

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 27 年 8 月 6 日 (2015.8.6)

【公表番号】特表 2014-521748 (P2014-521748A)

【公表日】平成 26 年 8 月 28 日 (2014.8.28)

【年通号数】公開・登録公報 2014-046

【出願番号】特願 2014-526199 (P2014-526199)

【国際特許分類】

C 0 7 D 498/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 498/10 C S P S

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 6 月 18 日 (2015.6.18)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

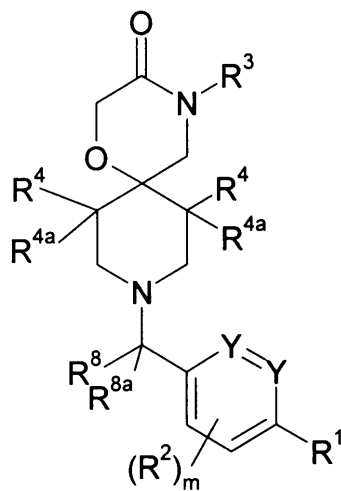
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



(I)

[式中、

R^1 は、フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフチル、9 もしくは 10 員環ヘテロシクリルであり、ここで、前記フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフチル、9 もしくは 10 員環ヘテロシクリルは、置換されていてよい C_1 C_6 アルキル；
 $-CF_3$ 、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_6 アルキル C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)(\text{フェニル})$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、 $-O(C_2$ C_4 アルキル) NR^5R^6 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ハロゲン、 C_1 C_4 アルコキシ、 C_3 C_7 シクロアルキル C_1 C_4 アルコキシ、ヒドロキシ C_1 C_4 アルキル -、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NR^7C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7C(=O)NR^5R^6$ 、 $-NR^7SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7SO_2NR^5R^6$ 、および R^9 からなる群から独立して選択される 1 から 3 つの置換基により置換されていてよく；

R^5 は、水素、 C_1 C_4 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C_1$ C_3 アルキル C_3 C_7 シクロアルキル、フェニル、および $-C_1$ C_3 アルキルフェニルからなる群から選択され；

R^6 は、水素、 C_1 C_4 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、または $-C_1$ C_3 アルキル C_3 C_7 シクロアルキルであり；

あるいは、 R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、酸素、窒素、または硫黄であるさらに 1 個のヘテロ原子を含有してよく、オキソまたは C_1 C_4 アルキルにより、独立して、1 または 2 回置換されていてよい、3 から 7 員環の飽和環を表し；

R^7 は、水素またはメチルであり；

R^9 は、酸素、窒素、および硫黄から選択される 1 から 4 個のヘテロ原子を含有し、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキル、 CF_3 、 C_1 C_4 アルコキシ、および $-NR^5R^6$ から選択される 1 または 2 つの置換基により置換されていてよい、5 または 6 員環のヘテロアリール環であり；

各 R^2 は、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、ヒドロキシル、および C_1 C_4 アルコキシからなる群から選択され；

R^3 は、 C_1 C_6 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、ヒドロキシ C_1 C_6 アルキル -、および C_4 C_6 ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、前記 C_1 C_6 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、ヒドロキシ C_1 C_6 アルキル -、および C_4 C_6 ヘテロシクロアルキルは、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、 $-CF_3$ 、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)(\text{フェニル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ヒドロキシ C_1 C_4 アルキル -、 C_1 C_4 アルコキシ、 C_3 C_7 シクロアルコキシ、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NHC(O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NHCONR^5R^6$ 、 $-NH SO_2C_1$ C_4 アルキル、および $-NH SO_2NR^5R^6$ からなる群から独立して選択される 1 から 4 つの置換基により置換されていてよく；

各 R^4 および R^{4a} は、水素、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、ヒドロキシル、または C_1 C_6 アルコキシから独立して選択され；

ここで、 R^8 および R^{8a} は、水素、重水素、シアノ、置換されていてよい C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキルヒドロキシ、 C_1 C_6 アルコキシ、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OH$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C$

