

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年5月18日(2006.5.18)

【公表番号】特表2005-531520(P2005-531520A)

【公表日】平成17年10月20日(2005.10.20)

【年通号数】公開・登録公報2005-041

【出願番号】特願2003-579734(P2003-579734)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/64	(2006.01)
A 6 1 K 31/4418	(2006.01)
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)
A 6 1 K 31/455	(2006.01)
A 6 1 K 31/496	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
A 6 1 K 45/00	(2006.01)
A 6 1 K 47/02	(2006.01)
A 6 1 K 47/10	(2006.01)
A 6 1 K 47/26	(2006.01)
A 6 1 K 47/34	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/10	(2006.01)
A 6 1 P 1/16	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/30	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
C 0 7 D 213/79	(2006.01)
C 0 7 D 213/80	(2006.01)
C 0 7 D 213/81	(2006.01)
C 0 7 D 213/82	(2006.01)
C 0 7 D 213/85	(2006.01)
C 0 7 D 213/86	(2006.01)
C 0 7 D 213/87	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/64	C S P
A 6 1 K 31/4418	
A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/4545	

A 6 1 K 31/455  
A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 45/00  
A 6 1 K 47/02  
A 6 1 K 47/10  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/34  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 1/10  
A 6 1 P 1/16  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 25/06  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/18  
A 6 1 P 25/22  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/30  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 43/00 1 1 4  
C 0 7 D 213/79  
C 0 7 D 213/80  
C 0 7 D 213/81  
C 0 7 D 213/82  
C 0 7 D 213/85  
C 0 7 D 213/86  
C 0 7 D 213/87  
C 0 7 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月20日(2006.3.20)

【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

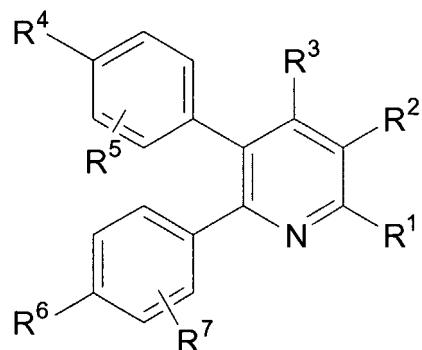
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記構造式Iの化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化1】



(I)

[式中、

R<sup>1</sup> は、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、

(4) シクロヘテロアルキル、

(5) シクロヘテロアルキル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、

(6) ヘテロアリール、

(7) アリール - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、(8) ヘテロアリール - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、(9) - OR<sup>d</sup>、(10) - SR<sup>d</sup>、(11) - O - (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、(12) - O - (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> - NH - C(O) - R<sup>d</sup>、(13) - O - (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> - NH - S(O)<sub>p</sub> R<sup>d</sup>、(14) - O - (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> - NH - C(O) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、(15) - O - (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> - C(O) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、(16) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、(17) - C(O) R<sup>d</sup>、(18) - CO<sub>2</sub> R<sup>d</sup>、

(19) - CN、

(20) - C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、(21) - NR<sup>e</sup> C(O) R<sup>d</sup>、(22) - NR<sup>e</sup> C(O) OR<sup>d</sup>、(23) - NR<sup>e</sup> C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

前記アルキル基は、独立に R<sup>a</sup> から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く；シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールは、独立に R<sup>b</sup> から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く；

R<sup>2</sup> は、

(1) 水素、

(2) シアノ、

(3) - C(O) OR<sup>d</sup>、(4) - C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、

(5) ハロゲン、

(6) ニトロ、

( 7 ) トリフルオロメチル、および  
( 8 )  $C(O)NH-NR^dR^e$

から選択され；

ただし、 $R^1$  および  $R^2$  が両方とも水素であることはなく；  
 $R^3$  は、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 )  $C_{1-3}$  アルキル、
- ( 3 ) シクロアルキル、および
- ( 4 ) トリフルオロメチル

から選択され；

アルキルおよびシクロアルキルは、独立に  $R^a$  から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換  
されていても良く；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  および  $R^7$  はそれぞれ独立に、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) ハロゲン、
- ( 3 ) アミノ、
- ( 4 ) カルボキシ、
- ( 5 )  $C_{1-4}$  アルキル、
- ( 6 )  $C_{1-4}$  アルコキシ、
- ( 7 ) アリール、
- ( 8 ) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、
- ( 9 ) ヒドロキシ、

( 10 ) トリフルオロメチル、

( 11 )  $-OC(O)C_{1-4}$  アルキルおよび

( 12 )  $-OC(O)NR^dR^e$

から選択され；

ただし、 $R^6$  と  $R^7$  が両方とも水素であることはなく；

各  $R^a$  は独立に、

- ( 1 )  $-C(O)R^d$ 、
- ( 2 )  $-CO_2R^d$ 、
- ( 3 )  $-CO_2(CR^fR^g)_nCONR^dR^e$ 、
- ( 4 )  $-OC(O)R^d$ 、
- ( 5 )  $-CN$ 、
- ( 6 )  $-C(O)NR^dR^e$ 、
- ( 7 )  $-NR^eC(O)R^d$ 、
- ( 8 )  $-OC(O)NR^dR^e$ 、
- ( 9 )  $-NR^eC(O)OR^d$ 、
- ( 10 )  $-NR^eC(O)NR^dR^e$ 、
- ( 11 )  $-CR^d(N-OR^d)$ 、
- ( 12 )  $-CF_3$ 、
- ( 13 )  $-OCF_3$  および
- ( 14 )  $C_{3-8}$  シクロアルキル

から選択され；

各  $R^b$  は独立に、

- ( 1 )  $R^a$ 、
- ( 2 )  $C_{1-4}$  アルキル、
- ( 3 )  $C_{2-4}$  アルケニル、
- ( 4 )  $C_{2-4}$  アルキニル、
- ( 5 ) アリールおよび
- ( 6 ) アリール  $-C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

アルキル、アルケニル、アルキニルおよびアリールは、独立に  $R^c$  から選択される基から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く；

各  $R^c$  は独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) カルボキシ、
- (4) -OR<sup>d</sup>、
- (5) -NR<sup>e</sup>S(O)<sub>m</sub>R<sup>d</sup>、
- (6) -NO<sub>2</sub>、
- (7) ハロゲン、
- (8) -S(O)<sub>m</sub>R<sup>d</sup>、
- (9) -SR<sup>d</sup>、
- (10) -S(O)<sub>2</sub>OR<sup>d</sup>、
- (11) -S(O)<sub>m</sub>NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (12) -NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (13) -O(CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>)<sub>n</sub>NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (14) C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、
- (15) C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、
- (16) アリール、
- (17) アリール C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、
- (18) ヒドロキシ、
- (19) CF<sub>3</sub>、
- (20) -OC(O)C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび
- (21) -OC(O)NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>

から選択され；

$R^d$  および  $R^e$  は独立に、

- (1) 水素；

(2) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> ~ 10 アルキル；

- (3) C<sub>2</sub> ~ 10 アルケニル；

- (4) C<sub>2</sub> ~ 10 アルキニル；

(5) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロアルキル；

- (6) シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル；

(7) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロアルキル；

(8) 未置換であるか  $R^h$  置換基で置換されたシクロヘテロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル；

- (9) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール；

(10) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール；

(11) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル；および

(12) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール - C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル

から選択され；あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および N - R<sup>h</sup> から選択される 0 ~ 2 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

