

【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22年7月15日 (2010.7.15)

【公表番号】特表2009-541343(P2009-541343A)

【公表日】平成21年11月26日 (2009.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-047

【出願番号】特願2009-516686(P2009-516686)

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/38 (2006.01)

A 6 1 K 31/4166 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 233/38

A 6 1 K 31/4166

A 6 1 K 31/4178

C 0 7 D 405/04 C S P

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 7/02

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月28日 (2010.5.28)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 6】

(発明の要旨)

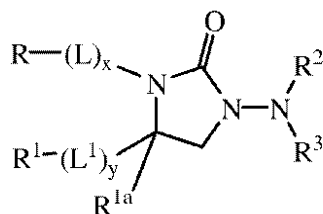
本発明の 1 - N - アミノ - 2 - イミダゾリジノン類は、新しいクラスの化合物である。このクラスの化合物は、K v 1 . 5 カリウムチャネル機能を阻害することが発見されている。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 I :

【化 4 0】



式 (I)

で表わされる化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R¹ は、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換された C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された C₃ - C₇ シクロアルキル、または必要に応じて置換されたヘテロアリールであり、

R^{1a} は、水素、または C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキルであり、

R² は、水素、または

i) - SO₂ [C (R^{5a} R^{5b})]_j R⁴ ;

ii) - C (O) [C (R^{5a} R^{5b})]_k R⁴ ; または

iii) - [C (R^{5a} R^{5b})]_n R⁴ から選択され、

R³ は、水素、または

i) C₁ - C₄ 直鎖または分岐状アルキル、または C₃ - C₇ シクロアルキル ;

ii) - SO₂ [C (R^{5a} R^{5b})]_j R⁴ ; または

iii) - [C (R^{5a} R^{5b})]_n R⁴ から選択され、あるいは

R² および R³ は、それらが結合する原子と一緒にあって、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成し、

R^{5a} および R^{5b} は、それぞれ独立して、水素または C₁ - C₄ 直鎖アルキルであり、

R⁴ は、

i) 水素 ;

ii) - N (R^{6a} R^{6b}) ;

iii) - SO₂ R⁷ ;

iv) - C (O) N (R^{8a} R^{8b}) ;

v) 必要に応じて置換された C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキル、または必要に応じて置換された C₃ - C₆ シクロアルキル ;

vi) 必要に応じて置換された C₂ - C₆ 直鎖または分岐状アルケニル ;

vii) 必要に応じて置換された C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルコキシ ;

viii) 必要に応じて置換された C₆ または C₁₀ アリール ;

ix) 必要に応じて置換された C₆ または C₁₀ アリールオキシ ;

x) 必要に応じて置換されたヘテロアリール ;

xi) 必要に応じて置換された複素環 ; または

xii) 必要に応じて置換された C (O) O (アリールアルキル) から選択され、

R^{6a} および R^{6b} は、それぞれ独立して、水素、必要に応じて置換された C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された C₃ - C₆ シクロアルキル、必要に

じて置換されたベンジル、必要に応じて置換されたフェニル、または $-C(O)OR^{7a}$ であり、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、それらが結合する原子と一緒に、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成し、

R^7 は、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または $N(R^{7a})_2$ であり、

R^{7a} は、出現毎に独立して、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、または必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、

R^{8a} および R^{8b} は、それぞれ独立して、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、あるいは R^{8a} および R^{8b} は、それらが結合する原子と一緒に、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成し、

L および L^1 は、独立して、 $-[C(R^{9a}R^{9b})]_m-$ であり、

R^{9a} および R^{9b} は、出現毎にそれぞれ独立して、水素またはメチル、あるいは R^{9a} および R^{9b} はそれらが結合する原子と一緒に、シクロプロピル環を形成し、

x および y は、独立して、0 または 1 であり、

m は、出現毎に独立して、0 ~ 4 であり、

j は、出現毎に独立して、0 ~ 4 であり、

k および n は、出現毎に独立して、0 ~ 3 である。)

(項目 2)

R^{1a} が水素である項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

R がパラ - 置換フェニルである項目 1 または 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 4)

R が、フェニル、4 - メチルフェニル、4 - (フルオロメチル)フェニル、4 - (ジフルオロメチル)フェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (フルオロメトキシ)フェニル、4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル、または 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニルである項目 1 または 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 5)

R が、4 - メトキシフェニルである項目 4 に記載の化合物。

(項目 6)

R^1 が、パラ - 置換フェニルである項目 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 7)

R^1 が、必要に応じてハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じてハロゲンで置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または必要に応じてハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルコキシから選択される 1 ~ 5 個の基で必要に応じて置換されたフェニルである項目 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

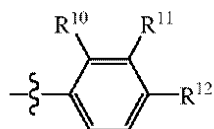
(項目 8)

R^1 が、3, 4 - ジメチルフェニル、4 - tert - ブチルフェニル、4 - シクロプロピルフェニル、4 - ジエチルアミノフェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル、または 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニルである項目 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載された化合物。

(項目 9)

R^1 が、式：

【化 4 1】



(式中、 R^{10} および R^{11} 、または R^{11} および R^{12} が、これらが結合する原子と一緒にあって、N、O または S から独立して選択される 1 個以上のヘテロ原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 5 ～ 7 個の原子を有する環を形成する。) で表わされる置換フェニルである項目 1 ～ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 10)

R^1 が、ベンゾ [1, 3] - ジオキソール - 4 - イル、2 - メチルベンゾ [1, 3] ジオキソール - 4 - イル、2, 2 - ジフルオロベンゾ [1, 3] ジオキソール - 4 - イル、2 - メチルベンゾ [1, 3] ジオキソール - 5 - イル、2, 2 - ジフルオロベンゾ [1, 3] - ジオキソール - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 5 - イル、2 - メチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] - ジオキシン - 5 - イル、2 - ヒドロキシメチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イル、2 - メチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イル、または 2 - ヒドロキシメチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イルである項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

R^2 および R^3 が、それらが結合する原子と一緒にあって、N、O または S から選択される 1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 3 ～ 7 個の環原子を有する環を形成する項目 1 ～ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 12)

R^2 および R^3 が、それらが結合する原子と一緒にあって、必要に応じて置換されたジオキシドイソチアゾリジニル、または必要に応じて置換されたピペラジニルを形成する項目 1 ～ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 13)

R^4 が、必要に応じて置換されたピペリジニル、必要に応じて置換されたピペラジニル、必要に応じて置換されたピラジニル、必要に応じて置換されたピリジニル、必要に応じて置換されたフラニル、必要に応じて置換されたイソキサゾリル、必要に応じて置換されたキノリニル、必要に応じて置換されたイミダゾリル、または必要に応じて置換されたモルホリニルである項目 1 ～ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 14)

R^2 が $-SO_2[C(R^{5a}R^{5b})]_jR^4$ であり、 j が 0 である項目 1 ～ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 15)

R^4 が、 $-N(R^{6a}R^{6b})$ 、 $C_1 - C_4$ の必要に応じて置換された直鎖または分岐状アルキル、または $C_3 - C_6$ の必要に応じて置換されたシクロアルキルである項目 14 に記載の化合物。

