

【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1月24日(2008.1.24)

【公表番号】特表2007-515477(P2007-515477A)

【公表日】平成19年6月14日(2007.6.14)

【年通号数】公開・登録公報2007-022

【出願番号】特願2006-546907(P2006-546907)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 491/056 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4741 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/14 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/06 C S P

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 409/06
C 0 7 D 417/06
C 0 7 D 491/056
C 0 7 D 405/14
C 0 7 D 401/14
A 6 1 K 31/4725
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/4741
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 29/02
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 19/04
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 13/02
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 11/14
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 1/10
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 25/30
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 25/34
A 6 1 P 25/36
A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年11月22日(2007.11.22)

【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

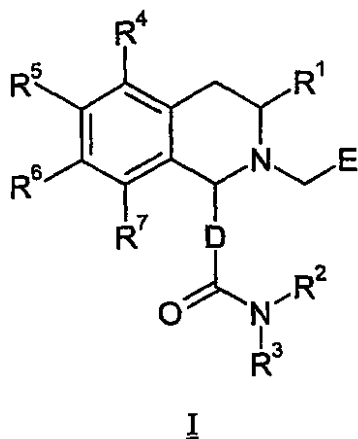
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化 1】



の化合物、その薬学的に許容しうる塩、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、 R^1 は - Hおよび C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 および R^3 は独立して - Hおよび C_{1-6} アルキルから選択され；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は独立して - H、- OH、ハロゲン、- NO_2 、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6}$ アルキル) $_2N - S(=O)_2 - O -$ から選択され；または

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 から選択される何れか2個の隣接する基は式Iのベンゼン環と縮合している5 - または6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6}$ アルキル) $_2N - S(=O)_2 - O -$ は場合によりハロゲン、 C_{1-3} アルコキシ、- O H、- NO_2 、 C_{1-3} アルキル、- NH_2 および- $CO_2 - C_{1-3}$ アルキルから選択される1個またはそれ以上の基で置換され；

Eは場合によりハロゲン、 C_{1-6} アルキル、- $C(=O) - O - C_{1-6}$ アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキルおよび C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 -$ から選択される1個またはそれ以上の基で置換される5 - 員のヘテロシクリルであり；そして

Dはベンゼン環を含有する二価の基である。

【請求項 2】

R^1 は - Hおよび C_{1-3} アルキルから選択され；

R^2 および R^3 は独立して C_{1-3} アルキルであり；

R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は独立して - H、- OH、ハロゲン、- NO_2 、 C_{1-6} アルキル、フェニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、テトラヒドロピラニルオキシ、ピリジニルオキシ、モルホリニルオキシ、テトラヒドロピラニル - C_{1-4} アルコキシ、ピリジニル - C_{1-4} アルコキシ、モルホリニル - C_{1-4} アルコキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、フェニル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-3} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-3}$ アルキル) $_2N - S(=O)_2 - O -$ から選択され；または

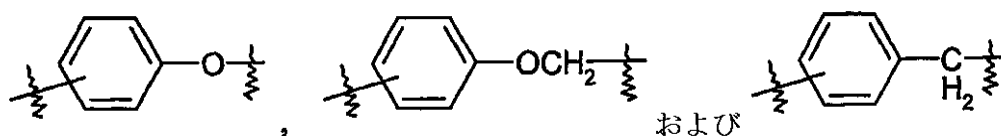
R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 から選択される何れか2個の隣接する基は - O - $CH_2 - O -$ および - O - $CH_2 - CH_2 - O -$ から選択される二価の基を形成し、ここで該 C_{1-6} アルキル、フェニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、テトラヒドロピラニルオキシ、ピリジニルオキシ、モルホリニルオキシ、テトラヒドロピラニル - C_{1-4} アルコキシ、ピリジニル - C_{1-4} アルコキシ、モルホリニル - C_{1-4} アルコキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、フェニル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-3} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-3}$ アルキル) $_2N - S(=O)_2 - O -$ は場合によりハロゲン、メトキシ、- OH、- NO_2 および C_{1-3}

アルキルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；

E はフリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびチアゾリルから選択され、ここで該フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびチアゾリルは場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-3}$ アルキル、フェニル、ベンジルおよびベンゼンスルホニルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；そして

D はフェニレン、ピリジレン、

【化 2】



から選択される、
請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 は -H およびメチルから選択され；

R^2 および R^3 はエチルおよびイソプロピルから選択され；

R^4 、 R^5 および R^6 は独立して -H、-OH、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 C_{1-6} アルキル、フェニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、テトラヒドロピラニルオキシ、ピリジニルオキシ、モルホリニルオキシ、テトラヒドロピラニル- C_{1-4} アルコキシ、ピリジニル- C_{1-4} アルコキシ、モルホリニル- C_{1-4} アルコキシ、フェノキシ、ベンジルオキシ、 C_{1-6} アルキル- $S(=O)_2-O-$ 、フェニル- $S(=O)_2-O-$ 、 C_{1-3} アルキル-NH- $S(=O)_2-O-$ および $(C_{1-3}$ アルキル) $_2N-S(=O)_2-O-$ から選択され；または

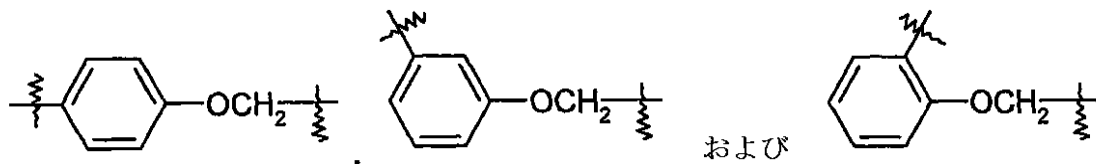
R^4 、 R^5 および R^6 から選択される何れか 2 個の隣接する基は $-O-CH_2-O-$ を形成し、ここで該フェノキシ、ベンジルオキシおよびフェニル- $S(=O)_2-O-$ は場合によりハロゲンおよびメトキシから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；

R^7 は -H および C_{1-3} アルコキシから選択され；

E はフリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびチアゾリルから選択され、ここで該フリル、チエニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびチアゾリルは場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 $-C(=O)-O-C_{1-3}$ アルキル、フェニル、ベンジルおよびベンゼンスルホニルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；そして

D は p-フェニレン、p-ベンジレン、

【化 3】



から選択される、
請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 は -H およびメチルから選択され；

R^2 および R^3 はエチルであり；

R^4 は -H、 NO_2 およびメトキシから選択され；

R^5 は -H、-Br、-F、-OH、メトキシ、メチルスルホニルオキシ、N,N-ジメチルスルファミルオキシから選択され；そして

R^6 は -H、-OH、 $-NO_2$ 、メトキシ、エトキシ、イソプロピルオキシ、ネオペンチルオキシ、シクロブチルオキシ、4-テトラヒドロ-2H-ピラニルオキシ、2-(4-モルホリノ)エトキシ、ベンジルオキシ、フェノキシ、4-フルオロフェノキシ、3-メトキシフェノキシ

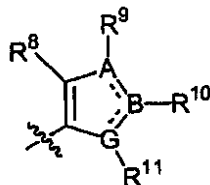
シ、4-メトキシフェノキシ、3-ピリジニルオキシ、メタンスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、ジメチルスルファミルオキシから選択され；または

R^4 、 R^5 および R^6 から選択される何れか2個の隣接する基は -O-CH₂-O- を形成し；

R^7 は -Hおよびメトキシから選択され；

Eは

【化4】



であり、ここでAおよびBは独立してC、NおよびSから選択され、そしてGはC、N、OおよびSから選択されるが、但しA、BおよびGのうち少なくとも1個はCであり、A、BおよびGのうち多くて1個はSであり、そしてAとBの結合がBとGの結合の一方は二重結合であり；

