

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年6月29日(2006.6.29)

【公表番号】特表2006-514925(P2006-514925A)

【公表日】平成18年5月18日(2006.5.18)

【年通号数】公開・登録公報2006-019

【出願番号】特願2004-551393(P2004-551393)

【国際特許分類】

C 0 7 C 235/34	(2006.01)
C 0 7 D 295/16	(2006.01)
C 0 7 D 295/12	(2006.01)
C 0 7 D 233/16	(2006.01)
C 0 7 D 333/20	(2006.01)
C 0 7 D 333/28	(2006.01)
C 0 7 D 307/52	(2006.01)
C 0 7 D 261/14	(2006.01)
C 0 7 D 213/40	(2006.01)
C 0 7 D 271/10	(2006.01)
C 0 7 D 277/28	(2006.01)
C 0 7 D 249/08	(2006.01)
A 6 1 K 31/197	(2006.01)
A 6 1 K 31/166	(2006.01)
A 6 1 K 31/5375	(2006.01)
A 6 1 K 31/4453	(2006.01)
A 6 1 K 31/496	(2006.01)
A 6 1 K 31/40	(2006.01)
A 6 1 K 31/397	(2006.01)
A 6 1 K 31/55	(2006.01)
A 6 1 K 31/417	(2006.01)
A 6 1 K 31/381	(2006.01)
A 6 1 K 31/341	(2006.01)
A 6 1 K 31/42	(2006.01)
A 6 1 K 31/54	(2006.01)
A 6 1 K 31/4406	(2006.01)
A 6 1 K 31/4245	(2006.01)
A 6 1 K 31/426	(2006.01)
A 6 1 K 31/4196	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
C 0 7 C 311/51	(2006.01)
C 1 2 N 15/09	(2006.01)

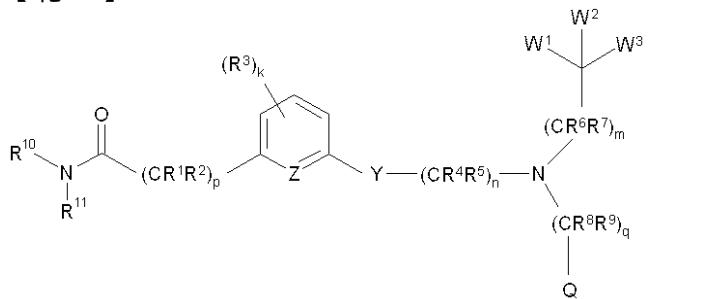
【F I】

C 0 7 C 235/34 C S P

C 0 7 D 295/16	Z N A Z
C 0 7 D 295/16	A
C 0 7 D 295/12	Z
C 0 7 D 233/16	
C 0 7 D 333/20	
C 0 7 D 333/28	
C 0 7 D 307/52	
C 0 7 D 261/14	
C 0 7 D 213/40	
C 0 7 D 271/10	
C 0 7 D 277/28	
C 0 7 D 249/08	5 3 5
A 6 1 K 31/197	
A 6 1 K 31/166	
A 6 1 K 31/5375	
A 6 1 K 31/4453	
A 6 1 K 31/496	
A 6 1 K 31/40	
A 6 1 K 31/397	
A 6 1 K 31/55	
A 6 1 K 31/417	
A 6 1 K 31/381	
A 6 1 K 31/341	
A 6 1 K 31/42	
A 6 1 K 31/54	
A 6 1 K 31/4406	
A 6 1 K 31/4245	
A 6 1 K 31/426	
A 6 1 K 31/4196	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 25/14	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/28	
C 0 7 C 311/51	
C 1 2 N 15/00	A

【手続補正書】**【提出日】**平成18年3月27日(2006.3.27)**【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:**

【化1】



[式中:]