$R^f$  および  $R^g$  は独立に、

- (1) 水素および  
(2)  $C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

各  $R^h$  は独立に、

- (1) ハロゲン、  
(2) アミノ、  
(3) ヒドロキシカルボニル、  
(4)  $C_{1-4}$  アルキル、  
(5)  $C_{1-4}$  アルコキシ、  
(6) アリール、  
(7) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、  
(8) ヒドロキシ、  
(9) -  $CF_3$ 、  
(10) -  $OC(O)C_{1-4}$  アルキル、  
(11) アリールオキシ、  
(12)  $C_{1-4}$  アルキルオキシカルボニル - および  
(13) -  $C(O)-NH-C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$m$  は 1 および 2 から選択され；

$n$  は 1、2、3 および 4 から選択され；

$p$  は 0、1 および 2 から選択される。】

## 【請求項 2】

$R^1$  が、

- (1) 水素、  
(2) ハロゲン、  
(3)  $C_{1-4}$  アルキル、  
(4) シクロヘテロアルキル、  
(5) シクロヘテロアルキル -  $C_{1-4}$  アルキル、  
(6) ヘテロアリール、  
(7) アリール -  $C_{1-4}$  アルキル、  
(8) ヘテロアリール -  $C_{1-4}$  アルキル、  
(9) -  $OR^d$ 、  
(10) -  $SR^d$ 、  
(11) -  $O-(CR^fR^g)_n-NR^dR^e$ 、  
(12) -  $O-(CR^fR^g)_n-NH-C(O)-R^d$ 、  
(13) -  $O-(CR^fR^g)_n-NH-S(O)_pR^d$ 、  
(14) -  $O-(CR^fR^g)_n-NH-C(O)-NR^dR^e$ 、  
(15) -  $O-(CR^fR^g)_n-C(O)-NR^dR^e$ 、  
(16) -  $NR^dR^e$ 、  
(17) -  $CO_2H$ 、  
(18) -  $C(O)NR^dR^e$ 、  
(19) -  $NR^eC(O)R^d$ 、  
(20) -  $NR^eC(O)OR^d$ 、  
(21) -  $NR^eC(O)NR^dR^e$

から選択され；

前記アルキル基が、独立に  $R^a$  から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されても良く；シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールが、独立に  $R^b$  から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されても良く；

$R^2$  が、

- (1) 水素、
- (2) シアノ、
- (3) - C (O) OR<sup>d</sup>、
- (4) - C (O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (5) ハロゲン、
- (6) ニトロ、および
- (7) C (O) NH - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

ただし、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が両方とも水素であることはなく；

R<sup>3</sup> が、

- (1) 水素、
- (2) C<sub>1 - 3</sub> アルキル、
- (3) シクロプロピル、
- (4) トリフルオロメチル

から選択され；

アルキルおよびシクロプロピルが、独立に R<sup>a</sup> から選択される置換基で置換されていても良く；

R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> がそれぞれ独立に、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) アミノ、
- (4) カルボキシ、
- (5) C<sub>1 - 4</sub> アルキル、
- (6) C<sub>1 - 4</sub> アルコキシ、
- (7) アリール、
- (8) アリール C<sub>1 - 4</sub> アルキル、
- (9) ヒドロキシ、

(10) トリフルオロメチル、

(11) - OC (O) C<sub>1 - 4</sub> アルキルおよび

(12) - OC (O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され

ただし、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> が両方とも水素であることはなく；

各 R<sup>a</sup> が独立に、

- (1) - OR<sup>d</sup>、
- (2) - NR<sup>e</sup> S (O)<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、
- (3) - NO<sub>2</sub>、
- (4) ハロゲン、
- (5) - S (O)<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、
- (6) - SR<sup>d</sup>、
- (7) - S (O)<sub>2</sub> OR<sup>d</sup>、
- (8) - S (O)<sub>m</sub> NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (9) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (10) - O (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (11) - C (O) R<sup>d</sup>、
- (12) - CO<sub>2</sub> R<sup>d</sup>、
- (13) - CO<sub>2</sub> (CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> CONR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (14) - OC (O) R<sup>d</sup>、
- (15) - CN、
- (16) - C (O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (17) - NR<sup>e</sup> C (O) R<sup>d</sup>、

( 1 8 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 1 9 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) O R <sup>d</sup> ,  
 ( 2 0 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 2 1 ) - C R <sup>d</sup> ( N - O R <sup>d</sup> ) ,  
 ( 2 2 ) - C F <sub>3</sub> ,  
 ( 2 3 ) - O C F <sub>3</sub> および  
 ( 2 4 ) C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> シクロアルキル

から選択され ;

各 R <sup>b</sup> が独立に、

( 1 ) R <sup>a</sup> ,  
 ( 2 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 3 ) アリールおよび  
 ( 4 ) アリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され ;

アルキルおよびアリールが、独立に R <sup>c</sup> から選択される基から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く ;

各 R <sup>c</sup> が独立に、

( 1 ) ハロゲン、  
 ( 2 ) アミノ、  
 ( 3 ) カルボキシ、  
 ( 4 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 5 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルコキシ、  
 ( 6 ) アリール、  
 ( 7 ) アリール C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 8 ) ヒドロキシ、  
 ( 9 ) - C F <sub>3</sub> ,  
 ( 1 0 ) - O C ( O ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルおよび  
 ( 1 1 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup>

から選択され ;

R <sup>d</sup> および R <sup>e</sup> が独立に、

( 1 ) 水素 ;  
 ( 2 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換された C <sub>1</sub> - <sub>1</sub> <sub>0</sub> アルキル ;

( 3 ) C <sub>2</sub> - <sub>1</sub> <sub>0</sub> アルケニル ;  
 ( 4 ) C <sub>2</sub> - <sub>1</sub> <sub>0</sub> アルキニル ;

( 5 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロアルキル ;

( 6 ) シクロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ;

( 7 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロアルキル ;

( 8 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> 置換基で置換されたシクロヘテロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ;

( 9 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール ;

( 1 0 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール ;

( 1 1 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ; および

( 1 2 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され ; あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および  $N - R^h$  から選択される 0 ~ 2 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

$R^f$  および  $R^g$  が独立に、

(1) 水素および

(2)  $C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

各  $R^h$  が独立に、

(1) ハロゲン、

(2) アミノ、

(3) ヒドロキシカルボニル、

(4)  $C_{1-4}$  アルキル、

(5)  $C_{1-4}$  アルコキシ、

(6) アリール、

(7) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、

(8) ヒドロキシ、

(9) トリフルオロメチル、

(10) -  $O C (O) C_{1-4}$  アルキル、

(11) アリールオキシ - 、

(12)  $C_{1-4}$  アルキルオキシカルボニル - および

(13) -  $C (O) - NH - C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$m$  が 1 および 2 から選択され；

$n$  が 1、2 および 3 から選択され；

$p$  が 0、1 および 2 から選択される請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

### 【請求項 3】

$R^1$  が、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3)  $C_{1-4}$  アルキル、

(4) シクロヘテロアルキル、

(5) ヘテロアリール、

(6) アリール -  $C_{1-4}$  アルキル、

(7) ヘテロアリール -  $C_{1-4}$  アルキル、

(8) -  $OR^d$  、

(9) -  $SR^d$  、

(10) -  $O - (CH_2)_n - NR^d R^e$  、

(11) -  $O - (CH_2)_n - NH - C(O) - R^d$  、

(12) -  $O - (CH_2)_n - NH - S(O)_p R^d$  、

(13) -  $O - (CH_2)_n - NH - C(O) - NR^d R^e$  、

(14) -  $O - (CH_2)_n - C(O) - NR^d R^e$  、

(15) -  $NR^d R^e$  ( $R^e$  は水素である) 、

(16) -  $CO_2H$  、

(17) -  $C(O)NR^d R^e$  、

(18) -  $NHC(O)R^d$  、

(19) -  $NHC(O)OR^d$  、

(20) -  $NHC(O)NR^d R^e$

から選択され；

前記アルキル基は、独立に  $R^a$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良

く；シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールは、独立に  $R^b$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く；

