

【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21年11月19日(2009.11.19)

【公表番号】特表2009-511516(P2009-511516A)

【公表日】平成21年3月19日(2009.3.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-011

【出願番号】特願2008-534894(P2008-534894)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 413/14 C S P

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 495/04 1 0 5 A

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 11/16

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月28日(2009.9.28)

【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

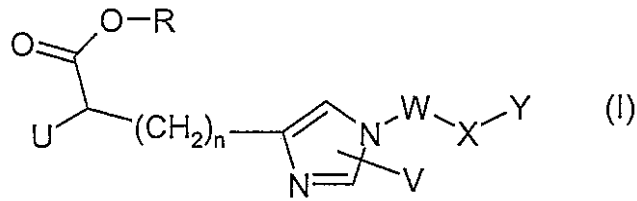
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



の化合物、または式 I の化合物の任意の立体異性体形態、または任意の比率のそれらの形態の混合物、または式 I の化合物の生理学的に受容可能な塩。

式中、

n が整数 0 または 1 であり、

U が、1) - (C₁ - C₆) - アルキレン - Z、

2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - Z、

3) - (C₁ - C₄) - アルキレン - H e t - Z (ここで、H e t は、互いに連結し、かつ、酸素、窒素および硫黄からなる群からの 1、2、3 または 4 個の同一または異なるヘテロ原子を含む、1、2 または 3 個の環系中に存在する 4 ~ 15 個の炭素原子を有する環系であり、該 H e t は、非置換であるか、または - (C₁ - C₄) - アルキルで一置換、二置換または三置換されている)、または

4) - (C₀ - C₂) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₁ - C₂) - Z (ここで、Z は塩基性窒素含有基である) であり、

R が、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル、

3) - (C₁ - C₆) - アルキレン - O H、

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、

5) - (C₁ - C₁₀) - アルキレン - O - C (O) - O - R 1、

6) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、非置換であるか、または互いに独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている)、または

7) - (C₀ - C₃) - アルキレン - H e t (ここで、H e t は、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている) であり、

V が、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₄) - アルキル、

3) ハロゲン、

4) - (C₆ - C₁₄) - アリール、

5) - N O₂、

6) - N H₂、

7) - O H、または

8) - C F₃ であり、

W が、- (C₁ - C₄) - アルキレン (ここで、アルキレンは、非置換であるか、またはハロゲンで置換されている) であり、

X が、環系が互いに連結し、かつ酸素、窒素および硫黄からなる群からの 1、2、3 または 4 個の同一かまたは異なるヘテロ原子を含み得る、1、2 または 3 個の環系中に存在する 5 ~ 13 個の炭素原子を含む 5 ~ 13 員環の芳香族複素環 (ここで、複素環は非置換であるか、または、独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている) であり、但し、X がピリジルであり、かつ Y が水素原子である場合は除き、

Y が、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立し

て、R 1で一置換、二置換または三置換されている)

3) - (C₁ - C₃) - ペルフルオロアルキル、

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₁₂) - シクロアルキル(ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)

5) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール(ここで、アリールは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、または

6) - (C₀ - C₄) - アルキレン - 複素環(ここで、該複素環は、環系が互いに連結し、かつ酸素、窒素および硫黄からなる群からの1、2、3または4個の同一かまたは異なるヘテロ原子を含み得る、1、2または3個の環系中に存在する5 ~ 13個の炭素原子を含む5 ~ 13員環の芳香族複素環であり、そして該複素環は非置換であるか、または、独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)であり、

nが整数0である場合、

Yが、1) - (C₁ - C₃) - ペルフルオロアルキル、

2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₁₂) - シクロアルキル(ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、

3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール(ここで、アリールは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、または