R^8 は -H、-Cl、メチル、-CO₂Meおよびフェニルから選択され；

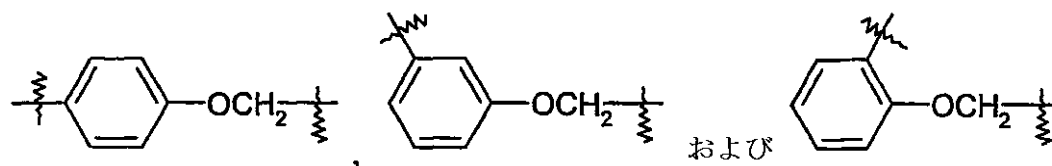
R^9 は -Hおよびメチルから選択され；

R^{10} は -H、メチル、n-ブチルおよびフェニルから選択され；

R^{11} は -H、メチル、ベンジルおよびベンゼンスルホニルから選択され；

Dは p-フェニレン、p-ベンジレン、

【化5】



から選択される、

請求項1記載の化合物。

【請求項5】

化合物12.1.1：N,N-ジエチル-2- { [2- (2-フリルメチル) - 6,7-ジメトキシ - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } ベンズアミド、

化合物12.1.2：2- { [6,7-ジメトキシ - 2- (チエン - 3-イルメチル) - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } - N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.3：N,N-ジエチル-3- { [2- (2-フリルメチル) - 6,7-ジメトキシ - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } ベンズアミド、

化合物12.1.4：3- { [6,7-ジメトキシ - 2- (チエン - 3-イルメチル) - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } - N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.5：N,N-ジエチル-4- { [2- (2-フリルメチル) - 6,7-ジメトキシ - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } ベンズアミド、

化合物12.1.6：4- { [6,7-ジメトキシ - 2- (チエン - 3-イルメチル) - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル]メトキシ } - N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.7：2- ({ 6,7-ジメトキシ - 2- [(2-フェニル - 1H-イミダゾール - 5-イル)メチル] - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル } メトキシ) - N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.8：4- ({ 6,7-ジメトキシ - 2- [(2-フェニル - 1H-イミダゾール - 5-イル)メチル] - 1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン - 1-イル } メチル) - N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.9：4- { 6,7-ジメトキシ - 2- [(2-フェニル - 1H-イミダゾール - 5-イ

ル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.10: N,N-ジエチル-4-{6-メトキシ-2-[(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.11: N,N-ジエチル-4-{7-メトキシ-2-[(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.12: N,N-ジエチル-4-{2-[(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.13: 4-{2-[(2-ブチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.14: 4-{2-[(2-ブチル-4-クロロ-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.15: 4-{6,7-ジメトキシ-2-[(2-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.16: 4-{6,7-ジメトキシ-2-[(3-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.17: 4-(6,7-ジメトキシ-2-{[1-(フェニルスルホニル)-1H-ピロール-2-イル]メチル}-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル)-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.18: N,N-ジエチル-4-{2-[(2-エチル-4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.19: 4-{6,7-ジメトキシ-2-[(4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.20: 4-{5,8-ジメトキシ-2-[(4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.21: N,N-ジエチル-4-[1,2,3,4-テトラヒドロ-6-メトキシ-2-[(4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1-イソキノリニル]-ベンズアミド、

化合物12.1.22: N,N-ジエチル-4-[2-(1H-イミダゾール-5-イルメチル)-6-メトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル]ベンズアミド、

化合物12.1.23: N,N-ジエチル-4-[2-(1H-イミダゾール-5-イルメチル)-6,7-ジメトキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル]ベンズアミド、

化合物12.1.24: 4-{6,7-ジメトキシ-2-[(5-フェニル-2-フリル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}-N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物12.1.25: N,N-ジエチル-4-{6-メトキシ-2-[(5-フェニル-2-フリル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.26: N,N-ジエチル-4-{7-ヒドロキシ-6-メトキシ-2-[(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.27: N,N-ジエチル-4-{7-ヒドロキシ-6-メトキシ-2-[(2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物 12.1.28 : 4 - { 2 - [(1 - ベンジル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 6,7 - ジメトキシ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.29 : 4 - { 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(1 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.30 : 4 - { 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(1 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.31 : 4 - ({ 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } メトキシ) - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.32 : 4 - ({ 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } メチル) - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.33 : 1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イルメタンスルホネート、

化合物 12.1.34 : 1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イルメタンスルホネート、

化合物 12.1.35 : 1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イルジメチルスルファメート、