$R^2$  が、

- (1) 水素、
- (2) シアノ、
- (3) -C(O)OH、
- (4) -C(O)OCH<sub>3</sub>、
- (5) -C(O)NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (6) ハロゲン、
- (7) ニトロ、および
- (8) C(O)NH-NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup> (R<sup>e</sup> は水素である)

から選択され；

ただし、 $R^1$  および  $R^2$  が両方とも水素であることはなく；

$R^3$  が

- (1) 水素、および
  - (2) メチル
- から選択され；
- $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  および  $R^7$  がそれぞれ独立に、
- (1) 水素、
  - (2) ハロゲン、
  - (3) アミノ、
  - (4) カルボキシ、
  - (5) C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、
  - (6) C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、
  - (7) アリール、
  - (8) アリール C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、
  - (9) ヒドロキシ、

(10) トリフルオロメチル、

- (11) -OC(O)C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび
- (12) -OC(O)NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>

から選択され；

ただし、 $R^6$  と  $R^7$  が両方とも水素であることはなく；

各  $R^a$  が独立に、

- (1) -OR<sup>d</sup>、
- (2) -NR<sup>e</sup>S(O)<sub>m</sub>R<sup>d</sup>、
- (3) -NO<sub>2</sub>、
- (4) ハロゲン、
- (5) -S(O)<sub>m</sub>R<sup>d</sup>、
- (6) -SR<sup>d</sup>、
- (7) -S(O)<sub>2</sub>OR<sup>d</sup>、
- (8) -S(O)<sub>m</sub>NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (9) -NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (10) -O(CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>)<sub>n</sub>NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (11) -C(O)R<sup>d</sup>、
- (12) -CO<sub>2</sub>R<sup>d</sup>、
- (13) -CO<sub>2</sub>(CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>)<sub>n</sub>C(=O)NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (14) -OC(O)R<sup>d</sup>、
- (15) -CN、
- (16) -C(O)NR<sup>d</sup>R<sup>e</sup>、
- (17) -NR<sup>e</sup>C(O)R<sup>d</sup>、

( 1 8 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 1 9 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) O R <sup>d</sup> ,  
 ( 2 0 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 2 1 ) - C R <sup>d</sup> ( N - O R <sup>d</sup> ) ,  
 ( 2 2 ) - C F <sub>3</sub> ,  
 ( 2 3 ) - O C F <sub>3</sub> および  
 ( 2 4 ) C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> シクロアルキル

から選択され ;

各 R <sup>b</sup> が独立に、

( 1 ) R <sup>a</sup> ,  
 ( 2 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 3 ) アリールおよび  
 ( 4 ) アリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され ;

アルキルおよびアリールが、独立に R <sup>c</sup> から選択される基から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く ;

各 R <sup>c</sup> が独立に、

( 1 ) ハロゲン、  
 ( 2 ) アミノ、  
 ( 3 ) カルボキシ、  
 ( 4 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 5 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルコキシ、  
 ( 6 ) アリール、  
 ( 7 ) アリール C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 8 ) ヒドロキシ、  
 ( 9 ) C F <sub>3</sub> ,  
 ( 1 0 ) - O C ( O ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルおよび  
 ( 1 1 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup>

から選択され ;

R <sup>d</sup> が、

( 1 ) 水素 ;  
 ( 2 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換された C <sub>1</sub> - <sub>1</sub> <sub>0</sub> アルキル ;

( 3 ) C <sub>2</sub> - <sub>4</sub> アルケニル ;  
 ( 4 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロアルキル ;

( 5 ) シクロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ;  
 ( 6 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロアルキル ;

( 7 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> 置換基で置換されたシクロヘテロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ;

( 8 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール ;

( 9 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール ;

( 1 0 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ; および

( 1 1 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され ;

R <sup>e</sup> が水素であり ; あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および  $N - R^h$  から選択される 0 ~ 2 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

$R^f$  および  $R^g$  が独立に、

(1) 水素および

(2) メチル

から選択され；

各  $R^h$  が独立に、

(1) ハロゲン、

(2) アミノ、

(3) ヒドロキシカルボニル、

(4)  $C_{1-4}$  アルキル、

(5)  $C_{1-4}$  アルコキシ、

(6) アリール、

(7) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、

(8) ヒドロキシ、

(9) トリフルオロメチル、

(10) -  $O C(O) C_{1-4}$  アルキル、

(11) アリールオキシ - 、

(12)  $C_{1-4}$  アルキルオキシカルボニル - および

(13) -  $C(O) - NH - C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$m$  が 1 および 2 から選択され；

$n$  が 1、2 および 3 から選択され；

$p$  が 0、1 および 2 から選択される請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【請求項 4】

- (1) 2 - (ベンジルオキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル；
- (2) 2 - (アリルオキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル；
- (3) 2 - (ベンジルオキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - ニトリル；
- (4) 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - ニトリル；
- (5) 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル；
- (6) 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル；
- (7)  $N - (ピペリジン - 1 - イル) - 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボキサミド；$
- (8) 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) - 3 - (ピペリジン - 1 - イルカルボニル) ピリジン；
- (9)  $N - (モルホリン - 4 - イル) - 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボキサミド；$
- (10)  $N - (t - ブチル) - 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボキサミド；$
- (11)  $N - (シクロペンチル) - 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (フェニル) ピリジン - 3 - カルボキサミド；$
- (12)  $N - (フェニル) - 2 - (メトキシ) - 6 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ($

フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (13)N-(シクロヘキシル)-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (14)N-ベンジル-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (15)N-(n-ペンチル)-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (16)N-(t-ブチル)-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (17)N-(ピペリジン-1-イル)-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (18)N,N-ジメチル-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (19)N-メチル-2-(ベンジルオキシ)-6-(4-クロロフェニル)-5-(フェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (20)2-(ベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (21)2-(4-フルオロベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (22)2-(2,4-ジフルオロベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (23)2-(3,4-ジフルオロベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (24)2-(3,5-ジフルオロベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (25)2-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-ニトリル；  
 (26)5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-[2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-2-イル)エトキシ]ニコチノニトリル；  
 (27)2-(2-アミノエトキシ)-5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)ニコチノニトリル；  
 (28)N-(2-{[5-(4-クロロフェニル)-3-シアノ-6-(2,4-ジクロロフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}エチル)ベンズアミド；  
 (29)N-(2-{[5-(4-クロロフェニル)-3-シアノ-6-(2,4-ジクロロフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}エチル)-4-フルオロベンズアミド；  
 (30)N-(2-{[5-(4-クロロフェニル)-3-シアノ-6-(2,4-ジクロロフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}エチル)シクロペンタンカルボキサミド；  
 (31)N-(2-{[5-(4-クロロフェニル)-3-シアノ-6-(2,4-ジクロロフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}エチル)シクロブタンカルボキサミド；  
 (32)N-(2-{[5-(4-クロロフェニル)-3-シアノ-6-(2,4-ジクロロフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}エチル)シクロプロパンカルボキサミド；  
 (33)2-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-N-ピペリジン-1-イルニコチニアミド；  
 (34)N-(n-ヘキシル)-2-(クロロ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；  
 (35)N-(n-プロピル)-2-(クロロ)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-