C_1 C_4 アルキル SO_2 C_1 C_4 アルキル、 $-SO_2$ C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル SO_2 $NR^5 R^6$ 、 $-SO_2$ $NR^5 R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5 R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5 SO_2$ C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5 SO_2$ $NR^5 R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5 C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5 C(=O)NR^5 R^6$ 、 C_1 C_4 アルキル $(=O)NR^5 OR^6$ 、
 トリアゾリル、および R^9 から独立して選択され、ここで、いずれの C_1 C_4 アルキル
 および C_1 C_6 アルコキシ部分も、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキル、 $-CF_3$ 、 C_3
 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロ
 アルキル、 $-C(=O)$ フェニル、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OH$ 、 $C(=O)OH$
 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-CONR^5 R^6$ 、フェニル、 $-SO_2$ C_1 C_4
 C_4 アルキル、 $-SO_2$ $NR^5 R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、 C_1 C_4 アルコキ
 シ、 C_3 C_7 シクロアルコキシ、ヒドロキシ C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルコ
 キシ C_1 C_4 アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5 R^6$ 、 $R^5 R^6 NC_1$ C_4 アルキル
 、 $-NR^7 C(O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7 CONR^5 R^6$ 、 $-NR^7 SO_2$ C_1
 C_4 アルキル、 $-NR^7 SO_2$ $NR^5 R^6$ 、および R^9 の群から独立して選択される
 1 から 6 つの置換基で置換されていてよく、ここで、 R^8 が水素である場合、 R^{8a} は、
 水素または重水素ではなく、およびここで、 R^8 が重水素である場合、 R^{8a} は、水素ま
 たは重水素ではなく；

あるいは、 R^8 および R^{8a} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、酸素、窒
 素、および硫黄から選択される 1 もしくは 2 個のヘテロ原子を含有してよく、オキソ、 C_1
 C_4 アルキル、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキルヒドロキシ、 C_1 C_4 アルコキシ、
 もしくは $-NR^5 R^6$ により 1 から 3 回置換されていてよい、3 から 6 員環の飽和環を表
 し；

m は、0、1、2、または 3 であり；

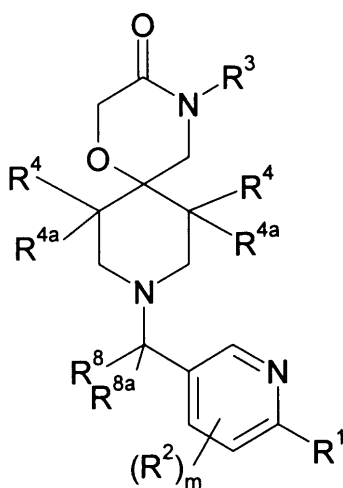
Y は、C または N である。]

による化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

式 (I) (A)：

【化 2】



(I) (A)

[式中、

R^1 は、フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフチル、9 もしくは 10 員環
 ヘテロシクリルであり、ここで、前記フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフ
 チル、9 もしくは 10 員環ヘテロシクリルは、置換されていてよい C_1 C_6 アルキル；
 $-CF_3$ 、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_6

アルキル C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)(\text{フェニル})$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、 $-O(C_2$ C_4 アルキル) NR^5R^6 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ハロゲン、 C_1 C_4 アルコキシ、ヒドロキシ C_1 C_4 アルキル -、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NR^7C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7C(=O)NR^5R^6$ 、 $-NR^7SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7SO_2NR^5R^6$ 、および R^9 からなる群から独立して選択される 1 から 3 つの置換基により置換されていてよく；

R^5 は、水素、 C_1 C_4 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C_1$ C_3 アルキル C_3 C_7 シクロアルキル、フェニル、および $-C_1$ C_3 アルキルフェニルからなる群から選択され；

R^6 は、水素、 C_1 C_4 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、または $-C_1$ C_3 アルキル C_3 C_7 シクロアルキルであり；

あるいは、 R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒にあって、酸素、窒素、または硫黄であるさらに 1 個のヘテロ原子を含有してよく、オキソまたは C_1 C_4 アルキルにより、独立して、1 または 2 回置換されていてよい、3 から 7 員環の飽和環を表し；

R^7 は、水素またはメチルであり；

R^9 は、酸素、窒素、および硫黄から選択される 1 から 4 個のヘテロ原子を含有し、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキル、 CF_3 、 C_1 C_4 アルコキシ、および $-NR^5R^6$ から選択される 1 または 2 つの置換基により置換されていてよい、5 または 6 員環のヘテロアリール環であり；

各 R^2 は、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、ヒドロキシル、および C_1 C_4 アルコキシからなる群から選択され；

