原子又は炭素数1～8のアルキル基を表し、

G^{Ha} は、置換基として、炭素数1～8のアルキル基、炭素数2～8のアルケニル基、炭素数1～8のアルコキシ基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルキル基、1～3のハロゲン原子で置換された炭素数1～8のアルコキシ基、ハロゲン原子、ヒドロキシル基、ニトロ基、シアノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数2～8のジアルキルアミノ基、カルバモイル基、及びメタンスルホニル基から選択される同一又は異なってもよい置換基を1～5個有していてもよいベンゼン環、ピリジン環、イミダゾール環、ピロール環、ピラゾール環、チオフェン環、フラン環、チアゾール環、オキサゾール環、ピリミジン環、ピリダジン環、ピラジン環、ナフタレン環、キノリン環、キナゾリン環、インドール環、インドリン環、ピペラジン環、ピペリジン環、モルホリン環、又は5～8員のシクロアルキル環を表す。)で表される化合物である請求項1に記載の医薬。

[請求項97]

前記化合物又はその薬学的に許容される塩が、

(A1) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル

] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 2) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(A 3) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン カリウム塩 ;

(A 4) 5 - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 5) 5 - [4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(A 6) 1 - メチル - 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 7) 1, 3 - ジメチル - 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 8) 5 - [2 - クロロ - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 9) 5 - [2 - クロロ - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(A 10) 5 - [2 - メチル - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピ

ン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 1) 5 - [2 - メチル - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩 ;

(A 1 2) 5 - [2 - ブロモ - 5 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 3) 5 - [3 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 4) 5 - [3 - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 5) 5 - [3 - (5 - オキソー - 4 H - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 6) 5 - [3 - (5 - チオキソー - 4 H - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(A 1 7) 5 - [3 - (5 - チオキソー - 4 H - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩 ;

(A 1 8) 5 - [3 - (オキサゾール - 2 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ; 及び

(A 1 9) 5 - [3 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3

H, 5 H) -ジオン ;

(A 2 0) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニ
ル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ナフト [1, 2 - e] [1, 4] ジ
アゼピン - 2 - オン ;

(A 2 1) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニ
ル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ナフト [1, 2 - e] [1, 4] ジ
アゼピン - 2 - オン ナトリウム塩 ;

(A 2 2) 5 - [4 - フルオロ - 3 - (1 H - テトラゾール - 5
- イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼ
ピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(A 2 3) 5 - [4 - フルオロ - 3 - (1 H - テトラゾール - 5 -
イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピ
ン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(B 1) 5 - (3 - シアノフェニル) - 8, 9, 1 0, 1 1 - テ
トラヒドロナフト [2, 1 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) - ジオン ;

(B 2) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル
] - 8, 9, 1 0, 1 1 - テトラヒドロナフト [2, 1 - b] [1,
4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(B 3) 5 - (3 - ヒドロキシフェニル) - 8, 9, 1 0, 1 1
- テトラヒドロナフト [2, 1 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4
(3 H, 5 H) - ジオン ;

(B 4) 5 - (3 - シアノフェニル) - 5, 8, 9, 1 0 - テト
ラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (1
H, 3 H) - ジオン ;

(B 5) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル
) - 5, 8, 9, 1 0 - テトラヒドロインデノ [5, 4 - b] [1,
4] ジアゼピン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ナトリウム塩 ;

(B 6) 5-[3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ[5, 4-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(1H, 3H)-ジオン;

(B 7) 5-[3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ[5, 4-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(1H, 3H)-ジオン;

(B 8) 5-(3-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 9) 5-(3-アミノフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン 塩酸塩;

(B 10) 5-[3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 11) 5-[3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 12) 5-(4-アミノフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 13) 5-(4-メチルアミノフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン 塩酸塩;

(B 14) 5-(2, 3-ジヒドロベンゾ[1, 4]ジオキシシ-6-イル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 15) 5-(4-メトキシフェニル)-1, 5, 8, 9, 1

0, 11-ヘキサヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 16) 5-(4-ヒドロキシフェニル)-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 17) 5-[4-(イソプロピルカルボニルアミノ)フェニル]-1, 5, 8, 9, 10, 11-ヘキサヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 18) 5-(3-カルバモイルフェニル)-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ [6, 7-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 19) 1-アセチル-5-[3-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ [6, 7-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 20) 5-[3-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ [6, 7-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(B 21) 5-[3-(5-フェニル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)フェニル]-1, 5, 8, 10-テトラヒドロ-1H-インデノ [6, 7-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4-ジオン;

(C 1) 4-(3-シアノフェニル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 2) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオンナトリウム塩;

(C 3) 4-(3-メトキシフェニル)-1,4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(C 4) 4-(3-ヒドロキシフェニル)-1,4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン ナトリウム塩;

(C 5) 5-(3-メトキシフェニル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(C 6) 5-(3-ヒドロキシフェニル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(C 7) 4-(3-アミノフェニル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩酸塩;

(C 8) 4-(1H-インドール-4-イル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(C 9) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-4(1H)-イル)フェニル]-2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(C 10) 4-(3-メチルアミノフェニル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩酸塩;

(C 11) 1-メチル-4-(3-メチルアミノフェニル)-1,4,7,8,9,10-ヘキサヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩酸塩;

(C 12) 4-(3-フルオロフェニル)-1,4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン;

(C 13) 4-(3-アミノフェニル)-1,4-ジヒドロベンゾ[f]キノキサリン-2,3-ジオン 塩酸塩;

(C 14) 4-[3-[(2-ヨードフェニル)アセチル]アミノ

] フェニル) - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 1 5) 4-[3-(5-メチル-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-イル) フェニル] - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 1 6) 4-[3-(3-メチル-[1, 2, 4] オキサジアゾール-5-イル) フェニル] - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 1 7) 4-(4-ヒドロキシフェニル) - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン ナトリウム塩;

(C 1 8) 4-(4-アミノフェニル) - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン 塩酸塩;

(C 1 9) N-[4-(2, 3-ジオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-4 (1H) -イル) フェニル] - 2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(C 2 0) 4-[4-(5-メチル-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-イル) フェニル] - 1, 4-ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 2 1) 4-[3-[2-(トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] - 2, 3, 7, 8, 9, 10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ [f] キノキサリン-2, 3-ジオン;

(C 2 2) N-[3-(2, 3-ジオキソ-2, 3, 7, 8, 9, 10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ [f] キノキサリン-4-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(C 2 3) 3-ブromo-N-[3-(2, 3-ジオキソ-2, 3, 7, 8, 9, 10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ [f] キノキサリン-4-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(C 2 4) N-[3-(2, 3-ジオキソ-2, 3, 7, 8, 9

, 10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル
)フェニル]-1-ナフタレンスルホンアミド;

(C25) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,
10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル
)フェニル]-2-ナフタレンスルホンアミド;

(C26) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,
10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル
)フェニル]-2-チオフエンスルホンアミド;

(C27) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,
10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル
)フェニル]-3-ピリジンスルホンアミド 塩酸塩;

(C28) N-[3-(2,3-ジオキソ-2,3,7,8,9,
10-ヘキサヒドロ-1H-ベンゾ[f]キノキサリン-4-イル
)フェニル]-8-キノリンスルホンアミド 塩酸塩;

(C29) 4-[3-(1H-テトラゾール-1-イル)フェニ
ル]-2,3,7,8,9,10-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[f]
キノキサリン-2,3-ジオン;

(D1) 4-(3-シアノフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナ
ゾリン-2-オン;

(D2) 4-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル
]-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン ナトリウム塩;

(D3) 4-(3-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キ
ナゾリン-2-オン;

(D4) 4-(3-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]
キナゾリン-2-オン ナトリウム塩;

(D5) 4-(4-メトキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]キ
ナゾリン-2-オン;

(D6) 4-(4-ヒドロキシフェニル)-1H-ベンゾ[h]

キナゾリン-2-オン ナトリウム塩；

(D 7) 4-(3-アミノフェニル)-1H-ベンゾ[h]キナゾリン-2-オン 塩酸塩；

(D 8) N-[3-(2-オキソ-1, 2-ジヒドロベンゾ[h]キナゾリン-4-イル)フェニル]ベンゼンスルホンアミド。

(E 1) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン； (E 2) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩；

(E 3) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン カリウム塩；

(E 4) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン；

(E 5) 5-[3-(5-チオキソ-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン ナトリウム塩；

(E 6) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン；

(E 7) 5-[3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1, 3-ジヒドロ-2H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2-オン ナトリウム塩；

(E 8) 5-[4-フルオロ-3-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピ

ン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(E 9) 5 - [4 - フルオロ-3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩 ;

(E 10) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 8, 9, 10, 11 - テトラヒドロナフト [2, 1 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(E 11) 5 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 8, 9, 10, 11 - テトラヒドロナフト [2, 1 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ナトリウム塩 ;

(E 12) 4 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3 -ジオン ;

(E 13) 4 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [f] キノキサリン-2, 3 -ジオン
ナトリウム塩 ;

(E 14) 4 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 1 H - ベンゾ [h] キナゾリン-2 -オン ;

(E 15) 4 - [3 - (1 H - テトラゾール-5 - イル) フェニル] - 1 H - ベンゾ [h] キナゾリン-2 -オン ナトリウム塩 ;

(F 1) 5 - (4 - ベンゾイルアミノフェニル) - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 2) 5 - [4 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 3) 5 - [4 - (3 - ブロモベンゾイル) アミノフェニル]

－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 4) 5－[4－[4－(トリフルオロメチル)ベンゾイル]アミノフェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 5) 5－[4－(2－メチルベンゾイル)アミノフェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 6) 5－[4－(2, 6－ジメチルベンゾイルアミノ)フェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 7) 5－[4－(2, 6－ジクロロベンゾイル)アミノフェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 8) 5－[4－(3－クロロベンゾイル)アミノフェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 9) 5 [4－(2－フェニルアセチルアミノ)フェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 10) 1－[4－(2, 4－ジオキソ－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－5－イル)フェニル]－3－フェニルチオ尿素；

(F 11) 5－[4－(2, 3－ジメトキシベンゾイルアミノ)フェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (3 H, 5 H)－ジオン；

(F 12) 5－[4－(2－メトキシベンゾイルアミノ)フェニル]－1 H－ナフト [1, 2－b] [1, 4] ジアゼピン－2, 4 (

3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3) 5 - [4 - [(2 -クロロフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 4) 5 - [4 - (2, 3 -ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 5) 5 - [4 - (2, 5 -ジメチルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 6) 5 - [4 - (5 -ブromo - 2 -クロロベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 7) 5 - [4 - (2, 4 -ジクロロベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 8) 5 - [4 - (2 -ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 9) 5 - [4 - (2, 3 -ジヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 2 0) 1 - [4 - (2, 4 -ジオキソー 1, 2, 3, 4 -テトラヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 5 -イル) フェニル] - 3 -フェニル尿素 ;

(F 2 1) 5 - [4 - [(2, 6 -ジクロロフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 2 2) 5 - [4 - [(2 - メトキシフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 2 3) 5 - [4 - [(2 - ヒドロキシフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 2 4) 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] チオ尿素 ;

(F 2 5) 5 - [4 - [3 - (トリフルオロメチル) ベンゾイルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 2 6) 5 - [4 - [2 - [2 - (トリフルオロメチル) フェニル] アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 2 7) 1 - (2 - クロロフェニル) - 3 - [4 - (2, 4 - ジオキソー 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] 尿素 ;

(F 2 8) 5 - [4 - [(2 - フェニルプロピオニル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 2 9) 5 - [4 - (2 - クロロ - 3 - メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 3 0) 5 - [4 - (3 - フェニルプロピオニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 3 1) 5 - [4 - [(1 H - インドール - 3 - カルボニル)

アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 2) 5 - [4 - (2-クロロ-3-ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 3) 5 - [4 - [(2-メチル-2-フェニルプロピオニル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 4) 5 - [4 - (2-フェノキシアセチルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 5) 5 - [4 - [2 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) アセチルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 6) 5 - [4 - [(1-メチル-1H-イミダゾール-2-カルボニル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 7) 5 - [4 - [2 - (2, 4-ジクロロフェニル) アセチルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 8) 5 - [4 - [2 - (2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) アセチルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 3 9) 5 - [4 - (3-フェニルプロペニルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 4 0) 5 - [4 - [(3-ピリジルアセチル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4