( 3 6 ) N - N - ( ジメチル ) - 2 - ( クロロ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 3 7 ) 2 - クロロ - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 3 8 ) 2 - [ ( 3 - クロロベンジル ) オキシ ] - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 3 9 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( シクロヘキシルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 4 0 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - [ ( 5 - クロロピリジン - 3 - イル ) オキシ ] - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 4 1 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 5 - ジクロロフェノキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 4 2 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) ニコチノニトリル ;  
( 4 3 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 4 - メトキシフェノキシ ) ニコチノニトリル ;  
( 4 4 ) 2 - ( 3 - クロロフェノキシ ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 4 5 ) 2 - ( 4 - クロロフェノキシ ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
( 4 6 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) ニコチノニトリル ;  
( 4 7 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 - フルオロフェノキシ ) ニコチノニトリル ;  
( 4 8 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ ) ニコチノニトリル ;  
( 4 9 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ 1 - ( 4 - フルオロフェニル ) エトキシ ] ニコチノニトリル ;  
( 5 0 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 4 - フルオロフェニル ) チオ ] ニコチノニトリル ;  
( 5 1 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) ニコチノニトリル ;  
( 5 2 ) 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
( 5 3 ) N - ( ピペリジン - 1 - イル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 5 4 ) 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - ( ピペリジノカルボニル ) ピリジン ;  
( 5 5 ) N - ( n - ペンチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 5 6 ) N - ( n - プロピル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 5 7 ) N - ( メチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 5 8 ) N - N - ( ジメチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 5 9 ) N - ( エチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
( 6 0 ) N - ( n - プチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

( 6 1 ) N - ( シクロペンチル ) - 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 6 2 ) 2 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 6 3 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 6 4 ) N - ( ピペリジン - 1 - イル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ; 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - ( ピペリジノカルボニル ) ピリジン ;  
 ( 6 6 ) N - ( シクロヘキシル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 6 7 ) N - ( n - ヘキシル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 6 8 ) 2 - ( n - ブトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 6 9 ) 2 - ( n - ペントキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 7 0 ) 2 - ( シクロプロピルメトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 7 1 ) 2 - ( シクロヘキシルメトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 7 2 ) 2 - ( 2 - エトキシエトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 7 3 ) N - メチル - 2 - ( シクロヘキシルメトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 4 ) N - ( n - プロピル ) - 2 - ( シクロヘキシルメトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 5 ) 2 - ( n - ブトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 6 ) N - メチル - 2 - ( n - ブトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 7 ) N - ( n - プロピル ) - 2 - ( n - ブトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 8 ) N - シクロペンチル - 2 - ( n - ブトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 7 9 ) 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボン酸メチル ;  
 ( 8 0 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] ニコチン酸 ;  
 ( 8 1 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] - N - メチルニコチニアミド ;  
 ( 8 2 ) N - ( エチル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 8 3 ) N - ( n - プロピル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 8 4 ) N - ( 2 - フルオロエチル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジルオキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 ( 8 5 ) N - ( i - プロピル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジルオキシ ) - 6 - (

2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-3-カルボキサミド；

(86) 2-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)ニコチン酸メチル；

(87) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチン酸メチル；

(88) 5-(4-クロロフェニル)-2-[(5-クロロピリジン-3-イル)オキシ]-6-(2,4-ジクロロフェニル)ニコチン酸メチル；

(89) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチン酸；

(90) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチンアミド；

(91) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-N-メチルニコチンアミド；

(92) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-N,N-ジメチルニコチノヒドラジド；

(93) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-N-ピロリジン-1-イルニコチンアミド；

(94) 5-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシル-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチンアミド；

(95) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチンアミド；

(96) 5-(4-クロロフェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-N-イソプロピルニコチンアミド；

(97) 3-(4-クロロフェニル)-2-(2,4-ジクロロフェニル)-6-[(3,4-ジフルオロベンジル)オキシ]ピリジン；

(98) 6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボン酸メチル；

(99) N-(シクロヘキシル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(100) N-(ピペリジン-1-イル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(101) 6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-2-(ピペリジニル-1-カルボニル)ピリジン；

(102) N-(n-ヘキシル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(103) N-(シクロベンチル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(104) N-(シクロヘプチル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(105) N-(ヘプチル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(106) N-(ベンジル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(107) N-(フェニル)-6-(2,4-ジクロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ピリジン-2-カルボキサミド；

(108) 6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-[(3,4-ジフルオロベンジル)オキシ]-5-(4-フルオロフェニル)ニコチン酸メチル；

(109) 6-(2,4-ジクロロフェニル)-2-[(3,4-ジフルオロベンジル)オキシ]-5-(4-フルオロフェニル)ニコチン酸；

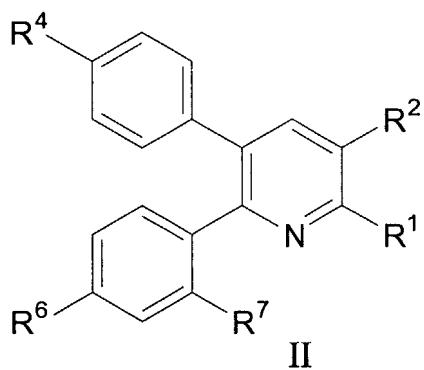
( 1 1 0 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) - N - メチルニコチニアミド ;  
 ( 1 1 1 ) 2 - [ ( 3 - クロロベンジル ) オキシ ] - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 2 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 3 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 2 - ( ピリジン - 3 - イルメトキシ ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 4 ) 2 - [ ( 4 - クロロベンジル ) オキシ ] - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 5 ) 2 - [ ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) メトキシ ] - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 6 ) 2 - クロロ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチニ酸メチル ;  
 ( 1 1 7 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ ) - 5 - ( 4 - フルオロフェニル ) ニコチニ酸メチル ;  
 ( 1 1 8 ) 2 - クロロ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 1 9 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - 2 - ( I - ( 4 - フルオロフェニル ) エトキシ ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 0 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ 2 - ( ジエチルアミノ ) エトキシ ] - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 1 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 2 ) 2 - ( シクロヘキシルメトキシ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 3 ) 2 - ブトキシ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 4 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - ニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 5 ) 4 - ( { [ 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } メチル ) 安息香酸メチル ;  
 ( 1 2 6 ) 4 - ( { [ 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } メチル ) 安息香酸 ;  
 ( 1 2 7 ) 4 - ( { [ 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } メチル ) - N - メチルベンズアミド ;  
 ( 1 2 8 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - 2 - ピペリジン - 1 - イルニコチノニトリル ;  
 ( 1 2 9 ) 2 - ( シクロヘキシルアミノ ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 3 0 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - 2 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) ニコチノニトリル ;  
 ( 1 3 1 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) アミノ ] - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - ニコチノニトリル ;  
 ( 1 3 2 ) 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メチルフェニル ) - 2 - ピロリジン - 1 - イルニコチノニトリル ;  
 ( 1 3 3 ) 6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] ニコチノニトリル ;  
 ( 1 3 4 ) 6 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - [ ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) オキシ ] ニコチニアミド ;

