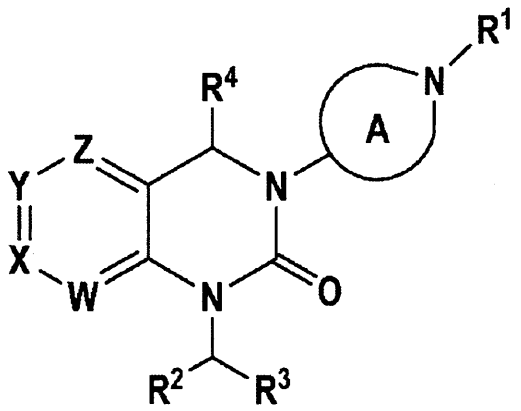
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年1月21日(2022.1.21)

【国際公開番号】WO2019/141808
【公表番号】特表2021-511327(P2021-511327A)
【公表日】令和3年5月6日(2021.5.6)
【出願番号】特願2020-539797(P2020-539797)
【国際特許分類】
C07D401/04(2006.01)
A61K 31/517(2006.01)
C07D401/14(2006.01)
A61K 31/55(2006.01)
C07D417/14(2006.01)
C07D403/04(2006.01)
A61P 9/00(2006.01)
A61P 29/00(2006.01)
A61P 37/02(2006.01)
A61P 25/00(2006.01)
A61P 9/10(2006.01)
A61P 1/04(2006.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 17/02(2006.01)
A61P 3/10(2006.01)
A61P 7/02(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ４０１/０４　　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ ３１/５１７
Ｃ０７Ｄ４０１/１４
Ａ６１Ｋ ３１/５５
Ｃ０７Ｄ４１７/１４
Ｃ０７Ｄ４０３/０４
Ａ６１Ｐ　９/００
Ａ６１Ｐ ２９/００
Ａ６１Ｐ ３７/０２
Ａ６１Ｐ ２５/００
Ａ６１Ｐ　９/１０
Ａ６１Ｐ　１/０４
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ １７/０２
Ａ６１Ｐ　３/１０
Ａ６１Ｐ　７/０２
Ａ６１Ｐ ４３/００　１１１

【手続補正書】
【提出日】令和4年1月13日(2022.1.13)
【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）の化合物又はその薬学的に許容される塩：
【化１】



式（Ｉ）

（式中、
Ｗは、Ｎ又はＣＲ５（Ｒ５は、水素又は（Ｃ１－３）アルコキシを表す。）を表し；
Ｘ、Ｙ及びＺは、独立に、ＣＨ又はＮを表し；
環Ａは、Ｒ１が結合する環窒素原子を有する未置換の４～７員の単環式飽和炭素環を表し；
Ｒ１は、フェニル；５員のヘテロアリール；又は、６員のヘテロアリールを表し；
当該フェニル、５員のヘテロアリール又は６員のヘテロアリールは、独立に、１、２又は３個の置換基により置換され、当該置換基は、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択され；
Ｒ２は、フェニル；５員のヘテロアリール；又は、６員のヘテロアリールを表し；当該フェニル、５員のヘテロアリール又は６員のヘテロアリールは、独立に、１又は２個の置換基により置換され、当該置換基は、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　ヒドロキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）アルキル－カルボニル－オキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　シアノ－（Ｃ１－２）アルコキシ；
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル－Ｘ２１－（Ｘ２１は、直接結合、－Ｏ－、又は、－（Ｃ１－３）アルキレン－Ｏ－を表し、上記（Ｃ３－６）シクロアルキルは、独立に、１個の任意の環酸素原子を有する。）；又は、