(3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(F 4 1) 5 - [4 - (1 H - ベンズイミダゾール - 2 - カルボ
ニルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジ
アゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 2) 1 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) フ
ェニル] - 7 - メトキシ - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4
(3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 3) 5 - [4 - [(ベンゾイルアミノ) メチル] フェニル
] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 4) 5 - [4 - [(2 - クロロベンゾイルアミノ) メチル
] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン -
2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 5) 1 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) フ
ェニル] - 7 - ヒドロキシ - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2,
4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 6) 5 - [4 - (2 - クロロベンゾイルアミノ) フェニル
] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 7) 5 - [4 - (2 - ブロモベンゾイルアミノ) フェニル
] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 8) 5 - [4 - (2 - ヨードベンゾイルアミノ) フェニル
] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) -ジオン ;

(F 4 9) 5 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイルアミノ) -
3 - フルオロフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジ
アゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 5 0) 5 - [4 - [2 - (2 - メチルフェニル) アセチルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 1) 5 - [4 - [(キノキサリン - 2 イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 2) 5 - [4 - [(5 - メチルチオフェン - 2 イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 3) 5 - [3 - [(2 - クロロフェニルアセチル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 4) 5 - [4 - [(2, 4, 6 - トリメチルベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 5) 5 - [4 - (シクロヘキシルカルボニルアミノ) フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 6) 1 - [4 - (2, 3 - ジメチルベンゾイル) アミノフェニル] - 6 - メチル - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 7) 5 - [4 - [(2 - エチルベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 5 8) 5 - [4 - [(6 - メチルピリジン - 2 - イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (

3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 5 9) 5 - [4 - [(2 -メチルピリジン -3 -イル) カルボニルアミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 0) 1 - [4 - (2, 4 -ジオキソ -1, 2, 3, 4 -テトラヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -5 -イル) フェニル] -3 - (2 -メチルフェニル) チオ尿素 ;

(F 6 1) 5 - [4 - (2 -メトキシ -3 -メチルベンゾイル) アミノフェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 2) 5 - [4 - (2, 3 -ジクロロベンゾイル) アミノフェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 3) 5 - [4 - (2, 3 -ジメチルベンゾイルアミノ) -3 -ヒドロキシフェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 4) 5 - [4 - (2 -クロロ -3 -メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1, 3 -ジヒドロナフト [1, 2 -e] -1, 4 -ジアゼピン -2 -オン ;

(F 6 5) 5 - [4 - [(4 -ジメチルアミノベンゾイル) アミノ] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 6) 5 - [4 - [2 - (2, 4 -ジクロロフェノキシ) アセチルアミノ] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 6 7) 5 - [4 - [2 - (2 - メチルフェノキシ) アセチル
アミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼ
ピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 6 8) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テ
トラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル
) ブチル] - 2 - クロロ - 3 - メトキシベンズアミド ;

(F 6 9) 5 - [4 - (2 - クロロ - 3 - ヒドロキシベンゾイル
アミノ) フェニル] - 1, 3 - ジヒドロナフト [1, 2 - e] - 1,
4 - ジアゼピン - 2 - オン ;

(F 7 0) 5 - [4 - (2 - アセチルベンゾイルアミノ) フェニ
ル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) - ジオン ;

(F 7 1) 5 - [4 - (2 - t e r t - ブチルベンゾイルアミノ)
フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン -
2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 7 2) 5 - [2 - (2 - ヨードベンゾイル) アミノエチル]
- 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H,
5 H) - ジオン ;

(F 7 3) 5 - [3 - [(2 - ヨードベンゾイル) アミノ] フェ
ニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4
(3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 7 4) 6, 7 - ジメチル - 1 - [4 - (2 - ヨードベンゾイ
ル) アミノフェニル] - 1 H - 1, 5 - ベンゾジアゼピン - 2, 4 (3
H, 5 H) - ジオン ;

(F 7 5) 5 - [4 - [(1 - メチルピペリジン - 4 - イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4
] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(F 7 6) 5 [4 - [(ベンゾフラン - 2 - イル) カルボニルア

ミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 77) 5 - [4 - [(1-メチル-1 H-インドール-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 78) 5 - [4 - (2-プロペニルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 79) 5 - [4 - (2-プロピルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 80) 5 - [3-フルオロ-4 - (2-ヨードベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 81) 5 - [4 - (2-ヒドロキシ-3-メチルベンゾイル) アミノフェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 82) 5 - [4 - [(2-イソプロポキシベンゾイル) アミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 83) 5 - [4 - [(3-メチルチオフェン-2-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 84) 5 - [4 - (2-フェノキシプロピオニルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 85) 5 - [4 - [2 - (4-クロロ-2-メチルフェノキ

シ) アセチルアミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 86) 5 - [4 - [(4-フルオロ-2-トリフルオロメチル) ベンゾイル] アミノフェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 87) 5 - [4 - (4-フルオロ-2-メトキシベンゾイル) アミノフェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 88) 5 - [4 - (4-フルオロ-2-ヒドロキシベンゾイル) アミノフェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 89) 5 - [3 - [(2-ヨードフェニルアセチル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 90) 5 - [4 - (2-メチル-2-フェノキシプロピオニルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 91) 5 - [4 - (2-tert-ブチルベンゾイルアミノ) フェニル] -1, 3-ジヒドロナフト [1, 2-e] -1, 4-ジアゼピン-2-オン;

(F 92) 5 - [4 - [(3-ジメチルアミノベンゾイル) アミノ] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 93) 5 - [4 - (4-ヨード-2-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン;

(F 94) 5 - [4 - (6-フルオロ-2-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼ

ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 9 5) 5 - [4 - (2 -ヒドロキシ-4 -ヨードベンゾイル
アミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼ
ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 9 6) 5 - [4 - (6 -フルオロ-2 -ヒドロキシベンゾイ
ルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジア
ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 9 7) 5 - [4 - (2 -フルオロベンゾイル) アミノフェニ
ル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3
H, 5 H) -ジオン ;

(F 9 8) 5 - [4 - [(2 -ジメチルアミノベンゾイル) アミ
ノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン
-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 9 9) 5 - [4 - (2 -メトキシ-6 -メチルベンゾイルア
ミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピ
ン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 0 0) 5 - [4 - (2 -ヒドロキシ-6 -メチルベンゾイ
ルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジア
ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 0 1) 5 - [4 - [3 - (2 -メチルフェニル) プロピオ
ニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジ
アゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 0 2) 5 - (4 -フェニルカルバモイルフェニル) -1 H
-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H
) -ジオン ;

(F 1 0 3) 5 - (4 -ベンジルカルバモイルフェニル) -1 H
-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H
) -ジオン ;

(F 1 0 4) 5 - [4 - [3 - (2 - メチルフェニル) プロペノイルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 0 5) 5 - [4 - [3 - (2 - クロロフェニル) プロピオニルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 0 6) 5 - [4 - (2 - ヨードベンゾイル) アミノフェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 0 7) 5 - [4 - [(1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - イルアセチル) アミノ] フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 0 8) 5 - [4 - (2 - クロロベンジル) カルバモイルフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 0 9) 5 - [4 - [3 - (2 - クロロフェニル) プロペノイルアミノ] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 1 0) 5 - [4 - (2 - クロロフェニル) カルバモイルフェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 1 1) 5 - [4 - (6 - ブロモ - 2, 3 - メチレンジオキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(F 1 1 2) 5 - [4 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼ

ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 3) 5 - [4 - [(2 - t e r t -ブチルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 -オクタ ヒドロナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 4) 5 - [2 - (2 -ヨードベンゾイル) アミノピリジ ン-5 -イル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン -2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 5) 5 - [4 - (6 -ブロモ-2 -ヒドロキシベンゾイ ルアミノ) フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジア ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 6) 5 - [4 - (6 -クロロ-2 -メトキシベンゾイル アミノ) フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼ ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 7) 5 - [4 - (2 -ヨードベンゾイルアミノ) フェニ ル] -1 H - [1, 4] ジアゼピノ [2, 3 -h] キノリン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 8) 5 - [4 - (6 -クロロ-2 -ヒドロキシベンゾイ ルアミノ) フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジア ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 1 9) 5 - [4 - (2 -ヒドロキシ-6 -メトキシベンゾ イルアミノ) フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジ アゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 2 0) 5 - [4 - [2 -メトキシ-6 - (トリフルオロメ チル) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 2 1) 5 - [4 - [2 -ヒドロキシ-6 - (トリフルオロ メチル) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b

] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 2) 5 - [4 - [(2-イソプロペニルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 3) 5 - [4 - [(2-イソプロピルベンゾイル) アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 4) 5 - [4 - [2-クロロ-5-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 5) 5 - [4 - [2-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 6) 5 - [4 - [3-(メチルチオ) ベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 7) 5 - [4 - [2-エチル-6-メトキシベンゾイルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 8) 5 - [4 - (3-メタンスルホニルベンゾイルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 2 9) 6-エチル-1-[4-(2-ヨードベンゾイル) アミノフェニル] -1 H-1, 5-ベンゾジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 3 0) 5 - [4 - [2-エチル-6-ヒドロキシベンゾイ

ルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 1) 5 - [4 - (3-メタンスルフィニルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 2) 5 - [4 - (2-クロロ-5-メタンスルフィニルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 3) 5 - [4 - (2-メタンスルフィニルベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 4) 5 - [4 - [[2 - (4-モルホリニル) アセチル] アミノ] フェニル] - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩 ;

(F 1 3 5) 5 - [4 - (2-クロロ-6-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1, 3-ジヒドロナフト [1, 2-e] - 1, 4-ジアゼピン-2-オン ;

(F 1 3 6) 5 - [4 - [[(3-クロロピリジン-2-イル) カルボニル] アミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 7) 5 - [4 - (2-クロロ-6-ヒドロキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1, 3-ジヒドロナフト [1, 2-e] - 1, 4-ジアゼピン-2-オン ;

(F 1 3 8) 5 - [4 - (3-クロロ-2-メトキシベンゾイルアミノ) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(F 1 3 9) 5 - [4 - [(3-メチルピリジン-2-イル) カ

ルボニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4]
] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 0) 5 - [4 - [[(3 -クロロピリジン-2 -イル)
カルボニル] アミノ] フェニル] -1, 2, 3, 4, 8, 9, 10,
11 -オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2
, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 1) 5 - [4 - (3 -クロロ-2 -ヒドロキシベンゾイ
ルアミノ) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジア
ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 2) 5 - [4 - [[(3 -ヒドロキシピリジン-2 -イル)
カルボニル] アミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 3) 5 - [4 - [(3 -ビニルピリジン-2 -イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4]
] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 4) 5 - [4 - [(3 -エチルピリジン-2 -イル) カ
ルボニルアミノ] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4]
] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 1 4 5) N - [4 - (2, 4 -ジオキソ-1, 2, 3, 4 -
テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5 -
イル) フェニル] -2 -ニトロベンゼンスルホンアミド;

(F 1 4 6) N - [4 - (2, 4 -ジオキソ-1, 2, 3, 4 -
テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 -イル
) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 4 7) 3 -ブロモ-N - [4 - (2, 4 -ジオキソ-1,
2, 3, 4 -テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピ
ン-5 -イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 4 8) N - [4 - (2, 4 -ジオキソ-1, 2, 3, 4 -

テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル
) フェニル] - 3-メトキシベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 4 9) N- [3- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H
-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル
] ベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 5 0) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-
テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-
イル) フェニル] - 2-ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 5 1) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4,
8, 9, 10, 11-オクタヒドロ-ナフト [1, 2-b] [1, 4
] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] - 2-ニトロ-ベンゼンスル
ホンアミド ;

(F 1 5 2) N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4,
8, 9, 10, 11-オクタヒドロ-ナフト [1, 2-b] [1, 4
] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] - N-メチル-2-ニトロベ
ンゼンスルホンアミド ;

(F 1 5 3) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-
テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-
イル) フェニル] - N-メチル-2-ニトロベンゼンスルホンアミド
;

(F 1 5 4) 4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9
, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼ
ピン-5-イル) - N-フェニルベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 5 5) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-
テトラヒドロナフト [1, 2-b] - [1, 4] ジアゼピン-5-イ
ル) フェニル] - 2-ナフタレンスルホンアミド ;