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - 複素環(ここで、該複素環は、上記定義の通りであり、そして該複素環は、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)であるか、または

nが整数1である場合、

R 1が、1) ハロゲン、

2) - NO₂、

3) - CN、

4) - N(R 2) - R 3(ここで、R 2およびR 3は、同一かまたは異なり、かつ互いに独立して、

1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル、

3) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール、

4) - (C₀ - C₃) - アルキレン - H e t(ここで、H e tは、上記定義の通りである)、または

5) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキルである)、

5) - OH、

6) - C(O) - O - R 4(ここで、R 4は、

1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル、

3) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール、

4) - (C₀ - C₃) - アルキレン - H e t(ここで、H e tは、上記定義の通りである)、または

5) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキルである)、

7) - C(O) - N(R 2) - R 3(ここで、R 2およびR 3は、同一かまたは異なり、かつ互いに独立して、上記定義の通りである)、

8) - O - CF₃、

9) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール(ここで、アリールは非置換であるか、または独立して、ハロゲン、- (C₁ - C₄) - アルキル、- (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロゲンまたは - O - (C₁ - C₈) - アルキルで一置換、二置換また

は三置換されている)、

10) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、

11) - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、ハロゲン、-NH₂、-OHまたはメトキシで一置換、二置換または三置換されている)、

12) - O - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、ハロゲン、-NH₂、-OHまたはメトキシで一置換、二置換または三置換されている)、

13) - O - (C₁ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、非置換であるか、または独立して、ハロゲン、- (C₁ - C₄) - アルキル、- (C₃ - C₈) - シクロアルキル、ハロゲンまたは - O - (C₁ - C₈) - アルキルで一置換、二置換または三置換されている)、

14) - SO₂ - CH₃、または

15) - SO₂ - CF₃

である。

【請求項2】

nが、整数0または1であり、

Uが、1) - (C₁ - C₄) - アルキレン - Z、

2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - Z、

3) - (C₁ - C₄) - アルキレン - H e t - Z (ここで、H e tは、アクリジニル、アゼピニル、アゼチジニル、ベンゾイミダザリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾテトラゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、カルボリニル、キナゾリニル、キノリニル、4H - キノリジニル、キノキサリニル、キヌクリジニル、シンノリニル、デカヒドロキノリニル、フラザニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリル、1H - インダゾリル、インドリニル、インドリジニル、インドリル、3H - インドリル、イソインダゾリル、イソインドリニル、イソインドリル、イソキノリニル、イソチアゾリジニル、2 - イソチアゾリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリジニル、2 - イソオキサゾリニル、ナフチリジニル、オクタヒドロイソキノリニル、オキサジアゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、オキサゾリジニル、オキサゾリル、オキサゾリジニル、フェナントリジニル、フェナントロリニル、フタラジニル、プテリジニル、プリニル、ピラゾリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリドオキサゾリル、ピリドイミダゾリル、ピリドチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリジニル、ピロリニル、2H - ピロリル、ピロリル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロピリジニル、6H - 1, 2, 5 - チアダジニル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、チアゾリル、チエノチアゾリル、チエノオキサゾリル、チエノイミダゾリル、チエノピリジニル、トリアジニル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、1, 2, 5 - トリアゾリルおよび1, 3, 4 - トリアゾリルからなる群から選択され、該H e tは、非置換であるか、または - (C₁ - C₃) - アルキル、- O - (C₁ - C₃) - アルキルまたは - CF₃で一置換または二置換されている)、または

4) - (C₀ - C₂) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₁ - C₂) - アルキレン - Z (ここで、Zは、アミノ、アミジノまたはグアニジノである)であり、

Rが、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル、

3) (C₃ - C₆) - シクロアルキル、

4) - (C₁ - C₁₀) - アルキレン - O - C(O) - O - R1、または

5) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、アントリル、フルオレニル、インダニル、ナフチル、フェニルおよびテトラヒドロナフタ

レニルからなる群から選択され、そして非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)であり、

Vが1)水素原子、

2) - (C₁ - C₄) - アルキル、

3) ハロゲン(ここで、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素 またはヨウ素からなる群から選択される)、

