

【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 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2005-532982 (P2005-532982A)

【公表日】平成 17 年 11 月 4 日 (2005.11.4)

【年通号数】公開・登録公報 2005-043

【出願番号】特願 2003-530660 (P2003-530660)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 207/34 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/155 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/401 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4439 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/454 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/64 (2006.01)**

**A 6 1 K 45/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 15/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**

**A 6 1 K 38/28 (2006.01)**

【 F I 】

C 0 7 D 207/34

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 31/401

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 37/26

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月10日(2005.8.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

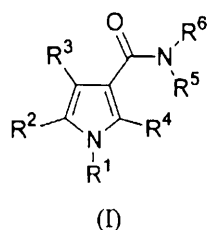
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



[ 式中、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> はそれぞれ場合により 1 個もしくはそれより多いハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、シアノ又はニトロで置換されていることができるフェニル基であり；

R<sup>3</sup> は水素であり；

R<sup>4</sup> は C H<sub>3</sub> であり；

R<sup>5</sup> は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sup>6</sup> は 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル - アミノ、ビス[(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されているシクロヘキシル、

場合により 1 個もしくはそれより多いシクロ(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル - アミノ、ビス[(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができる (C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub>) アルキル、

それぞれ場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル - アミノ、ビス[(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができるシクロペンチル、シクロヘプチル又はシクロ(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) アルキル - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、

フェニル環上で 1 個もしくはそれより多いフッ素、臭素、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ又はニトロで置換されているベンジル、

1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、ニトロ又はハロゲンで置換されているフェニル、

それぞれ場合によりピペリジン又はピロリジン環の窒素原子上で (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができるピペリジン - 4 - イル、ピペリジン - 3 - イル又はピロリジン - 3 - イル、

-  $\text{NR}^7\text{R}^8$

であり、

ここで  $\text{R}^7$  は水素又は  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキルであり；

$\text{R}^8$  は  $(\text{C}_1 - \text{C}_9)$  アルキル又は場合により 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、ヒドロキシ - 置換  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基であるか；あるいは

$\text{R}^7$  及び  $\text{R}^8$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、それは場合により 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、ヒドロキシ - 置換  $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシ又はフッ素で置換されていることができ；

あるいは

$\text{R}^5$  及び  $\text{R}^6$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、少なくとも 1 個の追加の窒素原子を含有する 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、ここで

複素環式基の炭素原子の 1 個もしくはそれより多くは、場合により  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル又はフッ素で置換されていることができ且つここで

複素環式基の追加の窒素原子の一方もしくは両方は、場合により  $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$  アルキルで置換されていることができ且つここで

複素環式基のいずれの炭素もしくは窒素原子も、場合により 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、ヒドロキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができるか；

あるいは

$\text{R}^5$  及び  $\text{R}^6$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 1 - ピペリジニル、1 - ピロリジニル又は 1 - モルホリノ基を形成し、それは 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、フッ素あるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、ヒドロキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されている

の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

#### 【請求項 2】

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$  及び  $\text{R}^4$  が請求項 1 における通りに定義され；

$\text{R}^5$  が水素又は  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキルであり；

$\text{R}^6$  が 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル - アミノ、ビス[ $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されているシクロヘキシル、

場合により 1 個もしくはそれより多いシクロ  $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル - アミノ、ビス[ $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができる  $(\text{C}_1 - \text{C}_5)$  アルキル、

それぞれ場合により 1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル - アミノ、ビス[ $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができるシクロペンチル、シクロヘプチル又はシクロ  $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  アルキル -  $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、

フェニル環上で 1 個もしくはそれより多いフッ素、臭素、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ又はニトロで置換されているベンジル、

1 個もしくはそれより多い  $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルキル、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$  アルコキシ、トリフル

オロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、ニトロ又はハロゲンで置換されているフェニル、

それぞれ場合によりピペリジン又はピロリジン環の窒素原子上で ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ - 置換 ( $C_1 - C_6$ ) アルキルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができるピペリジン - 4 - イル、ピペリジン - 3 - イル又はピロリジン - 3 - イル、

-  $NR^7R^8$

であり、

ここで  $R^7$  は水素又は ( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり；

$R^8$  は ( $C_1 - C_9$ ) アルキル又は場合により 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基であるか；あるいは