R^3 は、 C_1 C_6 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、ヒドロキシ C_1 C_6 アルキル -、および C_4 C_6 ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、前記 C_1 C_6 アルキル、 C_3 C_7 シクロアルキル、ヒドロキシ C_1 C_6 アルキル -、および C_4 C_6 ヘテロシクロアルキルは、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、 $-CF_3$ 、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)(\text{フェニル})$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、 C_1 C_4 アルコキシ、 C_3 C_7 シクロアルコキシ、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NHC(O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NHCONR^5R^6$ 、 $-NH SO_2C_1$ C_4 アルキル、および $-NH SO_2NR^5R^6$ からなる群から独立して選択される 1 から 4 つの置換基により置換されていてよく；

各 R^4 および R^{4a} は、水素、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、ヒドロキシル、または C_1 C_6 アルコキシから独立して選択され；

ここで、 R^8 および R^{8a} は、水素、重水素、シアノ、置換されていてよい C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキルヒドロキシ、 C_1 C_6 アルコキシ、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OH$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル SO_2C_1 C_4 アルキル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $SO_2NR^5R^6$ 、 $-SO_2NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル NR^5R^6 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5SO_2NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5C(=O)NR^5R^6$ 、 C_1 C_4 アルキル $(=O)NR^5OR^6$ 、トリアゾリル、および R^9 から独立して選択され、ここで、いずれの C_1 C_4 アルキル および C_1 C_6 アルコキシ部分も、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキル、 $-CF_3$ 、 C_3

C₇シクロアルキル、-C(=O)C₁ C₄アルキル、-C(=O)C₃ C₇シクロアルキル、-C(=O)フェニル、-C₁ C₄アルキル(=O)OH、-C(=O)OC₁ C₄アルキル、-CONR⁵R⁶、フェニル、-SO₂C₁ C₄アルキル、-SO₂NR⁵R⁶、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、C₁ C₄アルコキシ、C₃ C₇シクロアルコキシ、ヒドロキシC₁ C₄アルキル-、C₁ C₄アルコキシC₁ C₄アルキル-、-OCF₃、-NR⁵R⁶、R⁵R⁶NC₁ C₄アルキル-、-NR⁷C(O)C₁ C₄アルキル、-NR⁷CONR⁵R⁶、-NR⁷SO₂C₁ C₄アルキル、-NR⁷SO₂NR⁵R⁶、トリアゾリル、およびR⁹の群から独立して選択される1から6つの置換基で置換されていてよく、ここで、R⁸が水素である場合、R^{8a}は、水素または重水素ではなく、およびここで、R⁸が重水素である場合、R^{8a}は、水素または重水素ではなく；

あるいは、R⁸およびR^{8a}は、それらが結合している炭素と一緒にあって、酸素、窒素、および硫黄から選択される1もしくは2個のヘテロ原子を含有してよく、オキソ、C₁ C₄アルキル、ハロゲン、C₁ C₄アルキルヒドロキシ、C₁ C₄アルコキシ、もしくは-NR⁵R⁶により1から3回置換されていてよい、3から6員環の飽和環を表し；

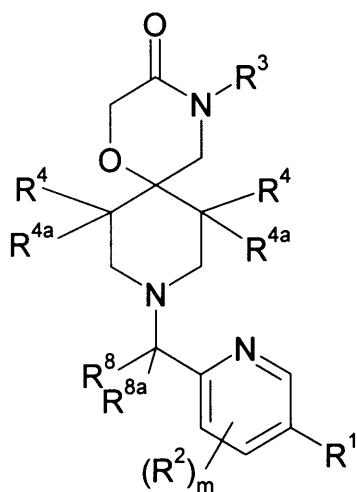
mは、0、1、2、または3である。]

による、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項3】

式(I)(B)：

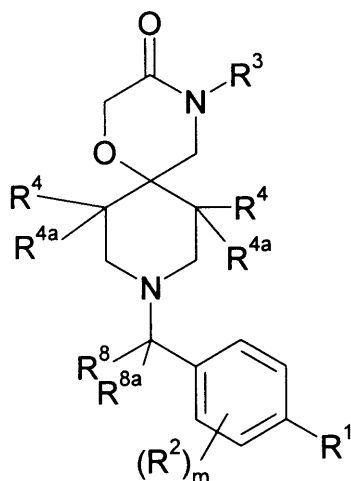
【化3】



(I)(B)

または、式(I)(C)：

【化 4】



(I) (C)