(F 1 5 6) N- [3- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-
テトラヒドロナフト [1, 2-b] - [1, 4] ジアゼピン-5-イ

ル) フェニル] - 1 - ナフタレンスルホンアミド ;

(F 1 5 7) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] シクロヘキサンスルホンアミド ;

(F 1 5 8) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 3 - ピリジンスルホンアミド 塩酸塩 ;

(F 1 5 9) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] - 4 - イソプロピルベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 6 0) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル] フェニルメタンスルホンアミド ;

(F 1 6 1) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 3 - ピリジンスルホンアミド ;

(F 1 6 2) N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 2 - ナフタレンスルホンアミド ;

(F 1 6 3) 4 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロナフト - [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 - イル) フェニル 3 - ブロモベンゼンスルホネート ;

(F 1 6 4) N - ベンジル - N - [4 - (1 - ベンジル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 イル) フェニル] - 2 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 6 5) N - ベンジル - N - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 1

, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(F 1 6 6) 3-ブロモ-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-メチルベンゼンスルホンアミド;

(F 1 6 7) N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-メチル-2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(F 1 6 8) N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト- [1, 2-b] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-(2-ヒドロキシエチル)-2-ニトロベンゼンスルホンアミド;

(F 1 6 9) N-[4-(7-クロロ-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 7 0) N-[4-(7-ブromo-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 7 1) N-[4-[(2, 4-ジオキソ-7-(トリフルオロメチル)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル)] フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 7 2) N-[4-(2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド;

(F 1 7 3) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [

1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 7 4) 1-(3-ブロモフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 7 5) N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト-[1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル]-2-トリフルオロメチルベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 7 6) N-[4-(7-ブロモ-6-メチル-2, 4-ジオキソ-2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 7 7) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 7 8) 3-ブロモ-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] ベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 7 9) N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル]-3-メトキシベンゼンスルホンアミド ;

(F 1 8 0) 1-(2-ブロモフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 1) N-[4-(2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル

) フェニル] - 1 - (2-メチルフェニル) メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 2) N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル

) フェニル] - 1 - (2-ニトロフェニル) メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 3) N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル

) フェニル] - 2-フェニルエタンスルホンアミド ;

(F 1 8 4) 1 - (2, 3-ジクロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 5) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-7-メトキシ-1H-ベンゾ [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 6) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-7-ヒドロキシ-1H-ベンゾ [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 7) 1 - (4-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 8) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) ベンジル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 8 9) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) - 2-メトキシフェニル] メタンスルホンアミド ;

(F 1 9 0) 1 - (2-クロロフェニル) - N - [4 - (2, 4

ージオキソー1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) -2-ヒドロキシフェニル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 1) 1-(2, 6-ジクロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソー1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 2) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソー6-メチル-1H-ベンゾ [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-1-イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 3) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキシー1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) プロピル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 4) 1-(2-クロロフェニル)-N-[2-(2, 4-ジオキソー1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) エチル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 5) N-[4-(2, 4-ジオキソー1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -1-(2-ヨードフェニル) メタンスルホンアミド;

(F 1 9 6) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2, 4-ジオキソー1, 2, 3, 4, 8, 9, 10, 11-オクタヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 1 9 7) 1-(2-クロロフェニル)-N-[4-(2-オキソー2, 3-ジハイドロ-1H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] メタンスルホンアミド;

(F 1 9 8) 1-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] -N

ー [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 199) 1- (2-エチルフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 200) 1- (2, 3-ジメチルフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 201) 2- (2-クロロフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルエタンスルホンアミド;

(F 202) 1- (2-ニトロフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 203) 1- (2-アミノフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 204) 1- (2-ジメチルアミノフェニル) -N- [4- (2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] フェニル-N-メチルメタンスルホンアミド;

(F 205) 5- [4- [(ピリジン-4-イル) カルボニルア

ミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(F 2 0 6) 5 - [4 - [2 - [(ピリジン-3-イル) オキシ] アセチルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(F 2 0 7) 5 - [4 - [(ピリジン-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(F 2 0 8) 5 - [4 - [(2-メチルピリジン-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(F 2 0 9) 5 - [4 - [(2-クロロピリジン-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 2 1 0) 5 - [4 - [2 - [(ピリジン-2-イル) オキシ] アセチルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 2 1 1) 5 - [4 - [[4 - (トリフルオロメチル) ピリジン-3-イル] カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 2 1 2) 5 - [4 - [(2-クロロピリジン-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 1 H-[1, 4] ジアゼピノ [2, 3-f] イソキノリン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 2 1 3) 5 - [4 - [(2-クロロピリジン-3-イル) カルボニルアミノ] フェニル] - 8, 9, 10, 11-テトラヒドロ-1 H-[1, 4] ジアゼピノ [2, 3-f] イソキノリン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(F 2 1 4) 5 - [4 - [(2-イソプロピルベンゾイル) アミ

ノ] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン
- 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(G1) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナ
フト [1, 2-e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル]
- 3- (ピリジン-2-イル) プロピオン酸アミド ;

(G2) 2-エチル-3-ヒドロキシ-N- [4- (2-オキソ
-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] -ジア
ゼピン-5-イル) フェニル] ベンズアミド ;

(G3) 2-エチル-N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒド
ロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル
) フェニル] ニコチンアミド 二塩酸塩 ;

(G4) 2-エチル-6-ヒドロキシ-N- [4- (2-オキソ
-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] -ジア
ゼピン-5-イル) フェニル] ベンズアミド ;

(G5) 3-エチル-N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒド
ロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル
) フェニル] ピコリンアミド 塩酸塩 ;

(G6) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナ
フト [1, 2-e] [1, 4] -ジアゼピン-5-イル) フェニル]
- 2- (ピリジン-2-イルオキシ) アセトアミド 塩酸塩 ;

(G7) 2- (2-メトキシフェニル) -N- [4- (2-オキ
ソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジア
ゼピン-5-イル) フェニル] アセトアミド ;

(G8) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナ
フト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) -フェニル]
- 3- (ピリジン-3-イル) プロピオンアミド 二塩酸塩 ;

(G9) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナ
フト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-5-イル) フェニル] -

3-フェニルプロパンアミド；

(G10) N-[4-(2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-3-イル)プロピオンアミド塩酸塩；

(G11) N-[4-(2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イル)プロピオンアミド塩酸塩；

(G12) 2-tert-ブチル-N-[4-(2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)2-フルオロフェニル]ベンズアミド；

(G13) N-[4-(2,4-ジオキソ-3,4-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)-フェニル]-3-(ピリジン-2-イル)プロピオンアミド塩酸塩；

(G14) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2,4-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-b][1,4]ジアゼピン-5(2H)-イル)フェニル]ニコチンアミド塩酸塩；

(G15) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド；

(G16) 2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル)フェニル]ニコチンアミド二塩酸塩；

(G17)

2-(ジメチルアミノ)-N-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ナフト[1,2-e][1,4]ジアゼピン-5-イル

) フェニル] ニコチンアミド ニメタンスルホン酸塩 ;

(G 1 8) N- [4- (2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4]-ジアゼピン-5 (2 H)-イル) フェニル] -2- (モルホリン-4-イル) -ニコチンアミド 塩酸塩 ;

(G 1 9) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2- (1 H-ピロール-1-イル) ニコチンアミド 二塩酸塩 ;

(G 2 0) 2- (モルホリン-4-イル) -N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド 二塩酸塩 ;

(G 2 1) N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] -2- (ピロリジン-1-イル) ニコチンアミド 二塩酸塩 ;

(G 2 2) 4- (ジメチルアミノ) -N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド二塩酸塩 ;

(G 2 3) 2-イソプロピル-N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド二塩酸塩 ;

(G 2 4) 2- (イソプロピルアミノ) -N- [4- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1 H-ナフト [1, 2-e] [1, 4]-ジアゼピン-5-イル) フェニル] ニコチンアミド二塩酸塩 ;

(H 1) 5- [4- [5- (2-メトキシベンジル) -1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H)-ジオン ;

(H 2) 5- [4- [5- (2-ヒドロキシベンジル) -1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]

[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 3) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-3-イル) エチル]
] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1,
2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン
塩酸塩 ;

(H 4) 5 - [4 - (5-フェネチル-1 H-テトラゾール-1-
イル) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼ
ピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 5) 5 - [4 - [5 - (ピリジン-4-イルメチル) - 1 H-
テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b
] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 6) 5 - [4 - (5-ベンジル-1 H-テトラゾール-1-
イル) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピ
ン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 7) 5 - [4 - [5 - (ピリジン-3-イルメチル) - 1 H-
テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b
] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 8) 7-メトキシ-1 - [4 - [5 - (2-メトキシベンジ
ル) - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ベンゾ [b
] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 9) 5 - [6 - [5 - (2-メトキシベンジル) - 1 H-テ
トラゾール-1-イル] ピリジン-3-イル] - 1 H-ナフト [1,
2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 10) 5 - [4 - [5 - (2-シクロヘキシルエチル) - 1
H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b
] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン ;

(H 11) 5 - [6 - [5 - (2-ヒドロキシベンジル)] - 1
H-テトラゾール-1-イル] ピリジン-3-イル] - 1 H-ナフト

[1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(H 1 2) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-4-イル) エチル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩 ;

(H 1 3) 5 - [4 - [5 - (ピリジン-2-イルメチル) - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(H 1 4) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン 塩酸塩 ;

(H 1 5) 5 - [4 - [5 - [(1H-イミダゾール-1-イル) メチル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(H 1 6) 5 - [4 - [5 - [2 - (1H-イミダゾール-1-イル) エチル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(H 1 7) 5 - [4 - [5 - [2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-e] [1, 4] ジアゼピン-2 (3H) -オン 二塩酸塩 ;

(H 1 8) 5 - [4 - [5 - (2-メトキシフェネチル) - 1H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H) -ジオン ;

(H 1 9) 5 - [4 - [5 - (2-メトキシベンジル) - 1H-

テトラゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-e]
[1, 4] ジアゼピン-2 (3 H) -オン;

(H 2 0) 5 - [4 - [5 - (3-フェニルプロピル) -1 H-
テトラゾール-1-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 2 1) 5 - [4 - (2-フェネチル-1 H-イミダゾール-
1-イル) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジア
ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 2 2) 5 - [4 - (1-フェネチル-1 H-イミダゾール-
2-イル) フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジア
ゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 2 3) 5 - [4 - [1 - (4-クロロベンジル) -1 H-イ
ミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b] [1,
4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 2 4) 5 - [4 - [1 - (2-メトキシベンジル) -1 H-
イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 2 5) 5 - [4 - [1 - (3-メトキシフェネチル) -1 H-
イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 2 6) 5 - [4 - [1 - (3-メトキシフェネチル) -1 H-
イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 2 7) 5 - [4 - [1 - (3-ヒドロキシフェネチル) -1
H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1, 2-b]
[1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 2 8) 5 - [4 - [1 - (2, 4, 6-トリメチルベンジル)
-1 H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1 H-ナフト [1

, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン
塩酸塩;

(H 2 9) 4 - [3 - [5 - [2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] -ベンゾ [f] キノキサリン-2, 3 (1 H, 4 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 0) 5 - [4 - [5 - [2 - (6-メチルピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] -フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 1) 5 - [4 - [(2 - (3-フルオロフェニル) エチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 2) 5 - [4 - [(2 - (2-メトキシフェニル) エチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 3) 5 - [4 - [(2 - (4-フルオロフェニル) エチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 4) 5 - [4 - [(2 - (2-フルオロフェニル) エチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 3 5) 5 - [4 - [1 - [2 - (トリフルオロメチル) ベンジル] - 1 H-イミダゾール-2-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン

ン 塩酸塩；

(H 3 6) 5-[4-[2-[4-(トリフルオロメチル)フェニルエチル]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩；

(H 3 7) 5-[4-[2-(2, 6-ジメチルフェニルエチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩；

(H 3 8) 5-[4-[2-[3-(トリフルオロメチル)フェニルエチル]-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩；

(H 3 9) 5-[4-[5-[2-(ピリジン-2-イル)エチル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン 二塩酸塩；

(H 4 0) 5-[4-(5-フェネチル-1H-テトラゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン；

