

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年5月8日(2008.5.8)

【公表番号】特表2008-500337(P2008-500337A)

【公表日】平成20年1月10日(2008.1.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-001

【出願番号】特願2007-514981(P2007-514981)

【国際特許分類】

C 07 C 237/42 (2006.01)  
C 07 C 231/02 (2006.01)  
C 07 C 237/44 (2006.01)  
C 07 D 207/09 (2006.01)  
C 07 D 295/12 (2006.01)  
C 07 D 295/22 (2006.01)  
C 07 D 295/18 (2006.01)  
C 07 D 211/26 (2006.01)  
C 07 D 309/04 (2006.01)  
C 07 D 211/42 (2006.01)  
C 07 D 211/22 (2006.01)  
C 07 D 317/28 (2006.01)  
C 07 D 207/12 (2006.01)  
C 07 D 207/08 (2006.01)  
C 07 D 309/14 (2006.01)  
C 07 D 401/04 (2006.01)  
C 07 D 215/48 (2006.01)  
C 07 D 241/44 (2006.01)  
C 07 D 241/24 (2006.01)  
C 07 D 237/24 (2006.01)  
C 07 D 213/81 (2006.01)  
C 07 D 213/82 (2006.01)  
C 07 D 321/10 (2006.01)  
C 07 D 307/79 (2006.01)  
C 07 D 217/26 (2006.01)  
C 07 D 215/50 (2006.01)  
C 07 D 237/28 (2006.01)  
C 07 D 317/46 (2006.01)  
C 07 D 319/08 (2006.01)  
C 07 D 319/12 (2006.01)  
C 07 D 265/30 (2006.01)  
C 07 D 453/02 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 1/00 (2006.01)  
A 61 P 25/22 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 25/16 (2006.01)  
A 61 P 25/14 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/196	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
A 6 1 K	31/4465	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/351	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/498	(2006.01)
A 6 1 K	31/4965	(2006.01)
A 6 1 K	31/50	(2006.01)
A 6 1 K	31/4409	(2006.01)
A 6 1 K	31/455	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
A 6 1 K	31/502	(2006.01)
A 6 1 K	31/4402	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C	237/42	C S P
C 0 7 C	231/02	
C 0 7 C	237/44	
C 0 7 D	207/09	
C 0 7 D	295/12	Z
C 0 7 D	295/22	Z
C 0 7 D	295/18	A
C 0 7 D	211/26	
C 0 7 D	295/12	A
C 0 7 D	309/04	
C 0 7 D	211/42	
C 0 7 D	211/22	
C 0 7 D	295/18	Z
C 0 7 D	317/28	
C 0 7 D	207/12	
C 0 7 D	207/08	
C 0 7 D	309/14	
C 0 7 D	401/04	
C 0 7 D	215/48	
C 0 7 D	241/44	
C 0 7 D	241/24	
C 0 7 D	237/24	
C 0 7 D	213/81	
C 0 7 D	213/82	
C 0 7 D	321/10	
C 0 7 D	307/79	

C 0 7 D 217/26  
C 0 7 D 215/50  
C 0 7 D 237/28  
C 0 7 D 317/46  
C 0 7 D 319/08  
C 0 7 D 319/12  
C 0 7 D 265/30  
C 0 7 D 453/02  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 1/00  
A 6 1 P 25/22  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 K 31/40  
A 6 1 K 31/5375  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/196  
A 6 1 K 31/495  
A 6 1 K 31/4465  
A 6 1 K 31/445  
A 6 1 K 31/351  
A 6 1 K 31/55  
A 6 1 K 31/357  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 K 31/4545  
A 6 1 K 31/47  
A 6 1 K 31/498  
A 6 1 K 31/4965  
A 6 1 K 31/50  
A 6 1 K 31/4409  
A 6 1 K 31/455  
A 6 1 K 31/343  
A 6 1 K 31/472  
A 6 1 K 31/502  
A 6 1 K 31/4402  
A 6 1 K 31/439  
A 6 1 P 25/00

**【手続補正書】**

【提出日】平成20年3月19日(2008.3.19)

**【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

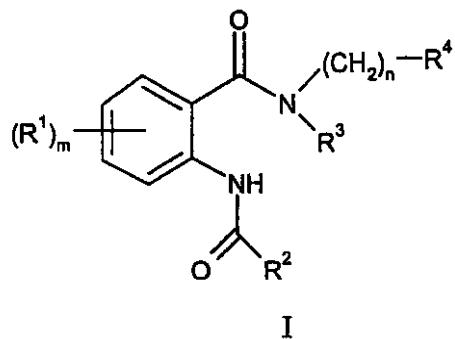
【補正方法】変更

**【補正の内容】**

【特許請求の範囲】

**【請求項1】**

式 I  
【化 1】



の化合物、その医薬上許容しうる塩、ジアステレオマー、エナンチオマー、またはそれらの混合物。

式中、

$m$  は 0、1 および 2 から選択され；

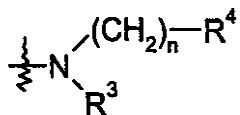
$n$  は 0、1、2、3、4 および 5 から選択され；

$R^1$  はハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ、アセチルアミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルケニル、およびハロゲン化 $C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され；