Z は、C H または N であり、ここに、 k は、0、1 または 2 であり；
 Y は、- O - または - C (R⁴) (R⁵) - であり；
 W^1 は、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、アリールまたは H e t から選択され、ここに該 C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、A r および H e t は、非置換であっても、あるいは、ハロ、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ アルキニル、- C₀ - C₄ アルキル - C O₂ R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C (O) S R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C O N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - S O₃ H、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - S O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C (O) O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C O N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C O R¹ - R⁵ および - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C (O) N R¹ - R³ R¹ - R⁴ から独立して選択される 1 個以上の基により置換されていてもよく、ここに、該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1 個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；
 W^2 は、H、ハロ、C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₂ - C₆ アルキニル、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C O₂ R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C (O) S R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C O N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - H e t、- C₀ - C₄ アルキル - A r および - C₀ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択され、ここに、該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1 個以上のハロ置換基により置換されていてもよく、ここに、該 - C₀ - C₄ アルキル - H e t、- C₀ - C₄ アルキル - A r および - C₀ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルの C₃ - C₇ シクロアルキル、A r および H e t 基は、非置換であっても、あるいは、ハロ、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ アルキニル、- C₀ - C₄ アルキル - C O₂ R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C (O) S R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - C O N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - S O₃ H、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ R¹ - R²、- C₀ - C₄ アルキル - S O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) N R¹ - R³ R¹ - R⁴、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C (O) O R¹ - R⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C (O) N R¹ - R³ R¹ - R⁴ および - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ - R³ C (O) O R¹ - R⁵ から独立して選択される 1 個以上の基により置換されていてもよく、ここに、該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1 個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；

W³ は、 H、 ハロ、 C₁ - C₆ アルキル、 - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ R¹ ⁴、 - C₀ - C₄ アルキル - S R¹ ²、 - C₀ - C₄ アルキル - O R¹ ²、 - C₀ - C₄ アルキル - C O₂ R¹ ²、 - C₀ - C₄ アルキル - C (O) S R¹ ²、 - C₀ - C₄ アルキル - C O N R¹ ³ R¹ ⁴、 - C₀ - C₄ アルキル - C O R¹ ⁵、 - C₀ - C₄ アルキル - O C O R¹ ⁵、 - C₀ - C₄ アルキル - O C O N R¹ ³ R¹ ⁴、 - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ C O N R¹ ³ R¹ ⁴、 - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ C O R¹ ⁵、 - C₀ - C₄ アルキル - H e t、 - C₁ - C₄ アルキル - A r および - C₁ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルからなる群から選択され、ここに該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；

Q は、フェニルまたは H e t であり；ここに、該フェニルまたは H e t は、非置換であっても、あるいは、ハロ、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ アルキニル、- C₀ - C₄ アルキル - C O₂ R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - C (O) S R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - C O N R¹ ³ R¹ ⁴、- C₀ - C₄ アルキル - C O R¹ ⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ R¹ ⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - S O₃ H、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ N R¹ ³ R¹ ⁴、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - S O R¹ ⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C O R¹ ⁵、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) N R¹ ³ R¹ ⁴、- C₀ - C₄ アルキル - O C (O) O R¹ ⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ C (O) O R¹ ⁵、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ C (O) N R¹ ³ R¹ ⁴ および - C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ C O R¹ ⁵ から独立して選択される1個以上の基により置換されていてもよく、該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；

p は 0 ~ 4 であり；

n は 3 であり；

m は 0 または 1 であり；

q は 0 または 1 であり；

t は 0 であり；

R¹ および R² は、各々独立して、H、フルオロ、C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - S R¹ ²、- C₁ - C₄ アルキル - H e t、- C₁ - C₄ アルキル - A r および - C₁ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択され、ここに、いずれの該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；

R³ は、各々、同じであっても異なっていてもよく、独立して、ハロ、シアノ、C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₄ アルキル - N R¹ ³ R¹ ⁴、- C₀ - C₄ アルキル - O R¹ ²、- C₀ - C₄ アルキル - S O₂ N R¹ ³ R¹ ⁴ および - C₀ - C₄ アルキル - C O₂ H から選択され、ここに、該 C₁ - C₆ アルキルは、非置換であっても、あるいは、1個以上のハロ置換基により置換されていてもよく；

R⁴ および R⁵ は、各々独立して、H、フルオロおよび C₁ - C₆ アルキルから選択され；

R⁶ および R⁷ は、各々独立して、H、フルオロおよび C₁ - C₆ アルキルから選択され；

R⁸ および R⁹ は、各々独立して、H、フルオロおよび C₁ - C₆ アルキルから選択され；

R¹ ⁰ および R¹ ¹ は、各々独立して、H、C₁ - C₁ ₀ アルキル、C₃ - C₈ アルケニル、C₃ - C₈ アルキニル、- C₀ - C₆ アルキル - A r、- C₀ - C₆ アルキル - H e t、- C₀ - C₆ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキル、- C₀ - C₆ アルキル - O - H e t、- C₀ - C₆ アルキル - O - H e t、- C₀ - C₆ アルキル - O - C₃ - C₇ シクロアルキル、- C₀ - C₆ アルキル - S (O) _x - C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₆ アルキル - S (O) _x - A r、- C₀ - C₆ アルキル - S (O) _x - H e t、- C₀ - C₆ アルキル - S (O) _x - C₃ - C₇ シクロアルキル、- C₀ - C₆ アルキル - N H - A r