(H 4 1) 5-[4-(2-フェネチル-1H-イミダゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-e][1, 4]ジアゼピン-2(3H)-オン 二塩酸塩；

(H 4 2) 5-[4-[2-(3-メトキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩；

(H 4 3) 5-[4-[2-(3-ヒドロキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン 塩酸塩

;

(H 4 4) 3-[2-[1-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5(2H)-イル)フェニル]-1H-テトラゾール-5-イル]エチル]ベンゾニトリル;

(H 4 5) 3-[2-[1-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5(2H)-イル)フェニル]-1H-テトラゾール-5-イル]エチル]ベンズアミド;

(H 4 6) 5-[4-[5-[2-(2-メトキシピリジン-3-イル)エチル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(H 4 7) 5-[4-[5-[2-(ジメチルアミノ)ベンジル]-1H-テトラゾール-1-イル]フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン メシル酸塩;

(H 4 8) 4-[2-[1-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5(2H)-イル]フェニル]-1H-イミダゾール-2-イル]エチル]ベンゾニトリル;

(H 4 9) 4-[2-[1-[4-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロ-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-5(2H)-イル]フェニル]-1H-イミダゾール-2-イル]エチル]ベンズアミド;

(H 5 0) 5-[4-(2-フェニル-1H-イミダゾール-1-イル)フェニル]-1H-ナフト[1, 2-b][1, 4]ジアゼピン-2, 4(3H, 5H)-ジオン;

(H 5 1) 5 - [4 - [2 - (2 - メトキシフェニル) - 1 H - イミダゾール - 1 - イル] フェニル] - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(H 5 2) 2 - [[2 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 1 - イル] メチル] ベンゾニトリル ;

(H 5 3) 2 - [[2 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 1 - イル] メチル] ベンズアミド ;

(H 5 4) 2 - [2 - [1 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] エチル] ベンゾニトリル ;

(H 5 5) 2 - [2 - [1 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] エチル] ベンズアミド ;

(H 5 6) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] エチル] ベンゾニトリル ;

(H 5 7) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 1 H - ナフト [1, 2 - b] [1, 4] ジアゼピン - 5 (2 H) - イル) フェニル] - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] エチル] ベンズアミド ;

(H 5 8) 3 - [2 - [1 - [4 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4

ージヒドロ-1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-5 (2H)-イル) フェニル] -1H-イミダゾール-2-イル] エチル] ベンズアミド 塩酸塩;

(H 59) 5-[4-[2-[4-(メチルスルホニル) フェネチル]-1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(H 60) 5-[4-[2-(2-フルオロ-3-メトキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(H 61) 5-[4-[2-(3-メトキシフェネチル)-1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1H, 3H)-ジオン 塩酸塩;

(H 62) 5-[4-[2-[2-(チオフェン-3-イル) エチル]-1H-イミダゾール-1-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン 塩酸塩;

(H 63) 5-[4-[1-(2-アミノベンジル)-1H-イミダゾール-2-イル] フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン;

(H 64) 5-[3-メトキシ-4-(1-フェネチル-1H-イミダゾール-2-イル)-フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン;

(H 65) 5-[3-ヒドロキシ-4-(1-フェネチル-1H-イミダゾール-2-イル)-フェニル] -1H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3H, 5H)-ジオン;

(H 6 6) 5 - [4 - [2 - [2 - (フラン-2-イル) エチル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] - フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(H 6 7) 5 - [4 - [2 - (2-フルオロフェネチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 5, 8, 9, 10-テトラヒドロインデノ [4, 5-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン ;

(H 6 8) 5 - [4 - [2 - (フェノキシメチル) - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン ;

(H 6 9) 5 - [4 - [5 - [2 - メチル-2 - (ピリジン-2-イル) プロピル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(H 7 0) 5 - [4 - [5 - [2 - (3-メトキシピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-テトラゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(H 7 1) 5 - [4 - [[2 - (ピリジン-2-イル) エチル] - 1 H-イミダゾール-1-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 二塩酸塩 ;

(H 7 2) 5 - [4 - (5-フェニル-1 H-イミダゾール-4-イル) フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) - ジオン 塩酸塩 ;

(H 7 3) 5 - [4 - [(5-フェニルエチル) - 1 H-イミダゾール-4-イル] フェニル] - 1 H-ナフト [1, 2-b] [1,

4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 7 4) 5 - [4 - (4, 4 -ジメチル-2 -フェネチル-4, 5 -ジヒドロ-1 H -イミダゾール-1 -イル) フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 7 5) 5 - [4 - [2 - [(2 -メトキシフェニル) アミノ] -1 H -イミダゾール-1 -イル] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 7 6) 5 - [4 - [2 - (フェニルアミノ) -1 H -イミダゾール-1 -イル] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 7 7) 5 - [4 - [1 - [(6 -メトキシピリジン-2 -イル) メチル] -1 H -イミダゾール-2 -イル] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 7 8) 5 - [4 - [1 - [(6 -ヒドロキシピリジン-2 -イル) メチル] -1 H -イミダゾール-2 -イル] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 7 9) 5 - [4 - [2 - (3 -フルオロフェネチル) -1 H -イミダゾール-1 -イル] フェニル] -5, 8, 9, 10 -テトラヒドロインデノ [4, 5 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (1 H, 3 H) -ジオン 塩酸塩;

(H 8 0) 5 - [4 - [2 - [(フェニルアミノ) メチル] -1 H -イミダゾール-1 -イル] フェニル] -1 H -ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5 H) -ジオン;

(H 8 1) 3 - [[2 - [4 - [2, 4 -ジオキソ-3, 4 -ジヒドロ-1 H -ナフト [2, 1 -b] [1, 4] ジアゼピン-5 - (

2 H) -イル] フェニル] -1 H-イミダゾール-1 -イル] メチル]
] ベンゾニトリル ;

(H 8 2) 3 - [[2 - [4 - [2, 4 -ジオキソ-3, 4 -ジ
ヒドロ-1 H-ナフト [2, 1 -b] [1, 4] ジアゼピン-5 - (
2 H) -イル] フェニル] -1 H-イミダゾール-1 -イル] メチル
] ベンズアミド ; 及び

(H 8 3) 5 - [4 - [(2 - (3 -フルオロ-2 -メトキシフ
ェニル) エチル) -1 H-イミダゾール-1 -イル] フェニル] -1
H-ナフト [1, 2 -b] [1, 4] ジアゼピン-2, 4 (3 H, 5
H) -ジオン 塩酸塩からなる群から選ばれる化合物又はその薬学的
に許容される塩である、請求項 1 に記載の医薬。

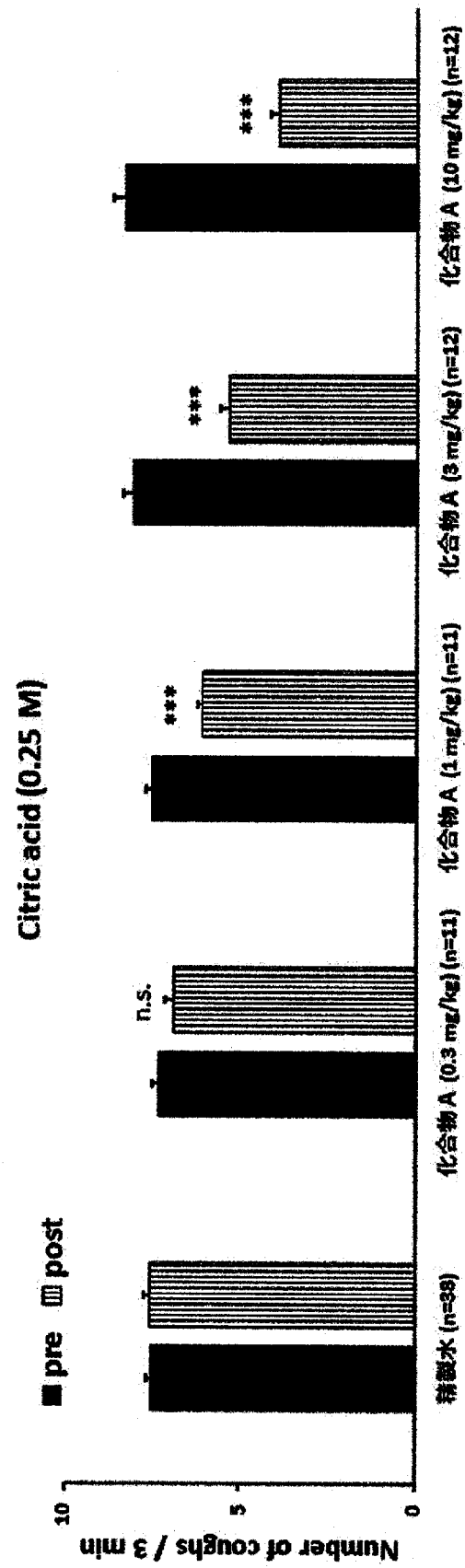
[請求項98] 咳嗽が急性咳嗽、遷延性咳嗽又は慢性咳嗽である請求項 1 ないし 9
7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[請求項99] 咳嗽が慢性咳嗽である請求項 9 8 に記載の医薬。

[請求項100] 咳嗽が乾性咳嗽である咳喘息による咳嗽、アトピー性咳嗽、胃食道
逆流による咳嗽、薬剤性の咳嗽又はアレルギー性咳嗽である、請求項
1 ないし 9 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

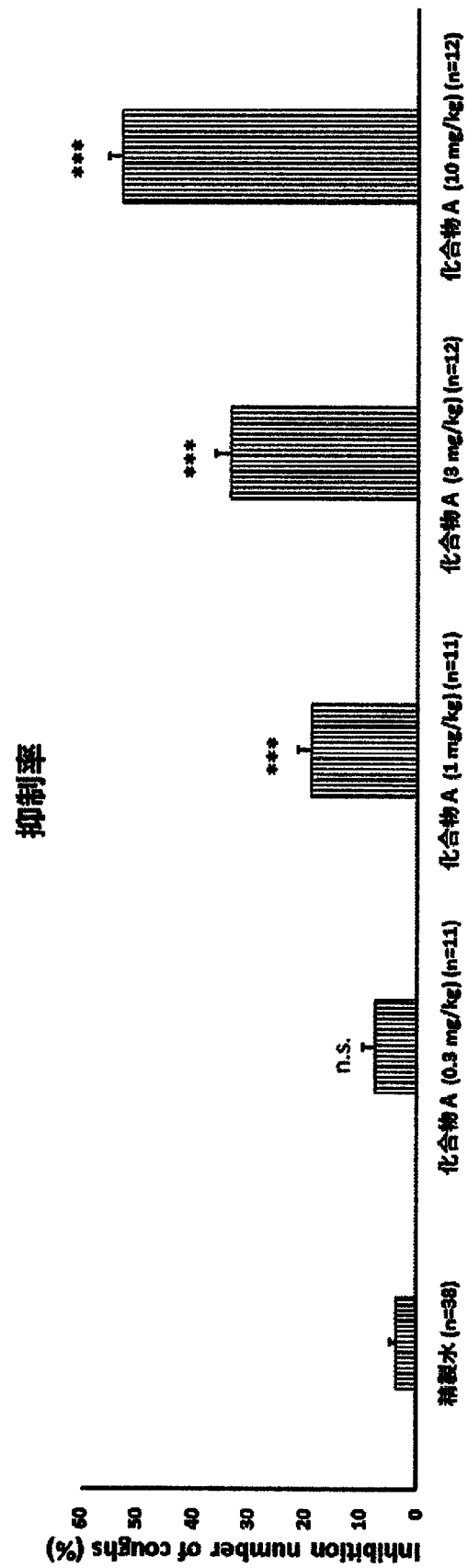
[請求項101] 咳嗽が湿性咳嗽である副鼻腔気管支症候群による咳嗽、慢性気管支
炎による咳嗽、慢性閉そく性肺疾患による咳嗽又は喘息による咳嗽で
ある、請求項 1 ないし 9 7 のいずれか 1 項に記載の医薬。

[図1]