$R^2$  は  $C_{6-10}$ アリールおよび  $C_{2-10}$ ヘテロシクリルから選択され；ここで  $R^2$  の定義に用いられる上記  $C_{6-10}$ アリールおよび  $C_{2-10}$ ヘテロシクリルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-6}$ アルキル-アミノ、アミノ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ ヘテロアリール、ヘテロアリール- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、および  $C_{6-10}$ アリール- $C_{1-6}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換され；そして

$R^3$  は水素および  $C_{1-6}$ アルキルから選択され； $R^4$  は  $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{4-7}$ シクロアルケニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリル-アミノ、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリルオキシ-アミノおよび  $C_{2-6}$ ヘテロシクリルから選択され；ここで  $R^4$  の定義に用いられる上記  $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{4-7}$ シクロアルケニル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリル-アミノ、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリルオキシ-アミノおよび  $C_{2-6}$ ヘテロシクリルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-6}$ アルキル-アミノ、アミノ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ ヘテロアリール、ヘテロアリール- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、および  $C_{6-10}$ アリール- $C_{1-6}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換されるか；または

【化 2】



は  $C_{2-10}$ ヘテロシクリルであり、これはハロゲン、ハロゲン置換 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-6}$ アルキル-ア

ミノ、アミノ -  $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ ヘテロアリール、ヘテロアリール -  $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、および $C_{6-10}$ アリール -  $C_{1-6}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換される。

【請求項 2】

$m$ が 0、1 および 2 から選択され；

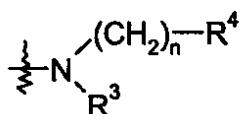
$n$ が 0、1、2、3 および 4 から選択され；

$R^1$ がハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、アセチルアミノ、ヒドロキシリ、 $C_{1-3}$ アルコキシ、 $C_{1-3}$ アルキル、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルコキシ、およびハロゲン化 $C_{1-3}$ アルキルから独立して選択され；

$R^2$ が $C_{6-10}$ アリールおよび $C_{2-10}$ ヘテロシクリルから選択され、ここで $R^2$ の定義に用いられる上記 $C_{6-10}$ アリールおよび $C_{2-10}$ ヘテロシクリルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルキル、ニトロ、 $C_{1-3}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-3}$ アルコキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{2-5}$ ヘテロシクリル -  $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-3}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-3}$ アルキル - アミノ、およびアミノ -  $C_{1-3}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換され；そして

$R^3$ が水素および $C_{1-6}$ アルキルから選択され； $R^4$ が $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリル - アミノ、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリルオキシ - アミノ、および $C_{2-6}$ ヘテロシクリルから選択され；ここで $R^4$ の定義に用いられる上記 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリル - アミノ、 $C_{2-6}$ ヘテロシクリルオキシ - アミノ、および $C_{2-6}$ ヘテロシクリルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルキル、ニトロ、 $C_{1-3}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-3}$ アルコキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-3}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-3}$ アルキル - アミノ、およびアミノ -  $C_{1-3}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換されるか；または

【化 3】



はアゼパニル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリル、イミダゾリジニル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イソオキサゾリジニル、トリアゾリル、モルホリニル、ペリジニル、チオモルホリニル、ピリダジニル、ペラジニル、トリアジニルまたは 1,4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ [ 4.5 ] デカン - 8 - イルから選択され；ここで上記アゼパニル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリル、イミダゾリジニル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イソオキサゾリジニル、トリアゾリル、モルホリニル、ペリジニル、チオモルホリニル、ピラジニル、トリアジニルおよび 1,4 - ジオキサ - 8 - アザスピロ [ 4.5 ] デカン - 8 - イルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルキル、ニトロ、 $C_{1-3}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-3}$ アルコキシ -  $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-3}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-3}$ アルキル - アミノ、およびアミノ -  $C_{1-3}$ アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換される。