[式中、

R^1 は、フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフチル、9 もしくは 10 員環ヘテロシクリルであり、ここで、前記フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、ナフチル、9 もしくは 10 員環ヘテロシクリルは、置換されていてよい $C_1 - C_6$ アルキル；
 $-CF_3$ 、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $-C(=O)C_1 - C_4$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $-C(=O)C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $-C(=O)(\text{フェニル})$ 、 $-C(=O)OC_1 - C_4$ アルキル、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、 $-O(C_2 - C_4 \text{ アルキル})NR^5R^6$ 、フェニル、 $-SO_2C_1 - C_4$ アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ヒドロキシ $C_1 - C_4$ アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 R^5R^6N $C_1 - C_4$ アルキル -、 $-NR^7C(=O)C_1 - C_4$ アルキル、 $-NR^7C(=O)NR^5R^6$ 、 $-NR^7SO_2C_1 - C_4$ アルキル、 $-NR^7SO_2NR^5R^6$ 、および R^9 からなる群から独立して選択される 1 から 3 つの置換基により置換されていてよく；

R^5 は、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $-C_1 - C_3$ アルキル $C_3 - C_7$ シクロアルキル、フェニル、および $-C_1 - C_3$ アルキルフェニルからなる群から選択され；

R^6 は、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、または $-C_1 - C_3$ アルキル $C_3 - C_7$ シクロアルキルであり；

あるいは、 R^5 および R^6 は、それらが結合している窒素と一緒に、酸素、窒素、または硫黄であるさらに 1 個のヘテロ原子を含有してよく、オキソまたは $C_1 - C_4$ アルキルにより、独立して、1 または 2 回置換されていてよい、3 から 7 員環の飽和環を表し；

R^7 は、水素またはメチルであり；

R^9 は、酸素、窒素、および硫黄から選択される 1 から 4 個のヘテロ原子を含有し、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 CF_3 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、および $-NR^5R^6$ から選択される 1 または 2 つの置換基により置換されていてよい、5 または 6 員環のヘテロアリール環であり；

各 R^2 は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、ヒドロキシル、および $C_1 - C_4$ アルコキシからなる群から選択され；

R^3 は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、ヒドロキシ $C_1 - C_6$ アルキル -、および $C_4 - C_6$ ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、前記 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、ヒドロキシ $C_1 - C_6$ アルキル -、および $C_4 - C_6$ ヘテロシクロアルキルは、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CF_3$ 、 C

C_3 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)$ (フェニル)、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)NR^5R^6$ 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、 C_1 C_4 アルコキシ、 C_3 C_7 シクロアルコキシ、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NHC(O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NHCONR^5R^6$ 、 $-NH SO_2C_1$ C_4 アルキル、および $-NH SO_2NR^5R^6$ からなる群から独立して選択される 1 から 4 つの置換基により置換されていてよく；

各 R^4 および R^{4a} は、水素、ハロゲン、 C_1 C_6 アルキル、ヒドロキシル、または C_1 C_6 アルコキシから独立して選択され；

ここで、 R^8 および R^{8a} は、水素、重水素、シアノ、置換されていてよい C_1 C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキルヒドロキシ、 C_1 C_6 アルコキシ、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OH$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル SO_2C_1 C_4 アルキル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $SO_2NR^5R^6$ 、 $-SO_2NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル NR^5R^6 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5SO_2NR^5R^6$ 、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C_1$ C_4 アルキル $NR^5C(=O)NR^5R^6$ 、 C_1 C_4 アルキル $(=O)NR^5OR^6$ 、トリアゾリル、および R^9 から独立して選択され、ここで、いずれの C_1 C_4 アルキル および C_1 C_6 アルコキシ部分も、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキル、 $-CF_3$ 、 C_3 C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)C_1$ C_4 アルキル、 $-C(=O)C_3$ C_7 シクロアルキル、 $-C(=O)$ フェニル、 $-C_1$ C_4 アルキル $(=O)OH$ 、 $-C(=O)OC_1$ C_4 アルキル、 $-CONR^5R^6$ 、フェニル、 $-SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、 C_1 C_4 アルコキシ、 C_3 C_7 シクロアルコキシ、ヒドロキシ C_1 C_4 アルキル -、 C_1 C_4 アルコキシ C_1 C_4 アルキル -、 $-OCF_3$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $R^5R^6NC_1$ C_4 アルキル -、 $-NR^7C(O)C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7CONR^5R^6$ 、 $-NR^7SO_2C_1$ C_4 アルキル、 $-NR^7SO_2NR^5R^6$ 、トリアゾリル、および R^9 の群から独立して選択される 1 から 6 つの置換基で置換されていてよく、ここで、 R^8 が水素である場合、 R^{8a} は、水素または重水素ではなく、およびここで、 R^8 が重水素である場合、 R^{8a} は、水素または重水素ではなく；