、 - C₀ - C₆ アルキル - NH - Het、 - C₀ - C₆ アルキル - NH - C₃ - C₇ シクロアルキル、 - C₀ - C₆ アルキル - N (C₁ - C₄ アルキル) - Ar、 - C₀ - C₆ アルキル - N (C₁ - C₄ アルキル) - C₃ - C₇ シクロアルキル、 - C₀ - C₆ アルキル - N (C₁ - C₄ アルキル) - Het および - C₀ - C₆ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択され、ここに、x は、0、1 または 2 であるか、あるいは、R¹¹ および R¹² は、それらが結合している窒素と一緒にになって、4 ~ 7 員のヘテロサイクリック環を形成し、該環は、N、O および S から選択される、1 個以上の付加的なヘテロ原子を含有していてもよく、ここに、該 C₁ - C₁₀ アルキル、C₃ - C₁₀ アルケニル、C₃ - C₁₀ アルキニルは、ハロ、- OH、- SH、- NH₂、- NH (非置換 C₁ - C₄ アルキル)、- N (非置換 C₁ - C₄ アルキル) (非置換 C₁ - C₄ アルキル)、非置換 - OC₁ - C₄ アルキル、- CO₂H、- CO₂ (非置換 C₁ - C₄ アルキル)、- CONH₂、- CONH (非置換 C₁ - C₄ アルキル)、- CON (非置換 C₁ - C₄ アルキル) (非置換 C₁ - C₄ アルキル)、- SO₃H、- SO₂NH₂、- SO₂NH (非置換 C₁ - C₄ アルキル) および - SO₂N (非置換 C₁ - C₄ アルキル) (非置換 C₁ - C₄ アルキル) から独立して選択される 1 個以上の置換基により置換されていてもよく；

R¹² は、H、C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₄ アルキル - Ar、- C₀ - C₄ アルキル - Het および - C₀ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択され；

R¹³ および R¹⁴ は、各々独立して、H、C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₄ アルキル - Ar、- C₀ - C₄ アルキル - Het および - C₀ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択されるか、あるいは、R¹³ および R¹⁴ は、それらが結合している窒素と一緒にになって、4 ~ 7 員のヘテロサイクリック環を形成し、該環は、N、O および S から選択される 1 個以上の付加的なヘテロ原子を含有していてもよく；

R¹⁵ は、C₁ - C₆ アルキル、- C₀ - C₄ アルキル - Ar、- C₀ - C₄ アルキル - Het および - C₀ - C₄ アルキル - C₃ - C₇ シクロアルキルから選択される；

ただし、Z が CH または N であり、Y が -O- であり、n が 3 であり、m が 1 であり、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷ が H であり、W³ が H であり、p が 0 であるか、または p が 1 または 2 であり、R¹ および R² が、各々 H であり、k が 0 であるか、または k が 1 であり、R³ が ハロまたは C₁ - C₄ アルコキシであり、q が 0 であるか、または q が 1 または 2 であり、R⁸ および R⁹ が、各々 H であり、Q が 非置換フェニルもしくは Het または フェニル (ハロ、- CH₃、- CH₂CH₃、- CF₃、- OC₁ - C₄ アルキル、- OCH₂CH₂OH、- OCF₃、- OCF₂H、- SCH₃、- SCF₃、- SO₂CH₃、- CO₂H、- CO₂CH₃、- OH、- OCH₂CO₂H、- CH₂CONH₂、- NO₂、- CN、- N(CH₃)₂ および - NHCO(O)CH₃ から選択される 1 個以上の置換基により置換されている) もしくは Het (- C₁ - C₃ アルキル、- OC₁ - C₄ アルキル、- CH₂OH、- CO₂H、- CO₂CH₂CH₃、- CO₂ - tert - C₄H₉ アルキル、- CO₂CH₂ - フェニル、- CONH₂、- C(O)フェニル、- C(O)CH₃、- CH₂CH₂ - フェニルおよびオキソから選択される 1 個以上の置換基により置換されている) であり、t が 0 であり、W¹ および W² が、各々独立して、非置換シクロヘキシルおよび非置換フェニルである場合、R¹⁰ および R¹¹ は H 以外である】