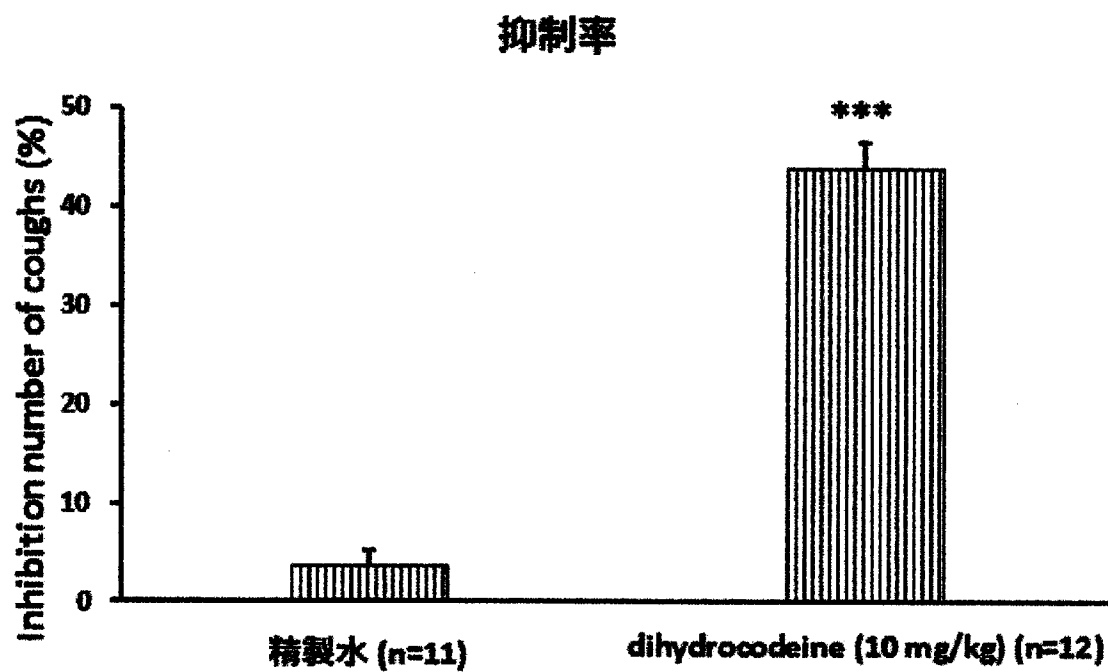
mean $\pm$ S.E. ***P < 0.001 vs. Pure water -post group

[図2]

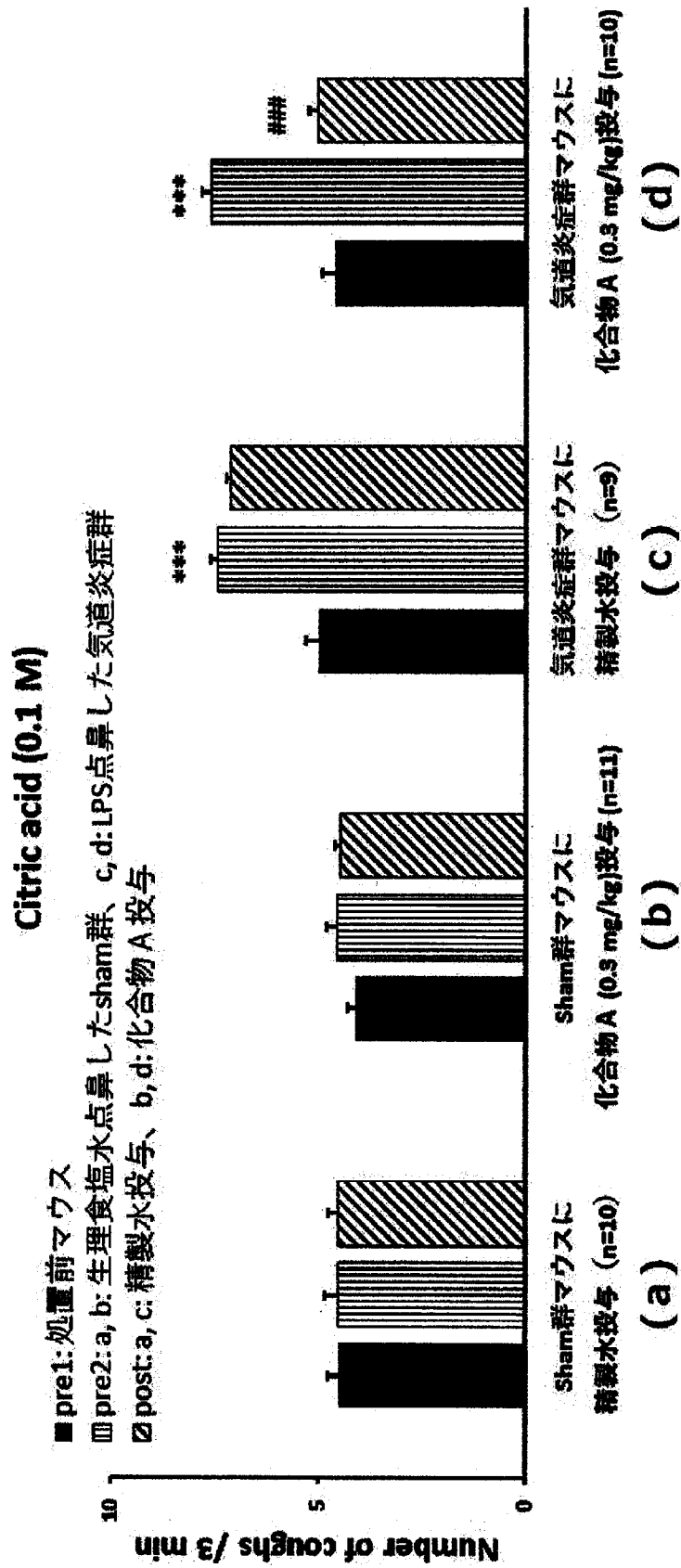


mean $\pm$ S.E. ***P < 0.001 vs. Pure water -post group

[図3]



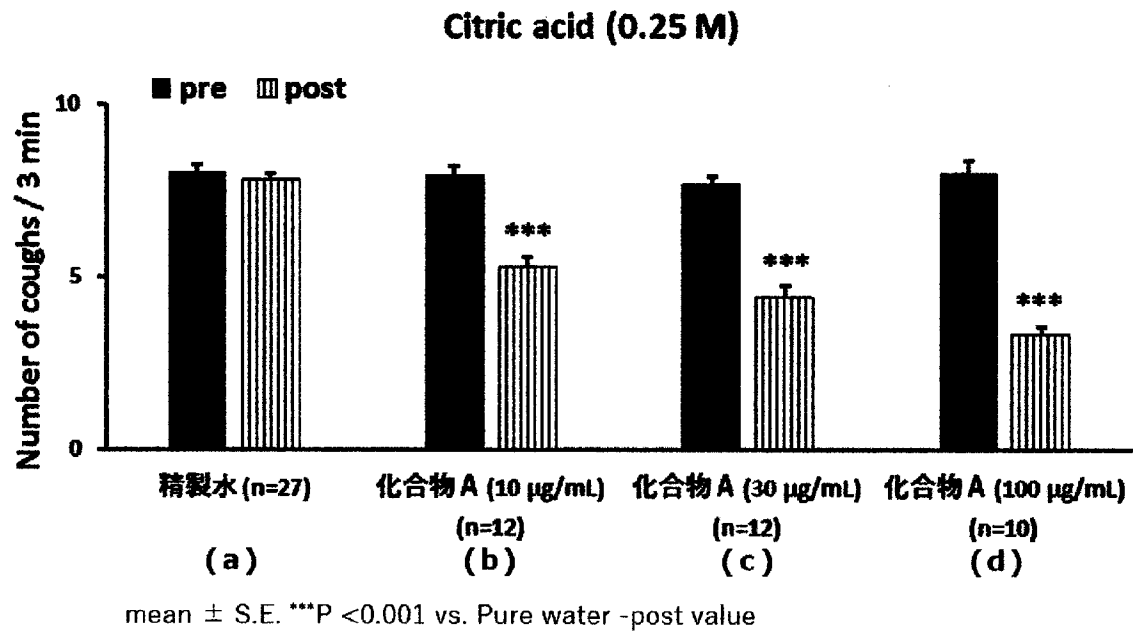
[図4]



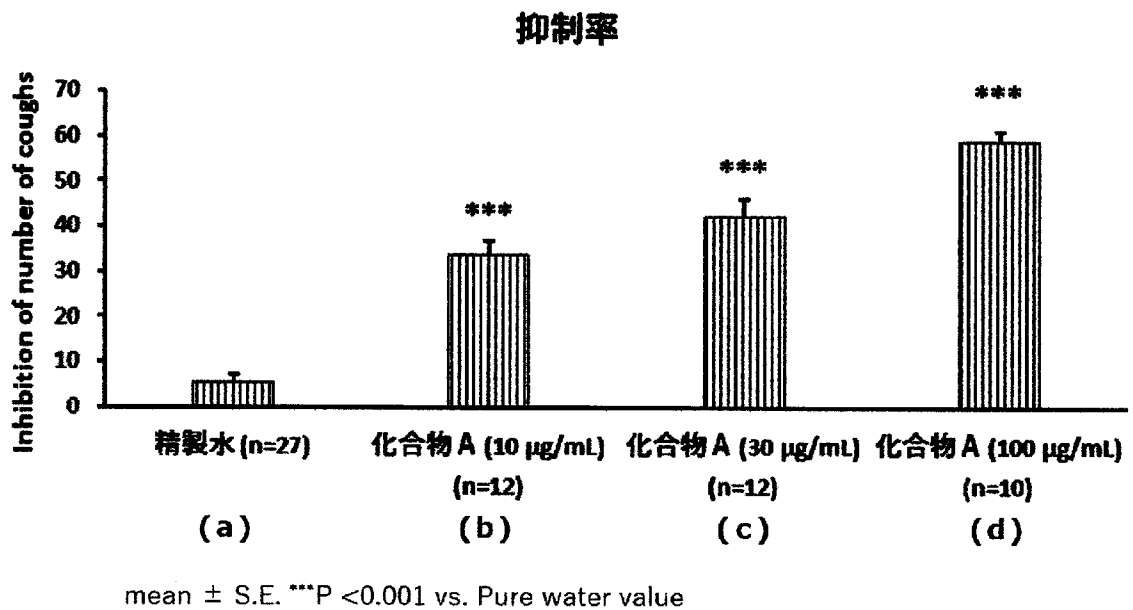
mean ± S.E. ***P < 0.001 vs. each pre1 value

mean ± S.E. ###P < 0.001 vs. each pre2 value

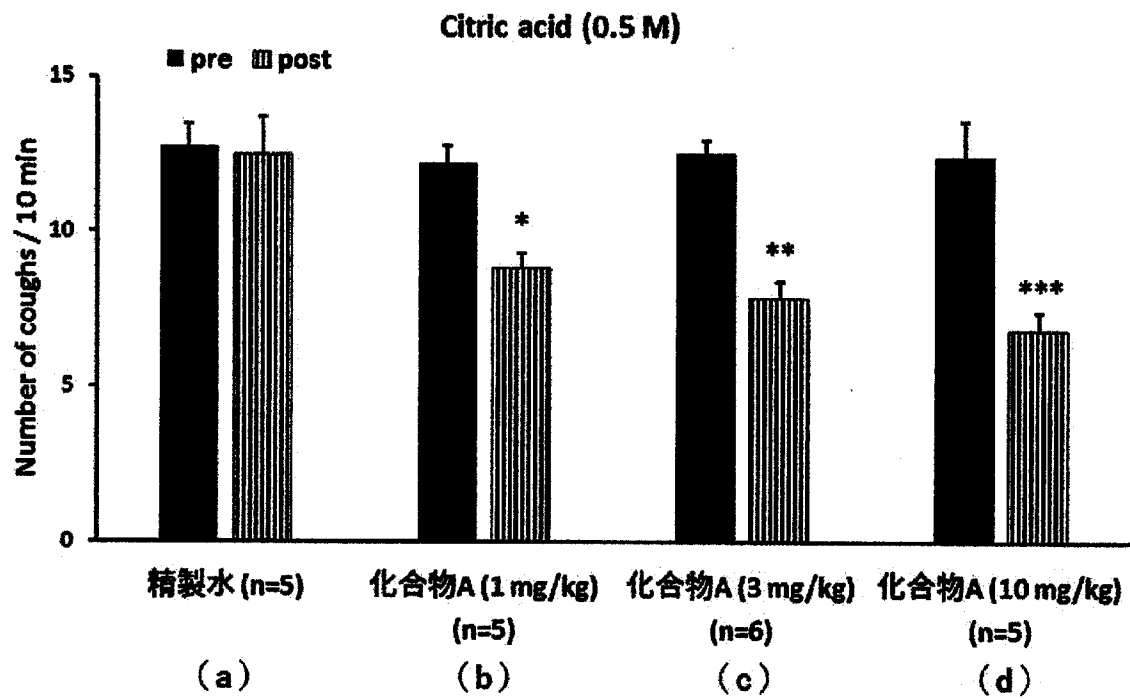
[図5]