化合物 12.1.36 : 1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 6 - イルジメチルスルファメート、

化合物 12.1.37 : 4 - { 2 - [(2,5 - ジメチル - 1,3 - チアゾール - 4 - イル)メチル] - 6,7 - ジメトキシ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.38 : 4 - { 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1,3 - チアゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.39 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.40 : N,N - ジエチル - 4 - [6 - メトキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 7 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル]ベンズアミド、

化合物 12.1.41 : 4 - { 7 - エトキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.42 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.43 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - メトキシ - 7 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.44 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.45 : メチル 5 - { [1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 6,7 - ジメトキシ - 3,4 - ジヒドロイソキノリン - 2(1H) - イル]メチル } - 1H - イミダゾール - 4 - カルボキシレート、

化合物 12.1.46 : 1 - { 4 - [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル } - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イルメタンスルホネート、

化合物 12.1.47 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 5,6,7,8 - テトラヒドロ[1,3]ジオキサソロ[4,5 - g]イソキノリン - 5 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.48 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 5,6,7,8 - テトラヒドロ[1,3]ジオキサソロ[4,5 - g]イソキノリン - 5 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.49 : 4 - { 6 - プロモ - 7 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.50 : 4 - { 6 - プロモ - 7 - メトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.51 : 4 - { 6,7 - ジメトキシ - 3 - メチル - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.52 : N,N - ジエチル - 4 - [2 - (1H - イミダゾール - 5 - イルメチル) - 6,7 - ジメトキシ - 3 - メチル - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル]ベンズアミド、

化合物 12.1.53 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 7 - ニトロ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.54 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 5 - ニトロ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.55 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 6,7,8,9 - テトラヒドロ[1,3]ジオキサソロ[4,5 - f]イソキノリン - 6 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.56 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 6,7,8,9 - テトラヒドロ[1,3]ジオキサソロ[4,5 - f]イソキノリン - 6 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.57 : N,N - ジエチル - 4 - { 5,6,7 - トリメトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.58 : N,N - ジエチル - 4 - { 5,6,7 - トリメトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 12.1.59 : 4 - { 7 - (シクロブチルオキシ) - 6 - メトキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 12.1.60 : N,N - ジエチル - 4 - [6 - メトキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 7 - (ネオペンチルオキシ) - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル]ベンズアミド、

化合物 12.1.61 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - フルオロ - 7 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物12.1.62: N,N-ジエチル-4- {6-フルオロ-7-メトキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物12.1.63: 1- {4- [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル} -6-メトキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イルジメチルスルファメート、

化合物13.1.1: N,N-ジエチル-4- [6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-7- (テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルオキシ)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル]ベンズアミド、

化合物14.1.1: N,N-ジエチル-4- {6-メトキシ-7-フェノキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物14.1.2: N,N-ジエチル-4- {6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-7-フェノキシ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物14.1.3: N,N-ジエチル-4- {7- (4-フルオロフェノキシ)-6-メトキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物14.1.4: N,N-ジエチル-4- {7- (4-フルオロフェノキシ)-6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物14.1.5: N,N-ジエチル-4- {6-メトキシ-7- (4-メトキシフェノキシ)-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物14.1.6: N,N-ジエチル-4- [6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-7- (ピリジン-3-イルオキシ)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル]ベンズアミド、

化合物15.1.1: 4- {7- (ベンジルオキシ)-6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル} -N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物16.4.1: N,N-ジエチル-4- {6-メトキシ-7- (3-メトキシフェノキシ)-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物16.4.2: N,N-ジエチル-4- {6-メトキシ-7- (4-メトキシフェノキシ)-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物16.4.3: 1- {4- [(ジエチルアミノ)カルボニル]フェニル} -6-メトキシ-2- [(5-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-7-イルベンゼンスルホネート、

化合物17.1.1: 4- {6,7-ジヒドロキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル} -N,N-ジエチルベンズアミド、

化合物17.1.2: N,N-ジエチル-4- {6-ヒドロキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物17.1.3: N,N-ジエチル-4- {7-ヒドロキシ-2- [(2-フェニル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-1-イル}ベンズアミド、

