

【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2005-519876(P2005-519876A)

【公表日】平成17年7月7日(2005.7.7)

【年通号数】公開・登録公報2005-026

【出願番号】特願2003-546818(P2003-546818)

【国際特許分類】

C 0 7 D	215/38	(2006.01)
A 6 1 K	31/403	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/4995	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/54	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(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	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(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	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/30	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
C 0 7 D	405/04	(2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)
C 0 7 D 453/00 (2006.01)
C 0 7 D 471/08 (2006.01)
C 0 7 D 487/08 (2006.01)
C 0 7 D 487/10 (2006.01)
C 0 7 D 491/08 (2006.01)
C 0 7 D 495/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/38 C S P

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/4995

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/54

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 1/16 1 0 5

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 7/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 453/00
 C 0 7 D 471/08
 C 0 7 D 487/08
 C 0 7 D 487/10
 C 0 7 D 491/08
 C 0 7 D 495/10
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月17日(2005.6.17)

【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

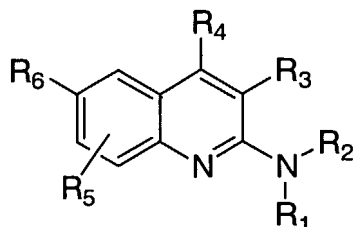
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

【化1】



[式中、

R^1 および R^2 は独立に、

(1) 水素、

(2) C_{1-6} アルキル、

(3) C_{2-6} アルケニル、

(4) C_{2-6} アルキニル、

(5) シクロアルキル - C_{0-6} アルキル、

(6) ヘテロシクロアルキル - C_{0-10} アルキル、

(7) アリール - C_{0-10} アルキル、および

(8) ヘテロアリール - C_{0-10} アルキル

からなる群から選択され；

上記のアルキル、アルケニルおよびアルキニル部分は、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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分は、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いても良く；含硫黄複素環は硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

あるいは R^1 および R^2 は、それらが結合している窒素原子とともに、N、SおよびOから選択される1個もしくは2個の別のヘテロ原子を有していても良く、1以上の不飽和度を有していても良く、6員のヘテロ芳香環もしくは芳香環に縮合していても良く、未置換であるか独立に R^b から選択される1～4個の置換基で置換されている、4～11員の架橋もしくは非架橋もしくはスピロ環状の複素環を形成しており；含硫黄複素環は、硫黄原子上でモノ酸化もしくはジ酸化されていても良く；

R^3 および R^4 は独立に、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) C_{1-8} アルキル、
- (4) パーフフルオロ C_{1-6} アルキル、
- (5) C_{2-6} アルケニル、
- (6) C_{2-6} アルキニル、
- (7) シクロアルキル、
- (8) シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、
- (9) シクロヘテロアルキル、
- (10) シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル、
- (11) アリール、
- (12) アリール - C_{1-6} アルキル、
- (13) ヘテロアリール、
- (14) ヘテロアリール - C_{1-6} アルキル、
- (15) - OR^7 、
- (16) - NR^7R^7 、
- (17) - CO_2R^7 、
- (18) シアノおよび
- (19) - $C(O)NR^7R^7$

からなる群から選択され；

上記のアルキル、アルケニルおよびアルキニル部分は、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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分は、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いても良く；含硫黄複素環は、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

あるいは R^3 および R^4 は、それらが結合している環炭素原子とともに、未置換であるか独立に R^b から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されている、5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルまたはシクロアルキル環を形成しており；

R^5 は、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) C_{1-6} アルキル、
- (4) パーフフルオロ C_{1-6} アルキル、
- (5) - OR^7 、および
- (6) - NR^7R^7