あるいは、 R^8 および R^{8a} は、それらが結合している炭素と一緒にあって、酸素、窒素、および硫黄から選択される 1 もしくは 2 個のヘテロ原子を含有してよく、オキソ、 C_1 C_4 アルキル、ハロゲン、 C_1 C_4 アルキルヒドロキシ、 C_1 C_4 アルコキシ、もしくは $-NR^5R^6$ により 1 から 3 回置換されていてよい、3 から 6 員環の飽和環を表し；

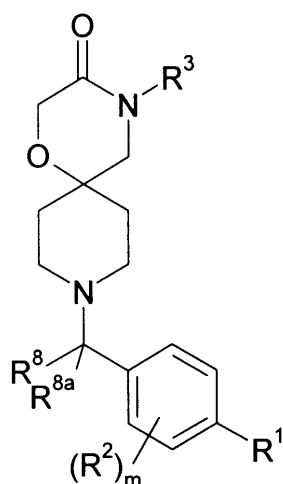
m は、0、1、2、または 3 である。]

による、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

式 (I) (D)：

【化 5】



(I) (D)

[式中、

R¹ は、フェニル、ナフチル、キノリル、イソキノリルであり、ここで、前記フェニル、ナフチル、キノリル、イソキノリルは：

置換されていてよい C₁ - C₆ アルキル； - CF₃、C₃ - C₇ シクロアルキル、 - シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ハロゲン、C₁ - C₄ アルコキシ、ヒドロキシ C₁ - C₄ アルキル - 、C₁ - C₄ アルコキシ C₁ - C₄ アルキル - 、および - OCF₃ から独立して選択される 1 から 3 つの置換基によって置換されていてよく；

各 R² は、ハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、ヒドロキシル、シアノ、および C₁ - C₄ アルコキシからなる群から選択され；

R³ は、C₁ - C₆ アルキルおよび C₃ - C₇ シクロアルキルからなる群から選択され、

ここで、R⁸ および R^{8a} は、水素、重水素、シアノ、C₁ - C₄ アルキル、- C₁ - C₄ アルキルヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、- C₁ - C₄ アルキル(=O)OH、- C₁ - C₄ アルキル(=O)OC₁ - C₄ アルキル、- C₁ - C₄ アルキル(=O)NR⁵R⁶、- C₁ - C₄ アルキルNR⁵R⁶、- C₁ - C₄ アルキルNR⁵C(=O)C₁ - C₄ アルキル、- C₁ - C₄ アルキルNR⁵C(=O)NR⁵R⁶、C₁ - C₄ アルキル(=O)NR⁵OR⁶、およびトリアゾリルから独立して選択され、ここで、R⁸ が水素である場合、R^{8a} は、水素または重水素ではなく、およびここで、R⁸ が重水素である場合、R^{8a} は、水素または重水素ではなく；

R⁵ は、水素および C₁ - C₄ アルキルからなる群から選択され；

R⁶ は、水素および C₁ - C₄ アルキルであり、

m は、0、1、2、または 3 である。]

による、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

R¹ が、フェニル、フラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ナフチル、ベンゾフラニル、イソベンゾフリル、2,3-ジヒドロベンゾフリル、1,3-ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾジオキシニル、ベンゾチエニル、インドリジニル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、イソインドリニル、1-H-インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ジヒドロベンズイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、ジヒドロベンゾキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ジ

ヒドロベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ピロロピリジニル、ピロロピリミジニル、イミダゾピリジニル、イミダゾピリミジニル、ピラゾロピリジニル、ピラゾロピリミジニル、ベンゾキサジアゾリル、ベンズチアジアゾリル、ベンゾトリアゾリル、トリアゾロピリジニル、プリニル、キノリニル、テトラヒドロキノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、1, 5 ナフチリジニル、1, 6 ナフチリジニル、1, 7 ナフチリジニル、1, 8 ナフチリジニルおよびプテリジニルから選択され、前記フェニル、フラニル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、トリアジニル、ナフチル、ベンゾフラニル、イソベンゾフリル、2, 3 ジヒドロベンゾフリル、1, 3 ベンゾジオキサソリル、ジヒドロベンゾジオキシニル、ベンゾチエニル、インドリジニル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、イソインドリニル、1 H インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ジヒドロベンズイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、ジヒドロベンゾキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ジヒドロベンゾイソチアゾリル、インダゾリル、ピロロピリジニル、ピロロピリミジニル、イミダゾピリジニル、イミダゾピリミジニル、ピラゾロピリジニル、ピラゾロピリミジニル、ベンゾキサジアゾリル、ベンズチアジアゾリル、ベンゾトリアゾリル、トリアゾロピリジニル、プリニル、キノリニル、テトラヒドロキノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、1, 5 ナフチリジニル、1, 6 ナフチリジニル、1, 7 ナフチリジニル、1, 8 ナフチリジニルおよびプテリジニルはすべて、置換されていてよい $C_1 - C_6$ アルキル； - CF_3 、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、- $C(=O)C_1 - C_4$ アルキル、- $C_1 - C_6$ アルキル $C_3 - C_7$ シクロアルキル、- $C(=O)C_3 - C_7$ シクロアルキル、- $C(=O)$ (フェニル)、- $C(=O)OC_1 - C_4$ アルキル、- $C(=O)OH$ 、- $C(=O)NR^5R^6$ 、- $O(C_1 - C_4$ アルキル) NR^5R^6 、フェニル、- $SO_2C_1 - C_4$ アルキル、- $SO_2NR^5R^6$ 、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル $C_1 - C_4$ アルコキシ、ヒドロキシ $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ $C_1 - C_4$ アルキル -、- OCF_3 、- NR^5R^6 、 $R^5R^6NC_1 - C_4$ アルキル -、- $NR^7C(=O)C_1 - C_4$ アルキル、- $NR^7C(=O)NR^5R^6$ 、- $NR^7SO_2C_1 - C_4$ アルキル、- $NR^7SO_2NR^5R^6$ 、および R^9 から独立して選択される 1 から 3 つの置換基により置換されていてよい、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

R^1 が、フェニルおよび置換されていてよいキノリニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

R^2 が、存在しないか、またはフルオロ、ヒドロキシル、メチル、もしくはメトキシである、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

R^3 が、エチル、イソプロピル、1 メチルシクロプロピル、1 ヒドロキシメチルシクロプロピル、およびシクロプロピルから選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

R^1 が、フェニル、インドリル、ベンゾフラニル、インダゾリル、ベンズイミダゾリニル、ナフタリル、キノリルの群より選択され、ここで、前記フェニル、インドリル、ベンゾフラニル、インダゾリル、ベンズイミダゾリニル、ナフタリル、キノリルは、 $C_1 - C_4$ 、メチルオキシ、シアノ、 NR^5R^6 、およびハロゲンから独立して選択される 1 から 3 つの置換基により置換されていてよく、

各 R^2 が、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、ヒドロキシル、および $C_1 - C_4$ アルコキシからなる群から選択され；

R³ が、C₁ C₆ アルキルおよびシクロプロピルからなる群から選択され；および、各 R⁴ および R^{4a} が、水素、オキソ、ハロゲン、または C₁ C₆ アルキルから独立して選択され；

各 R⁸ および R^{8a} が、水素、重水素、シアノ、置換されていてよい C₁ C₄ アルキル、-C₁ C₄ ヒドロキシ、C₁ C₆ アルコキシ、-C₁ C₄ (=O) OH、-C₁ C₄ (=O) OC₁ C₄、-C₁ C₄ (=O) NR⁵ R⁶、-C₁ C₄ NR⁵ R⁶、トリアゾリル、および R⁹ から独立して選択され、ここで、置換されていてよい C₁ C₄ アルキルおよび C₁ C₆ アルコキシ部分のいずれも、ハロゲン、C₁ C₄ アルキル、-CF₃、C₃ C₇ シクロアルキル、-C(=O) C₁ C₄ アルキル、-C(=O) C₃ C₇ シクロアルキル、-C(=O) フェニル、カルボキシル、-C(=O) OC₁ C₄ アルキル、-CONR⁵ R⁶、フェニル、5 もしくは 6 員環ヘテロアリール、-SO₂ C₁ C₄ アルキル、-SO₂ NR⁵ R⁶、シアノ、オキソ、ヒドロキシル、C₁ C₄ アルコキシ、C₃ C₇ シクロアルコキシ、ヒドロキシ C₁ C₄ アルキル、-C₁ C₄ アルコキシ C₁ C₄ アルキル、-OCF₃、-NR⁵ R⁶、R⁵ R⁶ NC₁ C₄ アルキル、-NHC(O) C₁ C₄ アルキル、-NR⁶ CONR⁵ R⁶、-NR⁶ SO₂ C₁ C₄ アルキル、-NR⁶ SO₂ NR⁵ R⁶、および R⁹ の群から独立して選択される 1 から 4 つの置換基により置換されていてよく、ここで、1 つの R⁸ が水素または重水素である場合、他方の R⁸ は、水素または重水素ではなく；

m が、0、1、2、または 3 であり；

Y が、C または N である；

請求項 1 に記載の化合物、または薬学的に許容可能な塩、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) 酢酸；