(項目 16)

R^4 が、 NH_2 、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、 n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 n - ブチル、イソ - ブチル、 $tert$ - ブチル、またはシクロブチルである項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

R^4 がメチルである項目 16 に記載の化合物。

(項目 18)

R^4 が、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 -

イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである項目 1 4 に記載の化合物。

(項目 1 9)

R^2 が $-SO_2 [C(R^{5a}R^{5b})]_j R^4$ であり、 j が 1 ~ 4 である項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 2 0)

R^4 が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換された複素環、または必要に応じて置換されたヘテロアリールである項目 1 9 に記載の化合物。

(項目 2 1)

R^2 が $-SO_2 CH_2 R^4$ であり、 R^4 は、フェニル、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、またはピラジン - 2 - イルである項目 1 9 に記載の化合物。

(項目 2 2)

R^2 が $-SO_2 [C(R^{5a}R^{5b})]_j R^4$ であり、 j が 1 であり、 R^{5a} および R^{5b} が、それぞれ、水素であり、 R^4 が $-C(O)N(R^{8a}R^{8b})$ であり、 R^{8a} および R^{8b} が、それぞれ独立して、水素、メチル、エチル、*n* - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n* - ブチル、*sec* - ブチル、イソ - ブチル、*tert* - ブチル、またはシクロプロピルメチルから選択される項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 2 3)

R^2 が、 $-SO_2 CH_2 C(O)NH_2$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)NHCH_3$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)NH(C_3H_5)$ 、または $-SO_2 CH_2 C(O)NHCH_2(C_3H_5)$ である項目 2 2 に記載の化合物。

(項目 2 4)

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_k R^4$ であり、 k が 0 であり、 R^4 が、必要に応じて置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルである項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 2 5)

R^4 が、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、(*N* - メチル - *N* - ベンジル) アミノメチル、(*N* - メチル - *N* - *tert* - ブトキシカルボニル) アミノメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、*n* - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n* - ブチル、イソ - ブチル、*tert* - ブチル、シクロプロピルメチル、またはシクロブチルである項目 2 4 に記載の化合物。

(項目 2 6)

R^2 が、 $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_k R^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリール、あるいは必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリールオキシであり、 k が 0 または 1 である項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 2 7)

R^4 が、フェニル、4 - フルオロ - フェニル、4 - クロロフェニル、4 - (トリフルオロメチル) フェニル、4 - メトキシフェニル、または 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニルである項目 2 6 に記載の化合物。

(項目 2 8)

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_k R^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリール、または必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ 複素環であり、 k が 0 ~ 2 である項目 1 ~ 1 0 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 2 9)

R^4 が、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピラジン - 2 - イル、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 -

メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである項目 28 に記載の化合物。

(項目 30)

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_kR^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換されたメトキシ、必要に応じて置換されたエトキシ、必要に応じて置換された n - プロポキシ、必要に応じて置換されたイソ - プロポキシ、必要に応じて置換された n - ブトキシ、必要に応じて置換されたイソ - ブトキシ、または必要に応じて置換された *tert* - ブトキシであり、 k が 1 または 2 である、項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 31)

R^2 が $-[C(R^{5a}R^{5b})]_nR^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアリールオキシ、必要に応じて置換された複素環、または必要に応じて置換されたヘテロアリールであり、 n が 1 または 2 である項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 32)

R^2 が $-CH_2R^4$ であり、 R^4 が、キノリン - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、4 - ジメチルアミノフェニル、4 - ジエチルアミノフェニル、4 - フルオロフェニル、4 - クロロフェニル、4 - (イミダゾール - 1 - イル) フェニル、または 4 - シアノフェニルである項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 33)

R^2 が、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)$ シクロプロピル、 $C(O)OC(CH_3)_3$ 、 $C(O)CH_2N(CH_3)$ ベンジル、 $C(O)CH_2N(CH_3)C(O)OR^{7a}$ 、 $-C(O)$ フラン - 2 - イル、 $C(O)C_6H_5$ 、 $C(O)CH_2C_6H_5$ 、 $C(O)CH_2OC_6H_5$ 、 $-C(O)$ イソオキサゾール - 5 - イル、 $-C(O)$ ピラジン - 2 - イル、 $-CH_2$ (シクロプロピル)、 $CH_2C_6H_5$ 、 $CH_2CH_2C_6H_5$ 、 $CH_2C_6H_4(4-CN)$ 、 $CH_2C_6H_4(4-F)$ 、 $-CH_2C_6H_4[4-N(CH_3)_2]$ 、 $-CH_2C_6H_4[4-N(C_2H_5)_2]$ 、 $-CH_2C_6H_4[4-イミダゾリル]$ 、 $-CH_2$ (イミダゾール - 1 - イル)、 $-CH_2$ (ピリジン - 2 - イル)、 CH_2 (ピリジン - 3 - イル)、または CH_2 (ピリジン - 4 - イル) であり、 R^{7a} が、*tert* - ブチルである項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 34)

R^2 が、 SO_2R^4 、 $SO_2CH_2C(O)N(R^{8a}R^{8b})$ 、 $SO_2[C(R^{5a}R^{5b})]_jSO_2-R^7$ 、または $SO_2[C(R^{5a}R^{5b})]_jR^4$ である項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 35)

x が 1 であり、 L が $-CH_2CH_2-$ である項目 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 36)

x が 1 であり、 L が、 $-CH_2-$ または $-CH_2CH_2CH_2-$ である項目 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 37)

y が 1 であり、 L^1 が $-C(R^{9a}R^{9b})-$ である項目 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 38)

R^{9a} および R^{9b} がそれぞれ水素である項目 37 に記載の化合物。

(項目 39)

R^{9a} および R^{9b} が、それらが結合する原子と一緒にあって、シクロプロピルを形成する項目 37 に記載の化合物。

(項目 40)

y が 0 である項目 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 4 1)

x が 1 であり、L が -CH₂CH₂- であり、y が 0 である項目 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 4 2)

R^2 が、水素、 SO_2R_4 、 $SO_2CH_2C(O)N(R^8aR^8b)$ 、 $SO_2[C(R^5aR^5b)]_j$ 、 SO_2-R^7 、または $SO_2[C(R^5aR^5b)]_jR^4$ であり、 R^4 が、 $-NH_2$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_3$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CHF_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、シクロプロピル、 $-CH=CH_2$ 、 CHF_2 、 $CHCl_2$ 、 $-CH_2CN$ 、(ピリジン-2-イル)、(ピリジン-3-イル)、(ピリジン-4-イル)、または $-C_6H_5$ であり、

R^{8a} が、水素、-CH₃、-シクロプロピル、または-CH₂（シクロプロピル）であ
り、

R^{8b} が、水素、-CH₃、-シクロプロピル、または-CH₂（シクロプロピル）であり、

R^{5a} が水素であり、

R^{5b} が水素であり、

R⁷ が、-CH₃、-CH₂CH₃、-CH₂CH₂CH₃、-CH₂CH₂CH₂CH₃、または-シクロプロピルであり、

j が 0、1 または 2 である項目 1 に記載の化合物。

(項目 4 3)