から選択され；

R^6 は、

- (1) - $(CH_2)_n - R^7$ 、
- (2) - $(CH_2)_n -$ アリール - R^7 、
- (3) - $(CH_2)_n -$ ヘテロアリール - R^7 、
- (4) - $(CH_2)_n -$ ヘテロシクロアルキル - R^7 、
- (5) - $(CH_2)_n C \equiv N$ 、
- (6) - $(CH_2)_n CON(R^7)_2$ 、
- (7) - $(CH_2)_n CO_2R^7$ 、
- (8) - $(CH_2)_n COR^7$ 、
- (9) - $(CH_2)_n NR^7C(O)R^7$ 、
- (10) - $(CH_2)_n NR^7C(O)(CH_2)_n SR^7$ 、
- (11) - $(CH_2)_n NR^7CO_2R^7$ 、
- (12) - $(CH_2)_n NR^7C(O)N(R^7)_2$ 、

- (13) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{SO}_2 \text{R}^7$ 、
 (14) - $(\text{CH}_2)_n \text{S}(\text{O})_p \text{R}^7$ 、
 (15) - $(\text{CH}_2)_n \text{SO}_2 \text{N}(\text{R}^7)_2$ 、
 (16) - $(\text{CH}_2)_n \text{OR}^7$ 、
 (17) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{R}^7$ 、
 (18) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{OR}^7$ 、
 (19) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、
 (20) - $(\text{CH}_2)_n \text{N}(\text{R}^7)_2$ 、および
 (21) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{SO}_2 \text{N}(\text{R}^7)_2$

からなる群から選択され；

$(\text{CH}_2)_n$ における水素原子の 1 個もしくは 2 個が R^a で置換されていても良く；
 R^7 は、各場合で独立に、

- (1) 水素、
 (2) C_{1-6} アルキル、
 (3) アリール、
 (4) ヘテロアリール、
 (5) シクロアルキル、
 (6) ヘテロシクロアルキル、
 (7) アリール C_{1-3} アルキル、
 (8) ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、
 (9) シクロアルキル C_{1-3} アルキル、
 (10) ヘテロシクロアルキル C_{1-3} アルキル、
 (11) アリール C_{2-3} アルケニル、
 (12) ヘテロアリール C_{2-3} アルケニル、
 (13) シクロアルキル C_{2-3} アルケニル、および
 (14) ヘテロシクロアルキル C_{2-3} アルケニル

からなる群から選択され；

前記アルキルおよびアルケニル部分は 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；前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分は独立に R^b から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されており；含硫黄複素環は、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

各 R^a は独立に、

- (1) - OR^d 、
 (2) - $\text{NR}^d \text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、
 (3) - NO_2 、
 (4) ハロゲン、
 (5) - $\text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、
 (6) - SR^d 、
 (7) - $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^d$ 、
 (8) - $\text{S}(\text{O})_p \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (9) - $\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (10) - $\text{O}(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (11) - $\text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (12) - $\text{CO}_2 \text{R}^d$ 、
 (13) - $\text{CO}_2 (\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{CON}(\text{R}^d)_2$ 、
 (14) - $\text{OC}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (15) - CN 、
 (16) - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (17) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (18) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、

- (1 9) - $\text{NR}^{\text{d}} \text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{d}}$ 、
 (2 0) - $\text{NR}^{\text{d}} \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、
 (2 1) - $\text{CR}^{\text{d}}(\text{N}-\text{OR}^{\text{d}})$ 、
 (2 2) - CF_3 、
 (2 3) シクロアルキル、
 (2 4) シクロヘテロアルキル、および
 (2 5) オキソ

から選択され；

各 R^{b} は独立に、

- (1) R^{a} 、
 (2) - $\text{Sn}(\text{CH}_3)_3$ 、
 (3) C_{1-10} アルキル、
 (4) C_{2-10} アルケニル、
 (5) C_{2-10} アルキニル、
 (6) ヘテロアリール、
 (7) アリール、および
 (8) アリール - C_{1-10} アルキル

から選択され；

アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールは、独立に R^{c} から選択される群から選択される 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) 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 、
 (1 0) - $\text{OC}(\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキル、
 (1 1) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{d}})_2$ 、および
 (1 2) アリールオキシ