－－　Ｒ２１ａＲ２１ｂＮ-（Ｃ２－３）アルキレン－Ｏ－（Ｒ２１ａ及びＲ２１ｂは、独立に、水素又は（Ｃ１－４）アルキルを表す。）；
から独立に選択され；
Ｒ３は、水素、（Ｃ１－３）アルキル又は（Ｃ１－３）アルコキシ－カルボニルを表し；
Ｒ４は、水素又は（Ｃ１－４）アルキルを表す。）。
【請求項２】
環（Ａ）が、Ｒ１が結合する環窒素原子を有する４～７員の単環式飽和炭素環を表し、当該環が、アゼチジン－１，３－ジイル、ピロリジン－１，３－ジイル、ピペリジン－１，４－ジイル及びアゼパン－１，４－ジイルから選択される、請求項１に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項３】
環Ａが、ピロリジン－１，３－ジイル又はピペリジン－１，４－ジイルを表す、請求項１又は２に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項４】
－　Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺがすべてＣＨを表し；
－　ＷがＣＲ５を表し、Ｒ５が（Ｃ１－３）アルコキシ（特にメトキシ）を表し；かつ、Ｘ、Ｙ及びＺがすべてＣＨを表し；
－　ＷがＣＲ５を表し、Ｒ５が、水素又は（Ｃ１－３）アルコキシ（特にメトキシ）を表し；Ｘ、Ｙ及びＺの１つがＮを表し、かつ、Ｘ、Ｙ及びＺの残りがＣＨを表し；
－　ＷがＮを表し；かつ、Ｘ、Ｙ及びＺがすべてＣＨを表し；
－　Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺの２つがＮを表し、かつ、Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺの残りがＣＨを表す；
請求項２に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項５】
－　Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺがすべてＣＨを表し；
－　ＷがＣＲ５を表し、Ｒ５が（Ｃ１－３）アルコキシ（特にメトキシ）を表し；かつ、Ｘ、Ｙ及びＺがすべてＣＨを表し；
－　Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺの２つがＮを表し、かつ、Ｗ、Ｘ、Ｙ及びＺの残りがＣＨを表す；
請求項３に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項６】
Ｒ１が、
－　フェニルであって、１、２又は３個の置換基により置換され、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択される、フェニル；又は、
－　ピラゾリルであって、１、２又は３個の置換基により置換され、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択される、ピラゾリル；又は、
－　ピリジニルであって、１、２又は３個の置換基により置換され、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；及び

－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択される、ピリジニル；
を表す；請求項１～５のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項７】
Ｒ１が、
－　フェニルであって、１又は２個の置換基により置換され、少なくとも１個の置換基は、分子の残りの部分の結合点に対してオルト位に結合し、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択される、フェニル；
－　ピラゾリルであって、３個の置換基により置換され、当該置換基の２つが：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択され；
当該置換基の残りが、独立に、ハロゲン又はシアノである；
ピラゾリル；又は、
－　ピリジニルであって、２個の置換基により置換され、少なくとも１個の置換基は、分子の残りの部分の結合点に対してオルト位に結合し、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；及び
－－　ハロゲン；
から独立に選択される、ピリジニル；
を表す；請求項１～６のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項８】
Ｒ１が、
－　フェニルであって、１又は２個の置換基により置換され、少なくとも１個の置換基は、分子の残りの部分の結合点に対してオルト位に結合し、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　シアノ；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択される、フェニル；又は、
－　ピリジニルであって、２個の置換基により置換され、少なくとも１個の置換基は、分子の残りの部分の結合点に対してオルト位に結合し、当該置換基が：
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；及び
－－　ハロゲン；
から独立に選択される、ピリジニル；
を表す；請求項１～７のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項９】
－　Ｒ２がフェニルを表し；当該フェニルが１又は２個の置換基により置換され、当該置換基が、