化合物17.1.4: N,N-ジエチル-4- [1,2,3,4-テトラヒドロ-6-ヒドロキシ-2- [(4-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)メチル]-1-イソキノリニル]-ベンズアミド、

化合物 17.1.5 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - ヒドロキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド

化合物 17.1.6 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - ヒドロキシ - 7 - フェノキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 17.1.7 : N,N - ジエチル - 4 - { 6 - ヒドロキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 7 - フェノキシ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 17.1.8 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - (4 - フルオロフェノキシ) - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 17.1.9 : N,N - ジエチル - 4 - { 7 - (4 - フルオロフェノキシ) - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 18.1.1 : 4 - { 2 - [(1,4 - ジメチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 6,7 - ジメトキシ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 18.1.2 : 4 - { 2 - [(1,5 - ジメチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 6,7 - ジメトキシ - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 19.1.1 : 4 - { 7 - エトキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(5 - メチル - 1H - イミダゾール - 4 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 20.1.1 : 4 - { (1S) - 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 20.2.1 : 4 - { (1R) - 6,7 - ジメトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } - N,N - ジエチルベンズアミド、

化合物 20.1.2 : N,N - ジエチル - 4 - { (1S) - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.2.2 : N,N - ジエチル - 4 - { (1R) - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.1.3 : N,N - ジエチル - 4 - { (1S) - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.2.3 : N,N - ジエチル - 4 - { (1R) - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.1.4 : N,N - ジエチル - 4 - { (1S) - 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.2.4 : N,N - ジエチル - 4 - { (1R) - 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.1.5 : N,N - ジエチル - 4 - { (1S) - 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン

- 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.2.5 : N,N - ジエチル - 4 - { (1R) - 7 - イソプロポキシ - 6 - メトキシ - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.1.6 : N,N - ジエチル - 4 - { (1S) - 6 - メトキシ - 7 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.2.6 : N,N - ジエチル - 4 - { (1R) - 6 - メトキシ - 7 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) - 2 - [(2 - フェニル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1,2,3,4 - テトラヒドロイソキノリン - 1 - イル } ベンズアミド、

化合物 20.1.7 : N,N - ジエチル - 4 - [(1S) - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1 - イソキノリニル] - ベンズアミド、

化合物 20.2.7 : N,N - ジエチル - 4 - [(1R) - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - 6 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1 - イソキノリニル] - ベンズアミド、

化合物 20.1.8 : N,N - ジエチル - 4 - [(1S) - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1 - イソキノリニル] - ベンズアミド、

化合物 20.2.8 : N,N - ジエチル - 4 - [(1R) - 1,2,3,4 - テトラヒドロ - 6 - ヒドロキシ - 2 - [(4 - メチル - 1H - イミダゾール - 5 - イル)メチル] - 1 - イソキノリニル] - ベンズアミド

から選択される化合物およびそれらの薬学的に許容しうる塩。

【請求項 6】

疼痛、不安症または機能性胃腸障害を治療するための薬剤の製造における請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の化合物および薬学的に許容しうる担体を含有する医薬組成物。

【請求項 8】

治療的に有効な量の請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の化合物を含む、疼痛の治療のための薬剤。

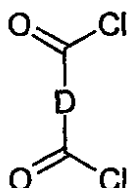
【請求項 9】

治療的に有効な量の請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の化合物を含む、機能性胃腸障害の治療のための薬剤。

【請求項 10】

式 III

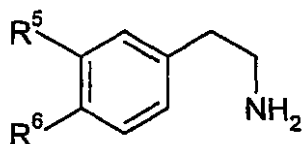
【化 6】



III

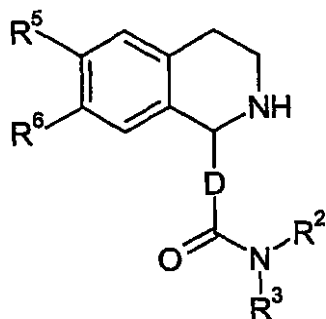
の化合物を HNR^2R^3 の存在下で式 IV

【化 7】

IV

の化合物と反応させる工程を含む式II

【化 8】

II

の化合物の製造法。

各式中、 R^2 および R^3 は独立して - Hおよび C_{1-6} アルキルから選択され；

R^5 および R^6 は独立して - H、- OH、ハロゲン、- NO_2 、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6}アルキル)_2N - S(=O)_2 - O -$ から選択され；または