から選択され；

R^{d} は独立に、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル； C_{2-6} アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；シクロヘテロアルキル；シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル；アリール；ヘテロアリール；アリール - C_{1-6} アルキル；およびヘテロアリール - C_{1-6} アルキルから選択され； R^{d} における前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールは、独立に R^{e} 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^{e} は、ハロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシおよびヒドロキシから選択され；

m は 1 および 2 から選択され；

n は 0、1、2、3、4 および 5 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 および R^2 が独立に、

- (1) 水素、

- (2) C_{1-6} アルキル、
- (3) C_{2-6} アルケニル、
- (4) シクロアルキル - C_{0-6} アルキル、
- (5) ヘテロシクロアルキル - C_{0-6} アルキル、
- (6) アリール - C_{0-6} アルキル、および
- (7) ヘテロアリール - C_{0-10} アルキル

からなる群から選択され；

上記のアルキルおよびアルケニル部分が、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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が、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；

あるいは R^1 および R^2 が、それらが結合している窒素原子とともに、N、S および O から選択される 1 個の別のヘテロ原子を有していても良く、1 以上の不飽和度を有していても良く、6 員のヘテロ芳香環もしくは芳香環に縮合していても良く、未置換であるか R^b 置換基で置換されている、4 ~ 11 員の架橋もしくは非架橋もしくはスピロ環状の複素環を形成しており；

R^3 および R^4 が独立に、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) C_{1-8} アルキル、
- (4) トリフルオロメチル、
- (5) C_{2-6} アルケニル、
- (6) シクロアルキル、
- (7) シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、
- (8) シクロヘテロアルキル、
- (9) シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル、
- (10) アリール、
- (11) アリール - C_{1-6} アルキル、
- (12) ヘテロアリール、
- (13) ヘテロアリール - C_{1-6} アルキル、
- (14) - OR^7 、
- (15) - NR^7R^7 、
- (16) - CO_2R^7 および
- (17) - $C(O)NR^7R^7$

からなる群から選択され；

上記のアルキルおよびアルケニル部分が、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いても良く；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が R^b 置換基で置換されていても良く；

あるいは R^3 と R^4 が、それらが結合している環炭素原子とともに、未置換であるか R^b 置換基で置換されている、5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルまたはシクロアルキル環を形成しており；

R^5 が、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) メチル、
- (4) トリフルオロメチル、
- (5) ヒドロキシ、
- (6) メトキシ、
- (7) フェノキシ、
- (8) - NH_2 、

(9) - $\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、および

(10) - $\text{N}(\text{CH}_3)_2$

から選択され；

R^6 が、

(1) - $(\text{CH}_2)_n - \text{R}^7$ 、

(2) - $(\text{CH}_2)_n$ - アリール - R^7 、

(3) - $(\text{CH}_2)_n$ - ヘテロアリール - R^7 、

(4) - $(\text{CH}_2)_n$ - ヘテロシクロアルキル - R^7 、

(5) - $(\text{CH}_2)_n \text{C} \equiv \text{N}$ 、

(6) - $(\text{CH}_2)_n \text{CON}(\text{R}^7)_2$ 、

(7) - $(\text{CH}_2)_n \text{CO}_2 \text{R}^7$ 、

(8) - $(\text{CH}_2)_n \text{COR}^7$ 、

(9) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、

(10) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n \text{SR}^7$ 、

(11) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{CO}_2 \text{R}^7$ 、

(12) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、

(13) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{SO}_2 \text{R}^7$ 、

(14) - $(\text{CH}_2)_n \text{S}(\text{O})_p \text{R}^7$ 、

(15) - $(\text{CH}_2)_n \text{SO}_2 \text{N}(\text{R}^7)_2$ 、

(16) - $(\text{CH}_2)_n \text{OR}^7$ 、

(17) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{R}^7$ 、

(18) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{OR}^7$ 、

(19) - $(\text{CH}_2)_n \text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、