4) - (C₆ - C₁₄) - アリール(ここで、該アリールは、上記定義の通りである)、

5) - NO₂、

6) - NH₂、

7) - OH、または

8) - CF₃であり、

Wが、- (C₁ - C₄) - アルキレン(ここで、アルキレンは、非置換であるか、またはFまたはClで置換されている)であり、

Xが、アクリジニル、ベンゾイミダザリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフラニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾテトラゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイソチアゾリル、カルバゾリル、 α -カルボリニル、キナゾリニル、キノリジニル、キノキサリニル、クロマニル、クロメニル、シンノリニル、ジベンゾフラニル、ジベンゾチオフエニル、2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン、フリル、イミダゾリル、1H-インダゾリル、インドリニル、インドリジニル、インドリル、3H-インドリル、イソベンゾフラニル、イソキノリニル、イソクロマニル、イソインダゾリル、イソインドリニル、イソインドリル、イソチアゾリジニル、2-イソチアゾリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリジニル、2-イソオキサゾリニル、ナフチリジニル、オキサジアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,2,5-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピリミジニル、フェナントリジニル、フェナントレニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサチイニル、フェノキサジニル、フタラジニル、プテリジニル、プリニル、ピラジニル、ピロアゾリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリル、ピラダジニル、ピリドオキサゾリル、ピリドイミダゾリル、ピリドチアゾリル、ピリドチオフエニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、6H-1,2,5-チアダジニル、1,2,3-チアアジアゾリル、1,2,4-チアアジアゾリル、1,2,5-チアアジアゾリル、1,3,4-チアアジアゾリル、チアアントレニル、チアジニル、チエニル、チエノチアゾリル、チエノオキサゾリル、チエノイミダゾリル、チエノピリジニル、トリアジニル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,5-トリアゾリル、1,3,4-トリアゾリルおよびキサンテニルからなる群から選択される5~13員環の芳香族複素環(ここで、該複素環は、非置換であるか、または、独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)であり、但し、Xがピリジルであり、かつYが水素原子である場合を除き、

Yが、1)水素原子、

2) - (C₁ - C₈) - アルキル(ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、

3) - (C₃ - C₈) - シクロアルキル(ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、

4) - (C₁ - C₃) - ペルフルオロアルキル、

5) - (C₆ - C₁₄) - アリール(ここで、アリールは、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)、または

6) - (C₀ - C₄) - アルキレン-複素環(ここで、該複素環は、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R 1で一置換、二置換または三置換されている)であり、

nが整数0である場合、

- Y が、
- 1) - (C₁ - C₃) - ペルフルオロアルキル、
 - 2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル (ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている)、
 - 3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている)、または
 - 4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - 複素環 (ここで、該複素環は、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている) であるか、または
 - n が整数 1 である場合、
 - R 1 が、
- 1) ハロゲン (ここで、ハロゲンは、上記定義の通りである)、
 - 2) - NO₂、
 - 3) - CN、
 - 4) - N (R 2) - R 3 (ここで、R 2 および R 3 は、同一かまたは異なり、そして互いに独立して、
 - 1) 水素原子、
 - 2) - (C₁ - C₆) - アルキル、
 - 3) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、上記定義の通りである)、
 - 4) - (C₀ - C₃) - アルキレン - Het (ここで、Het は、上記定義の通りである)、または
 - 5) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル
 である)、
 - 5) - OH、
 - 6) - C (O) - O - R 4 (ここで、R 4 は、
 - 1) 水素原子、
 - 2) - (C₁ - C₆) - アルキル、
 - 3) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、上記定義の通りである)、
 - 4) - (C₀ - C₃) - アルキレン - Het (ここで、Het は、上記定義の通りである)、または
 - 5) - (C₀ - C₃) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル
 である)、
 - 7) - C (O) - N (R 2) - R 3 (ここで、R 2 および R 3 は、同一かまたは異なり、そして互いに独立して、上記定義の通りである)、
 - 8) - O - CF₃、
 - 9) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、ハロゲンまたは - O - (C₁ - C₈) - アルキルで一置換、二置換または三置換されており、ハロゲンは、上記定義の通りである)、
 - 10) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル、
 - 11) - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、ハロゲン、- NH₂、- OH またはメトキシで一置換、二置換または三置換されており、該ハロゲンは、上記定義の通りである)、
 - 12) - O - (C₁ - C₈) - アルキル (ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、ハロゲン、- NH₂、- OH またはメトキシで一置換、二置換または三置換されており、該ハロゲンは上記定義の通りである)、
 - 13) - O - (C₁ - C₄) - アルキレン - (C₆ - C₁₄) - アリール (ここで、アリールは、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、ハロゲンまたは