(135) 2-クロロ-6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ニコチノニトリル；  
 (136) 6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-2-[5-クロロピリジン-3-イル]オキシ]ニコチノニトリル；  
 (137) 6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-2-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ニコチノニトリル；  
 (138) 6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-2-[2-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-2-イル)エトキシ]ニコチノニトリル；  
 (139) 2-(2-アミノエトキシ)-6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)ニコチノニトリル；  
 (140) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)ベンゼンスルホンアミド；  
 (141) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)アセトアミド；  
 (142) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)シクロプロパンカルボキサミド；  
 (143) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)ベンズアミド；  
 (144) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)メタンスルホンアミド；  
 (145) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)-N,N-ジメチル尿素；  
 (146) N-(2-{[6-(2-クロロフェニル)-5-(4-クロロフェニル)-3-シアノピリジン-2-イル]オキシ}エチル)モルホリン-4-カルボキサミド  
 から選択される請求項1に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

## 【請求項5】

下記構造式IIの請求項1に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

## 【化2】



[式中、

R<sup>1</sup>は、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) C<sub>1</sub>-4アルキル、
- (4) シクロヘテロアルキル、
- (5) シクロヘテロアルキル-C<sub>1</sub>-4アルキル、
- (6) ヘテロアリール、
- (7) アリール-C<sub>1</sub>-4アルキル、

- ( 8 ) ヘテロアリール - C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 9 ) - O R<sup>d</sup>、  
 ( 10 ) - S R<sup>d</sup>、  
 ( 11 ) - O - ( C R<sup>f</sup> R<sup>g</sup> )<sub>n</sub> - N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 12 ) - O - ( C R<sup>f</sup> R<sup>g</sup> )<sub>n</sub> - NH - C ( O ) - R<sup>d</sup>、  
 ( 13 ) - O - ( C R<sup>f</sup> R<sup>g</sup> )<sub>n</sub> - NH - S ( O )<sub>p</sub> R<sup>d</sup>、  
 ( 14 ) - O - ( C R<sup>f</sup> R<sup>g</sup> )<sub>n</sub> - NH - C ( O ) - N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 15 ) - O - ( C R<sup>f</sup> R<sup>g</sup> )<sub>n</sub> - C ( O ) - N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 16 ) - N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 17 ) - C O<sub>2</sub> H、  
 ( 18 ) - C ( O ) N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 19 ) - N R<sup>e</sup> C ( O ) R<sup>d</sup>、  
 ( 20 ) - N R<sup>e</sup> C ( O ) O R<sup>d</sup>、  
 ( 21 ) - N R<sup>e</sup> C ( O ) N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

前記アルキル基は、独立に R<sup>a</sup> から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されても良く；シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールは、独立に R<sup>b</sup> から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されても良く；

R<sup>2</sup> は、

- ( 1 ) 水素、  
 ( 2 ) シアノ、  
 ( 3 ) - C ( O ) O R<sup>d</sup>、  
 ( 4 ) - C ( O ) N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、  
 ( 5 ) ハロゲン、  
 ( 6 ) ニトロおよび  
 ( 7 ) C ( O ) NH - N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

ただし、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が両方とも水素であることはなく；

R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> はそれぞれ独立に、

- ( 1 ) 水素、  
 ( 2 ) ハロゲン、  
 ( 3 ) アミノ、  
 ( 4 ) カルボキシ、  
 ( 5 ) C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 6 ) C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルコキシ、  
 ( 7 ) アリール、  
 ( 8 ) アリール C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 9 ) ヒドロキシ、

( 10 ) トリフルオロメチル、

- ( 11 ) - O C ( O ) C<sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル および  
( 12 ) - O C ( O ) N R<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

ただし、R<sup>6</sup> と R<sup>7</sup> が両方とも水素であることはなく；

各 R<sup>a</sup> は独立に、

- ( 1 ) - O R<sup>d</sup>、  
 ( 2 ) - N R<sup>e</sup> S ( O )<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、  
 ( 3 ) - N O<sub>2</sub>、  
 ( 4 ) ハロゲン、  
 ( 5 ) - S ( O )<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、  
 ( 6 ) - S R<sup>d</sup>、

- ( 7 ) - S ( O ) <sub>2</sub> O R <sup>d</sup> ,  
 ( 8 ) - S ( O ) <sub>m</sub> N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 9 ) - N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 10 ) - O ( C R <sup>f</sup> R <sup>g</sup> ) <sub>n</sub> N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 11 ) - C ( O ) R <sup>d</sup> ,  
 ( 12 ) - C O <sub>2</sub> R <sup>d</sup> ,  
 ( 13 ) - C O <sub>2</sub> ( C R <sup>f</sup> R <sup>g</sup> ) <sub>n</sub> C O N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 14 ) - O C ( O ) R <sup>d</sup> ,  
 ( 15 ) - C N ,  
 ( 16 ) - C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 17 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) R <sup>d</sup> ,  
 ( 18 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 19 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) O R <sup>d</sup> ,  
 ( 20 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ,  
 ( 21 ) - C R <sup>d</sup> ( N - O R <sup>d</sup> ) ,  
 ( 22 ) - C F <sub>3</sub> ,  
 ( 23 ) - O C F <sub>3</sub> および  
 ( 24 ) C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> シクロアルキル

から選択され ;

各 R <sup>b</sup> は独立に、

- ( 1 ) R <sup>a</sup> ,  
 ( 2 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 3 ) アリールおよび  
 ( 4 ) アリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され ;

アルキルおよびアリールは、独立に R <sup>c</sup> から選択される基から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く ;

各 R <sup>c</sup> は独立に、

- ( 1 ) ハロゲン、  
 ( 2 ) アミノ、  
 ( 3 ) カルボキシ、  
 ( 4 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 5 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルコキシ、  
 ( 6 ) アリール、  
 ( 7 ) アリール C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 8 ) ヒドロキシ、  
 ( 9 ) C F <sub>3</sub> ,  
 ( 10 ) - O C ( O ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルおよび  
 ( 11 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup>

から選択され ;

R <sup>d</sup> および R <sup>e</sup> は独立に、

- ( 1 ) 水素 ;  
 ( 2 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換された C <sub>1</sub> - <sub>10</sub> アルキル ;  
 ( 3 ) C <sub>2</sub> - <sub>10</sub> アルケニル ;  
 ( 4 ) C <sub>2</sub> - <sub>10</sub> アルキニル ;  
 ( 5 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロアルキル ;  
 ( 6 ) シクロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル ;  
 ( 7 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロ

アルキル；

(8) 未置換であるか  $R^h$  置換基で置換されたシクロヘテロアルキル -  $C_{1-4}$  アルキル；

(9) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール；

(10) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール；

(11) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール -  $C_{1-4}$  アルキル；および

(12) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-4}$  アルキル

から選択され；あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および  $N - R^h$  から選択される 0 ~ 2 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

$R^f$  および  $R^g$  は独立に、

(1) 水素および

(2)  $C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

各  $R^h$  は独立に、

(1) ハロゲン、

(2) アミノ、

(3) ヒドロキシカルボニル、

(4)  $C_{1-4}$  アルキル、

(5)  $C_{1-4}$  アルコキシ、

(6) アリール、

(7) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、

(8) ヒドロキシ、

(9) トリフルオロメチル、

(10)  $-OC(O)C_{1-4}$  アルキル、

(11) アリールオキシ - 、

(12)  $C_{1-4}$  アルキルオキシカルボニル - および

(13)  $-C(O)-NH-C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$m$  は 1 および 2 から選択され；

$n$  は 1、2 および 3 から選択され；

$p$  は 0、1 および 2 から選択される。】

#### 【請求項 6】

$R^1$  が、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3)  $C_{1-4}$  アルキル、