(20) - $(\text{CH}_2)_n \text{N}(\text{R}^7)_2$ 、および

(21) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{SO}_2 \text{N}(\text{R}^7)_2$

からなる群から選択され；

$(\text{CH}_2)_n$ における水素原子の 1 個もしくは 2 個が R^a で置換されていても良く；

R^7 が、各場合で独立に、

(1) 水素、

(2) C_{1-6} アルキル、

(3) アリール、

(4) ヘテロアリール、

(5) シクロアルキル、

(6) ヘテロシクロアルキル、

(7) アリール C_{1-3} アルキル、

(8) ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、

(9) シクロアルキル C_{1-3} アルキル、

(10) ヘテロシクロアルキル C_{1-3} アルキル、

(11) アリール C_{2-3} アルケニル、

(12) ヘテロアリール C_{2-3} アルケニル、

(13) シクロアルキル C_{2-3} アルケニル、および

(14) ヘテロシクロアルキル C_{2-3} アルケニル

からなる群から選択され；

前記アルキルおよびアルケニル部分が、 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；前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分が独立に、 R^b から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されており；含硫黄複素環が、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

各 R^a が独立に、

(1) - OR^d 、

(2) - $\text{NR}^d \text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、

- (3) - NO_2 、
- (4) ハロゲン、
- (5) - $\text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、
- (6) - SR^d 、
- (7) - $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^d$ 、
- (8) - $\text{S}(\text{O})_p \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (9) - $\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (10) - $\text{O}(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (11) - $\text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (12) - $\text{CO}_2 \text{R}^d$ 、
- (13) - $\text{CO}_2(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{CON}(\text{R}^d)_2$ 、
- (14) - $\text{OC}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (15) - CN 、
- (16) - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (17) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (18) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (19) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{OR}^d$ 、
- (20) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (21) - $\text{CR}^d(\text{N} - \text{OR}^d)$ 、
- (22) - CF_3 、
- (23) シクロアルキル、
- (24) シクロヘテロアルキル、および
- (25) オキシ

から選択され；

各 R^b が独立に、

- (1) R^a 、
- (2) - $\text{Sn}(\text{CH}_3)_3$ 、
- (3) C_{1-10} アルキル、
- (4) C_{2-10} アルケニル、
- (5) ヘテロアリール、
- (6) アリール、および
- (7) アリール - C_{1-10} アルキル

から選択され；

アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールが、1～4個の R^c 置換基で置換されていても良く；

各 R^c が独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) カルボキシ、
- (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) - $\text{OC}(\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキル、
- (11) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、および
- (12) アリールオキシ

から選択され；

各 R^d が独立に、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル； C_{2-6} アルキニル

；シクロアルキル；シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；シクロヘテロアルキル；シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル；アリール；ヘテロアリール；アリール - C_{1-6} アルキル；およびヘテロアリール - C_{1-6} アルキルから選択され； R^d における前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールが、独立に R^e から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；

各 R^e が、ハロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシおよびヒドロキシから選択され；

m が 1 および 2 から選択され；

n が 0、1、2、3、4 および 5 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 に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

【請求項 3】

R^1 が、

(1) 水素および

(2) 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い C_{1-6} アルキル

からなる群から選択され；

R^2 が、

(1) 水素、

(2) C_{1-6} アルキル、

(3) シクロアルキル - C_{0-6} アルキル、

(4) ヘテロシクロアルキル - C_{0-6} アルキル、

(5) アリール - C_{0-6} アルキル、および

(6) ヘテロアリール - C_{0-10} アルキル

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が独立に 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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が、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；