$R^7$  及び  $R^8$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、それは場合により 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 ( $C_1 - C_3$ ) アルキル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシ又はフッ素で置換されていることができる

請求項 1 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

#### 【請求項 3】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が請求項 1 における通りに定義され；

$R^5$  が水素であり；

$R^6$  がシクロヘキシル、トランス - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル、シス - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル、1 - ピペリジニル、1 - ピロリジニル、1 - アゼパニル、2 - トリフルオロメチル - フェニルアミノ又は 4 - トリフルオロメチル - フェニルアミノである

請求項 2 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

#### 【請求項 4】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が請求項 1 における通りに定義され；

$R^5$  及び  $R^6$  がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、少なくとも 1 個の追加の窒素原子を含有する 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、ここで

複素環式基の炭素原子の 1 個もしくはそれより多くは、場合により ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル又はフッ素で置換されていることができ且つここで

複素環式基の追加の窒素原子の 1 個もしくは両方は、場合により ( $C_2 - C_6$ ) アルキルで置換されていることができ且つここで

複素環式基のいずれの炭素もしくは窒素原子も、場合により 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができる

請求項 1 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

#### 【請求項 5】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が請求項 1 における通りに定義され；

$R^5$  及び  $R^6$  がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 1 - ピペラジニル基を形成し、ここでピペラジン環の 4 - 位における窒素原子は場合により 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基で置換されていることができる

請求項 3 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 6】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ が請求項 1 における通りに定義され；

$R^5$ 及び $R^6$ がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 1 - ピペリジニル、1 - ピロリジニル又は 1 - モルホリノ基を形成し、それは 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、フッ素あるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されている

請求項 1 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 7】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及び $R^4$ が請求項 1 における通りに定義され；

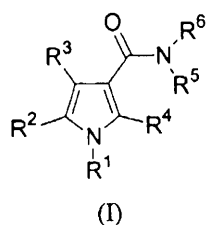
$R^5$ 及び $R^6$ がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 1 - ピペリジニル基を形成し、それは 4 - 位においてヒドロキシならびに場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基で置換されている

請求項 4 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 8】

式 (I)

## 【化 2】



[ 式中、

$R^1$ 及び $R^2$ はそれぞれ場合により 1 個もしくはそれより多いハロゲン、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ又はニトロで置換されていることができるフェニル基であり；

$R^3$ は水素、( $C_1 - C_6$ ) アルキル又はベンジルであり；そして $R^4$ は( $C_2 - C_6$ ) アルキル又は $NH_2$ であるか

あるいは

$R^3$ は( $C_1 - C_6$ ) アルキル又はベンジルであり；そして $R^4$ は $CH_3$ であり；

$R^5$ は水素又は( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり；

$R^6$ は場合により 1 個もしくはそれより多いヒドロキシ、ベンジルオキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、( $C_1 - C_6$ ) アルキル - アミノ、ビス[( $C_1 - C_3$ ) アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができる( $C_1 - C_9$ ) アルキル、

場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多いハロゲン、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ又はニトロで置換されていることができるベンジル、

1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジルオキシ、ニトロ又はハロゲンで置換されているフェニル、

それぞれ場合によりピペリジン又はピロリジン環の窒素原子上で ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ - 置換 ( $C_1 - C_6$ ) アルキルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_1 - C_6$ ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができるピペリジン - 4 - イル、ピペリジン - 3 - イル又はピロリ

ジン - 3 - イル、  
- N R<sup>7</sup> R<sup>8</sup>

であり、

ここで R<sup>7</sup> は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sup>8</sup> は (C<sub>1</sub> - C<sub>9</sub>) アルキル又は場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基であるか；あるいは

R<sup>7</sup> 及び R<sup>8</sup> はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、それは場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシ又はフッ素で置換されていることができるか；

あるいは

R<sup>5</sup> 及び R<sup>6</sup> はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、フッ素あるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロもしくはハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができる 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成する]

の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

【請求項 9】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> 及び R<sup>4</sup> が請求項 8 における通りに定義され；

R<sup>5</sup> が水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sup>6</sup> が場合により 1 個もしくはそれより多いヒドロキシ、ベンジロキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル - アミノ、ビス[(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル] - アミノ又はフッ素で置換されていることができる (C<sub>1</sub> - C<sub>9</sub>) アルキル、

場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多いハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジロキシ又はニトロで置換されていることができるベンジル、

