

【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

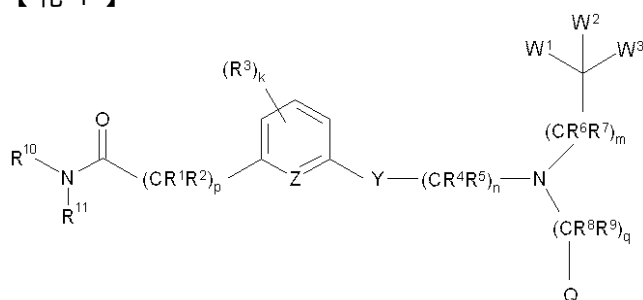
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

## 【化 1】



[ 式中 : ]

Z は、CH 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 ( R<sup>4</sup> ) ( R<sup>5</sup> ) - であり；

W<sup>1</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> 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 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> 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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C ( O ) S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>3</sub> H、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>2</sub> N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C ( O ) N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C ( O ) O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C ( O ) O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C ( O ) N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup> および - C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C O R<sup>1 5</sup> 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 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 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<sup>2</sup> は、H、ハロ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C ( O ) S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C O N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C O N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - H e t、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - A r および - C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルから選択され、ここに、該 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 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 - C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - H e t、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - A r および - C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルの C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> 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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C ( O ) S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>3</sub> H、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>2</sub> N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - S O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C ( O ) N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - O C ( O ) O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C ( O ) O R<sup>1 5</sup>、- C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C ( O ) N R<sup>1 3</sup> R<sup>1 4</sup> および - C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - N R<sup>1 3</sup> C O R<sup>1 5</sup> から独立して選択される 1 個以上の基より置換されていてもよく、ここに、該 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 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；

$W^3$  は、H、ハロ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $CO_2R^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $C(O)SR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $CONR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $COR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OCOR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OCONR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}CONR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}COR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $Het$ 、 $-C_1 - C_4$  アルキル -  $Ar$  および  $-C_1 - C_4$  アルキル -  $C_3 - C_7$  シクロアルキルからなる群から選択され、ここに該  $C_1 - C_6$  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  $Het$  であり；ここに、該フェニルまたは  $Het$  は、非置換であっても、あるいは、ハロ、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_6$  アルケニル、 $C_3 - C_6$  アルキニル、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $CO_2R^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $C(O)SR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $CONR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $COR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SO_3H$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SO_2NR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SO_2R^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SOR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OCOR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OC(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OC(O)OR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}C(O)OR^{15}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}C(O)NR^{13}R^{14}$  および  $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}COR^{15}$  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  $C_1 - C_6$  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；

$R^1$  および  $R^2$  は、各々独立して、H、フルオロ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SR^{12}$ 、 $-C_1 - C_4$  アルキル -  $Het$ 、 $-C_1 - C_4$  アルキル -  $Ar$  および  $-C_1 - C_4$  アルキル -  $C_3 - C_7$  シクロアルキルから選択され、ここに、いずれの該  $C_1 - C_6$  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；

$R^3$  は、各々、同じであっても異なってもよく、独立して、ハロ、シアノ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $NR^{13}R^{14}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $OR^{12}$ 、 $-C_0 - C_4$  アルキル -  $SO_2NR^{13}R^{14}$  および  $-C_0 - C_4$  アルキル -  $CO_2H$  から選択され、ここに、該  $C_1 - C_6$  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；

$R^4$  および  $R^5$  は、各々独立して、H、フルオロおよび  $C_1 - C_6$  アルキルから選択され；

$R^6$  および  $R^7$  は、各々独立して、H、フルオロおよび  $C_1 - C_6$  アルキルから選択され；

$R^8$  および  $R^9$  は、各々独立して、H、フルオロおよび  $C_1 - C_6$  アルキルから選択され；

$R^{10}$  および  $R^{11}$  は、各々独立して、H、 $C_1 - C_{10}$  アルキル、 $C_3 - C_8$  アルケニル、 $C_3 - C_8$  アルキニル、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $Ar$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $Het$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $O - Ar$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $O - Het$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $O - C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $S(O)_x - C_1 - C_6$  アルキル、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $S(O)_x - Ar$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $S(O)_x - Het$ 、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $S(O)_x - C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $-C_0 - C_6$  アルキル -  $NH - Ar$