(4) シクロヘテロアルキル、

(5) ヘテロアリール、

(6) アリール -  $C_{1-4}$  アルキル、

(7) ヘテロアリール -  $C_{1-4}$  アルキル、

(8)  $-OR^d$  、

(9)  $-SR^d$  、

(10)  $-O-(CH_2)_n-NR^dR^e$  、

(11)  $-O-(CH_2)_n-NH-C(O)-R^d$  、

(12)  $-O-(CH_2)_n-NH-S(O)_pR^d$  、

- (13) - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - NH - C(O) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (14) - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - C(O) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (15) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup> (R<sup>e</sup> は水素である)、
- (16) - CO<sub>2</sub> H、
- (17) - C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (18) - NH C(O) R<sup>d</sup>、
- (19) - NH C(O) OR<sup>d</sup>、
- (20) - NH C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

前記アルキル基は、独立に R<sup>a</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く；シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールは、独立に R<sup>b</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く；

R<sup>2</sup> が、

- (1) 水素、
- (2) シアノ、
- (3) - C(O) OH、
- (4) - C(O) OCH<sub>3</sub>、
- (5) - C(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (6) ハロゲン、
- (7) ニトロ、および
- (8) C(O) NH - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup> (R<sup>e</sup> は水素である)

から選択され；

ただし、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が両方とも水素であることはなく；

R<sup>4</sup>、R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> がそれぞれ独立に、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) アミノ、
- (4) カルボキシ、
- (5) C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、
- (6) C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、
- (7) アリール、
- (8) ベンジル、
- (9) ヒドロキシ、
- (10) トリフルオロメチル、
- (11) - OC(O) C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび
- (12) - OC(O) NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>

から選択され；

ただし、R<sup>6</sup> と R<sup>7</sup> が両方とも水素であることはなく；

各 R<sup>a</sup> が独立に、

- (1) - OR<sup>d</sup>、
- (2) - NR<sup>e</sup> S(O)<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、
- (3) - NO<sub>2</sub>、
- (4) ハロゲン、
- (5) - S(O)<sub>m</sub> R<sup>d</sup>、
- (6) - SR<sup>d</sup>、
- (7) - S(O)<sub>2</sub> OR<sup>d</sup>、
- (8) - S(O)<sub>m</sub> NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (9) - NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (10) - O(CR<sup>f</sup> R<sup>g</sup>)<sub>n</sub> NR<sup>d</sup> R<sup>e</sup>、
- (11) - C(O) R<sup>d</sup>、

( 1 2 ) - C O <sub>2</sub> R <sup>d</sup> 、  
 ( 1 3 ) - C O <sub>2</sub> ( C R <sup>f</sup> R <sup>g</sup> ) <sub>n</sub> C O N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> 、  
 ( 1 4 ) - O C ( O ) R <sup>d</sup> 、  
 ( 1 5 ) - C N 、  
 ( 1 6 ) - C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> 、  
 ( 1 7 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) R <sup>d</sup> 、  
 ( 1 8 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> 、  
 ( 1 9 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) O R <sup>d</sup> 、  
 ( 2 0 ) - N R <sup>e</sup> C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup> 、  
 ( 2 1 ) - C R <sup>d</sup> ( N - O R <sup>d</sup> ) 、

( 2 2 ) - C F <sub>3</sub> 、

( 2 3 ) - O C F <sub>3</sub> および

( 2 4 ) C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> シクロアルキル

から選択され；

各 R <sup>b</sup> が独立に、

- ( 1 ) R <sup>a</sup> 、  
 ( 2 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 3 ) アリールおよび  
 ( 4 ) アリール - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル

から選択され；

アルキルおよびアリールが、独立に R <sup>c</sup> から選択される基から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く；

各 R <sup>c</sup> が独立に、

- ( 1 ) ハロゲン、  
 ( 2 ) アミノ、  
 ( 3 ) カルボキシ、  
 ( 4 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 5 ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルコキシ、  
 ( 6 ) アリール、  
 ( 7 ) アリール C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル、  
 ( 8 ) ヒドロキシ、  
 ( 9 ) C F <sub>3</sub> 、  
 ( 1 0 ) - O C ( O ) C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキルおよび  
 ( 1 1 ) - O C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup>

から選択され；

R <sup>d</sup> が、

( 1 ) 水素；

( 2 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換された C <sub>1</sub> - <sub>1</sub> <sub>0</sub> アルキル；

( 3 ) C <sub>2</sub> - <sub>4</sub> アルケニル；

( 4 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロアルキル；

( 5 ) シクロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル；

( 6 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロアルキル；

( 7 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> 置換基で置換されたシクロヘテロアルキル - C <sub>1</sub> - <sub>4</sub> アルキル；

( 8 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール；

( 9 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール；

(10) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール -  $C_{1-4}$  アルキル；および

(11) 未置換であるか  $R^h$  から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール -  $C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$R^e$  が水素であり；あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および  $N - R^h$  から選択される 0 個もしくは 1 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

$R^f$  および  $R^g$  が独立に、

(1) 水素および

(2) メチル

から選択され；

各  $R^h$  が独立に、

(1) ハロゲン、

(2) アミノ、

(3) ヒドロキシカルボニル、

(4)  $C_{1-4}$  アルキル、

(5)  $C_{1-4}$  アルコキシ、

(6) アリール、

(7) アリール  $C_{1-4}$  アルキル、

(8) ヒドロキシ、

(9) トリフルオロメチル、

(10)  $-OC(O)C_{1-4}$  アルキル、

(11) アリールオキシ - 、

(12)  $C_{1-4}$  アルキルオキシカルボニル - および

(13)  $-C(O)-NH-C_{1-4}$  アルキル

から選択され；

$m$  は 1 および 2 から選択され；

$n$  は 1、2 および 3 から選択され；

$p$  は 0、1 および 2 から選択される請求項 5 に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【請求項 7】

$R^1$  が、

(1) 水素、

(2) 塩素、

(3) ピペリジル、ピペラジニルおよびペルヒドロアゼピンから選択されるシクロヘテロアルキル、

(4) イミダゾール、トリアゾール、ベンズイミダゾールから選択されるヘテロアリール、

(5) ベンジル、

(6)  $-OR^d$  、

(7)  $-SR^d$  、

(8)  $-O-(CH_2)_2-NR^dR^e$  、

(9)  $-O-(CH_2)_2-NH-C(O)-R^d$  、

(10)  $-O-(CH_2)_2-NH-S(O)_pR^d$  、

(11)  $-O-(CH_2)_2-NH-C(O)-NR^dR^e$  、

(12)  $-O-(CH_2)_n-C(O)-NR^dR^e$  、

(13)  $-NR^dR^e$  ( $R^e$  は水素である) 、

(14)  $-CO_2H$  、

( 1 5 ) - C ( O ) N R <sup>d</sup> R <sup>e</sup>

から選択され；

前記シクロヘテロアルキル、アリールおよびヘテロアリールは、独立に R <sup>b</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていても良く；

R <sup>2</sup> が、

( 1 ) 水素、

( 2 ) シアノ、

( 3 ) - C ( O ) OH、

( 4 ) - C ( O ) OCH <sub>3</sub>、

( 5 ) - C ( O ) NR <sup>d</sup> R <sup>e</sup>、

( 6 ) ハロゲン、

( 7 ) ニトロ、および

( 8 ) C ( O ) NH - NR <sup>d</sup> R <sup>e</sup> ( R <sup>e</sup> は水素である )