R^3 が、水素またはメチルである項目 42 に記載の化合物。

(項目 4 4)

R および R¹ が、ハロゲンまたは C₃ - C₆ シクロアルキルで必要に応じて置換された C₁ - C₄ 直鎖または分岐状アルキル、C₃ - C₆ シクロアルキル、-OR¹₃、-CN、-N(R¹₃)₂、-CO₂R¹₃、-C(O)N(R¹₃)₂、-NR¹₃C(O)R¹₃、-NO₂、または-SO₂R¹₃ から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で必要に応じて置換されたフェニルから独立して選択され、各 R¹₃ は、独立して、水素、C₁ - C₄ 直鎖または分岐状アルキル、C₁ - C₄ 直鎖または分岐状ハロアルキルまたは C₃ - C₆ シクロアルキルから選択され、あるいは 2 個の R¹₃ 単位が、それらが結合する原子と一緒に、3 ~ 7 個の環原子を含み、N、O または S から独立して選択される 1 個以上の追加のヘテロ原子を必要に応じて含有する環を形成する項目 4.2 に記載の化合物。

(項目 4 5)

R が、フェニルまたは 4 - メトキシフェニルであり、R¹ が、4 - tert - ブチルフ
 エニル、4 - シクロプロピルフェニル、3 , 4 - ジメチルフェニル、4 - メトキシフェニ
 ル、4 - ジフルオロメトキシフェニル、4 - イソプロポキシフェニル、4 - (ジエチルア
 ミノ) フェニル、ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル、2 , 2 - ジフルオロベンゾ
 [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル、2 , 2 - ジメチルベンゾ [1 , 3] ジオキソール -
 5 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル、4 - ジフルオロ
 メトキシフェニル、または 4 - メトキシフェニルである項目 1 に記載の化合物。

(項 目 4 6)

アルキル、ベンジル、アルケニル、アリール、アリールオキシ、アルコキシ、ヘテロアリール、複素環基が、 $-OR^{15}$ ； $-C(O)R^{15}$ ； $-C(O)OR^{15}$ ； $-C(O)N(R^{15})_2$ ； $-N(R^{15})_2$ ； $-NR^{15}COR^{15}$ ；ハロゲン； $-SO_2R^{15}$ ；必要に応じて C_3-C_6 シクロアルキルまたはハロゲンで置換された C_1-C_6 直鎖または分岐状アルキル； C_3-C_6 シクロアルキル；シアノ；ニトロ；オキソ；ヘテロアリール；または複素環から独立して選択される1～5個の置換基で必要に応じて置換され、ここで、2個の R^{15} 単位は、それらが結合する原子と一緒にあって、3～7個の環原子を含み、N、OまたはSから独立して選択される1個以上の追加のヘテロ原子を必要に

じて含有する環を形成することができ、あるいは各 R^{1-5} は、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、 $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状ハロアルキル、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルである項目 1 に記載の化合物。

(項目 47)

R^2 および R^3 が同時に水素ではない項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 48)

R^2 および R^3 のうちの 1 つが、水素、または必要に応じて置換されたアルキルである場合、 R^2 および R^3 のうちのもう 1 つが、水素、または必要に応じて置換されたアルキルではない項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 49)

R^2 または R^3 が $-[C(R^{5a}R^{5b})]_nR^4$ である場合、 R^4 はアリーロキシではない項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

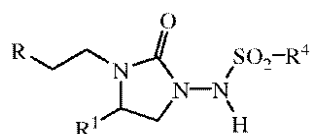
(項目 50)

R^2 および R^3 が一緒になって、必要に応じて置換された 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成する場合、 R は、少なくとも 1 個のアルコキシ置換基で必要に応じて置換されたフェニルである項目 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

(項目 51)

式 (XI) :

【化 42】



式 (XI)

で表わされる項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、 R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R^1 は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R^4 は、

i) 水素；

ii) 必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、あるいは $C_3 - C_6$ シクロアルキル；

iii) 必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリール；

iv) 必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリール；または

v) 必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ 複素環から選択される。)

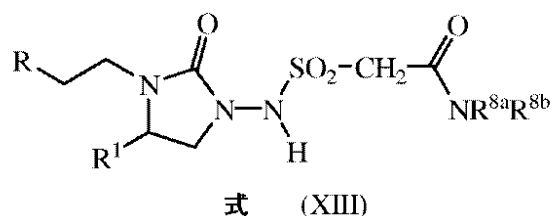
(項目 52)

R^4 が、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、 n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 n - ブチル、イソ - ブチル、 $tert$ - ブチル、シクロブチル、フェニル、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イルおよびピラジン - 2 - イル、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである項目 51 に記載の化合物。

(項目 53)

式 (XIII) :

【化 4 3】



で表わされる項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

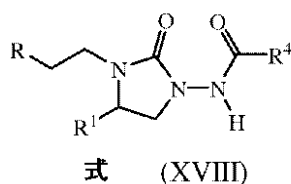
R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁸ᵃ および R⁸ᵇ は、それぞれ独立して、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、sec - ブチル、イソ - ブチル、tert - ブチル、またはシクロプロピルメチルである。)

(項目 5 4)

式 (XVII) :

【化 4 4】



で表わされる項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

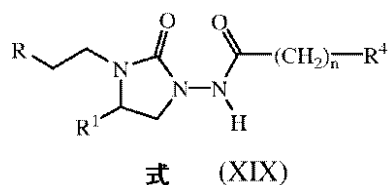
R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁴ は、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、アミノメチル、(N - メチル)アミノメチル、(N, N - ジメチル)アミノ - メチル、(N - メチル - N - ベンジル)アミノメチル、(N - メチル - N - tert - ブトキシカルボニル) - アミノメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、イソ - ブチル、tert - ブチル、シクロプロピルメチル、またはシクロブチルである。)

(項目 5 5)

式 (XIX) :

【化 4 5】



で表わされる項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁴ は、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、イソ - プロポキシ、n - ブトキシ、イソ - ブトキシ、tert - ブトキシ、フェニル、4 - フルオロフェニル、4 - クロロフェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール -

1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピラジン - 2 - イル、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである。)

(項目 56)

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 57)

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - シクロプロピル) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) ベンジル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 - メチル - 4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 - メトキシ - 4 - メチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - イソプロピルオキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (2 , 2 - ジフルオロベンゾ - [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (2 , 2 - ジメチルベンゾ - [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) メチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4

- メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 (4 - クロロフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 [(4 - ジエチルアミノ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] -
 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] -
 4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4
 - (tert - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (シクロプロピルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] -
 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (プロピルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4
 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (ブチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4
 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (ブチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [4
 - (tert - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (ビニルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 -
 [(2 , 3 - ジヒドロベンゾ - [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジ
 ノン ;
 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル
] - 4 - (4 - シクロプロピル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル
] - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル
] - 4 - (4 - tert - ブチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル
] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2
 - イミダゾリジノン ;
 1 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエタンスルホニルアミノ) - 4 - [4 - (tert - ブ
 チル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジ
 ノン ;
 1 - (クロロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル]
 - 4 - (4 - tert - ブチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (シアノメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル]
 - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 -
 イミダゾリジノン ;
 1 - (シアノメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル]
 - 4 - [(4 - メトキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [(N - 3 - ピリジニルメチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフ
 エニル) エチル] - 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エ