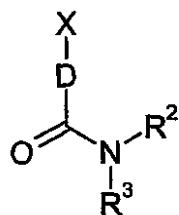
R^5 および R^6 は一緒になって式Iのベンゼン環と縮合している5 - または6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6}アルキル)_2N - S(=O)_2 - O -$ は場合によりハロゲン、 C_{1-3} アルコキシ、- OH、- NO_2 、 C_{1-3} アルキル、- NH_2 および - $CO_2 - C_{1-3}$ アルキルから選択される1個またはそれ以上の基で置換され；そして

Dはベンゼン環を含有する二価の基である。

【請求項 1 1】

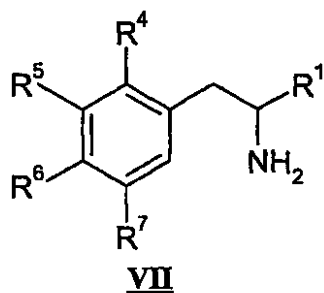
式VI

【化 9】

VI

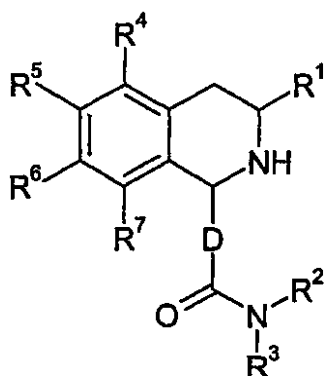
の化合物を酸触媒の存在下で式VII

【化 1 0】



の化合物と反応させる工程を含む式 V

【化 1 1】



V

の化合物の製造法。

各式中、X は -CH(OEt)₂、=CHOMe および -CHO から選択され；R¹ は -H および C₁₋₆ アルキル から選択され；R² および R³ は独立して -H および C₁₋₆ アルキル から選択され；

R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は独立して -H、-OH、ハロゲン、-NO₂、C₁₋₆ アルキル、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₆ シクロアルコキシ、C₃₋₆ ヘテロシクリル - オキシ、C₃₋₆ ヘテロシクリル - C₁₋₄ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリール - オキシ、C₆₋₁₀ アリール - C₁₋₄ アルコキシ、C₁₋₆ アルキル - S(=O)₂ - O -、C₆₋₁₀ アリール - S(=O)₂ - O -、C₁₋₆ アルキル - NH - S(=O)₂ - O - および (C₁₋₆ アルキル)₂N - S(=O)₂ - O - から選択され；または

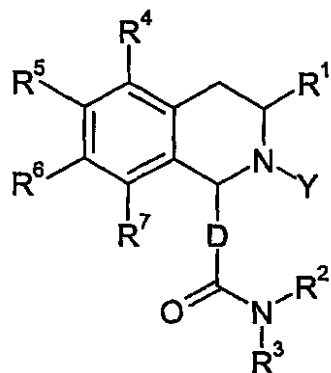
R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ から選択される何れか 2 個の隣接する基は式 I のベンゼン環と縮合している 5 - または 6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C₁₋₆ アルキル、C₆₋₁₀ アリール、C₁₋₆ アルコキシ、C₃₋₆ シクロアルコキシ、C₃₋₆ ヘテロシクリル - オキシ、C₃₋₆ ヘテロシクリル - C₁₋₄ アルコキシ、C₆₋₁₀ アリール - オキシ、C₆₋₁₀ アリール - C₁₋₄ アルコキシ、C₁₋₆ アルキル - S(=O)₂ - O -、C₆₋₁₀ アリール - S(=O)₂ - O -、C₁₋₆ アルキル - NH - S(=O)₂ - O - および (C₁₋₆ アルキル)₂N - S(=O)₂ - O - は場合によりハロゲン、C₁₋₃ アルコキシ、-OH、-NO₂、C₁₋₃ アルキル、-NH₂ および -CO₂ - C₁₋₃ アルキル から選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；そして