請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

$m$ が 0 および 1 から選択され；

$n$ が 0、1、2、3 および 4 から選択され；

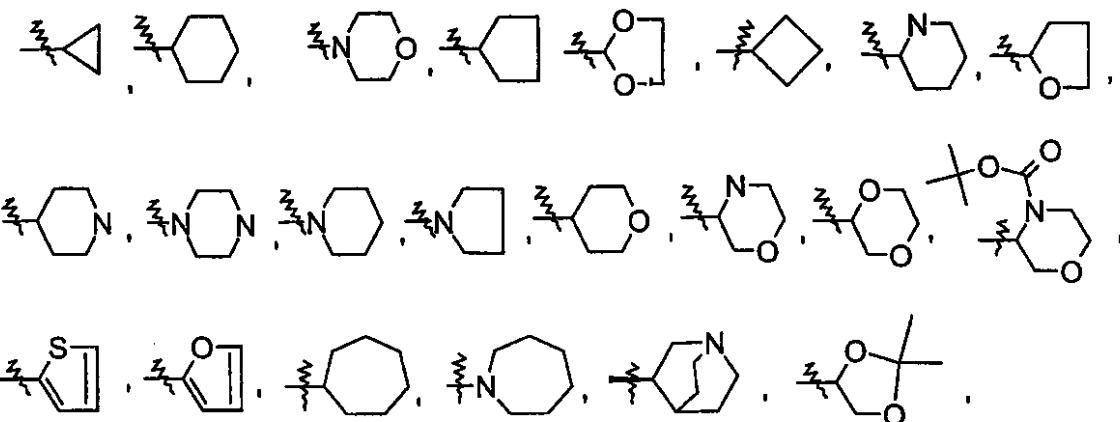
$R^1$ がハロゲン、アミノ、ニトロ、アセチルアミノ、ヒドロキシリ、 $C_{1-3}$ アルコキシ、 $C_{1-3}$ アルキル、ハロゲン化 $C_{1-3}$ アルコキシ、およびハロゲン化 $C_{1-3}$ アルキルから独立して選択され；

$R^2$  がフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、チエニル、フリル、ピロリル、イミダゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、1,2,3-トリアゾリル、テトラゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-トリアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、および1,3,4-オキサジアゾリル、インドリル、インドリニル、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、1,4-ベンゾジオキサン二基、クマリン、ジヒドロクマリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,2-ベンゾイソオキサゾリル、1,3-ベンゾジオキソリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、3,4-ジヒドロ-2H-1,5-ベンゾジオキセピニル、4H-1,3-ベンゾジオキシニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、チオキサンチニル、カルバゾリル、カルボリニル、アクリジニル、ピロリジジニル、およびキノリジジニルから選択され、これらはハロゲン、ヒドロキシ、メチル、メトキシ、アミノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、1H-1,2,3-トリアゾリルメチルおよび1H-ピラゾリルメチルから選択される1またはそれ以上の基により場合により置換され；