チル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メタンスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - イミダゾリジン - 2 - オン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 5 8)

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - シクロプロピル) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 5 9)

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキシエチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

;

1 - { [2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ({ [(2 , 2 - ジメチル - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノ] - 2 - オキシエチル } スルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ]

ノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

(S) - 1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (シクロブチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [[2 - [(ビス (メトキシエチル) アミノ)] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 0)

1 - [(メチルスルホニルメチル) スルホニル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(N - メチル - N - メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(N - メトキシエチル - N - メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(N - メチル - N - フェニルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 1)

{ 2 - オキシ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - イミダゾリジン - 1 - イル } - ウレア ;

1 - (アセチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アセチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - tert - ブチル) ベンジル] - 2 - イミダゾリジノン ;

シクロプロパンカルボン酸 { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - アミド ;

1 - シクロプロパンカルボニルアミノ - 4 - [4 - (tert - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (2 - フラノイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (ベンゾイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - フェノキシアセトアミド ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 , 4 - ジメチルフェニル)] - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - フェニル - アセトアミド ;

1 - (イソオキサゾール - 5 - イルカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (イソオキサゾール - 5 - イルカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [4 - (tert - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

;

1 - (メトキシカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

2 - (ベンジルメチルアミノ) - N - { 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - アセトアミド ; または

N - (4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - (4 - メトキシフェネチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 2 - (N , N - ジメチルスルファモイル) アセトアミド ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 2)

1 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ベンジルアミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ベンジルアミノ - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - フルオロフェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - シアノフェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - (t e r t - ブチル) フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(キノリン - 2 - イルメチル) - アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルエチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - N - [2 - (イミダゾール - 1 - イル) エチル] - N - [アセチル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - N - [2 - (イミダゾール - 1 - イル) エチル] - N - [イソ - ブチリル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキソエチル) スルホニルアミノ] - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン

i

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 3)

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - tert - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - tert - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - tert - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (3, 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - tert - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 4)

1 - アミノ - 4 - [4 - (tert - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (スルファモイルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (9H - フルオレン - 9 - イルメトキシ) - 2 - オキソエチル] スルホニル

アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メタンスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - イミダゾリジン - 2 - オン ;

4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - イミダゾリジン - 2 - オン ;

{ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル ;

4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - [(キノリン - 3 - イルメチル) - アミノ] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[(ジメチルアミノ) スルホニル] アセチルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - { [2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 5)

N - { (4 S) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

t e r t - ブチル [2 - ({ 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } アミノ) - 2 - オキソエチル] メチルカルバメート ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 , 4 - ジエチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - ピペラジン - 1 - イルイミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 3 - [2 - (4 - エトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - (メチルスルホニル) エタンスルホンアミド ;

2 - ({ 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) アセトアミド ;

4 - { 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - N - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

N - [4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - { 4 - [2 - (ジメチルアミノ) エトキシ] フェニル } エチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル] メタンスルホンアミド ;

1 - アミノ - 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 1 - { [2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) エチル] アミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - ピリジン - 3 - イルアセトアミド ;
4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 1 - { [4 - (ジエチルアミノ) ベンジル] アミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - (1 , 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - モルホリン - 4 - イルエタンスルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド ;

1 - シアノ - N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { 4 - ブチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

1 - アミノ - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

4 - { 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - N , N - ジメチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

2 - (N - (4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - (4 - メトキシフェネチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) スルファモイル) - N - (2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - N - メチルアセトアミド ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - 4 - (1 - フェニルシクロプロピル) イミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド ;

メチル 3 - アミノ - 4 - ({ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } アミノ) ベンゾエート ;

N - (シクロプロピルメチル) - 2 - ({ (4 R) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) アセトアミド ;

N - { 4 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - { [(1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル] アミノ } イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - 4 - (1 - フェニル

シクロプロピル)イミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
 1 - アミノ - 4 - [4 - (2 - メトキシエトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]イミダゾリジン - 2 - オン;
 N - [3 - { 2 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]エチル } - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル]メタンスルホンアミド;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソ - 4 - キノリン - 6 - イルイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
 N - { 4 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル) - 3 - [2 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
 N - { 4 - シクロヘキシル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
 tert - ブチル { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } [2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル]カルバメート;
 N - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } ピラジン - 2 - カルボキサミド;
 N - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 , 1 , 1 - トリフルオロメタンスルホンアミド;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド;
 4 - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } ビピラジン - 1 - カルボキサミド;
 N - { 4 - [4 - (2 - メトキシエトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド;
 N - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソ - 3 - { 2 - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチル }イミダゾリジン - 1 - イル]メタンスルホンアミド;
 N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル)メタンスルホンアミド;
 1 - アミノ - 3 - { 2 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]エチル } - 4 - (4 - メトキシフェニル)イミダゾリジン - 2 - オン;
 1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 4 - (1 - フェニルシクロプロピル)イミダゾリジン - 2 - オン;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - N - [(1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)メチル]メタンスルホンアミド;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド;
 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 1 - { [(1 - オキシドピリジン - 4 - イル)メチル]アミノ }イミダゾリジン - 2 - オン;
 N - { 4 , 4 - ジエチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド;
 1 - アミノ - 4 - [1 - (4 - フルオロフェニル)シクロプロピル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]イミダゾリジン - 2 - オン;
 N - { 4 - [1 - (4 - フルオロフェニル)シクロプロピル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]

] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル} - 4 - メチルピペラジン - 1 - スルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } スルファミド ;

N - [4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - { 2 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) フェニル] エチル } - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル] メタンズルホンアミド ; または

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - (ジメチルスルファモイル) アセトアミド ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 6)

tert - ブチル { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } (キノリン - 3 - イルメチル) カルバメート ;

tert - ブチル ({ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) カルバメート ;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - フェニルプロピル) イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - N - (フェニルスルホニル) ベンゼンスルホンアミド ;

1 - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニルウレア ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - ブチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンズルホンアミド ;

1 - アミノ - 4 - (4 - イソ - プロボキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ; または

2 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - イル) - N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - オキシエタンズルホンアミド ;

1 - [(N - メチル - N - ベンジルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 7)

1 - アミノ - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

N - { (4 S) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)

エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
t e r t - ブチル { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } (キノリン - 3 - イルメチル)
カルバメート ;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジン ;

1 - [[2 - [(ビス (メトキシエチル) アミノ)] - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジン ;

N - { (4 R) - 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { (4 S) - 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { (4 R) - 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { (4 S) - 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

[[[4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル] アミノ] スルホニル] 酢酸 ;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジン ;

1 - (スルファモイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジン ;

1 - ({ [(2 , 2 - ジメチル - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノ] - 2 - オキソエチル } スルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジン ;