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド；

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) N, N ジメチル 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド；

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) N メチル 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド；

メチル 3 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 3 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) プロパノエート；

3 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 3 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) プロパン酸；

(-) 3 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 3 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) プロパナミド；

(+) 3 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 3 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) プロパナミド；

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 2 [2 フルオロ 4 (7 キノリニル) フェニル] アセトアミド；

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5.5] ウンデカン 9 イル) 2 [2 フルオロ 4 (7 キノリニル) フェニル]

ル] アセトアミド ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メチルキノリン
7 イル) フェニル) アセトアミド ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メチルキノリン
7 イル) フェニル) アセトアミド ;

4 シクロプロピル 9 (1 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) エチル)
1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン ;

4 シクロプロピル 9 (1 (3 フルオロ 4 ' メトキシ [1 , 1 ' ビフ
ェニル] 4 イル) エチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカ
ン 3 オン ;

(+) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル
) フェニル) エチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3
オン ;

(-) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル
) フェニル) エチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3
オン ;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセトニトリ
ル ;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル
) 酢酸 ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセ
トアミド ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (4 (キノリン 7 イル) フェニル) アセ
トアミド ;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル
) アセトアミド ;

4 シクロプロピル 9 (2 ヒドロキシ 1 (4 (キノリン 7 イル) フェ
ニル) エチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン ;

メチル 3 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 3 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)
フェニル) プロパノエート ;

4 シクロプロピル 9 (2 オキソ 1 (4 (キノリン 7 イル) フェニル
) プロピル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン ;

(+) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル
) フェニル) 2 ヒドロキシエチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5]
ウンデカン 3 オン ;

(-) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル
) フェニル) 2 ヒドロキシエチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5]
ウンデカン 3 オン ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)
フェニル) N メチルアセトアミド ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ

[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) N メチルアセトアミド;

(+) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) 2 (4 (1 (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) アセトアミド;

(-) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) 2 (4 (1 (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) アセトアミド;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 メチルキノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 メチルキノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (3 フルオロ 4 ' メトキシ [1 , 1 ' ビフェニル] 4 イル) アセトアミド;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 ヒドロキシキノリン 7 イル) フェニル) アセトアミド;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (3 , 4 ' ジフルオロ [1 , 1 ' ビフェニル] 4 イル) アセトアミド;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) N ヒドロキシアセトアミド;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) N ヒドロキシアセトアミド;

(+) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 , 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) 2 ヒドロキシエチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン;

(-) 4 シクロプロピル 9 (1 (2 , 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) 2 ヒドロキシエチル) 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 5 イル) フェニル) アセトアミド;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 5 イル) フェニル) アセトアミド;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) N , N ジメチルアセトアミド;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル) N , N ジメチルアセトアミド;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 メチルキノリン 5 イル) フェニル) アセトアミド;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 メチルキノリン
5 イル) フェニル) アセトアミド ;

(+) メチル 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジア
ザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシ
キノリン 7 イル) フェニル) アセテート ;

(-) メチル 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジア
ザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシ
キノリン 7 イル) フェニル) アセテート ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 ヒドロキシキノリ
ン 7 イル) フェニル) アセトアミド ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (2 ヒドロキシキノリ
ン 7 イル) フェニル) アセトアミド ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)
フェニル) N メトキシアセトアミド ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)
フェニル) N メトキシアセトアミド ;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 フルオロキノリン 7 イ
ル) フェニル) アセトアミド ;

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 フルオロキノリン 7 イ
ル) フェニル) アセトアミド ;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 メトキシキノリン 7 イ
ル) フェニル) アセトアミド ;

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 メトキシキノリン 7 イ
ル) フェニル) アセトアミド ;

2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 , 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル) フ
ェニル) アセトアミド ;

エチル 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル
) アセテート ;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル
) アセトアミド ;

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ [5 . 5
] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル) フェニル
) アセトアミド ;

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 フルオロキノリン
7 イル) フェニル) アセトアミド ;

(-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4 , 9 ジアザスピロ
[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 フルオロキノリン