あるいは R^1 と R^2 が、それらが結合している窒素原子とともに、N、S および O から選択される 1 個の別のヘテロ原子を有していても良く、未置換であるか R^b 置換基で置換された、4 ~ 11 員の架橋もしくは非架橋もしくはスピロ環状の複素環を形成しており；

R^3 が、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) C_{1-8} アルキル、

(4) トリフルオロメチル、

(5) - OH、

(6) - OCH₃、

(7) - NH₂、

(8) - CO₂ R^7 および

(9) - C(O)NH₂

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が、独立に R^a から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；

R^4 が

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) C_{1-8} アルキル、

(4) トリフルオロメチル、

- (5) シクロアルキル、
- (6) シクロヘテロアルキル、
- (7) アリール、
- (8) アリール - C_{1-6} アルキル、
- (9) ヘテロアリール、
- (10) - OH、
- (11) - OCH₃、
- (12) - NH₂、
- (13) - CO₂ R⁷ および
- (14) - C(O)NH₂

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が独立に R^a から選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されていても良く；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が R^b 置換基で置換されていても良く；

あるいは R³ および R⁴ が、それらが結合している環炭素原子とともに、未置換であるか R^b 置換基で置換されている、5 ~ 7 員のシクロアルキル環を形成しており；

R⁵ が、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) メチル、
- (4) トリフルオロメチル、
- (5) ヒドロキシ、
- (6) メトキシ、
- (7) フェノキシ、
- (8) - NH₂、
- (9) - NH(CH₃)、および
- (10) - N(CH₃)₂

から選択され；

R⁶ が、

- (1) - (CH₂)_n - R⁷、
- (2) - (CH₂)_n - アリール - R⁷、
- (3) - (CH₂)_n - ヘテロアリール - R⁷、
- (4) - (CH₂)_n - ヘテロシクロアルキル - R⁷、
- (5) - (CH₂)_n C≡N、
- (6) - (CH₂)_n CON(R⁷)₂、
- (7) - (CH₂)_n CO₂ R⁷、
- (8) - (CH₂)_n COR⁷、
- (9) - (CH₂)_n NR⁷ C(O)R⁷、
- (10) - (CH₂)_n NR⁷ C(O)(CH₂)_n SR⁷、
- (11) - (CH₂)_n NR⁷ CO₂ R⁷、
- (12) - (CH₂)_n NR⁷ C(O)N(R⁷)₂、
- (13) - (CH₂)_n NR⁷ SO₂ R⁷、
- (14) - (CH₂)_n S(O)_p R⁷、
- (15) - (CH₂)_n SO₂ N(R⁷)₂、
- (16) - (CH₂)_n OR⁷、
- (17) - (CH₂)_n OC(O)R⁷、
- (18) - (CH₂)_n OC(O)OR⁷、
- (19) - (CH₂)_n OC(O)N(R⁷)₂、
- (20) - (CH₂)_n N(R⁷)₂、および
- (21) - (CH₂)_n NR⁷ SO₂ N(R⁷)₂

からなる群から選択され；

(CH_2)_nにおける水素原子の1個もしくは2個が R^a で置換されていても良く；

R^7 が、各場合で独立に、

- (1) 水素、
- (2) C_{1-6} アルキル、
- (3) アリール、
- (4) ヘテロアリール、
- (5) シクロアルキル、
- (6) ヘテロシクロアルキル、
- (7) アリール C_{1-3} アルキル、
- (8) ヘテロアリール C_{1-3} アルキル、
- (9) シクロアルキル C_{1-3} アルキル、
- (10) ヘテロシクロアルキル C_{1-3} アルキル、
- (11) アリール C_{2-3} アルケニル、
- (12) ヘテロアリール C_{2-3} アルケニル、
- (13) シクロアルキル C_{2-3} アルケニル、および
- (14) ヘテロシクロアルキル C_{2-3} アルケニル

からなる群から選択され；

前記アルキルおよびアルケニル部分が 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；前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分が独立に、 R^b から選択される1～3個の置換基で置換されており；含硫黄複素環が、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