－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　ヒドロキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）アルキル－カルボニル－オキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　シアノ－（Ｃ１－２）アルコキシ；
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル－Ｘ２１－（Ｘ２１は、直接結合、－Ｏ－、又は、－（Ｃ１－３）アルキレン－Ｏ－を表し、上記（Ｃ３－６）シクロアルキルは、独立に、１個の任意の環酸素原子を有する。）；及び
－－　Ｒ２１ａＲ２１ｂＮ－（Ｃ２－３）アルキレン－Ｏ－（Ｒ２１ａ及びＲ２１ｂは、独立に、水素又は（Ｃ１－４）アルキルを表す。）；
から独立に選択され；
－　又は、Ｒ２がチアゾリルを表し；当該チアゾリルが、１又は２個の置換基により置換され、当該置換基が、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；及び
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル；
から独立に選択され；
－　又は、Ｒ２が６員のヘテロアリールを表し；当該６員のヘテロアリールが、独立に、１又は２個の置換基により置換され、当該置換基が、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；及び
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
から独立に選択される；
請求項６に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項１０】
－　Ｒ２がフェニルを表し；当該フェニルが、１又は２個の置換基により置換され、当該置換基が、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルコキシ；
－－　ハロゲン；
－－　ヒドロキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　（Ｃ１－３）アルキル－カルボニル－オキシ－（Ｃ２－３）アルコキシ；
－－　シアノ－（Ｃ１－２）アルコキシ；
－－　（Ｃ３－６）シクロアルキル－Ｘ２１－（Ｘ２１は、直接結合、－Ｏ－、又は、－（Ｃ１－３）アルキレン－Ｏ－を表し、上記（Ｃ３－６）シクロアルキルは、独立に、１個の任意の環酸素原子を有する。）；及び
－－　Ｒ２１ａＲ２１ｂＮ－（Ｃ２－３）アルキレン－Ｏ－（Ｒ２１ａ及びＲ２１ｂは、独立に、水素又は（Ｃ１－４）アルキル（特にメチル）を表す。）；
から独立に選択され；
－　又は、Ｒ２が６員のヘテロアリールを表し；当該６員のヘテロアリールが、独立に、１又は２個の置換基により置換され、当該置換基が、
－－　（Ｃ１－４）アルキル；
－－　（Ｃ１－４）アルコキシ；及び
－－　（Ｃ１－３）フルオロアルキル；
から独立に選択される；

請求項7に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項１１】
３－［１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２，６－ジフルオロ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
８－メトキシ－３－［１－（２－メトキシ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メトキシ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－メトキシ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メトキシ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジフルオロ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
８－メトキシ－３－［（Ｒ）－１－（２－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－フルオロ－６－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（４－クロロ－５－シクロプロピル－２－メチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｓ）－１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｓ）－１－（２，６－ジフルオロ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｓ）－１－（２－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｓ）－１－（２－フルオロ－６－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（

２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジフルオロ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－フルオロ－６－メトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
８－メトキシ－３－［（Ｒ）－１－（２－メトキシ－６－メチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－メトキシ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジメトキシ－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－８－メトキシ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
８－メトキシ－３－［１－（２－メトキシ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－メトキシ－６－メチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－（２’，４’－ジメチル－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，３’］ビピリジニル－４－イル）－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－（２’－メトキシ－４’－メチル－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，３’］ビピリジニル－４－イル）－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－（２’－フルオロ－４’－メチル－３，４，５，６－テトラヒドロ－２Ｈ－［１，３’］ビピリジニル－４－イル）－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－メトキシ－４－メチル－ピリジン－３－イル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，４－ジメチル－ピリジン－３－イル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－フルオロ－４－メチル－ピリジン－３－イル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－メトキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［（Ｒ）－１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピロリジン－３－イル］－１－（２－メトキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；