、 $-C_0-C_6$  アルキル $-NH-Het$ 、 $-C_0-C_6$  アルキル $-NH-C_3-C_7$  シクロアルキル、 $-C_0-C_6$  アルキル $-N(C_1-C_4$  アルキル) $-Ar$ 、 $-C_0-C_6$  アルキル $-N(C_1-C_4$  アルキル) $-Het$ 、 $-C_0-C_6$  アルキル $-N(C_1-C_4$  アルキル) $-C_3-C_7$  シクロアルキル、 $-C_0-C_6$  アルキル $-Ar$ 、 $-C_0-C_6$  アルキル $-Het$  および  $-C_0-C_6$  アルキル $-C_3-C_7$  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、 $R^{11}$  および  $R^{12}$  は、それらが結合している窒素と一緒にあって、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  $C_1-C_{10}$  アルキル、 $C_3-C_{10}$  アルケニル、 $C_3-C_{10}$  アルキニルは、ハロ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル)、 $-N$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル) (非置換  $C_1-C_4$  アルキル)、非置換  $-OC_1-C_4$  アルキル、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CONH$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル)、 $-CON$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル) (非置換  $C_1-C_4$  アルキル)、 $-SO_3H$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル) および  $-SO_2N$  (非置換  $C_1-C_4$  アルキル) (非置換  $C_1-C_4$  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；

$R^{12}$  は、H、 $C_1-C_6$  アルキル、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Ar$ 、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Het$  および  $-C_0-C_4$  アルキル $-C_3-C_7$  シクロアルキルから選択され；

$R^{13}$  および  $R^{14}$  は、各々独立して、H、 $C_1-C_6$  アルキル、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Ar$ 、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Het$  および  $-C_0-C_4$  アルキル $-C_3-C_7$  シクロアルキルから選択されるか、あるいは、 $R^{13}$  および  $R^{14}$  は、それらが結合している窒素と一緒にあって、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；

$R^{15}$  は、 $C_1-C_6$  アルキル、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Ar$ 、 $-C_0-C_4$  アルキル $-Het$  および  $-C_0-C_4$  アルキル $-C_3-C_7$  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、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  が H であり、 $W^3$  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、 $R^1$  および  $R^2$  が、各々 H であり、k が 0 であるか、または k が 1 であり、 $R^3$  がハロまたは  $C_1-C_4$  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、 $R^8$  および  $R^9$  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、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1-C_4$  アルキル、 $-OCH_2CH_2OH$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2H$ 、 $-SCH_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-SO_2CH_3$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_2CO_2H$ 、 $-CH_2CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-N(CH_3)_2$  および  $-NHC(O)CH_3$  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 ( $-C_1-C_3$  アルキル、 $-OC_1-C_4$  アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2CH_2CH_3$ 、 $-CO_2-tert-C_4H_9$  アルキル、 $-CO_2CH_2$ -フェニル、 $-CONH_2$ 、 $-C(O)$  フェニル、 $-C(O)CH_3$ 、 $-CH_2CH_2$ -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、 $W^1$  および  $W^2$  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、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  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】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  および  $W^3$  が、各々 H であり； $R^4$  および  $R^5$  が、各々独立して、H および  $C_1-C_4$  アルキルから選択され、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  が、各々独立して、H、 $C_1-C_{10}$  アルキル、 $-C_1-C_4$  アルキル $-O-Ar$ 、 $-S(O)_2C_1-C_4$  アルキル、 $-S(O)_2-Ar$ 、 $-C_0-C_4$  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、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  が、それらが結合している窒素と一緒にあって、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、 $-CO_2H$  または  $-CO_2$  (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  $-C(R^4)(R^5)-$  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； $W^1$  および  $W^2$  がアリールであるか、あるいは  $W^1$  がアリールであり、 $W^2$  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】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  および  $W^3$  が、各々 H であり； $R^4$  および  $R^5$  が、各々独立して、H およびメチルから選択され； $R^{10}$  および  $R^{11}$  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 - プロモ - 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 - 4 H - [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、 $R^{10}$  および  $R^{11}$  が、それらが結合している窒素と一緒にあって、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； $W^1$  および  $W^2$  が非置換フェニルであるか、あるいは  $W^1$  が非置換フェニルであり、 $W^2$  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, 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, 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) - 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 - プロモ - 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 - チオフエン - 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 - チオフエン - 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 ] - プロポキシ } - 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 - メタンスルホンアミド ;

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。