1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、ベンジロキシ、ニトロ又はハロゲンで置換されているフェニル、

それぞれ場合によりピペリジン又はピロリジン環の窒素原子上で (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルあるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ又はハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができるピペリジン - 4 - イル、ピペリジン - 3 - イル又はピロリジン - 3 - イル、

- N R<sup>7</sup> R<sup>8</sup>

であり、

ここで R<sup>7</sup> は水素又は (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R<sup>8</sup> は (C<sub>1</sub> - C<sub>9</sub>) アルキル又は場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ又はハロゲンで置換されていることができるフェニル基であるか；あるいは

R<sup>7</sup> 及び R<sup>8</sup> はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成し、それは場合により 1 個もしくはそれより多い (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルコキシ、ヒドロキシ - 置換 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、ベンジル、フェニル、ヒドロキシ又はフッ素で置換されていることができる

請求項 8 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 10】

$R^1$  及び  $R^2$  が請求項 8 における通りに定義され；  
 $R^5$  及び  $R^6$  が請求項 9 における通りに定義され；  
 $R^3$  が水素、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル又はベンジルであり；  
 $R^4$  が (  $C_2 - C_6$  ) アルキル又は  $NH_2$  である  
 請求項 9 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 11】

$R^1$  及び  $R^2$  が請求項 8 における通りに定義され；  
 $R^5$  及び  $R^6$  が請求項 9 における通りに定義され；  
 $R^3$  が (  $C_1 - C_6$  ) アルキル又はベンジルであり；  
 $R^4$  が  $CH_3$  である  
 請求項 9 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 12】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$  及び  $R^4$  が請求項 8 における通りに定義され；  
 $R^5$  及び  $R^6$  がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合により 1 個もしくはそれより多い (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、フッ素あるいは場合によりフェニル環上で 1 個もしくはそれより多い (  $C_1 - C_6$  ) アルキル、ヒドロキシ、(  $C_1 - C_6$  ) アルコキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロもしくはハロゲンで置換されていることができるベンジル又はフェニル基で置換されていることができる 5 - ~ 10 - 員飽和複素環式基を形成する  
 請求項 8 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 13】

$R^1$  及び  $R^2$  が請求項 8 における通りに定義され；  
 $R^5$  及び  $R^6$  が請求項 12 における通りに定義され；  
 $R^3$  が水素、(  $C_1 - C_6$  ) アルキル又はベンジルであり；  
 $R^4$  が (  $C_2 - C_6$  ) アルキル又は  $NH_2$  である  
 請求項 12 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 14】

$R^1$  及び  $R^2$  が請求項 8 における通りに定義され；  
 $R^5$  及び  $R^6$  が請求項 12 における通りに定義され；  
 $R^3$  が (  $C_1 - C_6$  ) アルキル又はベンジルであり；  
 $R^4$  が  $CH_3$  である  
 請求項 12 の化合物ならびにその製薬学的塩及びエステル。

## 【請求項 15】

2 - アミノ - 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - N - シクロヘキシル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキシアミド塩酸塩；  
 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチル - N - ( 1 - ピペリジニル ) - 1 H - ピロール - 3 - カルボキシアミド塩酸塩；  
 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 2 - メチル - N' - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 H - ピロール - 3 - カルボヒドラジド塩酸塩；  
 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - メチル - N' - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 H - ピロール - 3 - カルボヒドラジド塩酸塩；  
 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 2, 4 - ジメチル - N' - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 H - ピロール - 3 - カルボヒドラジド塩酸塩；  
 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - N - [ シス - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ] - 2 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキシアミド；及び  
 1 - ( 2 - クロロフェニル ) - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - N - [ トランス - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ] - 2 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボキシアミド  
 より成る群から選ばれる請求項 1 の化合物。

## 【請求項 16】

有効量の請求項 1 の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 17】

有効量の請求項 15 の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 18】

有効量の請求項 1 の化合物あるいはその製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び 1 種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 19】

該血糖降下薬がインスリン、ピグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項 18 の製薬学的組成物。

## 【請求項 20】

有効量の請求項 15 の化合物あるいはそれらの製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体及び 1 種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 21】

該血糖降下薬がインスリン、ピグアニジン、スルホニルウレア、インスリン分泌促進薬、 $\alpha$ -グリコシダーゼ阻害剤及び $\beta_3$ -アドレナリン受容体アゴニストより成る群から選ばれる請求項 20 の製薬学的組成物。