３－［１－（２，６－ジメチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－メトキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－メトキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－フルオロ－２－｛４－［２－オキソ－１－（３－トリフルオロメチル－ピラジン－２－イルメチル）－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－３－イル］－ピペリジン－１－イル｝－ベンゾニトリル；
３－フルオロ－２－｛４－［１－（３－メトキシ－ピラジン－２－イルメチル）－２－オキソ－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－３－イル］－ピペリジン－１－イル｝－ベンゾニトリル；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－［１－（２－メトキシ－フェニル）－エチル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
６－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－８－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－５，８－ジヒドロ－６Ｈ－ピリミド［４，５－ｃ］ピリダジン－７－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－トリフルオロメチル－ピラジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－メトキシ－ピラジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－イソプロポキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－［１－（２－トリフルオロメチル－フェニル）－エチル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（２－エトキシ－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－［２－（２－ジメチルアミノ－エトキシ）－ベンジル］－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
酢酸　２－（２－｛３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－２－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－１－イルメチル｝－フェノキシ）－エチルエステル；
｛３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－２－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－１－イル｝－（２－メトキシ－フェニル）－酢酸　メチルエステル；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－［２－（２－ヒドロキシ－エトキシ）－ベンジル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－［２－（オキセタン－３－イルオキシ）－ベンジル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（２－シクロブトキシ－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－［２－（テトラヒドロ－ピラン－４－イルオキシ）－ベンジル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（２－シクロプロピルメトキシ－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチ

ル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
（２－｛３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－２－オキソ－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－１－イルメチル｝－フェノキシ）－アセトニトリル；
１－（２－シクロプロピル－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－イソプロピル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－プテリジン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－イソプロポキシ－ピラジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－イソプロポキシ－ピリジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（４－イソプロピル－ピリジン－３－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－イソプロピル－ピラジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（４－イソプロピル－ピリミジン－５－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－ピリミド［４，５－ｄ］ピリミジン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
７－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－５－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－７，８－ジヒドロ－５Ｈ－ピリミド［５，４－ｃ］ピリダジン－６－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（４－トリフルオロメチル－ピリジン－３－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（２－シクロプロポキシ－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（３－トリフルオロメチル－ピリジン－２－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－４－メチル－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１，３－ジメチル－５－｛４－［２－オキソ－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－１，４－ジヒドロ－２Ｈ－キナゾリン－３－イル］－ピペリジン－１－イル｝－１Ｈ－ピラゾール－４－カルボニトリル；

３－［１－（４－クロロ－２，５－ジメチル－２Ｈ－ピラゾール－３－イル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメトキシ－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（２－クロロ－ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－トリフルオロメチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－アゼパン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－トリフルオロメトキシ－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－クロロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（４－イソプロポキシ－ピリダジン－３－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－アゼチジン－３－イル］－１－（２－トリフルオロメチル－ベンジル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
１－（６－トリフルオロメチル［２－^{2}Ｈ］ベンジル）－３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；又は、
３－［１－（２－フルオロ－６－メチル－フェニル）－ピペリジン－４－イル］－１－（２－メチル－４－トリフルオロメチル－チアゾール－５－イルメチル）－３，４－ジヒドロ－１Ｈ－キナゾリン－２－オン；
からなる群より選択される、請求項１に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項１２】
有効成分としての請求項１～１１のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と、少なくとも１種の治療上不活性な賦形剤とを有する医薬組成物。
【請求項１３】
医薬として使用するための、請求項１～１１のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。
【請求項１４】
血管性疾患又は障害、血管内微細小胞放出が関与する炎症性疾患又は障害、免疫複合体（ＩＣ）疾患又は障害、神経変性疾患又は障害、補体関連炎症性疾患又は障害、水疱性疾患又は障害、虚血及び／又は虚血再灌流障害関連疾患又は障害、炎症性腸疾患又は障害、自己免疫疾患又は障害、又は癌の予防又は治療において使用するための、請求項１～１１のいずれか１項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、薬剤。
【請求項１５】
人工表面との接触により引き起こされる接触過敏症及び炎症の有害な結果の予防又は治療；白血球及び血小板活性化の増大及びその組織への浸潤の予防又は治療；中毒又は外傷である怪我、出血、ショック若しくは移植を含む外科手術等の損傷に関連する病理的続発症の予防又は治療；心筋梗塞又は血栓症の予防／そのリスクの低減；浮腫又は毛細血管透過性増大の予防又は治療；又は心肺バイパス及び／又は心臓麻痺により誘発される冠動脈内皮細胞機能不全の予防／その低減のための、請求項１～１１のいずれか１項に記載の化合

物又はその薬学的に許容される塩を含む、薬剤。