D はベンゼン環を含有する二価の基である。

【請求項 1 2】

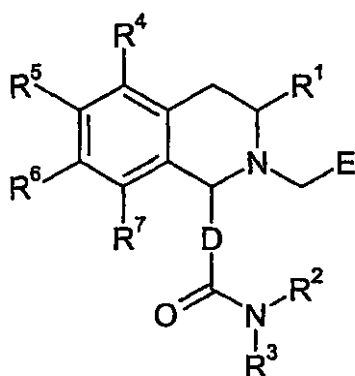
式 VIII

【化 1 2】

**VIII**

の化合物をE-CHOと反応させることからなる式 I

【化 1 3】

**I**

の化合物の製造法。

各式中、Y は -H および -C(=O)-O-t-ブチルから選択され；

R¹ は -H および C₁₋₆アルキルから選択され；R² および R³ は独立して -H および C₁₋₆アルキルから選択され；

R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は独立して -H、-OH、ハロゲン、-NO₂、C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₆アルコキシ、C₃₋₆シクロアルコキシ、C₃₋₆ヘテロシクリル-オキシ、C₃₋₆ヘテロシクリル-C₁₋₄アルコキシ、C₆₋₁₀アリール-オキシ、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₆アルキル-S(=O)₂-O-、C₆₋₁₀アリール-S(=O)₂-O-、C₁₋₆アルキル-NH-S(=O)₂-O- および (C₁₋₆アルキル)₂N-S(=O)₂-O- から選択され；または

R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ から選択される何れか 2 個の隣接する基は式 I のベンゼン環と縮合している 5 - または 6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₁₋₆アルコキシ、C₃₋₆シクロアルコキシ、C₃₋₆ヘテロシクリル-オキシ、C₃₋₆ヘテロシクリル-C₁₋₄アルコキシ、C₆₋₁₀アリール-オキシ、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₆アルキル-S(=O)₂-O-、C₆₋₁₀アリール-S(=O)₂-O-、C₁₋₆アルキル-NH-S(=O)₂-O- および (C₁₋₆アルキル)₂N-S(=O)₂-O- は場合によりハロゲン、C₁₋₃アルコキシ、-OH、-NO₂、C₁₋₃アルキル、-NH₂ および -CO₂-C₁₋₃アルキルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；

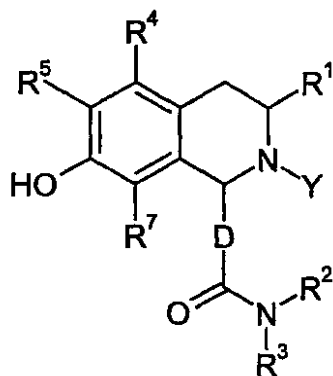
E は場合によりハロゲン、C₁₋₆アルキル、-C(=O)-O-C₁₋₆アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルキル および C₆₋₁₀アリール-S(=O)₂- から選択される 1 個またはそれ以上の基で置換される 5 - 員のヘテロシクリルであり；そして

D はベンゼン環を含有する二価の基である。

【請求項 1 3】

式 X

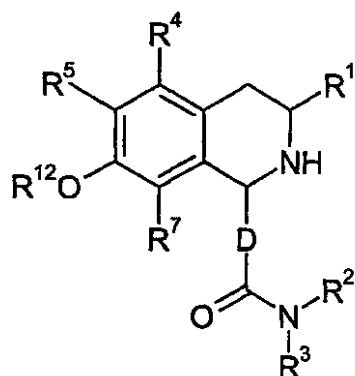
【化 1 4】



X

の化合物を $R^{12} - OH$ または $R^{12} - B(OH)_2$ と反応させることからなる式 IX

【化 1 5】



IX

の化合物の製造法。

各式中、Y は - H および - C(=O) - O - t - ブチルから選択され；

R^{12} は C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル、 C_{6-10} アリールおよび C_{3-6} ヘテロアリールから選択され、該 C_{6-10} アリール、 C_{3-6} ヘテロシクリルおよび C_{3-6} ヘテロアリールは場合によりハロゲン、 C_{1-3} アルコキシ、- OH、- NO_2 、 C_{1-3} アルキル、- NH_2 および - CO_2 - C_{1-3} アルキルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；