[図6]



[図7]

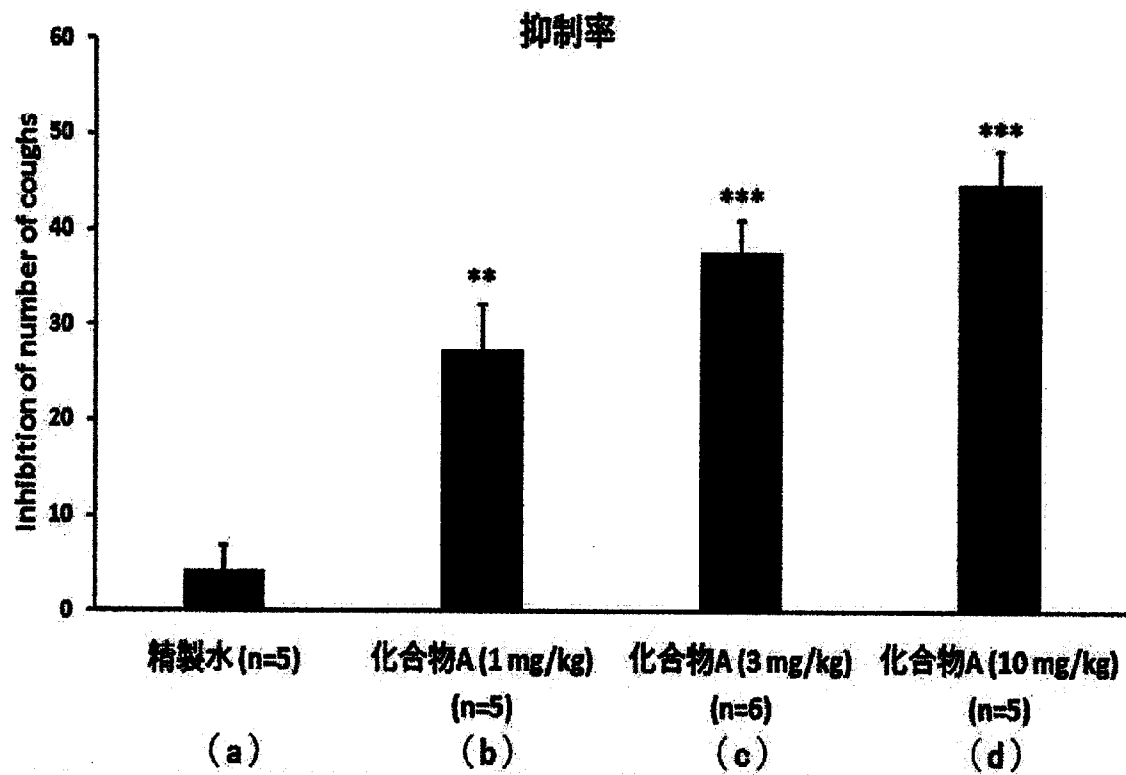


*P < 0.05 vs. PW-post value

**P < 0.01 vs. PW-post value

***P < 0.001 vs. PW-post value

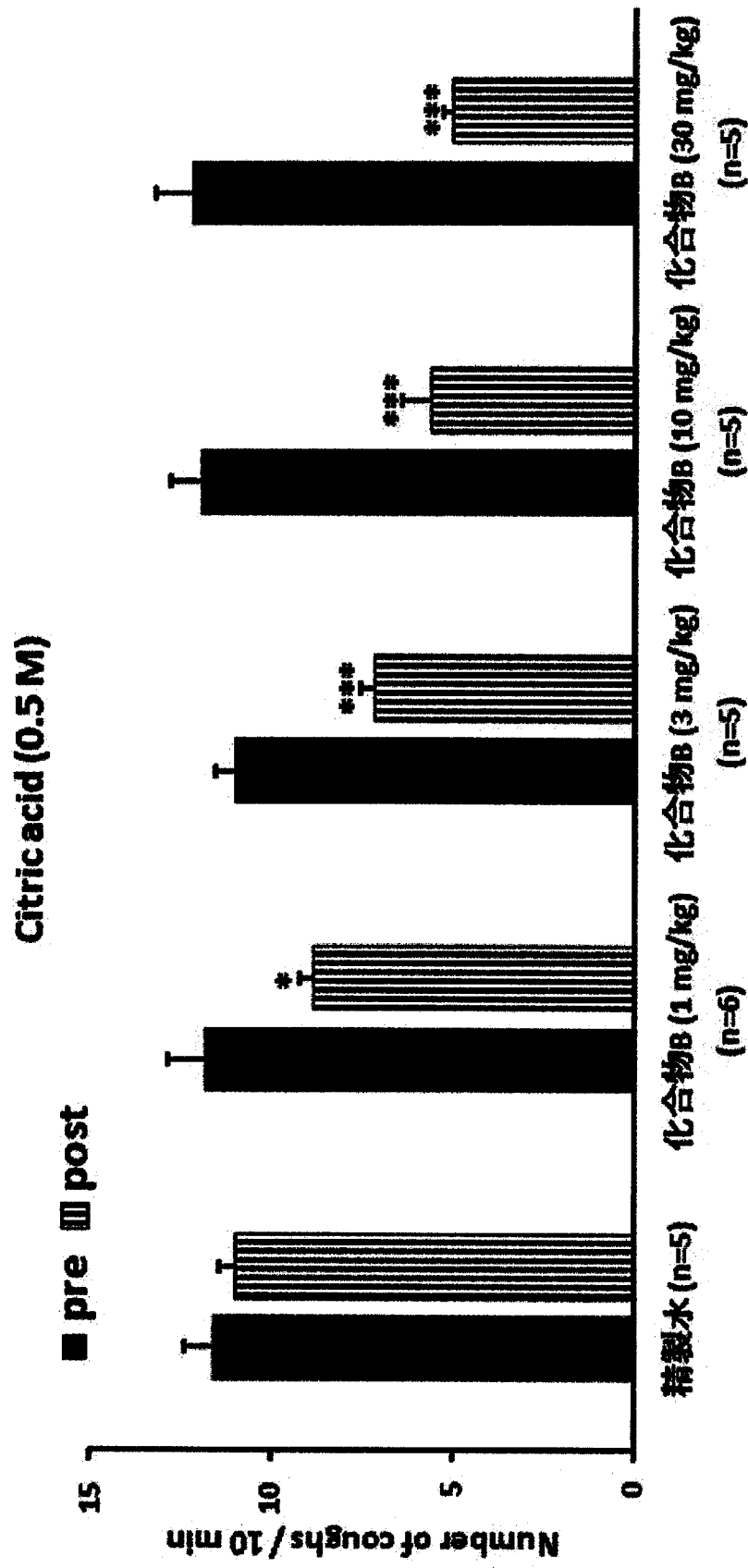
[図8]



**P < 0.01 vs. PW-post value

***P < 0.001 vs. PW-post value

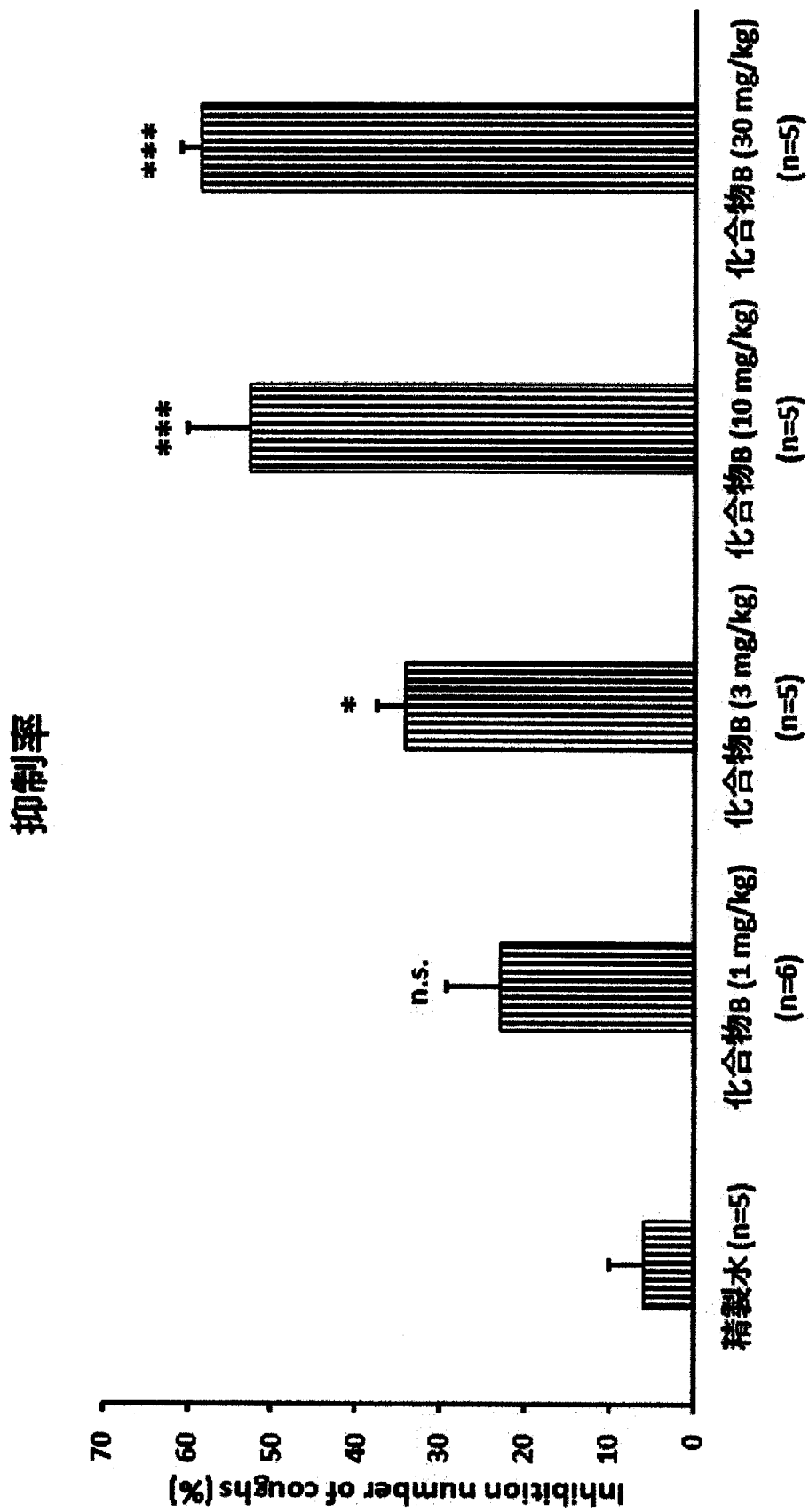
[図9]



*P < 0.05 vs. PW-post value

***P < 0.001 vs. PW-post value

[図10]