$R^3$  が水素およびC<sub>1-6</sub>アルキルから選択され；そして

$R^4$  が

【化4】

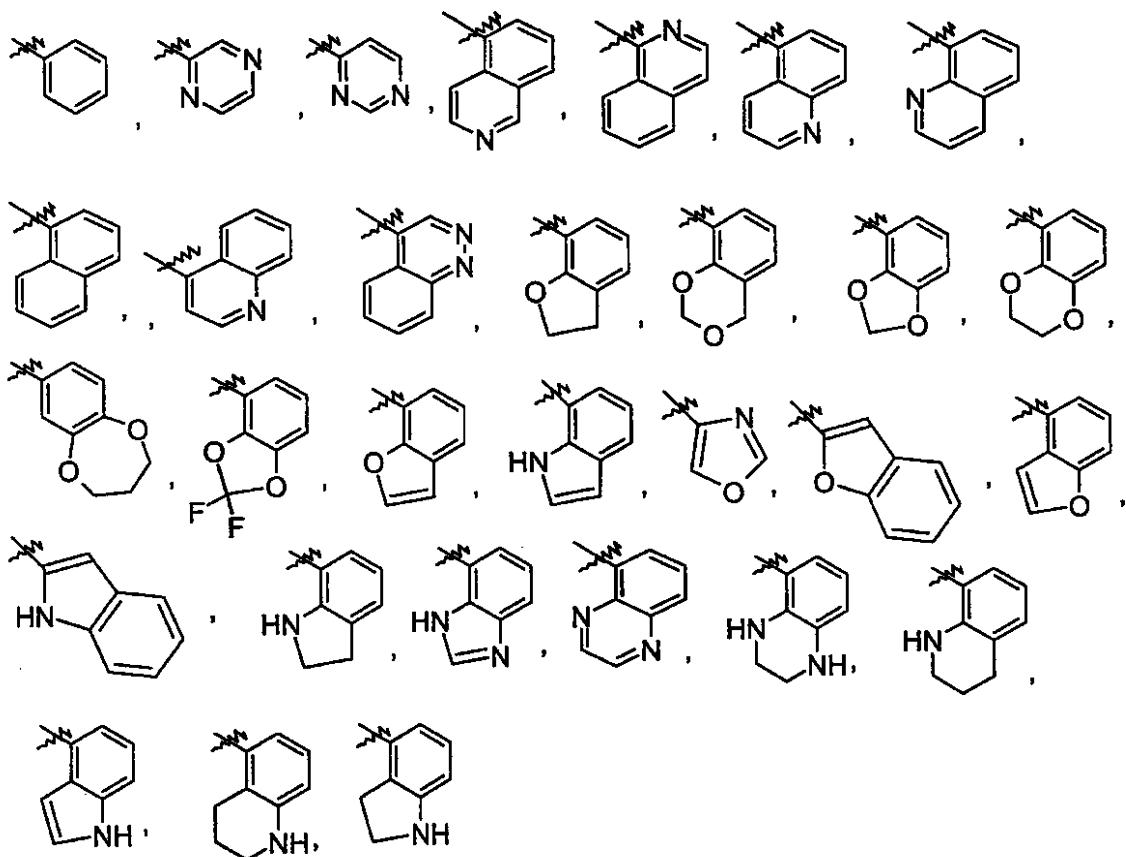


ピロリジン-1-アミノ、ピペリジン-1-アミノ、O-シクロヘキシルヒドロキシアミノ、O-シクロペンチルヒドロキシアミノ、O-シクロブチルヒドロキシアミノ、O-シクロプロピルヒドロキシアミノ、およびC<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、これらはハロゲン、アミノ、アミノメチル、2-アミノエチル、ヒドロキシ、ヒドロキシルメチル、メチルおよびエチルから選択される1またはそれ以上の基により場合により置換される、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

$R^2$  が

## 【化5】



から選択され、

これらはハロゲン、メチル、メトキシ、ヒドロキシル、メトキシメチル、1H-1,2,3-トリアゾリルメチルおよび1H-1,2-ジアゾリルメチルから選択される1またはそれ以上の基で場合により置換される、

請求項3記載の化合物。

## 【請求項5】

mが1であり；

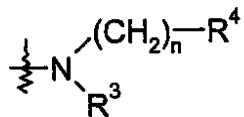
nが0、1、2、および3から選択され；

R<sup>1</sup>がハロゲン、アミノ、ニトロ、アセチルアミノ、ヒドロキシル、C<sub>1-3</sub>アルコキシ、C<sub>1-3</sub>アルキル、ハロゲン化C<sub>1-3</sub>アルコキシ、およびハロゲン化C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択され；

R<sup>2</sup>がフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、チエニル、フリル、ピロリル、イミダゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、1,2,3-トリアゾリル、テトラゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-トリアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、および1,3,4-オキサジアゾリル、インドリル、インドリニル、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、1,4-ベンゾジオキサン二ル、クマリン、ジヒドロクマリニル、2,3-ジヒドロベンゾフラニル、1,2-ベンゾイソオキサゾリル、1,3-ベンゾジオキソリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、3,4-ジヒドロ-2H-1,5-ベンゾジオキセビニル、4H-1,3-ベンゾジオキシニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、チオキサンチニル、カルバゾリル、カルボリニル、アクリジニル、ピロリジジニル、およびキノリジジニルから選択され、これらはハロゲン、ヒドロキシ、メチル、アミノ、トリフルオ

ロメチル、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、1H-1,2,3-トリアゾリルメチル、1H-ピラゾリルメチルから選択される1またはそれ以上の基により場合により置換され；そして

【化6】

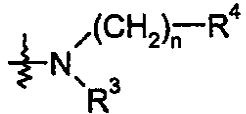


はアゼチジニル、アゼパニル、イソオキサゾリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピロリジニル、および1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン-8-イルから選択され、これらはハロゲン、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ヒドロキシ、ヒドロキシ-メチル、ヒドロキシ-エチル、アミノ-メチル、アミノ-エチル、メトキシ-メチル、メトキシ-フェニル、エトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ジフェニル-メチル、モルホリニル-エタ-2-イル、ピペリジニル-メチルおよびピリジニルから選択される1またはそれ以上の基で場合により置換される、