各 R^a が独立に、

- (1) - OR^d 、
- (2) - $\text{NR}^d \text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、
- (3) - NO_2 、
- (4) ハロゲン、
- (5) - $\text{S}(\text{O})_m \text{R}^d$ 、
- (6) - SR^d 、
- (7) - $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^d$ 、
- (8) - $\text{S}(\text{O})_p \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (9) - $\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (10) - $\text{O}(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (11) - $\text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (12) - $\text{CO}_2 \text{R}^d$ 、
- (13) - $\text{CO}_2(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{CON}(\text{R}^d)_2$ 、
- (14) - $\text{OC}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (15) - CN 、
- (16) - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (17) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
- (18) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (19) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{OR}^d$ 、
- (20) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
- (21) - $\text{CR}^d(\text{N}-\text{OR}^d)$ 、
- (22) - CF_3 、
- (23) シクロアルキル、
- (24) シクロヘテロアルキル、および
- (25) オキソ

から選択され；

各 R^b が独立に、

- (1) R^a 、
- (2) $-Sn(CH_3)_3$ 、
- (3) C_{1-10} アルキル、
- (4) C_{2-10} アルケニル、
- (5) ヘテロアリール、
- (6) アリール、および
- (7) アリール- C_{1-10} アルキル

から選択され；

R^a および R^b におけるアルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリール部分が、1～4個の R^c 置換基で置換されていても良く；

各 R^c が独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) カルボキシ、
- (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) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、および
- (12) アリールオキシ

から選択され；

R^d が独立に、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル； C_{2-6} アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキル- C_{1-6} アルキル；シクロヘテロアルキル；シクロヘテロアルキル- C_{1-6} アルキル；アリール；ヘテロアリール；アリール- C_{1-6} アルキル；およびヘテロアリール- C_{1-6} アルキルから選択され；

R^d における前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールが、独立に R^e から選択される1～2個の置換基で置換されていても良く；

各 R^e が、ハロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシおよびヒドロキシから選択され；

m が1および2から選択され；

n が0、1、2、3および4から選択され；

p が0、1および2から選択される、請求項2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4】

R^1 が、

- (1) 水素、
- (2) メチル、
- (3) エチル、および
- (4) プロピル

からなる群から選択され、これらが独立に 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；

R^2 が、

- (1) 水素、
- (2) C_{1-6} アルキル、
- (3) シクロアルキル- C_{0-6} アルキル、

(4) ヘテロシクロアルキル - $C_0 - 6$ アルキル、および

(5) アリール - $C_0 - 6$ アルキル

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が、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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が、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；

あるいは R^1 および R^2 が、それらが結合している窒素原子とともに、N、S および O から選択される 1 個の別のヘテロ原子を有していても良く、未置換であるか R^b 置換基で置換された、4 ~ 11 員の架橋もしくは非架橋もしくはスピロ環状の複素環を形成しており；

R^3 が、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) $C_1 - 8$ アルキルおよび

(4) トリフルオロメチル

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が、独立に R^a から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；

R^4 が、

(1) 水素、

(2) $C_1 - 8$ アルキル、

(3) トリフルオロメチル、

(4) シクロアルキル、

(5) シクロヘテロアルキル、

(6) アリール、

(7) ヘテロアリール、

(8) $-NH_2$ 、

(9) $-CO_2H$ 、

(10) $-CO_2CH_3$ および

(11) $-CO_2CH_2CH_3$

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が独立に R^a から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールおよびヘテロアリール部分が R^b 置換基で置換されていても良く；