- O - (C₁ - C₈) - アルキルで一置換、二置換または三置換されており、ハロゲンは、上記定義の通りである)

14) - S O₂ - C H₃、または

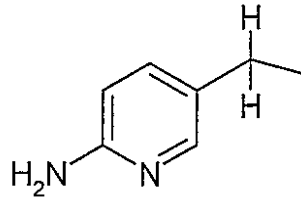
15) - S O₂ - C F₃

である、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 3】

U および Z が一緒になって、基：

【化 2】



となり、該基中のピリジル部分が、非置換であるか、またはメチルまたはエチルで置換されており、

n が整数 0 であり、

R が、水素原子または - (C₁ - C₄) - アルキルであり、

V が、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₃) - アルキル、または

3) フッ素、塩素もしくは臭素であり、

W が、- (C₁ - C₃) - アルキレンであり、

X が、5 ~ 13 員環の芳香族複素環（ここで、該複素環は、イソオキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、オキサゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、チエノピリジニルまたはチエニルからなる群から選択され、そして該複素環は、非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている）であり、

Y が 1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル（ここで、アルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている）、

3) - C F₃、

4) - (C₃ - C₆) - シクロアルキル（ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている）、

5) - (C₆ - C₁₄) - アリール（ここで、アリールは、インダニル、ナフチル、フェニルまたはテトラヒドロナフタレニルからなる群から選択され、該アリールは非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている）、または

6) 複素環（ここで、該複素環は、2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン、イソオキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、オキサゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、チエノピリジニルまたはチエニルからなる群から選択され、そして H e t は、非置換であるか、または独立して、R 1 で一置換、二置換または三置換されている）であり、そして

R 1 が、フッ素、塩素、臭素、- (C₁ - C₄) - アルキル、- (C₀ - C₄) - アルキレン - フェニル、- O - C H₃、- O - (C₁ - C₄) - アルキレン - フェニル（ここで、フェニルは、非置換であるか、またはフッ素、塩素、臭素または - O - (C₁ - C₄) - アルキルで一置換または二置換されている）、- (C₃ - C₆) - シクロアルキルまたは - C F₃ である、請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物。

【請求項4】

Uが、1) - (C₁ - C₄) - アルキレン - Z、
 2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - Z、または
 3) - (C₀ - C₂) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル - (C₁ - C₂) - アルキレン - Z (ここで、Zは、アミノ、アミジノまたはグアニジノである)であり、
 nが整数1であり、

Rが、水素原子または - (C₁ - C₄) - アルキルであり、

Vが、1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₃) - アルキル、または

3) フッ素、塩素もしくは臭素であり、

Wが - (C₁ - C₃) - アルキレンであり、

Xが、5 ~ 13員環の芳香族複素環 (ここで、該複素環は、イソオキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、オキサゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリルおよびチエノピリジニルからなる群から選択され、そして該複素環は、非置換であるか、または独立して、R1で一置換、二置換または三置換されている)であり、

Yが、1) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₆) - シクロアルキル (ここで、シクロアルキルは、非置換であるか、または独立して、R1で一置換、二置換または三置換されている)、

2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - フェニル (ここで、フェニルは、上記定義の通りであり、そして非置換であるか、または独立して、R1で一置換、二置換または三置換されている)、または