## 【請求項 22】

有効量の請求項 1 の化合物あるいはそれらの製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに HMG CoA レダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸 (fibrin acid) 誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 23】

有効量の請求項 15 の化合物あるいはそれらの製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに HMG CoA レダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 24】

有効量の請求項 1 の化合物あるいはそれらの製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 25】

有効量の請求項 15 の化合物あるいはそれらの製薬学的に許容され得る塩又はエステルを、製薬学的に許容され得る担体ならびに熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる製薬学的組成物。

## 【請求項 26】

有効量の請求項 1 の化合物あるいはそれらの塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

## 【請求項 27】

有効量の請求項 15 の化合物あるいはそれらの塩又はエステルを不活性担体と組み合わせて含んでなる組成物。

## 【請求項 28】

請求項 1 の化合物を 有効成分として含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 29】

該肥満 - 関連障害が異常脂肪血症、高トリグリセリド血症、高血圧、糖尿病、シンドローム X、アテローム硬化疾患、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、コレステロール胆石、ガン、月経異常、不妊症、多嚢胞性卵巣、変形性関節症及び睡眠無呼吸を含む請求項 28 の 処置剤。

【請求項 30】

請求項 15 の化合物を 有効成分として含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 31】

該肥満 - 関連障害が異常脂肪血症、高トリグリセリド血症、高血圧、糖尿病、シンドローム X、アテローム硬化疾患、心臓血管疾患、脳血管疾患、末梢血管疾患、コレステロール胆石、ガン、月経異常、不妊症、多嚢胞性卵巣、変形性関節症及び睡眠無呼吸を含む請求項 30 の 処置剤。

【請求項 32】

請求項 1 の化合物を 有効成分として含んでなる食欲及び食物摂取の調節剤。

【請求項 33】

請求項 15 の化合物を 有効成分として含んでなる食欲及び食物摂取の調節剤。

【請求項 34】

請求項 1 の化合物を 有効成分として含んでなる過食症の処置剤。

【請求項 35】

請求項 15 の化合物を 有効成分として含んでなる過食症の処置剤。

【請求項 36】

請求項 1 の化合物を 有効成分として 1 種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 37】

請求項 15 の化合物を 有効成分として 1 種もしくはそれより多い血糖降下薬と組み合わせて含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 38】

請求項 1 の化合物を 有効成分として消化及び / 又は代謝を調節する 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 39】

該消化及び / 又は代謝を調節する薬剤が熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤を含む請求項 38 の 処置剤。

【請求項 40】

該消化及び / 又は代謝を調節する薬剤が  $\beta_3$  - アドレナリン受容体作用薬を含む請求項 38 の 処置剤。

【請求項 41】

請求項 15 の化合物を 有効成分として消化及び / 又は代謝を調節する 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 42】

該消化及び / 又は代謝を調節する薬剤が熱発生、脂肪分解、腸運動性、脂肪吸収及び満腹を調節する薬剤を含む請求項 41 の 処置剤。

【請求項 43】

該消化及び / 又は代謝を調節する薬剤が  $\beta_3$  - アドレナリン受容体作用薬を含む請求項 41 の 処置剤。

【請求項 44】

請求項 1 の化合物を 有効成分として HMG CoA レダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて含んでなる肥満及び肥満 - 関連障害の処置剤。

【請求項 45】

請求項 15 の化合物を 有効成分として H M G   C o A レダクターゼ阻害剤、胆汁酸結合剤、フィブリン酸誘導体及び高血圧を調節する薬剤より成る群から選ばれる 1 種もしくはそれより多い薬剤と組み合わせて 含んで なる肥満及び肥満 - 関連障害の 処置剤。

【請求項 46】

請求項 1 の化合物を 有効成分として 含んで なる C N S 障害の 処置剤。

【請求項 47】

請求項 1 の化合物を 有効成分として 含んで なる認識及び記憶障害の 処置剤。

【請求項 48】

請求項 1 の化合物を 有効成分として 含んで なる物質及び行動嗜癖の 処置剤。

【請求項 49】

請求項 15 の化合物を 有効成分として 含んで なる C N S 障害の 処置剤。

【請求項 50】

請求項 15 の化合物を 有効成分として 含んで なる認識及び記憶障害の 処置剤。

【請求項 51】

請求項 15 の化合物を 有効成分として 含んで なる物質及び行動嗜癖の 処置剤。