請求項1記載の化合物。

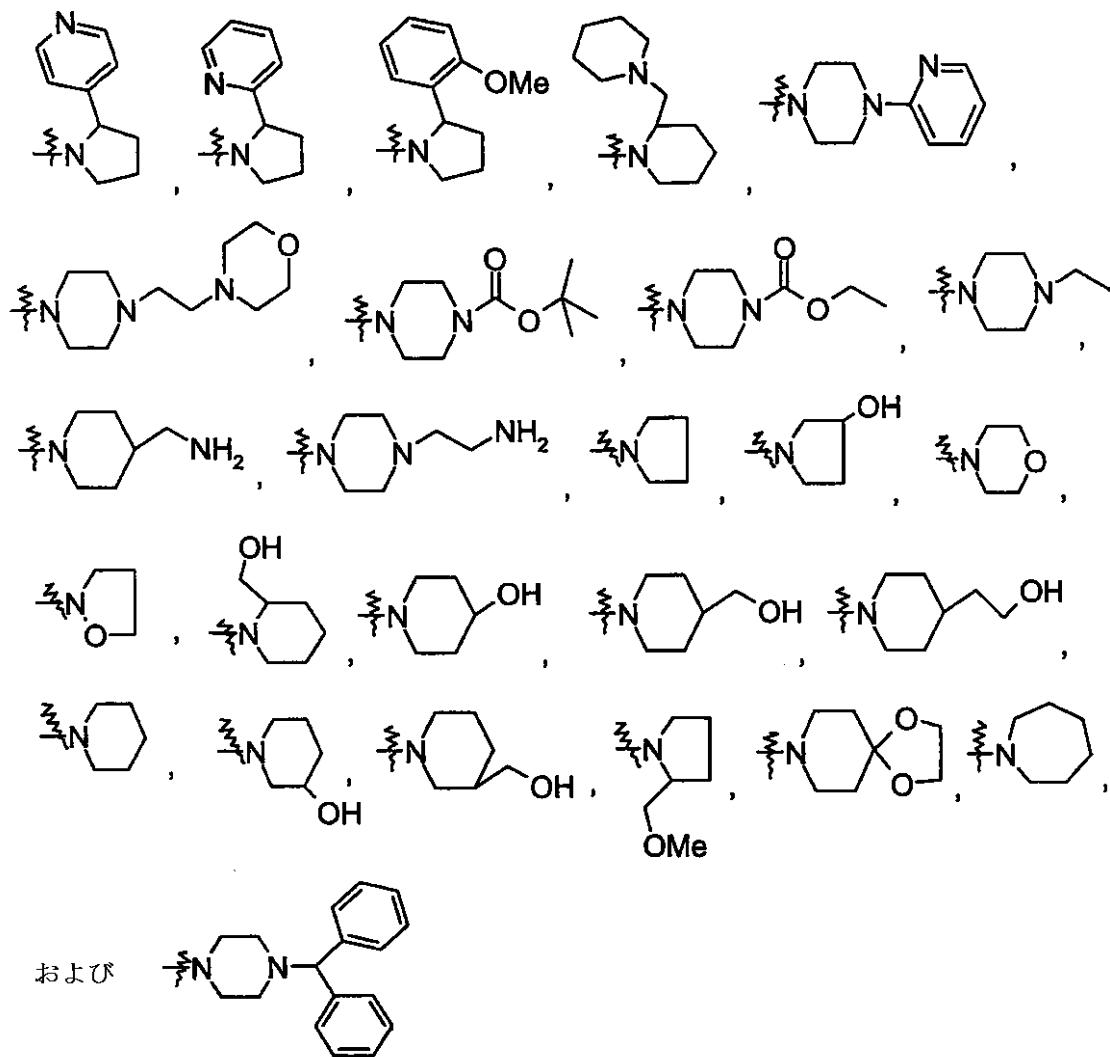
【請求項6】

【化7】



が

【化 8】

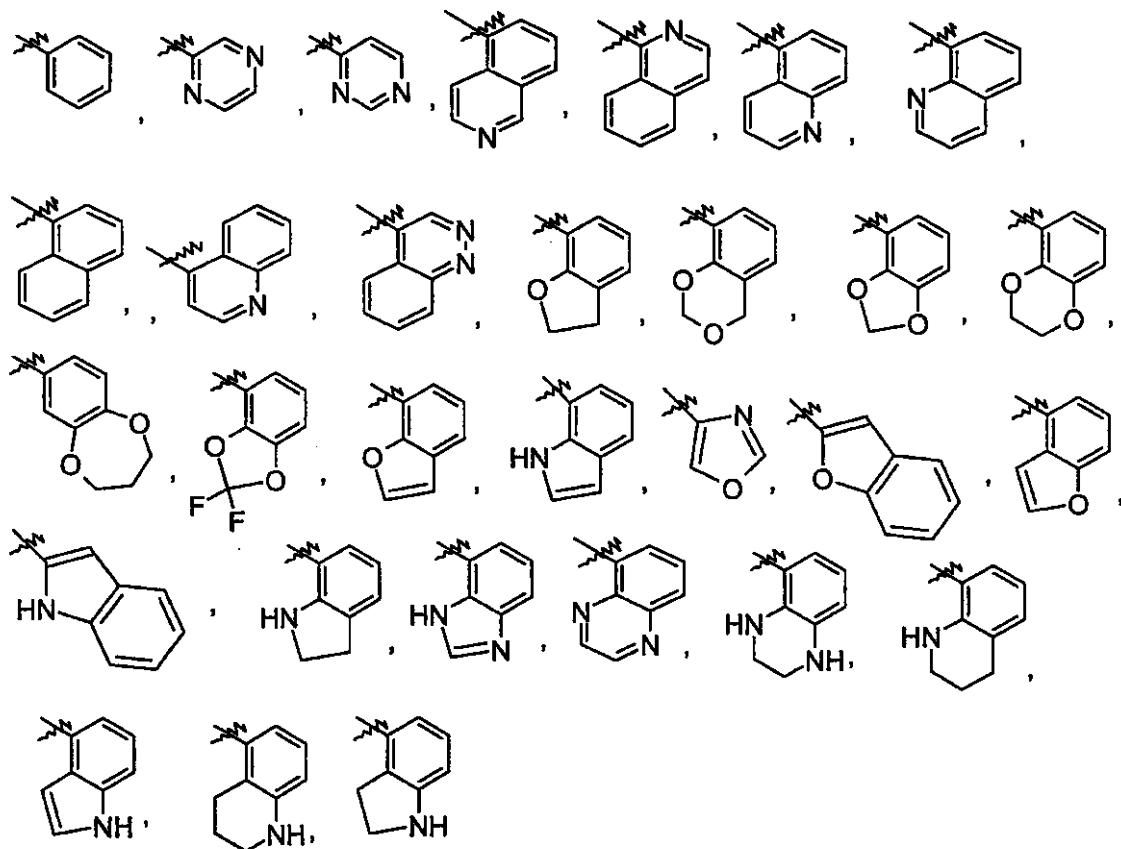


から選択される、  
請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R<sup>2</sup> が

【化 9】



から選択され、

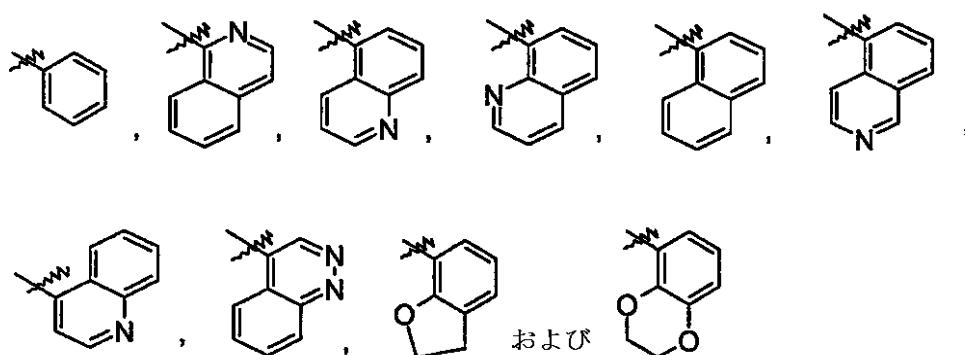
これらはハロゲン、メチル、メトキシ、ヒドロキシル、メトキシメチル、1H-1,2,3-トリアゾリルメチルおよび1H-ピラゾリルメチルから選択される1またはそれ以上の基で場合により置換される、

請求項 5 または 6 記載の化合物。

### 【請求項 8】

R<sup>2</sup> が

【化 1 0 】



から選択され、これらはハロゲン、メチル、メトキシ、ヒドロキシル、メトキシメチル、  
1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾリルメチルおよび 1 H - ピラゾリルメチルから選択される 1 ま  
たはそれ以上の基で場合により置換される、

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物。

### 【請求項 9】

以下：

N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ ( 1 - エチル - 2 - ピロリジニル ) メチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド :

N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 2 - ( 4 - モルホリニル ) エチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ 4 - [ 2 - ( 4 - モルホリニル ) エチル ] - 1 - ピペラジニル ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( 4 - モルホリニルアミノ ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( 4 - エチル - 1 - ピペラジニル ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 3 - ( 4 - モルホリニル ) プロピル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( 4 - ピペリジニルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ 4 - ( アミノメチル ) - 1 - ピペリジニル ] カルボニル ] - 4 - クロロフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ 4 - ( 2 - アミノエチル ) - 1 - ピペラジニル ] カルボニル ] - 4 - クロロフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 2 - ( 1 - ピペラジニル ) エチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - ( アセチルアミノ ) - 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - アミノ - 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ ( テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル ) メチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロプロピルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( シクロヘキシルアミノ ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロブチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロヘプチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ ( 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) メチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 1 - ピペリジニル ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ 3 - ( ヒドロキシメチル ) - 1 - ピペリジニル ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( ヘキサヒドロ - 1H - アゼピン - 1 - イル ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - ( 1 - ピロリジニルカルボニル ) フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 2 - ( 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル ) エチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 1 - ( ヒドロキシメチル ) シクロペンチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;