を有する化合物：ただし、2 - ヒドロキシ - 4 - [3 - [(2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチル) (フェニルメチル) アミノ] プロポキシ] - ベンズアミドを除く化合物、またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

R¹、R²、R³、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹ および W³ が、各々 H であり； R⁴ および R⁵ が、各々独立して、H および C₁ - C₄ アルキルから選択され、R¹⁰ および R¹¹ が、各々独立して、H、C₁ - C₁₀ アルキル、- C₁ - C₄ アルキル - O - Ar、- S(O)₂CH₃、- C₁ - C₄ アルキル、- S(O)₂CH₃、- Ar、- C₀ - C₄ アルキル - Het から選択され、ここに、Het 基が、イミダゾリル、チエニル (チオフェニル)、モルホリニ

ル、チオモルホリニル、フリル、テトラヒドロフラニル、ピリジル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリルおよびチアゾリルから選択されるか；あるいは、 $R^{1,0}$ および $R^{1,1}$ が、それらが結合している窒素と一緒にになって、NおよびOから選択される1個の付加的なヘテロ原子を含有していてもよい、置換または非置換4～7員のヘテロサイクリック環を形成し、ここに置換された環が C_1 ～ C_4 アルキルにより置換されており、ここに、該 C_0 ～ C_4 アルキルが C_1 ～ C_4 アルキルである場合、該 C_1 ～ C_4 アルキルは非置換であるか、-CO₂Hまたは-CO₂（非置換 C_1 ～ C_6 アルキル）により置換されており；ZがCHであり；Yが-O-または-C(R⁴)(R⁵)-であり；Qが、ハロおよび C_1 ～ C_4 ハロアルキルから選択される2個の置換基を含有する置換フェニル基であり；pが0、1または2であり；nが3であり；mが0または1であり；qが1であり；kが0であり；tが0であり；W¹およびW²がアリールであるか、あるいはW¹がアリールであり、W²がアリールまたは C_1 ～ C_4 アルキルである、請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項3】

$R^{1,0}$ 、 $R^{2,0}$ 、 $R^{3,0}$ 、 $R^{6,0}$ 、 $R^{7,0}$ 、 $R^{8,0}$ 、 $R^{9,0}$ およびW³が、各々Hであり； $R^{4,0}$ および $R^{5,0}$ が、各々独立して、Hおよびメチルから選択され； $R^{1,1}$ および $R^{1,1}$ が、各々独立して、H、メチル、エチル、イミダゾール-2-イル-メチル-、5-ブロモ-チオフェン-2-イル-メチル-、チオフェン-2-イル-メチル-、2-メトキシ-エチル-、2-ジメチルアミノ-エチル-、2-モルホリン-4-イル-エチル-、2-メトキシ-1-メチル-エチル-、2-メトキシ-エチル-、フラン-2-イル-メチル-、3-メチル-イソキサゾール-5-イル-メチル-、2-チオモルホリン-4-イル-エチル-、2-ピロリジン-1-イル-エチル-、ピリジン-3-イル-メチル-、2-ピリジン-2-イル-エチル-、3-フェノキシ-エチル-、3-イソプロポキシ-プロピル-、3-メトキシ-プロピル-、5-メチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル-メチル-、4-メチル-チアゾール-2-イル-メチル-、1-チオフェン-2-イル-エチル-、チオフェン-3-イル-メチル-5-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル-メチル-、ピリジン-2-イル-メチル-、テトラヒドロフラン-2-イル-メチル-、1-エチル-ピロリジン-2-イル-メチル-、オクチル、デシル、2-(2-ヒドロキシ-エトキシ)-エチル-、1-カルボキシ-チオフェン-2-イル-メチル-、フェニル、メチル-スルホニル-、フェニル-スルホニル-から選択されるか、あるいは、 $R^{1,0}$ および $R^{1,1}$ が、それらが結合している窒素と一緒にになって、アセチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、アゼパニル、4-メチル-ピペラジン-1-イルまたはモルホリン-4-イル基を形成し；ZがCHであり；Yが-O-であり；Qが2-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニルであり；pが1であり；nが3であり；qが1であり；kが0であり；tが0であり；mが1であり；W¹およびW²が非置換フェニルであるか、あるいはW¹が非置換フェニルであり、W²がメチルである、請求項1記載の化合物；またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項4】