N - { 4 - (シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - ジメチルスルファモイル - アセトアミド ; または

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキソエチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジン ;

である項目 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(項目 6 8)

有効量の 1 種以上の項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物と、1 種以上の賦形剤とを含む組成物。

(項目 6 9)

心房不整脈を治療または予防するための方法であって、有効量の項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物を対象に投与することを含む方法。

(項目 7 0)

血栓塞栓症、卒中、または心不全を治療または予防するための方法であって、有効量の項目 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物を対象に投与することを含む方法。

(項目 7 1)

項目 1 ～ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物の医薬品としての使用。

(項目 7 2)

心房不整脈を治療または予防するための医薬品の製造における項目 1 ～ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。

(項目 7 3)

血栓塞栓症、卒中または心不全を治療または予防するための医薬品の製造における項目 1 ～ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。

【 手続補正 2 】

【 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

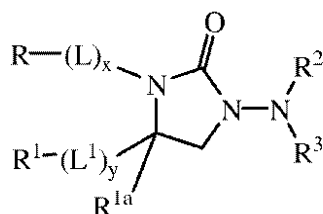
【 補正の内容 】

【 特許請求の範囲 】

【 請求項 1 】

式 I :

【 化 4 0 】



式 (I)

で表わされる化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、 R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R¹ は、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換された C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された C₃ - C₇ シクロアルキル、または必要に応じて置換されたヘテロアリールであり、

R^{1a} は、水素、または C₁ - C₆ 直鎖または分岐状アルキルであり、

R² は、水素、または

i) - SO₂ [C (R^{5a} R^{5b})]_j R⁴ ;

ii) - C (O) [C (R^{5a} R^{5b})]_k R⁴ ; または

iii) - [C (R^{5a} R^{5b})]_n R⁴ から選択され、

R³ は、水素、または

i) C₁ - C₄ 直鎖または分岐状アルキル、または C₃ - C₇ シクロアルキル ;

ii) - SO₂ [C (R^{5a} R^{5b})]_j R⁴ ; または

iii) - [C (R^{5a} R^{5b})]_n R⁴ から選択され、あるいは

R² および R³ は、それらが結合する原子と一緒にあって、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 3 ～ 7 個の環原子を有する環を形成し、

R^{5a} および R^{5b} は、それぞれ独立して、水素または C₁ - C₄ 直鎖アルキルであり、

R⁴ は、

i) 水素 ;

ii) - N (R^{6a} R^{6b}) ;

iii) - SO₂ R⁷ ;

iv) - C (O) N (R^{8a} R^{8b}) ;

v) 必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、または必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル；

vi) 必要に応じて置換された $C_2 - C_6$ 直鎖または分岐状アルケニル；

vii) 必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルコキシ；

viii) 必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリール；

ix) 必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリールオキシ；

x) 必要に応じて置換されたヘテロアリール；

xi) 必要に応じて置換された複素環；または

xii) 必要に応じて置換された $C(O)O$ (アリールアルキル) から選択され、
 R^{6a} および R^{6b} は、それぞれ独立して、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、必要に応じて置換されたベンジル、必要に応じて置換されたフェニル、または $-C(O)OR^{7a}$ であり、あるいは R^{6a} および R^{6b} は、それらが結合する原子と一緒に、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成し、
 R^7 は、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または $N(R^{7a})_2$ であり、
 R^{7a} は、出現毎に独立して、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、または必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり、
 R^{8a} および R^{8b} は、それぞれ独立して、水素、必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じて置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、あるいは R^{8a} および R^{8b} は、それらが結合する原子と一緒に、N、O または S から選択される、1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成し、
 L および L^1 は、独立して、 $-[C(R^{9a}R^{9b})]_m-$ であり、
 R^{9a} および R^{9b} は、出現毎にそれぞれ独立して、水素またはメチル、あるいは R^{9a} および R^{9b} はそれらが結合する原子と一緒に、シクロプロピル環を形成し、
 x および y は、独立して、0 または 1 であり、
 m は、出現毎に独立して、0 ~ 4 であり、
 j は、出現毎に独立して、0 ~ 4 であり、
 k および n は、出現毎に独立して、0 ~ 3 である。)

【請求項 2】

R^{1a} が水素である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R がパラ - 置換フェニルである請求項 1 または 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 4】

R が、フェニル、4 - メチルフェニル、4 - (フルオロメチル)フェニル、4 - (ジフルオロメチル)フェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (フルオロメトキシ)フェニル、4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル、または 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニルである請求項 1 または 2 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 5】

R が、4 - メトキシフェニルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 が、パラ - 置換フェニルである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が、必要に応じてハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、必要に応じてハロゲンで置換された $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または必要に応じてハロゲンで置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルコキシから選択される 1 ~ 5 個の基で必要に応じて置換されたフェニルである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

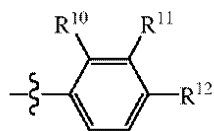
【請求項 8】

R¹ が、3, 4 - ジメチルフェニル、4 - tert - ブチルフェニル、4 - シクロプロピルフェニル、4 - ジエチルアミノフェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル、または 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニルである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載された化合物。

【請求項 9】

R¹ が、式：

【化 4 1】



(式中、R¹⁰ および R¹¹、または R¹¹ および R¹² が、これらが結合する原子と一緒に、N、O または S から独立して選択される 1 個以上のヘテロ原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 5 ~ 7 個の原子を有する環を形成する。) で表わされる置換フェニルである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 10】

R¹ が、ベンゾ [1, 3] - ジオキソール - 4 - イル、2 - メチルベンゾ [1, 3] ジオキソール - 4 - イル、2, 2 - ジフルオロベンゾ [1, 3] ジオキソール - 4 - イル、2 - メチルベンゾ [1, 3] ジオキソール - 5 - イル、2, 2 - ジフルオロベンゾ [1, 3] - ジオキソール - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 5 - イル、2 - メチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] - ジオキシン - 5 - イル、2 - ヒドロキシメチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イル、2 - メチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イル、または 2 - ヒドロキシメチル - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ジオキシン - 6 - イルである請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R² および R³ が、それらが結合する原子と一緒に、N、O または S から選択される 1 個以上の追加のヘテロ原子の環原子を必要に応じて含む、必要に応じて置換された 3 ~ 7 個の環原子を有する環を形成する請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 12】

R² および R³ が、それらが結合する原子と一緒に、必要に応じて置換されたジオキシドイソチアゾリジニル、または必要に応じて置換されたピペラジニルを形成する請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 13】

R⁴ が、必要に応じて置換されたピペリジニル、必要に応じて置換されたピペラジニル、必要に応じて置換されたピラジニル、必要に応じて置換されたピリジニル、必要に応じて置換されたフラニル、必要に応じて置換されたイソキサゾリル、必要に応じて置換されたキノリニル、必要に応じて置換されたイミダゾリル、または必要に応じて置換されたモルホリニルである請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 14】

R² が、-SO₂[C(R^{5a}R^{5b})]_jR⁴ であり、j が 0 である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 15】