N - [ 4 - クロロ - 2 - [ ( 3 - ヒドロキシ - 1 - ピロリジニル ) カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ 2 - ( 2 - メトキシフェニル ) - 1 - ピロリジニル ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ [ 2 - ( テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル ) エチル ] アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イルメチル ) メチルアミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ 2 - ( 2 - ピリジニル ) - 1 - ピロリジニル ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ 2 - ( 1 - ピペリジニルメチル ) - 1 - ピペリジニル ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 4 - メチルフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロブチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 4 - メチルフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 4 - フルオロフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 4 - フルオロフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 6 - メトキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - クロロ - 6 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 6 - メチルフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 5 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 3 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 3 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロブチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 3 - メチルフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 4 , 5 - ジメトキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 3 - メトキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロブチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 3 - メトキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 3 - ヒドロキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 2 - [ [ ( シクロブチルメチル ) アミノ ] カルボニル ] - 3 - ヒドロキシフェニル ] - 1 - ナフタレンカルボキサミド ;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 8 - キノリンカルボキサミド ;

N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - キノリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - キノキサリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 1 - ナフタレンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 3 - キノリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - ピラジンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 3 - ピリダジンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - ナフタレンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 4 - ピリジンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 3 - ピリジンカルボキサミド;  
2 - (ベンゾイルアミノ) - 5 - クロロ - N - (シクロヘキシルメチル) - ベンズアミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1, 5 - ベンゾジオキセピン - 7 - カルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2, 3 - ジヒドロ - 7 - ベンゾフランカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 1 - イソキノリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 4 - キノリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 4 - シンノリンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - メトキシ - 1 - ナフタレンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - ピリジンカルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンズアミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2, 3 - ジフルオロ - ベンズアミド;  
3 - クロロ - N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - フルオロ - ベンズアミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2, 3 - ジメチル - ベンズアミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 3 - フルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) - ベンズアミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2, 2 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 4 - カルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 6 - フルオロ - 4H - 1, 3 - ベンゾジオキシン - 8 - カルボキサミド;  
N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル  
] - 2 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンズアミド;

3 - クロロ - N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 2 - メチル - ベンズアミド；  
 N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 2,3 - ジメトキシ - ベンズアミド；  
 N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 3 - メトキシ - 2 - メチル - ベンズアミド；  
 N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 5 - イソキノリンカルボキサミド；  
 6 - クロロ - N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 2 - フルオロ - 3 - メチル - ベンズアミド；  
 2 - クロロ - N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンズアミド；  
 N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] フェニル] - 5 - キノリンカルボキサミド；  
 N - [ 2 - [ [ (シクロヘキシルメチル) アミノ] カルボニル] - 4 - メトキシフェニル] - 1 - ナフタレンカルボキサミド；  
 N - ( 3 - メトキシ - 2 - { [ ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエチル) アミノ] カルボニル} フェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 2 - { [ ( 1,4 - ジオキサン - 2 - イルメチル) アミノ] カルボニル} - 3 - メトキシフェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 3 - メトキシ - 2 - { [ ( 2 - モルホリン - 4 - イルエチル) アミノ] カルボニル} フェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 3 - メトキシ - 2 - { [ ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエチル) アミノ] カルボニル} フェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - { 3 - メトキシ - 2 - [ ( テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イルアミノ) カルボニル] フェニル} - 1 - ナフトアミド；  
 tert - ブチル 3 - ( { [ 2 - メトキシ - 6 - ( 1 - ナフトイルアミノ) ベンゾイル] アミノ} メチル) モルホリン - 4 - カルボキシレート；  
 N - { 2 - [ ( 1 - アザビシクロ [ 2.2.2 ] オクタ - 3 - イルアミノ) カルボニル] - 3 - メトキシフェニル} - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 3 - メトキシ - 2 - { [ ( モルホリン - 3 - イルメチル) アミノ] カルボニル} フェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - { 3 - メトキシ - 2 - [ ( モルホリン - 4 - イルアミノ) カルボニル] フェニル} - 1 - ナフトアミド；  
 N - { 3 - メトキシ - 2 - [ ( ピペリジン - 1 - イルアミノ) カルボニル] フェニル} - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 2 - { [ ( 2 - ヒドロキシエチル) アミノ] カルボニル} - 3 - メトキシフェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 2 - { [ ( 2 - ヒドロキシプロピル) アミノ] カルボニル} - 3 - メトキシフェニル) - 1 - ナフトアミド；  
 N - ( 2 - { [ ( 2 - ヒドロキシブチル) アミノ] カルボニル} - 3 - メトキシフェニル) - 1 - ナフトアミド；

から選択される化合物およびその医薬上許容しうる塩。

#### 【請求項 10】

疼痛の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

#### 【請求項 11】

機能性胃腸障害の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

#### 【請求項 12】

過敏性腸症候群の治療のための医薬の製造における、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項13】