2-(3-{3-[(2-クロロ-3-(トリフルオロメチル)-ベンジル)-(2-ジフェニルエチル)-アミノ]-プロポキシ}フェニル)-1-モルホリン-4-イル-エタノン；
 2-(3-{3-[(2-クロロ-3-(トリフルオロメチル)-ベンジル)-(2-ジフェニルエチル)-アミノ]-プロポキシ}フェニル)-N-メチル-アセトアミド；
 2-(3-{3-[(2-クロロ-3-(トリフルオロメチル)-ベンジル)-(2-ジフェニルエチル)-アミノ]-プロポキシ}フェニル)-N,N-ジエチル-アセトアミド；
 2-(3-{3-[(2-クロロ-3-(トリフルオロメチル)-ベンジル)-(2-ジフェニルエチル)-アミノ]-プロポキシ}フェニル)-1-ピペリジン-1-イル-エタノン；

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - 1 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - エタノン ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - 1 - ピロリジン - 1 - イル - エタノン ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - N - エチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - N , N - ジエチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - 1 - アゼチジン - 1 - イル - エタノン ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - 1 - アゼパン - 1 - イル - エタノン ;

(S) - 2 - (3 - { 3 - [[2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル] (2 - フェニル - プロピル) アミノ] プロポキシ } - フェニル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - アセトアミド ;

N - (5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イルメチル) - 2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - チオフェン - 2 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - メトキシ - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - モルホリン - 4 - イル - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - メトキシ - エチル) - N - メチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N , N - ビス - (2 - メトキシ - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - フラン - 2 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (3 - メチル - イソキサゾール - 5 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - チオモルホリン - 4 - イル - エチル) - アセトアミド；

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - ピロリジン - 1 - イル - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - ピリジン - 3 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (2 - ピリジン - 2 - イル - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (3 - フェノキシ - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (3 - イソプロポキシ - プロピル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (3 - メトキシ - プロピル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (5 - メチル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (4 - メチル - チアゾール - 2 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (1 - チオフェン - 2 - イル - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - チオフェン - 3 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (5 - メチル - 4 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - ピリジン - 2 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (テトラヒドロ - フラン - 2 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - (1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - オクチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - デシル - アセトアミド ;
 2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - [2 - (2 - ヒドロキシ - エトキシ) - エチル] - アセトアミド ;
 [2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイルアミノ] - 2 - チオフェン - 2 - イル - 酢酸 ;
 3 - [2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイルアミノ] - プロピオン酸 ;
 3 - [2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイルアミノ] - 酢酸 ;
 (R) - 2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - 2 - メチル - プロポキシ } フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン ;
 2 - (3 - { (R) - 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - ブトキシ } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン ;
 4 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - N , N - ジエチル - ベンズアミド ;
 1 - (4 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;
 1 - (4 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - 1 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン ;
 3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - N , N - ジエチル - ベンズアミド ;
 3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - N - フェニル - ベンズアミド ;
 1 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;
 1 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - 1 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン ;
 N - [1 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - メタノイル] - メタンスルホンアミド ;
 N - [1 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - メタノイル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 N - [2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイル] - メタンスルホンアミド ;
 N - [2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 N - [- (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル - エタノイル] - N - メチル - ベンゼンスルホンアミド ;

N - [2 - (3 - { 3 - [(クロロトリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - エタノイル] - N - メチル - メタンスルホニアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((S) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((S) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - エチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N , N - ジエチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - メチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N , N - ジエチル - アセトアミド ,

から選択される請求項 1 記載の化合物、またはその立体異性体、立体異性体混合物もしくはラセミ体、またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 5】

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - N - メチル - アセトアミド ,

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - N , N - ジエチル - アセトアミド ,

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - ベンジル) - (2 , 2 - ジフェニルエチル) - アミノ] - プロポキシ } フェニル) - N - エチル - アセトアミド ,

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N , N - ビス - (2 - メトキシ - エチル) - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ジフェニルエチル - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - チオフェン - 3 - イルメチル - アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) アセトアミド ;

2 - (3 - { 3 - [(2 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジル) - ((R) - 2 - フェニル - プロピル) - アミノ] - プロポキシ } - フェニル) - N - メチル - アセトアミド ;

から選択される請求項 1 記載の化合物、またはその立体異性体、立体異性体混合物もしくはラセミ体、またはその医薬上許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 いずれか 1 項記載の化合物および医薬上許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 7】

コレステロール逆輸送の増加用の医薬の製造における、請求項 1 ~ 5 いずれか 1 項記載

の化合物の使用。