から選択され；

ただし、R <sup>1</sup> および R <sup>2</sup> が両方とも水素であることはなく；

R <sup>4</sup> 、R <sup>6</sup> および R <sup>7</sup> がそれぞれ独立に、

( 1 ) 水素、

( 2 ) ハロゲン、

( 3 ) アミノ、

( 4 ) カルボキシ、

( 5 ) メチル、

( 6 ) メトキシおよび

( 7 ) トリフルオロメチル

から選択され；

ただし、R <sup>6</sup> と R <sup>7</sup> が両方とも水素であることはなく；

各 R <sup>b</sup> が独立に、

( 1 ) ハロゲン、

( 2 ) - CF <sub>3</sub>、

( 3 ) シクロプロピルおよび

( 4 ) メチル

から選択され；

R <sup>d</sup> が、

( 1 ) 水素；

( 2 ) C <sub>1</sub> ~ <sub>10</sub> アルキル；

( 3 ) C <sub>2</sub> ~ <sub>4</sub> アルケニル；

( 4 ) シクロアルキル；

( 5 ) シクロアルキル - C <sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> アルキル；

( 6 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたシクロヘテロアルキル；

( 7 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> 置換基で置換されたシクロヘテロアルキル - C <sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> アルキル；

( 8 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたアリール；

( 9 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール；

( 10 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されたアリール - C <sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> アルキル；および

( 11 ) 未置換であるか R <sup>h</sup> から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたヘテロアリール - C <sub>1</sub> ~ <sub>4</sub> アルキル

から選択され；

R <sup>e</sup> が水素であり；あるいは

$R^d$  が  $R^e$  およびそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および  $N - R^h$  から選択される 0 個または 1 個の別のヘテロ原子を有し、未置換であるか 1 個もしくは 2 個のオキソ基で置換された 4 ~ 7 員の複素環を形成しており；

各  $R^h$  が独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) ヒドロキシカルボニル、
- (4) メチル、
- (5) メトキシ - 、
- (6) フェニル、
- (7) ベンジル、
- (8) ヒドロキシ、

(9) トリフルオロメチル、

(10) メチルカルボニルオキシ - 、  
(11)  $C_{1 \sim 4}$  アルキルオキシカルボニル - および  
(12)  $-C(O)-NH-C_{1 \sim 4}$  アルキル

から選択され；

$m$  が 1 および 2 から選択され；

$n$  が 1、2 および 3 から選択され；

$p$  が 0、1 および 2 から選択される請求項 6 に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

#### 【請求項 8】

- (1)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、$
- (2)  $2 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ヘキシリニコチニアミド、$
- (3)  $2 - クロロ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - プロピルニコチニアミド、$
- (4)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - メチルニコチニアミド、$
- (5)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N, N - デミチルニコチニアミド、$
- (6)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - プロピルニコチニアミド、$
- (7)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ペンチルニコチニアミド、$
- (8)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ピペリジン - 1 - イルニコチニアミド、$
- (9)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチニアミド、$
- (10)  $2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチン酸メチル、$
- (11)  $5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ヘキシリニコチニアミド、$
- (12)  $5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ] ニコチノニトリル、$
- (13)  $5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(2, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] ニコチノニトリル、$
- (14)  $5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] ニコチノニトリル、$

(15) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(4 - トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}ニコチノニトリル、  
(16) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 5 - ジフルオロベンジル)オキシ]ニコチノニトリル、  
(17) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (シクロヘキシルメトキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチン酸メチル、  
(18) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチン酸メチル、  
(19) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (ペンチルオキシ)ニコチン酸メチル、  
(20) 2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - エチルニコチニアミド、  
(21) 2 - (ベンジルオキシ) - N - ブチル - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチニアミド、  
(22) 2 - (ベンジルオキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロペンチル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチニアミド、  
(23) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (2 - エトキシエトキシ)ニコチン酸メチル、  
(24) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (シクロヘキシルメトキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - メチルニコチニアミド、  
(25) 2 - ブトキシ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチニアミド、  
(26) 2 - ブトキシ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - メチルニコチニアミド、  
(27) 2 - ブトキシ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - プロピルニコチニアミド、  
(28) 2 - ブトキシ - 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロペンチル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ニコチニアミド、  
(29) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ] - N - エチルニコチニアミド、  
(30) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ] - N - プロピルニコチニアミド、  
(31) 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロヘキシル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(32) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ] - N - メチルニコチニアミド、  
(33) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ] - N - (2 - フルオロエチル)ニコチニアミド、  
(34) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ] - N - イソプロピルニコチニアミド、  
(35) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル)オキシ]ニコチン酸メチル、  
(36) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ピペリジン - 1 - イルピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(37) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - ヘキシルピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(38) 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロペンチル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(39) 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロヘプチル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル)ピリジン - 2 - カルボキサミド、

(40) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - (1 - プロピルブチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(41) N - ベンジル - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
(42) 5, 6 - ビス(2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] ニコチノニトリル、  
(43) 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] ニコチノニトリル、  
(44) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [1 - (4 - フルオロフェニル) エトキシ] ニコチノニトリル、  
(45) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) ニコチノニトリル、  
(46) 2 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルメトキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(47) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (2 - メトキシエトキシ) ニコチノニトリル、  
(48) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3 - フルオロフェノキシ) ニコチノニトリル、  
(49) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (シクロヘキシルオキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(50) 2 - (4 - クロロフェノキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(51) 2 - (3 - クロロフェノキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(52) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (4 - メトキシフェノキシ) ニコチノニトリル、  
(53) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (ピリジン - 3 - イルオキシ) ニコチノニトリル、  
(54) 2 - [(3 - クロロベンジル) オキシ] - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(55) 3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 6 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] ピリジン、  
(56) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - [(5 - クロロピリジン - 3 - イル) オキシ] - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
(57) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) ニコチノニトリル、  
(58) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) - N - メチルニコチノニトリル、  
(59) 5 - (4 - クロロフェニル) - N - シクロヘキシル - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) ニコチノニトリル、  
(60) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) - N - ピロリジン - 1 - イルニコチノニトリル、  
(61) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) - N, N - ジメチルニコチノヒドラジド、  
(62) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) - N - エチルニコチノニトリル、  
(63) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) - N - イソプロピルニコチノニトリル、  
(64) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - [(5 - クロロピリジン - 3 - イル) オキシ] - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、

( 6 5 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ ) ニコチニアミド、  
 ( 6 6 ) N - ( 2 - { [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } エチル ) シクロプロパンカルボキサミド、  
 ( 6 7 ) N - ( 2 - { [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } エチル ) シクロブタンカルボキサミド、  
 ( 6 8 ) N - ( 2 - { [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } エチル ) シクロペンタンカルボキサミド、  
 ( 6 9 ) N - ( 2 - { [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } エチル ) ベンズアミド、  
 ( 7 0 ) N - ( 2 - { [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } エチル ) - 4 - フルオロベンズアミド、  
 ( 7 1 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( ピリジン - 2 - イルオキシ ) ニコチノニトリル、  
 ( 7 2 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - N - シクロヘキシル - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
 ( 7 3 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 5 - ジフルオロフェノキシ ) ニコチノニトリル、  
 ( 7 4 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) ニコチノニトリル、  
 ( 7 5 ) [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ ) ピリジン - 3 - イル ] メタノール、  
 ( 7 6 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) ニコチノニトリル、  
 ( 7 7 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - N - シクロベンチル - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - カルボキサミド、  
 ( 7 8 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( 4 - 4 - ジメチル - 2 - オキソ - 1 , 3 - オキサゾリジン - 3 - イル ) ニコチノニトリル、  
 ( 7 9 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イルメトキシ ) ニコチノニトリル、  
 ( 8 0 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - イソプロポキシニコチノニトリル、  
 ( 8 1 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - エトキシニコチノニトリル、  
 ( 8 2 ) N - [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] ベンズアミド、  
 ( 8 3 ) N - ベンゾイル - N - [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] ベンズアミド、  
 ( 8 4 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( テトラヒドロフラン - 3 - イルオキシ ) ニコチノニトリル、  
 ( 8 5 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( テトラヒドロフラン - 3 - イルメトキシ ) ニコチノニトリル、  
 ( 8 6 ) 2 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ニコチノニトリル、  
 ( 8 7 ) N - [ 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - シアノ - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) ピリジン - 2 - イル ] - 3 , 4 - ジフルオロベンズアミド、  
 ( 8 8 ) 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 6 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 2 - ( ピペリジン - 1 - イルオキシ ) ニコチノニトリル、