R⁴ が、-N(R^{6a}R^{6b})、C₁ - C₄ の必要に応じて置換された直鎖または分岐状アルキル、または C₃ - C₆ の必要に応じて置換されたシクロアルキルである請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

R⁴ が、NH₂、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2

- トリクロロエチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、またはシクロブチルである請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

R^4 がメチルである請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

R^4 が、ピペリジン-1-イル、4-メチルピペリジン-1-イル、ピペラジン-1-イル、4-メチルピペラジン-1-イル、またはモルホリン-4-イルである請求項14に記載の化合物。

【請求項19】

R^2 が $-SO_2 [C(R^{5a} R^{5b})]_j R^4$ であり、 j が1~4である請求項1~10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項20】

R^4 が、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換された複素環、または必要に応じて置換されたヘテロアリールである請求項19に記載の化合物。

【請求項21】

R^2 が $-SO_2 CH_2 R^4$ であり、 R^4 は、フェニル、フラン-2-イル、イソオキサゾール-5-イル、イミダゾール-1-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、またはピラジン-2-イルである請求項19に記載の化合物。

【請求項22】

R^2 が $-SO_2 [C(R^{5a} R^{5b})]_j R^4$ であり、 j が1であり、 R^{5a} および R^{5b} が、それぞれ、水素であり、 R^4 が $-C(O)N(R^{8a} R^{8b})$ であり、 R^{8a} および R^{8b} が、それぞれ独立して、水素、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、またはシクロプロピルメチルから選択される請求項1~10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項23】

R^2 が、 $-SO_2 CH_2 C(O)NH_2$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)NHCH_3$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2 CH_2 C(O)NH(C_3H_5)$ 、または $-SO_2 CH_2 C(O)NHCH_2(C_3H_5)$ である請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a} R^{5b})]_k R^4$ であり、 k が0であり、 R^4 が、必要に応じて置換された $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルである請求項1~10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項25】

R^4 が、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、(*N*-メチル-*N*-ベンジル)アミノメチル、(*N*-メチル-*N*-*tert*-ブトキシカルボニル)アミノメチル、エチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、シクロプロピルメチル、またはシクロブチルである請求項24に記載の化合物。

【請求項26】

R^2 が、 $-C(O)[C(R^{5a} R^{5b})]_k R^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリール、あるいは必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリールオキシであり、 k が0または1である請求項1~10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項27】

R^4 が、フェニル、4-フルオロフェニル、4-クロロフェニル、4-(トリフルオロメチル)フェニル、4-メトキシフェニル、または4-(トリフルオロメトキシ)フェニルである請求項26に記載の化合物。

【請求項28】

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_kR^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリール、または必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ 複素環であり、 k が 0 ~ 2 である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 29】

R^4 が、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール - 1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピラジン - 2 - イル、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R^2 が $-C(O)[C(R^{5a}R^{5b})]_kR^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換されたメトキシ、必要に応じて置換されたエトキシ、必要に応じて置換された n - プロポキシ、必要に応じて置換されたイソ - プロポキシ、必要に応じて置換された n - ブトキシ、必要に応じて置換されたイソ - ブトキシ、または必要に応じて置換された *tert* - ブトキシであり、 k が 1 または 2 である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 31】

R^2 が $-[C(R^{5a}R^{5b})]_nR^4$ であり、 R^4 が、必要に応じて置換されたアリール、必要に応じて置換されたアリールオキシ、必要に応じて置換された複素環、または必要に応じて置換されたヘテロアリールであり、 n が 1 または 2 である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 32】

R^2 が $-CH_2R^4$ であり、 R^4 が、キノリン - 3 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、4 - ジメチルアミノフェニル、4 - ジエチルアミノフェニル、4 - フルオロフェニル、4 - クロロフェニル、4 - (イミダゾール - 1 - イル) フェニル、または 4 - シアノフェニルである請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 33】

R^2 が、 $C(O)CH_3$ 、 $C(O)OCH_3$ 、 $-C(O)$ シクロプロピル、 $C(O)OC(CH_3)_3$ 、 $C(O)CH_2N(CH_3)$ ベンジル、 $C(O)CH_2N(CH_3)C(O)OR^{7a}$ 、 $-C(O)$ フラン - 2 - イル、 $C(O)C_6H_5$ 、 $C(O)CH_2C_6H_5$ 、 $C(O)CH_2OC_6H_5$ 、 $-C(O)$ イソオキサゾール - 5 - イル、 $-C(O)$ ピラジン - 2 - イル、 $-CH_2$ (シクロプロピル)、 $CH_2C_6H_5$ 、 $CH_2CH_2C_6H_5$ 、 $CH_2C_6H_4$ (4 - CN)、 $CH_2C_6H_4$ (4 - F)、 $-CH_2C_6H_4$ [4 - $N(CH_3)_2$]、 $-CH_2C_6H_4$ [4 - $N(C_2H_5)_2$]、 $-CH_2C_6H_4$ [4 - イミダゾリル]、 $-CH_2$ (イミダゾール - 1 - イル)、 $-CH_2$ (ピリジン - 2 - イル)、 CH_2 (ピリジン - 3 - イル)、または CH_2 (ピリジン - 4 - イル) であり、 R^{7a} が、*tert* - ブチルである請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 34】

R^2 が、 SO_2R^4 、 $SO_2CH_2C(O)N(R^{8a}R^{8b})$ 、 $SO_2[C(R^{5a}R^{5b})]_jSO_2-R^7$ 、または $SO_2[C(R^{5a}R^{5b})]_jR^4$ である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 35】

x が 1 であり、 L が $-CH_2CH_2-$ である請求項 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 36】

x が 1 であり、 L が、 $-CH_2-$ または $-CH_2CH_2CH_2-$ である請求項 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 37】

y が 1 であり、 L^1 が $-C(R^{9a}R^{9b})-$ である請求項 1 ~ 34 のいずれか 1 つに記載の化合物。

アルキル、ベンジル、アルケニル、アリール、アリールオキシ、アルコキシ、ヘテロア

リール、複素環基が、 $-OR^{15}$ ； $-C(O)R^{15}$ ； $-C(O)OR^{15}$ ； $-C(O)N(R^{15})_2$ ； $-N(R^{15})_2$ ； $-NR^{15}COR^{15}$ ；ハロゲン； $-SO_2R^{15}$ ；必要に応じて $C_3 - C_6$ シクロアルキルまたはハロゲンで置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル； $C_3 - C_6$ シクロアルキル；シアノ；ニトロ；オキソ；ヘテロアリアル；または複素環から独立して選択される1～5個の置換基で必要に応じて置換され、ここで、2個の R^{15} 単位は、それらが結合する原子と一緒にあって、3～7個の環原子を含み、N、OまたはSから独立して選択される1個以上の追加のヘテロ原子を必要に応じて含有する環を形成することができ、あるいは各 R^{15} は、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状アルキル、 $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐状ハロアルキル、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルである請求項1に記載の化合物。

【請求項47】

R^2 および R^3 が同時に水素ではない請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項48】

R^2 および R^3 のうちの1つが、水素、または必要に応じて置換されたアルキルである場合、 R^2 および R^3 のうちのもう1つが、水素、または必要に応じて置換されたアルキルではない請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項49】