7 イル)フェニル)アセトアミド;
 2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4
 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウンデカン
 9 イル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2
 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウ
 ンデカン 9 イル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2
 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウ
 ンデカン 9 イル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 (3 クロロキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2
 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウ
 ンデカン 9 イル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 (3 クロロキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2
 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウ
 ンデカン 9 イル)アセトアミド;
 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]
]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 フルオロキノリン 7 イ
 ル)フェニル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 フルオロキノリン
 7 イル)フェニル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 フルオロキノリン
 7 イル)フェニル)アセトアミド;
 2 (2, 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) 2 (4 エチ
 ル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウンデカン 9 イル)
 アセトアミド;
 (+) 2 (2, 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) 2 (4
 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウンデカン 9
 イル)アセトアミド;
 (-) 2 (2, 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) 2 (4
 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ[5.5]ウンデカン 9
 イル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2, 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7
 イル)フェニル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2, 6 ジフルオロ 4 (キノリン 7
 イル)フェニル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシキノリン
 7 イル)フェニル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシキノリン
 7 イル)フェニル)アセトアミド;
 (+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ
 [5.5]ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 メトキシキノリン
 7 イル)フェニル)アセトアミド;
 (-) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ

[5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (8 メトキシキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

4 シクロプロピル 9 ((2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) (4 H 1, 2, 4 トリアゾール 3 イル)メチル) 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン;

(+) 4 シクロプロピル 9 ((2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) (4 H 1, 2, 4 トリアゾール 3 イル)メチル) 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン;

(-) 4 シクロプロピル 9 ((2 フルオロ 4 (キノリン 7 イル)フェニル) (4 H 1, 2, 4 トリアゾール 3 イル)メチル) 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 3 オン;

2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル)アセトアミド;

(+) 2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル)アセトアミド;

(-) 2 (4 (3 シアノキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル)アセトアミド;

2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メチルキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メチルキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メチルキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

(+) 2 (4 (3 クロロキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル)アセトアミド;

(-) 2 (4 (3 クロロキノリン 7 イル) 2 フルオロフェニル) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル)アセトアミド;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 フルオロキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 フルオロキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド;

(+) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド; および、

(-) 2 (4 エチル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ [5 . 5] ウンデカン 9 イル) 2 (2 フルオロ 4 (3 メトキシキノリン 7 イル)フェニル)アセトアミド、

から選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 11】

(+) 2 (4 シクロプロピル 3 オキソ 1 オキサ 4, 9 ジアザスピロ

[5 . 5] ウンデカ 9 イル) 2 [2 フルオロ 4 (7 キノリニル) フェニル] アセトアミドである、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 2】

前記化合物が、1つのエナンチオマーの他方に対するエナンチオマー過剰を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

前記化合物が、エナンチオマー的に純粋な R 異性体である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 4】

前記化合物が、エナンチオマー的に純粋な S 異性体である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能なキャリアを含んでなる、医薬組成物。

【請求項 1 6】

それを必要とするヒトにおいて癌を処置するための、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、医薬組成物であって、前記癌が、胃癌、脳癌（神経膠腫）、神経膠芽腫、白血病、パナヤン ゾナナ症候群、コーデン病、レーミット デュクロ病、乳癌、炎症性乳癌、ウィルムス腫瘍、ユーイング肉腫、横紋筋肉腫、上衣腫、髄芽腫、結腸癌、頭頸部癌、腎臓癌、肺癌、肝臓癌、黒色腫、腎癌、卵巣癌、膵臓癌、前立腺癌、肉腫、骨肉腫、膀胱癌、胃癌、ならびに骨および甲状腺の巨細胞腫からなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項 1 7】

それを必要とする哺乳類において癌を処置するための、

- a) 請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩；および、
- b) 少なくとも 1 つの抗新生物剤、

を含んでなる、医薬組成物であって、前記癌が、胃癌、脳癌（神経膠腫）、神経膠芽腫、白血病、パナヤン ゾナナ症候群、コーデン病、レーミット デュクロ病、乳癌、炎症性乳癌、ウィルムス腫瘍、ユーイング肉腫、横紋筋肉腫、上衣腫、髄芽腫、結腸癌、頭頸部癌、腎臓癌、肺癌、肝臓癌、黒色腫、腎癌、卵巣癌、膵臓癌、前立腺癌、肉腫、骨肉腫、膀胱癌、胃癌、ならびに骨および甲状腺の巨細胞腫からなる群から選択される、医薬組成物。