(89) N - [5 - (4 - クロロフェニル) - 3 - シアノ - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ピリジン - 2 - イル] - 2, 2 - ジメチルプロパンアミド、  
 (90) 2 - (3 - クロロフェノキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチン酸メチル、  
 (91) 2 - (3 - クロロフェノキシ) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N, N - ジメチルニコチノヒドラジド、  
 (92) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) ニコチノニトリル、  
 (93) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - [(3, 4 - ジフルオロベンジル) オキシ] - N, N - ジメチルニコチノヒドラジド、  
 (94) 2 - ブトキシ - 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチン酸メチル、  
 (95) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (シクロヘキシルメトキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - N - プロピルニコチニアミド、  
 (96) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (4 - フルオロフェノキシ) ニコチノニトリル、  
 (97) 5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - (3, 5 - ジクロロフェノキシ) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) ニコチノニトリル、  
 (98) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロベンジル) ニコチノニトリル、  
 (99) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (3, 4 - ジフルオロフェノキシ) ニコチニアミド、  
 (100) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - オキソ - 2H - 1, 2 - ピリジン - 3 - カルボニトリル、  
 (101) 5 - (4 - クロロフェニル) - 6 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - (イソプロピルアミノ) ニコチノニトリル

から選択される請求項 5 に記載の化合物ならびに該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項 10】

医薬的に有効量の請求項 1 に記載の化合物、および

アミノレックス、アンフェクロラール、アンフェタミン、ベンズフェタミン、クロルフェンテルミン、クロベンゾレックス、クロフォレックス、クロミノレックス、クロルテルミン、シクレキセドリン、デクスフェンフルラミン、デキストロアンフェタミン、ジエチルプロピオン、ジフェメトキシジン、N - エチルアンフェタミン、フェンブトラゼート、フェンフルラミン、フェニソレクス、フェンプロポレクス、フルドレクス、フルミノレクス、フルフリルメチルアンフェタミン、レバムフェタミン、レボファセトベラン、マジンドール、メフェノレックス、メタンフェプラモン、メタンフェタミン、ノルプソイドエフェドリン、ペントレクス、フェンジメトラジン、フェンメトラジン、フェンテルミン、フェニルプロパノールアミン、ピシロレクスおよびシブトラミンから選択される食欲抑制剤；

11 - HSD 1 の阻害薬；または

フルオキセチン、フルボキサミン、パロキセチンおよびセルトラリンから選択される選択的セロトニン再取り込み阻害薬；

および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項 11】

医薬的に有効量の請求項 1 に記載の化合物、および

ノルエピネフリン再取り込み阻害薬、選択的セロトニン再取り込み阻害薬、モノアミンオキシダーゼ阻害薬、モノアミンオキシダーゼの可逆的阻害薬、セロトニンおよびノルアドレナリン再取り込み阻害薬、コルチコトロピン放出因子拮抗薬、- アドレナリン受容

体拮抗薬、ニューロキニン-1拮抗薬および非定型抗鬱薬から選択される抗鬱薬；  
および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項12】

医薬的に有効量の請求項1に記載の化合物、および

VLA-4拮抗薬であるナタリズマブ；またはベクロメタゾン、メチルプレドニゾロン、ベタメタゾン、プレドニソン、デキサメタゾンおよびヒドロコルチゾンから選択されるステロイドまたはコルチコステロイド；またはプロモフェニラミン、クロルフェニラミン、デキスクロルフェニラミン、トリプロリジン、クレマスチン、ジフェンヒドラミン、ジフェニルピラリン、トリペレナミン、ヒドロキシジン、メトジラジン、プロメタジン、トリメプラジン、アザタジン、シプロヘプタジン、アンタゾリン、フェニラミン、ピリラミン、アステミゾール、テルフェナジン、ロラタジン、デスクロラタジン、セチリジン、フェクソフェナジンおよびデスカルボエトキシロラタジンから選択される抗ヒスタミン；またはテオフィリン、クロモリンナトリウム、アトロピンおよび臭化イプラトロピウムから選択せれる非ステロイド系抗喘息薬；またはテルブタリン、メタプロテレノール、フェノテロール、イソエタリン、アルブテロール、ビトルテロール、サルメテロール、エピネフリンおよびピルブテロールから選択される2-作働薬；またはザフィルルカスト、モンテルカスト、プランルカスト、イラルカスト、ポビルカストおよびSKB-106203から選択されるロイコトリエン拮抗薬；またはジロイトンおよびBAY-1005から選択されるロイコトリエン生合成阻害薬；または臭化イプラトロピウムおよびアトロピンから選択される抗コリン作動薬；またはCCR-3ケモカイン受容体の拮抗薬；

および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項13】

医薬的に有効量の請求項1に記載の化合物、および

ソルビトール、ラクツロース、ポリエチレングリコール、マグネシウム、リン酸塩および硫酸塩から選択される浸透圧剤；またはマグネシウムおよびドキュセートナトリウムから選択される緩下剤；またはアントロキノンおよびフェノールフタレインから選択される刺激剤；

および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項14】

医薬的に有効量の請求項1に記載の化合物、および

コルチコステロイド；またはペニシラミン；またはコルヒチン；またはインターフェロン-1、2-オキソグルタル酸類縁体；またはプロスタグランジン類縁体；またはアザチオプリン、メトトレキセート、レフルナミド、インドメタシンおよびナプロキセンから選択される抗炎症薬；

および製薬上許容される担体を含む組成物。

【請求項15】

処置を必要とするヒト患者でのカンナビノイド-1受容体介在疾患の治療に有用な医薬の製造における請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項16】

前記カンナビノイド-1受容体が介在する疾患が、精神病、記憶障害、認識力障害、片頭痛、神経症、神経炎症障害、脳血管発作、頭部外傷、不安障害、ストレス、癲癇、パーキンソン病、精神分裂病、物質乱用障害、便秘、慢性腸擬似閉塞、肝硬変、喘息、肥満および過剰食物摂取に関連する他の摂食障害から選択される請求項15に記載の使用。

【請求項17】

前記カンナビノイド-1受容体が介在する疾患が、過剰食物摂取に関連する摂食障害である請求項16に記載の使用。

【請求項18】

前記過剰食物摂取に関連する摂食障害が、肥満、神経性多食性および強迫性摂食障害から選択される請求項17に記載の使用。

【請求項19】

前記過剰食物摂取に関連する摂食障害が、肥満である請求項1 8に記載の使用。

【請求項 20】

肥満の危険性がある人における肥満予防のための医薬製造における請求項1に記載の化合物の使用。