3) 5 ~ 13員環の芳香族複素環 (ここで、該複素環は、イソオキサゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、オキサゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、チエノピリジニルおよびチエニルからなる群から選択され、そして該複素環は、非置換であるか、または独立して、R1で一置換、二置換または三置換されている)であり、そして

R1が、フッ素、塩素、臭素、-O-CH₃または-CF₃である、

請求項1または2に記載の式Iの化合物。

【請求項5】

化合物が、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオフエン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - フェニルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [2 - (5 - クロロチオフエン - 2 - イル) チアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (6 - クロロチエノ [2, 3 - b] ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - メトキシフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (3 - メチルブチル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオフエン - 2 - イル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - クロロフェニル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - tert - ブチル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロプロピル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - フェニル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [3 - (3, 4 - ジメトキシフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [3 - (4 - メトキシフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [3 - (4' - イソプロピルフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [3 - (4' - tert - ブチルフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (2 - メチルチアゾール - 4 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (3, 4 - ジクロロフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [3 - (4 - メトキシフェニル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - フェニル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - メトキシフェニル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル } プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - チオフェン - 2 - イルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - tert - ブチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオ

ン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - (1 - {3 - [4 - (4 - クロロベンジルオキシ)フェニル] - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イルメチル} - 1H - イミダゾール - 4 - イル) プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (4 - ブロモチオフェン - 2 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (4 - フェニル - 5 - トリフルオロメチルチオフェン - 2 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸

、
3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - ブロモフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - p - トリルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - (1 - {2 - [5 - (5 - クロロチオフェン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イル] - エチル} - 1H - イミダゾール - 4 - イル) プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - イソブチルフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸

、
3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロペンチル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロブチル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸

、
3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロプロピルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロヘキシルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロヘキシル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (3 - メチルブチル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロブチルイソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 1H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - フルオロフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - ベンジルフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - tert - ブチルフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (4 - tert - ブチル - 2, 6 - ジメチルフェニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、

3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - {1 - [5 - (2 - クロロフェニル) イ

ソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - s e c - ブチルフェ
 ニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオ
 ン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - インダン - 5 - イルイソオ
 キサゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - シクロペンチルフェ
 ニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオ
 ン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - イソプロピルフェニ
 ル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン
 酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - ブチルフェニル) イ
 ソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - シクロヘキシルフェ
 ニル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオ
 ン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラ
 ヒドロナフタレン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾ
 ール - 4 - イル} プロピオン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - プロピルフェニル) イ
 ソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (4 - フェネチルフェニル
) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イル} プロピオン酸
 、
 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (2 , 3 - ジヒドロベンゾ
 [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダ
 ザール - 4 - イル} プロピオン酸、
 (S) - 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオ
 フェン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イ
 ル} プロピオン酸エチル、
 (R) - 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオ
 フェン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イ
 ル} プロピオン酸エチル、
 (S) - 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオ
 フェン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イ
 ル} プロピオン酸、
 (R) - 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - 2 - { 1 - [5 - (5 - クロロチオ
 フェン - 2 - イル) イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - イミダゾール - 4 - イ
 ル} プロピオン酸、
 6 - アミノ - 2 - [1 - (5 - シクロプロピル - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 -
 イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] ヘキサン酸、
 3 - (6 - アミノ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル) - 2 - [1 - (5 - シクロプロピ
 ル - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル
] プロピオン酸、
 3 - (4 - アミノシクロヘキシル) - 2 - [1 - (5 - シクロプロピル - [1 , 3 , 4
] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸また
 は
 3 - (4 - アミノシクロヘキシル) - 2 - [1 - (5 - シクロプロピル - [1 , 3 , 4
] チアジアゾール - 2 - イルメチル) - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] プロピオン酸

である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 6】

少なくとも 1 つの請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の有効含量と一緒に、薬学的に適切でかつ生理学的に許容される担体、添加物ならびに / または他の有効成分および賦形剤を含有する医薬。