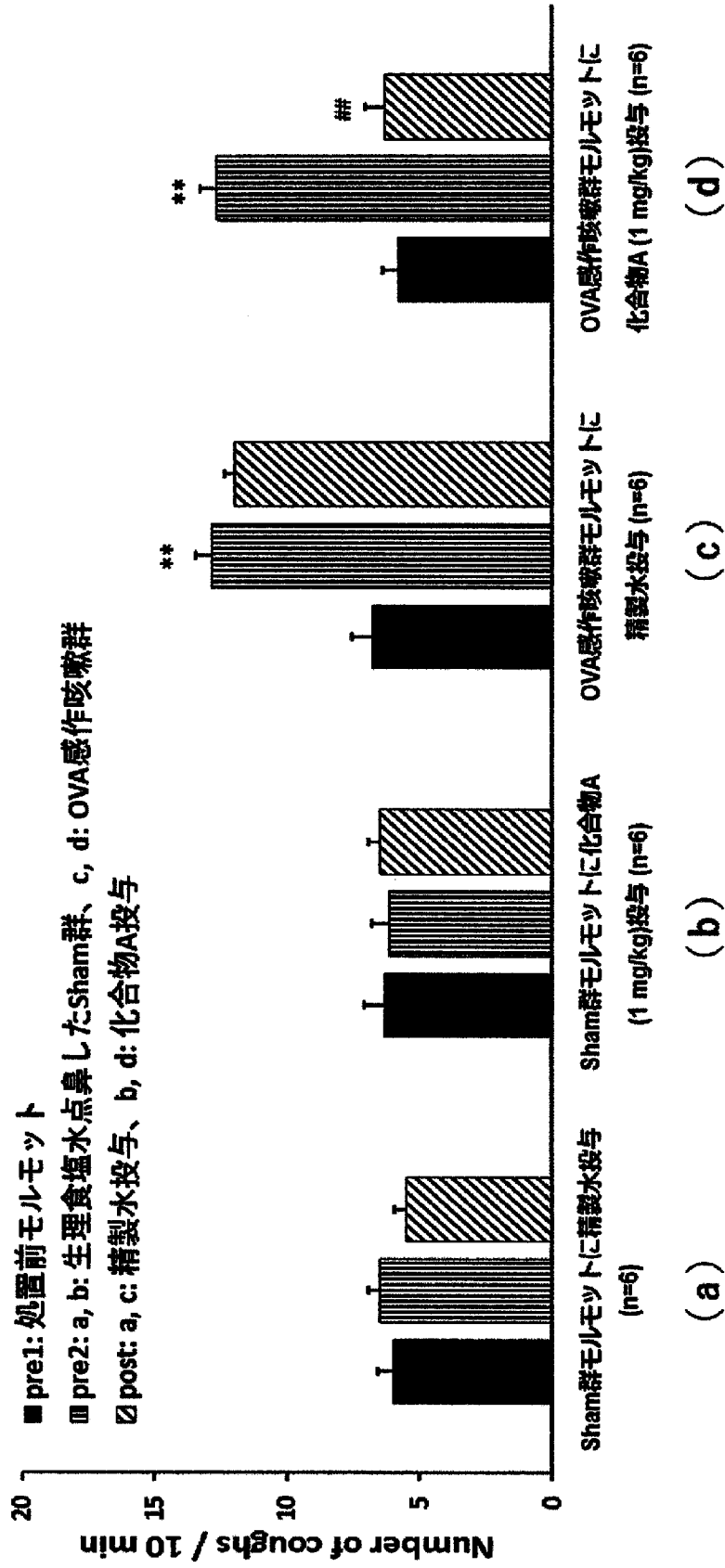


*P < 0.05 vs. PW-post value

***P < 0.001 vs. PW-post value

[図11]

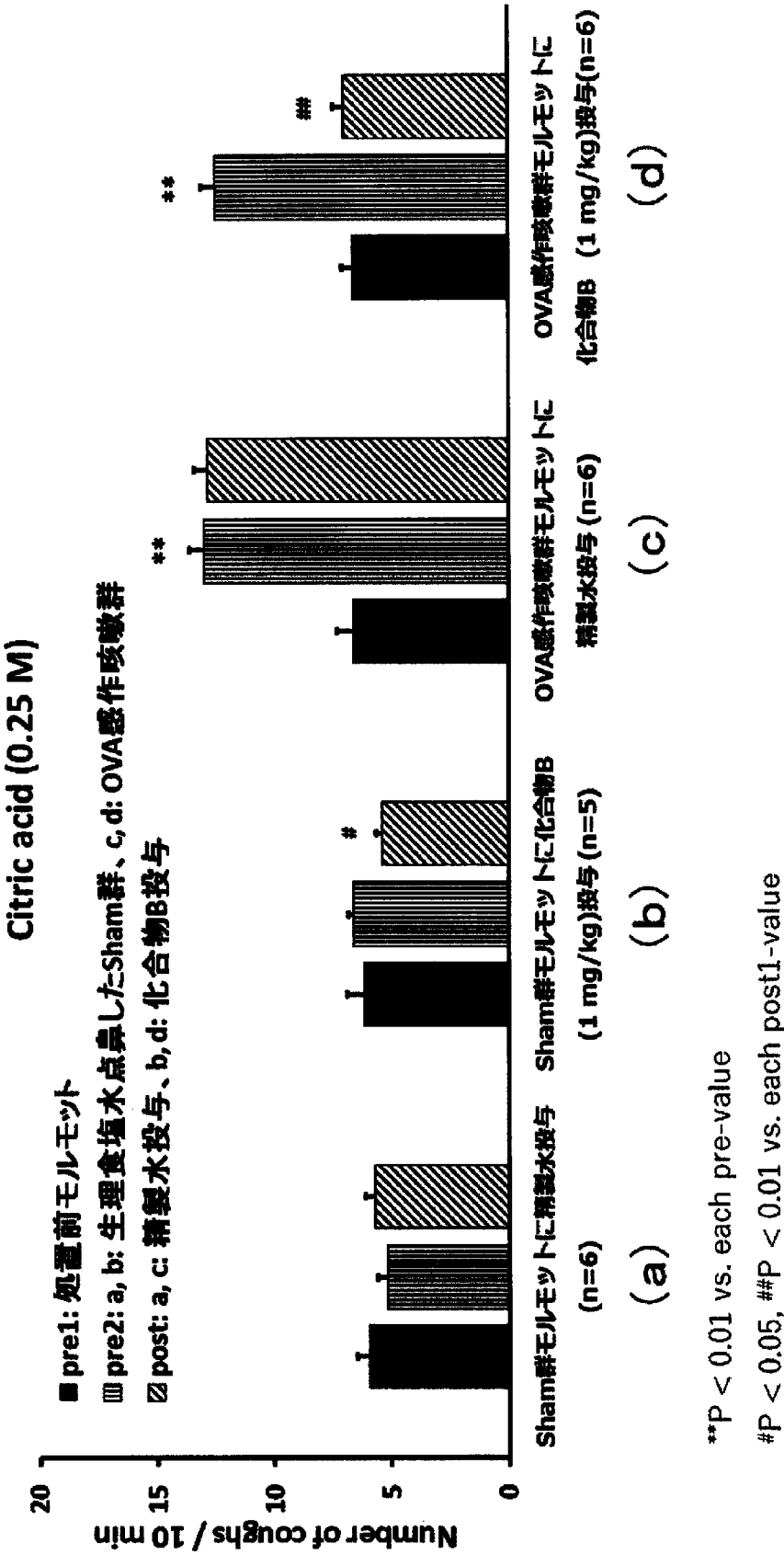
Citric acid (0.25 M)



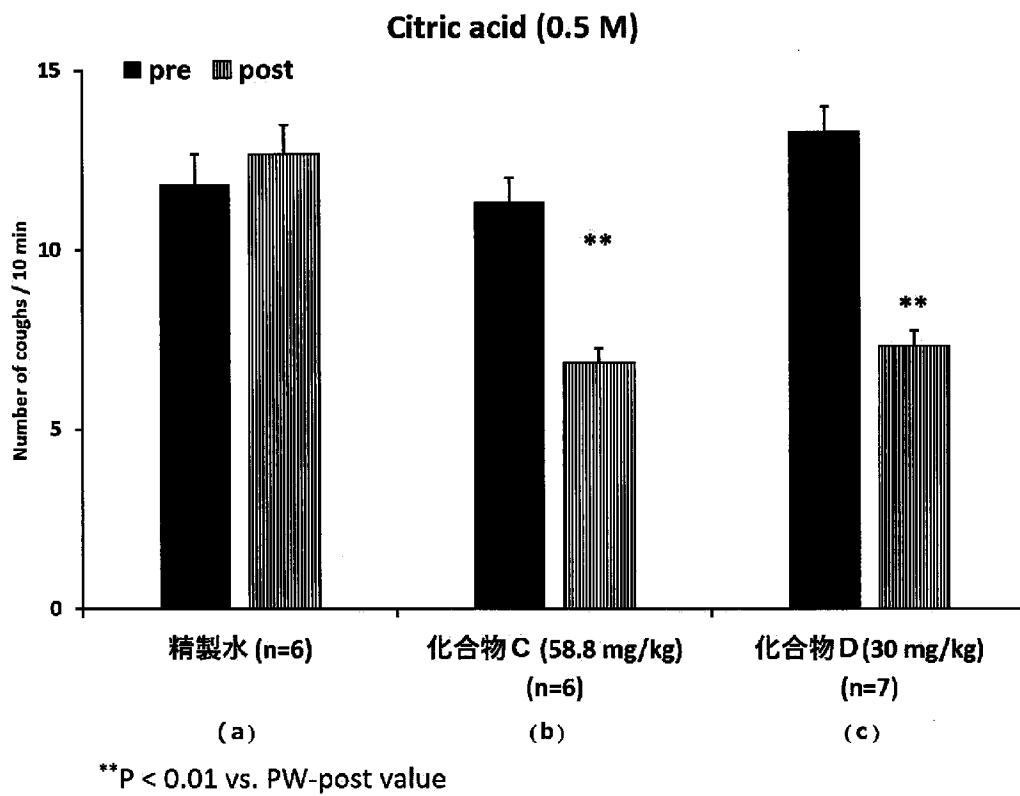
**P < 0.01 vs. each pre-value

##P < 0.01 vs. OVA-化合物A (1 mg/kg) post1 value

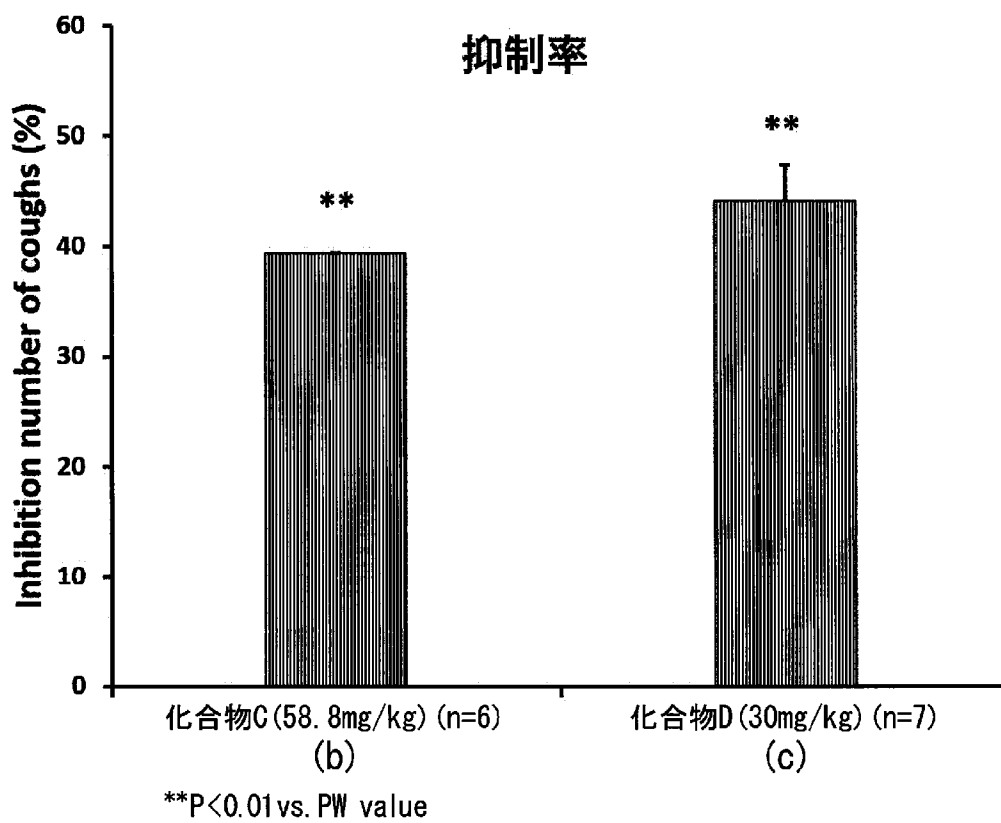
[図12]