不安症、癌、多発性硬化症、パーキンソン病、ハンチントン舞蹈病、アルツハイマー病、および心臓血管障害の治療のための医薬の製造における、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物の使用。

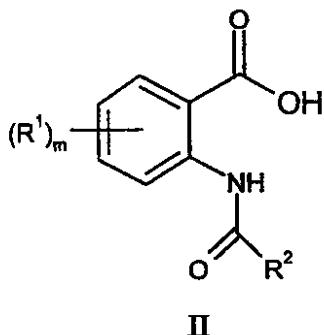
【請求項14】

請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物および医薬上許容しうる担体を含有する医薬組成物。

【請求項15】

式II

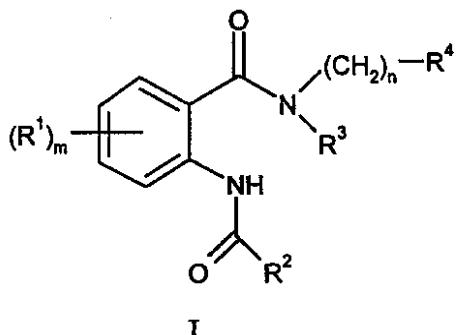
【化11】



の化合物を  $R^3(CH_2)_nR^4NH$  の化合物と、塩基、例えばDIPA、溶媒、例えばDMF、および場合によりカップリング試薬、例えばHATUの存在下で反応させる工程を含む、

式I

【化12】



の化合物を製造する方法であって、

式中、

$m$  は 0、1 および 2 から選択され；

$n$  は 0、1、2、3、4 および 5 から選択され；

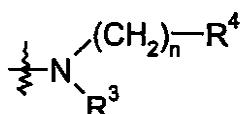
$R^1$  はハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ、アセチルアミノ、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルケニル、およびハロゲン化 $C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され；

$R^2$  は  $C_{6-10}$ アリールおよび  $C_{2-10}$ ヘテロシクリルから選択され；ここで  $R^2$  の定義に用いられる上記  $C_{6-10}$ アリールおよび  $C_{2-10}$ ヘテロシクリルはハロゲン、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキル、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロゲン化 $C_{1-6}$ アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ- $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、

ジ  $C_{1-6}$  アルキル - アミノ、アミノ -  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-5}$  ヘテロシクリル -  $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{2-6}$  ヘテロアリール、ヘテロアリール -  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、および  $C_{6-10}$  アリール -  $C_{1-6}$  アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換され；そして

$R^3$  は水素および  $C_{1-6}$  アルキルから選択され；  $R^4$  は  $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{3-7}$  シクロアルキル、  $C_{4-7}$  シクロアルケニル、  $C_{6-10}$  アリール、  $C_{2-6}$  ヘテロシクリル-アミノ、  $C_{2-6}$  ヘテロシクリルオキシ-アミノ、 および  $C_{2-6}$  ヘテロシクリルから選択され； ここで  $R^4$  の定義に用いられる上記  $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{3-7}$  シクロアルキル、  $C_{4-7}$  シクロアルケニル、  $C_{6-10}$  アリール、  $C_{2-6}$  ヘテロシクリル-アミノ、  $C_{2-6}$  ヘテロシクリルオキシ-アミノ、 および  $C_{2-6}$  ヘテロシクリルはハロゲン、 ハロゲン化  $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{1-6}$  アルキル、 シアノ、 ニトロ、  $C_{1-6}$  アルコキシ、 ハロゲン化  $C_{1-6}$  アルコキシ、 ヒドロキシ、 ヒドロキシ- $C_{1-6}$  アルキル、 アミノ、  $C_{1-6}$  アルコキシ- $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{1-6}$  アルキルカルボニル、  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル、  $C_{1-6}$  アルキルアミノ、 ジ  $C_{1-6}$  アルキル-アミノ、 アミノ- $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{3-6}$  シクロアルキル、  $C_{2-6}$  ヘテロアリール、 ヘテロアリール- $C_{1-6}$  アルキル、  $C_{6-10}$  アリール、 および  $C_{6-10}$  アリール- $C_{1-6}$  アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換されるか； または

【化 1 3】



は  $C_{2-10}$  ヘテロシクリルから選択され、これはハロゲン、ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  アルキル、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$  アルコキシ、ハロゲン化  $C_{1-6}$  アルコキシ、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-6}$  アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$  アルコキシ- $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ、ジ  $C_{1-6}$  アルキル-アミノ、アミノ- $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{2-6}$  ヘテロアリール、ヘテロアリール- $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{6-10}$  アリール、および  $C_{6-10}$  アリール- $C_{1-6}$  アルキルから選択される 1 またはそれ以上の基により場合により置換される、上記方法。