R^2 または R^3 が $-[C(R^{5a}R^{5b})]_nR^4$ である場合、 R^4 はアリアルオキシではない請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

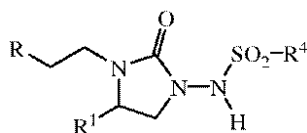
【請求項50】

R^2 および R^3 が一緒になって、必要に応じて置換された3～7個の環原子を有する環を形成する場合、 R は、少なくとも1個のアルコキシ置換基で必要に応じて置換されたフェニルである請求項1～10のいずれか1つに記載の化合物。

【請求項51】

式(XI)：

【化42】



式 (XI)

で表わされる請求項1に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、 R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R^1 は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R^4 は、

i) 水素；

ii) 必要に応じて置換された $C_1 - C_6$ 直鎖または分岐状アルキル、あるいは $C_3 - C_6$ シクロアルキル；

iii) 必要に応じて置換された C_6 または C_{10} アリアル；

iv) 必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ ヘテロアリアル；または

v) 必要に応じて置換された $C_1 - C_{10}$ 複素環から選択される。)

【請求項52】

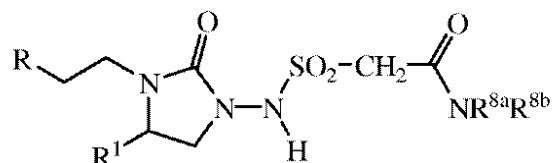
R^4 が、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、エチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、 n -プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 n -ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、シクロブチル、フェニル、フラン-2-イル、イソオキサゾール-5-イル、イミダゾール-1-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イルおよびピラジン-2-イル、ピペリジン-1-イル、4-メチルピペリジン-1-イル、ピペラジン-1-イル、4-メチルピペラジン-1-イル、またはモルホリン-4-イルである請

求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 3】

式 (XIII) :

【化 4 3】



式 (XIII)

で表わされる請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

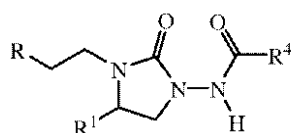
R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁸ᵃ および R⁸ᵇ は、それぞれ独立して、水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、sec - ブチル、イソ - ブチル、tert - ブチル、またはシクロプロピルメチルである。)

【請求項 5 4】

式 (XVIII) :

【化 4 4】



式 (XVIII)

で表わされる請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

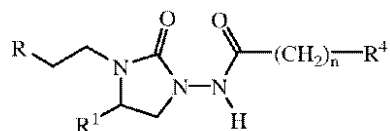
R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁴ は、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、アミノメチル、(N - メチル)アミノメチル、(N, N - ジメチル)アミノ - メチル、(N - メチル - N - ベンジル)アミノメチル、(N - メチル - N - tert - ブトキシカルボニル) - アミノメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、n - プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、n - ブチル、イソ - ブチル、tert - ブチル、シクロプロピルメチル、またはシクロブチルである。)

【請求項 5 5】

式 (XIX) :

【化 4 5】



式 (XIX)

で表わされる請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

(式中、R は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R¹ は、必要に応じて置換されたフェニルであり、

R⁴ は、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ、イソ - プロポキシ、n - ブトキシ、イソ - ブトキシ、tert - ブトキシ、フェニル、4 - フルオロフェニル、4 - クロロフェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、フラン - 2 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、イミダゾール -

1 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピラジン - 2 - イル、ピペリジン - 1 - イル、4 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、またはモルホリン - 4 - イルである。)

【請求項 56】

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 57】

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - シクロプロピル) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) ベンジル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 - メチル - 4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 - メトキシ - 4 - メチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - イソプロピルオキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (ベンゾ [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (2 , 2 - ジフルオロベンゾ - [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (2 , 2 - ジメチルベンゾ - [1 , 3] ジオキソール - 5 - イル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) メチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4

- メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - クロロフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - ジエチルアミノ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (シクロプロピルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (プロピルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (ブチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (ブチルスルホニルアミノ) - 3 - [(4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (ビニルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロベンゾ - [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - t e r t - ブチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (フルオロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエタンスルホニルアミノ) - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (クロロメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - t e r t - ブチル - フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (シアノメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] ジオキシン - 6 - イル)] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - (シアノメチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - メトキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - [(N - 3 - ピリジニルメチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
- 1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エ

チル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メタンスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - イミダゾリジン - 2 - オン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 5 8】

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - シクロプロピル) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) - フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メチルスルホニル] アミノ - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 5 9】

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキシエチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - { [2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ({ [(2 , 2 - ジメチル - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノ] - 2 - オキシエチル } スルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ]

ノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

(S) - 1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - (シクロブチルアミノ) - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [[2 - [(ビス (メトキシエチル) アミノ)] - 2 - オキシエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 60】

1 - [(メチルスルホニルメチル) スルホニル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(N - メチル - N - メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(N - メトキシエチル - N - メチルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(N - メチル - N - フェニルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 61】

{ 2 - オキシ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - イミダゾリジン - 1 - イル } - ウレア ;

1 - (アセチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (アセチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - tert - ブチル) ベンジル] - 2 - イミダゾリジノン ;

シクロプロパンカルボン酸 { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - アミド ;

1 - シクロプロパンカルボニルアミノ - 4 - [4 - (tert - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (2 - フラノイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (ベンゾイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - フェノキシアセトアミド ;

N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(3 , 4 - ジメチルフェニル)] - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - フェニル - アセトアミド ;

1 - (イソオキサゾール - 5 - イルカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (イソオキサゾール - 5 - イルカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [4 - (tert - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メトキシカルボニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

2 - (ベンジルメチルアミノ) - N - { 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - アセトアミド ; または

N - (4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - (4 - メトキシフェネチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 2 - (N , N - ジメチルスルファモイル) アセトアミド ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 6 2】

1 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ベンジルアミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - ベンジルアミノ - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - フルオロフェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - シアノフェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (ジメチルアミノ) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - (t e r t - ブチル) フェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(キノリン - 2 - イルメチル) - アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルエチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - N - [2 - (イミダゾール - 1 - イル) エチル] - N - [アセチル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - N - [2 - (イミダゾール - 1 - イル) エチル] - N - [イソ - ブチリル] アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - [(4 - t e r t - ブチル) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ; または

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキソエチル) スルホニルアミノ] - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン

;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 6 3】

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (R) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (S) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ; または
 1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - (3 - フェニルプロピル) - 4 - (S) - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 6 4】

1 - アミノ - 4 - [4 - (t e r t - ブチル) フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - アミノ - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - (スルファモイルアミノ) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - アミノ - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ) フェニル] - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;
 1 - [[2 - (9 H - フルオレン - 9 - イルメトキシ) - 2 - オキソエチル] スルホニル

アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(フェニルメチル) スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(ピリジン - 3 - イル) メタンスルホニル] アミノ - 3 - [(4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - イミダゾリジン - 2 - オン ;

4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - イミダゾリジン - 2 - オン ;

{ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル } - カルバミン酸 t e r t - ブチルエステル ;

4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - [(キノリン - 3 - イルメチル) - アミノ] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[(ジメチルアミノ) スルホニル] アセチルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - { [2 - (シクロプロピルアミノ) - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル) アミノ] - 2 - オキソエチル] スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 65】

N - { (4 S) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

t e r t - ブチル [2 - ({ 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } アミノ) - 2 - オキソエチル] メチルカルバメート ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 , 4 - ジエチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - ピペラジン - 1 - イルイミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 3 - [2 - (4 - エトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - (メチルスルホニル) エタンスルホンアミド ;

2 - ({ 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) アセトアミド ;

4 - { 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - N - メチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;

N - [4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - (2 - { 4 - [2 - (ジメチルアミノ) エトキシ] フェニル } エチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル] メタンスルホンアミド ;

1 - アミノ - 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;
 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 1 - { [2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) エチル] アミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - ピリジン - 3 - イルアセトアミド ;
 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 1 - { [4 - (ジエチルアミノ) ベンジル] アミノ } - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;
 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - (1 , 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - モルホリン - 4 - イルエタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド ;
 1 - シアノ - N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - ブチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;
 1 - アミノ - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ;
 4 - { 4 - (4 - t e r t - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - N , N - ジメチルピペラジン - 1 - カルボキサミド ;
 2 - (N - (4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - (4 - メトキシフェネチル) - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル) スルファモイル) - N - (2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル) - N - メチルアセトアミド ;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシ - 4 - (1 - フェニルシクロプロピル) イミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド ;
 メチル 3 - アミノ - 4 - ({ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } アミノ) ベンゾエート ;
 N - (シクロプロピルメチル) - 2 - ({ (4 R) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) アセトアミド ;
 N - { 4 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } メタンスルホンアミド ;
 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 1 - { [(1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル] アミノ } イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド ;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシ - 4 - (1 - フェニル

シクロプロピル)イミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド ;
 1 - アミノ - 4 - [4 - (2 - メトキシエトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - [3 - { 2 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]エチル } - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル]メタンスルホンアミド ;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソ - 4 - キノリン - 6 - イルイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル) - 3 - [2 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - シクロヘキシル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド ;
 tert - ブチル { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } [2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル]カルバメート ;
 N - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } ピラジン - 2 - カルボキサミド ;
 N - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 , 1 , 1 - トリフルオロメタンスルホンアミド ;
 N - { 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 4 - (6 - メトキシピリジン - 3 - イル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド ;
 4 - { 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } ピペラジン - 1 - カルボキサミド ;
 N - { 4 - [4 - (2 - メトキシエトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド ;
 N - [4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソ - 3 - { 2 - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチル }イミダゾリジン - 1 - イル]メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - (メチルスルホニル)メタンスルホンアミド ;
 1 - アミノ - 3 - { 2 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]エチル } - 4 - (4 - メトキシフェニル)イミダゾリジン - 2 - オン ;
 1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 4 - (1 - フェニルシクロプロピル)イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - N - [(1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)メチル]メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド ;
 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 1 - { [(1 - オキシドピリジン - 4 - イル)メチル]アミノ }イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 , 4 - ジエチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンスルホンアミド ;
 1 - アミノ - 4 - [1 - (4 - フルオロフェニル)シクロプロピル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]イミダゾリジン - 2 - オン ;
 N - { 4 - [1 - (4 - フルオロフェニル)シクロプロピル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル }メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]

] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 4 - メチルピペラジン - 1 - スルホンアミド ;

N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } スルファミド ;

N - [4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - { 2 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ) フェニル] エチル } - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル] メタンズルホンアミド ; または

N - { 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - (ジメチルスルファモイル) アセトアミド ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 66】

tert - ブチル { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } (キノリン - 3 - イルメチル) カルバメート ;

tert - ブチル ({ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } スルファモイル) カルバメート ;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - フェニルプロピル) イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - N - (フェニルスルホニル) ベンゼンズルホンアミド ;

1 - { 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 3 - フェニルウレア ;

1 - アミノ - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (4 - メチルフェニル) イミダゾリジン - 2 - オン ;

N - { 4 - ブチル - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 1 - ピリジン - 3 - イルメタンズルホンアミド ;

1 - アミノ - 4 - (4 - イソ - プロボキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] イミダゾリジン - 2 - オン ; または

2 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - イル) - N - { 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 2 - オキシイミダゾリジン - 1 - イル } - 2 - オキシエタンズルホンアミド ;

1 - [(N - メチル - N - ベンジルスルホニル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - [(4 - (1H - イミダゾール - 1 - イル) フェニルメチル) アミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 67】

1 - アミノ - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [3 - (4 - メトキシフェニル) プロピル] - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

1 - (メチルスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - (R) - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン ;

N - { (4S) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)

エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;
 tert - ブチル{ 4 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル} (キノリン - 3 - イルメチル)カルバメート;

1 - [[2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキソエチル]スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン;

1 - [[2 - [(ビス(メトキシエチル)アミノ)] - 2 - オキソエチル]スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシ - フェニル)エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン;

N - { (4 R) - 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;

N - { (4 S) - 4 - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;

N - { (4 R) - 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;

N - { (4 S) - 4 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル}メタンスルホンアミド;

[[[4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル]アミノ]スルホニル]酢酸;

1 - アミノ - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル]イミダゾリジン - 2 - オン;

1 - (アミノスルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ)フェニル] - 2 - イミダゾリジノン;

1 - (スルファモイルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)プロピル] - 4 - [(4 - メトキシ)フェニル] - 2 - イミダゾリジノン;

1 - ({ [(2 , 2 - ジメチル - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル)アミノ] - 2 - オキソエチル}スルホニルアミノ) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン;

1 - [[2 - [(シクロプロピルメチル)アミノ] - 2 - オキソエチル]スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - シクロプロピルフェニル)エチル] - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリジノン;

N - { 4 - (シクロプロピルフェニル) - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル} - 2 - ジメチルスルファモイル - アセトアミド;または

1 - [(2 - アミノ - 2 - オキソエチル)スルホニルアミノ] - 3 - [2 - (4 - メトキシフェニル)プロピル] - 4 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾリジノン;

である請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬的に許容しうる塩形態。

【請求項 68】

有効量の 1 種以上の請求項 1 ~ 67 のいずれか 1 つに記載の化合物と、1 種以上の賦形剤とを含む組成物。

【請求項 69】

心房不整脈を治療または予防するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 67 のいずれか 1 つに記載の化合物を含む組成物。

【請求項 70】

血栓塞栓症、卒中、または心不全を治療または予防するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 67 のいずれか 1 つに記載の化合物を含む組成物。

【請求項 7 1】

医薬品としての使用のための請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 7 2】

心房不整脈を治療または予防するための医薬品の製造における請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。

【請求項 7 3】

血栓塞栓症、卒中または心不全を治療または予防するための医薬品の製造における請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 つに記載の化合物の使用。