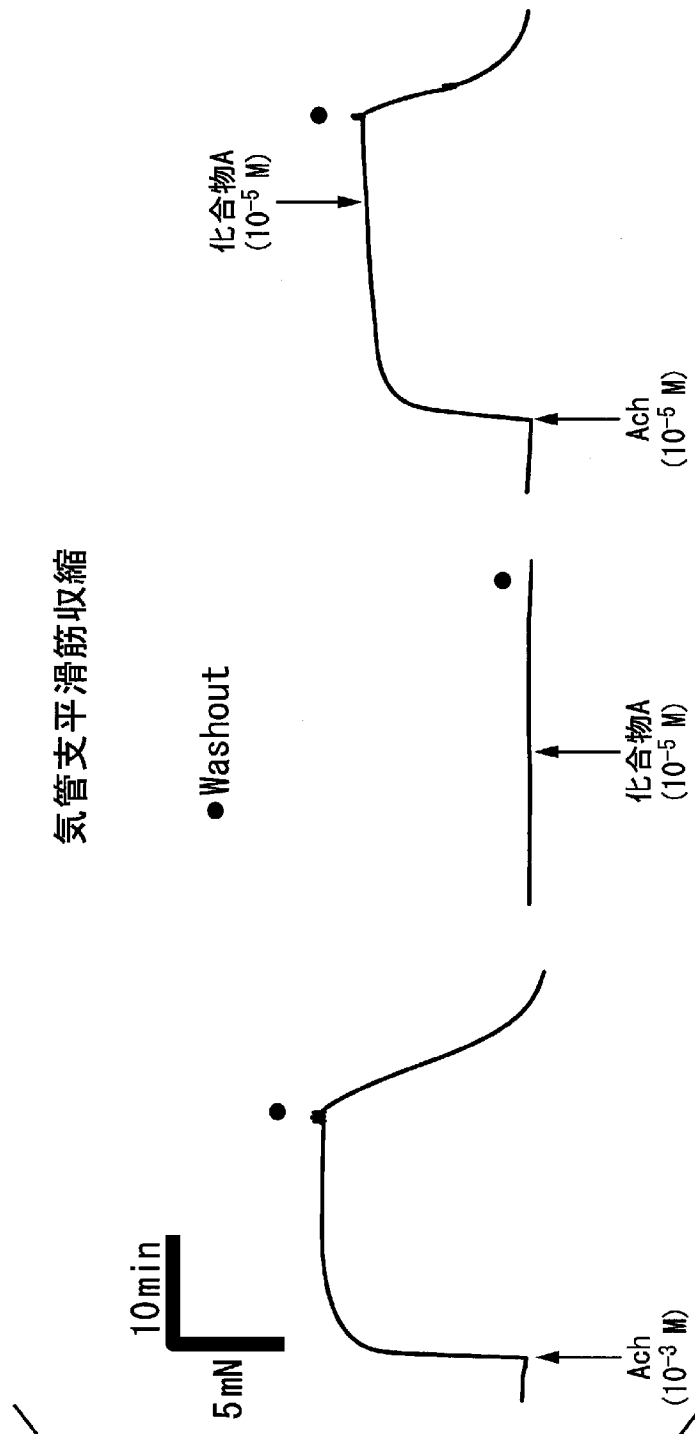
[図13]



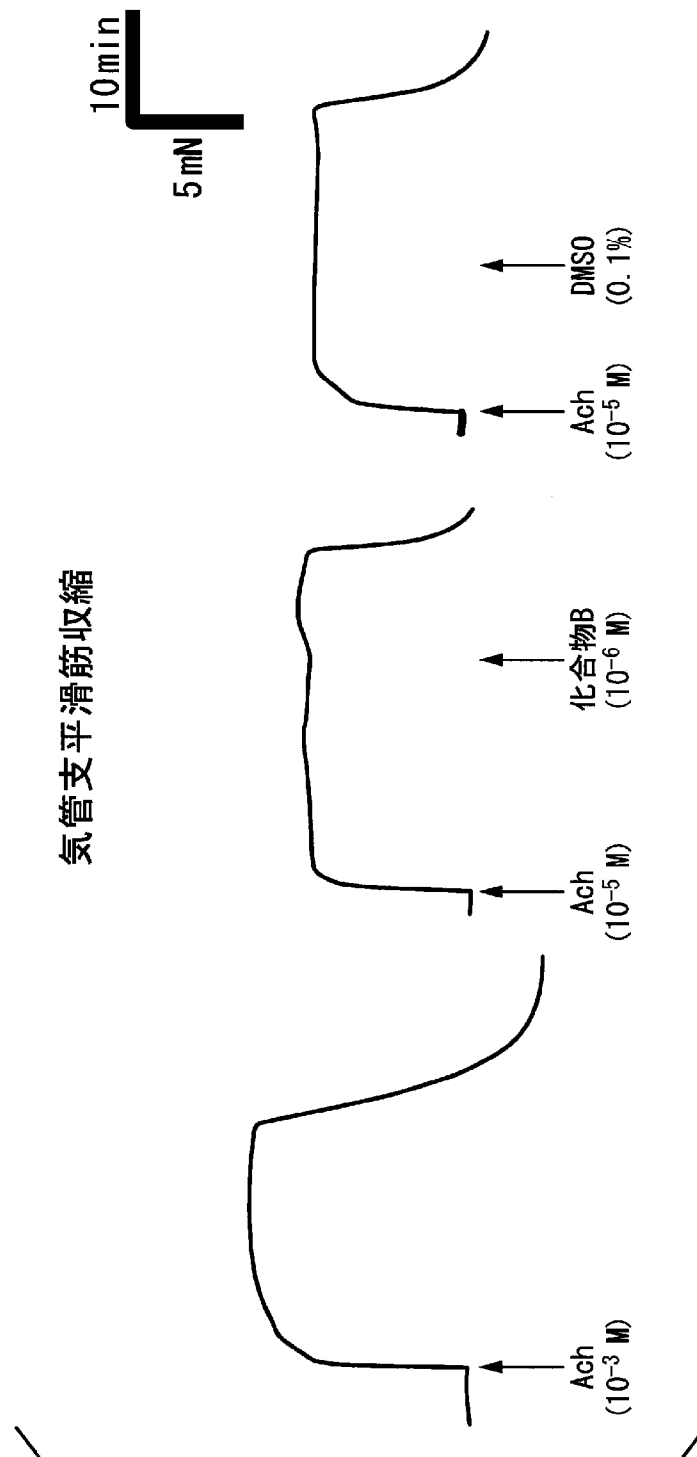
[図14]



[図15]



[図16]



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2019/010652

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl. A61K31/551 (2006.01) i, A61K31/498 (2006.01) i,
A61K31/517 (2006.01) i, A61K31/5513 (2006.01) i,
A61K45/00 (2006.01) i, A61P11/14 (2006.01) i, A61P43/00 (2006.01) i
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl. A61K31/551, A61K31/498, A61K31/517, A61K31/5513, A61K45/00,
A61P11/14, A61P43/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Published examined utility model applications of Japan	1922-1996
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2019
Registered utility model specifications of Japan	1996-2019
Published registered utility model applications of Japan	1994-2019

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), CAPLUS/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	KAMEI, J. et al., "Involvement of P2X receptor subtypes in ATP-induced enhancement of the cough reflex sensitivity", European Journal of Pharmacology, 2005, vol. 528, pp. 158-161, abstract	1-101
Y	WO 2010/093061 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 19 August 2010, claims 1-14, examples 1-17 & US 2011/0319610 A1 claims 16-29, examples 1-17 & US 2013/0281441 A1 & EP 2397480 A1 & KR 10-2011-0120939 A & CN 102395577 A & CA 2789641 A	1-15, 17-29, 37-53, 55-56, 97-101

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 22 April 2019 (22.04.2019)	Date of mailing of the international search report 14 May 2019 (14.05.2019)
Name and mailing address of the ISA/ Japan Patent Office 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915, Japan	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2019/010652

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 2012/008478 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 19 January 2012, claims 1-21, examples 1-20 & US 2013/0172550 A1 claims 23-45, examples 1-20 & EP 2597088 A1 & CA 2807354 A & CN 103080094 A & KR 10-2013-0041168 A	1, 30, 32, 97- 101
Y	WO 2012/014910 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 02 February 2012, claims 1-18, examples 1-31 & US 2013/0178625 A1 claims 20-38, examples 1-31 & EP 2631229 A1 & CA 2809113 A & CN 103237794 A & KR 10-2013-0094309 A	1, 33-34, 97- 101
Y	WO 2012/017876 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 09 February 2012, claims 1-16, examples 1-9 & US 2013/0184459 A1 claims 18-34, examples 1-9 & EP 2617717 A1 & CA 2810150 A & CN 103201270 A & KR 10-2013-0094311 A	1, 35-36, 97- 101
Y	WO 2013/105608 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 18 July 2013, claims 1-41, examples 1-216 & US 2014/0357858 A1 claims 1-41, examples 1-216 & EP 2803662 A1 & AU 2013208536 A & CA 2861024 A & CN 104066724 A & KR 10-2014-0116926 A	1, 57-93, 97- 101
Y	WO 2015/005467 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 15 January 2015, claims 1-15, examples 1-27 & US 2017/0081294 A1 claims 1-15, examples 1-27 & JP 2018-172431 A & US 2018/0319752 A1 & EP 3020707 A1 & CA 2921200 A & AU 2014288115 A	1, 94, 97-101
Y	WO 2015/005468 A1 (NIPPON CHEMIPHAR CO., LTD.) 15 January 2015, claims 1-28, examples 1-85 & US 2016/0244434 A1 claims 1-28, examples 1-85 & EP 3020717 A1 & CA 2921203 A & AU 2014288116 A	1, 16, 54, 95- 101

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A61K31/551(2006.01)i, A61K31/498(2006.01)i, A61K31/517(2006.01)i, A61K31/5513(2006.01)i, A61K45/00(2006.01)i, A61P11/14(2006.01)i, A61P43/00(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A61K31/551, A61K31/498, A61K31/517, A61K31/5513, A61K45/00, A61P11/14, A61P43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2019年
日本国実用新案登録公報	1996-2019年
日本国登録実用新案公報	1994-2019年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), Cplus/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
Y	KAMEI, J. et al., Involvement of P2X receptor subtypes in ATP-induced enhancement of the cough reflex sensitivity, European Journal of Pharmacology, 2005, Vol.528, pp.158-161, Abstract	1-101
Y	WO 2010/093061 A1 (日本ケミファ株式会社) 2010.08.19, 請求項 1-14, 実施例 1-17 & US 2011/0319610 A1 Claims16-29, Examples1-17 & US 2013/0281441 A1 & EP 2397480 A1 & KR 10-2011-0120939 A	1-15, 17-29, 37-53, 55-56, 97-101

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

22.04.2019

国際調査報告の発送日

14.05.2019

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

鳥居 福代

電話番号 03-3581-1101 内線 3439

4U

3436

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
	& CN 102395577 A & CA 2789641 A	
Y	WO 2012/008478 A1 (日本ケミファ株式会社) 2012. 01. 19, 請求項 1-21, 実施例 1-20 & US 2013/0172550 A1 Claims23-45, Examples1-20 & EP 2597088 A1 & CA 2807354 A & CN 103080094 A & KR 10-2013-0041168 A	1, 30-32, 97-101
Y	WO 2012/014910 A1 (日本ケミファ株式会社) 2012. 02. 02, 請求項 1-18, 実施例 1-31 & US 2013/0178625 A1 Claims20-38, Examples1-31 & EP 2631229 A1 & CA 2809113 A & CN 103237794 A & KR 10-2013-0094309 A	1, 33-34, 97-101
Y	WO 2012/017876 A1 (日本ケミファ株式会社) 2012. 02. 09, 請求項 1-16, 実施例 1-9 & US 2013/0184459 A1 Claims18-34, Examples1-9 & EP 2617717 A1 & CA 2810150 A & CN 103201270 A & KR 10-2013-0094311 A	1, 35-36, 97-101
Y	WO 2013/105608 A1 (日本ケミファ株式会社) 2013. 07. 18, 請求項 1-41, 実施例 1-216 & US 2014/0357858 A1 Claims1-41, Examples1-216 & EP 2803662 A1 & AU 2013208536 A & CA 2861024 A & CN 104066724 A & KR 10-2014-0116926 A	1, 57-93, 97-101
Y	WO 2015/005467 A1 (日本ケミファ株式会社) 2015. 01. 15, 請求項 1-15, 実施例 1-27 & US 2017/0081294 A1 Claims1-15, Examples1-27 & JP 2018-172431 A & US 2018/0319752 A1 & EP 3020707 A1 & CA 2921200 A & AU 2014288115 A	1, 94, 97-101
Y	WO 2015/005468 A1 (日本ケミファ株式会社) 2015. 01. 15, 請求項 1-28, 実施例 1-85 & US 2016/0244434 A1 Claims1-28, Examples1-85 & EP 3020717 A1 & CA 2921203 A & AU 2014288116 A	1, 16, 54, 95-101