R^1 は - H および C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 および R^3 は独立して - H および C_{1-6} アルキルから選択され；

R^4 、 R^5 および R^7 は独立して - H、- OH、ハロゲン、- NO_2 、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6} \text{ アルキル})_2 N - S(=O)_2 - O -$ から選択され；または

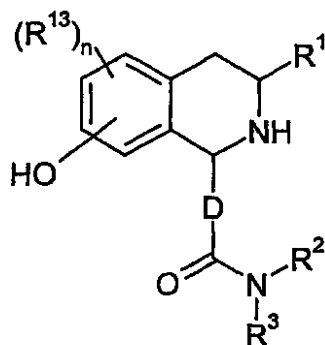
R^4 および R^5 は一緒になって式 I のベンゼン環と縮合している 5 - または 6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{6-10} アリール - $S(=O)_2 - O -$ 、 C_{1-6} アルキル - $NH - S(=O)_2 - O -$ および $(C_{1-6} \text{ アルキル})_2 N - S(=O)_2 - O -$ は場合によりハロゲン、 C_{1-3} アルコキシ、- OH、- NO_2 、 C_{1-3} アルキル、- NH_2 および - CO_2 - C_{1-3} アルキルから選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；そして

D はベンゼン環を含有する二価の基である。

【請求項 14】

式 XII

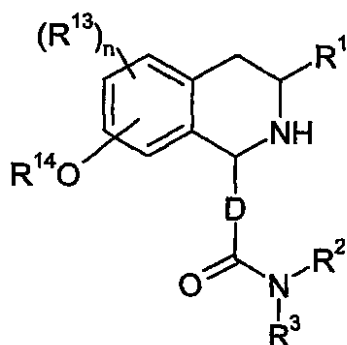
【化 16】

XII

の化合物を NsCl 、 NsBr または $(\text{CF}_3\text{CO})_2\text{O}$ と反応させて式 XI の $=\text{NH}$ 基を保護し；

保護化合物を $\text{R}^{14} - \text{Y}^1$ と反応させ、その後 $=\text{NH}$ 基を脱保護することからなる式 XI

【化 17】

XI

の化合物の製造法。

各式中、 n は 0、1、2 または 3 であり；

R^{13} はそれぞれ独立して $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $\text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ -、 C_{6-10} アリール - $\text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ -、 C_{1-6} アルキル - $\text{NH} - \text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ - および $(\text{C}_{1-6} \text{アルキル})_2\text{N} - \text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ - から選択され；または

何れか 2 個の隣接する R^{13} は式 I のベンゼン環と縮合している 5 - または 6 - 員環の一部を形成し、ここで該 C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} シクロアルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - オキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - オキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-6} アルキル - $\text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ -、 C_{6-10} アリール - $\text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ -、 C_{1-6} アルキル - $\text{NH} - \text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ - および $(\text{C}_{1-6} \text{アルキル})_2\text{N} - \text{S}(=\text{O})_2 - \text{O}$ - は場合によりハロゲン、 C_{1-3} アルコキシ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 C_{1-3} アルキル、 $-\text{NH}_2$ および $-\text{CO}_2 - \text{C}_{1-3}$ アルキル から選択される 1 個またはそれ以上の基で置換され；

Y^1 はハロゲンであり；

R^{14} は C_{1-6} アルキル - $\text{S}(=\text{O})_2 -$ 、 C_{6-10} アリール - $\text{S}(=\text{O})_2 -$ 、 C_{1-6} アルキル - $\text{NH} - \text{S}(=\text{O})_2 -$ および $(\text{C}_{1-6} \text{アルキル})_2\text{N} - \text{S}(=\text{O})_2 -$ から選択され；

R^1 は $-\text{H}$ および C_{1-6} アルキル から選択され；

R^2 および R^3 は独立して $-\text{H}$ および C_{1-6} アルキル から選択され；そして

D はベンゼン環を含有する二価の基である。