あるいは R^3 および R^4 が、それらが結合している環炭素原子とともに、未置換であるか R^b 置換基で置換されているシクロヘキシル環を形成しており；

R^5 が、

(1) 水素、

(2) ハロゲン、

(3) メチル、

(4) トリフルオロメチル、

(5) ヒドロキシ、および

(6) メトキシ

から選択され；

R^6 が、

(1) $-(CH_2)_n - R^7$ 、

(2) $-(CH_2)_n -$ アリール $- R^7$ 、

(3) $-(CH_2)_n -$ ヘテロアリール $- R^7$ 、

(4) $-(CH_2)_n -$ ヘテロシクロアルキル $- R^7$ 、

(5) $-(CH_2)_n CON(R^7)_2$ 、

- (6) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、
 (7) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})(\text{CH}_2)_n \text{SR}^7$ 、
 (8) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、
 (9) - $(\text{CH}_2)_n \text{NH}\text{SO}_2 \text{R}^7$ 、
 (10) - $(\text{CH}_2)_n \text{N}(\text{R}^7)_2$ 、および
 (11) - $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^7 \text{SO}_2 \text{N}(\text{R}^7)_2$

からなる群から選択され；

$(\text{CH}_2)_n$ 中の水素原子の 1 個もしくは 2 個が R^a で置換されていても良く；
 R^7 が、各場合で独立に、

- (1) 水素、
 (2) $\text{C}_1 - 6$ アルキル、
 (3) アリール、
 (4) ヘテロアリール、
 (5) シクロアルキル、
 (6) ヘテロシクロアルキル、
 (7) アリール $\text{C}_1 - 3$ アルキル、
 (8) ヘテロアリール $\text{C}_1 - 3$ アルキル、
 (9) シクロアルキル $\text{C}_1 - 3$ アルキル、
 (10) ヘテロシクロアルキル $\text{C}_1 - 3$ アルキル、
 (11) アリール $\text{C}_2 - 3$ アルケニル、
 (12) ヘテロアリール $\text{C}_2 - 3$ アルケニル、
 (13) シクロアルキル $\text{C}_2 - 3$ アルケニル、および
 (14) ヘテロシクロアルキル $\text{C}_2 - 3$ アルケニル

からなる群から選択され；

前記アルキルおよびアルケニル部分が 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；前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分が独立に、 R^b から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており；含硫黄複素環が、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く；

各 R^a が独立に、

- (1) - OR^d 、
 (2) - $\text{NH}\text{SO}_2 \text{CH}_3$ 、
 (3) - NO_2 、
 (4) ハロゲン、
 (5) - $\text{S}(\text{O})_m \text{CH}_3$ 、
 (6) - SR^d 、
 (7) - $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^d$ 、
 (8) - $\text{S}(\text{O})_p \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (9) - $\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (10) - $\text{O}(\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (11) - $\text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (12) - $\text{CO}_2 \text{R}^d$ 、
 (13) - $\text{CO}_2 (\text{CR}^d \text{R}^d)_n \text{CON}(\text{R}^d)_2$ 、
 (14) - $\text{OC}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (15) - CN 、
 (16) - $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (17) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{R}^d$ 、
 (18) - $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (19) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{OR}^d$ 、
 (20) - $\text{NR}^d \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^d)_2$ 、
 (21) - $\text{CR}^d (\text{N} - \text{OR}^d)$ 、

- (2 2) - C F ₃ 、
- (2 3) シクロアルキル、
- (2 4) シクロヘテロアルキル、および
- (2 5) オキソ

から選択され；

各 R^b が独立に、

- (1) R^a 、
- (2) - S n (C H ₃) ₃ 、
- (3) C ₁ - ₆ アルキル、
- (4) C ₂ - ₆ アルケニル、
- (5) ヘテロアリール、
- (6) アリール、および
- (7) アリール - C ₁ - ₁₀ アルキル

から選択され；

R^a および R^b におけるアルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリール部分が、1 ~ 4 個の R^c 置換基で置換されていても良く；

各 R^c が独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) カルボキシ、
- (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) - C F ₃ 、
- (10) - O C (O) C ₁ - ₄ アルキル、
- (11) - O C (O) N (R^d) ₂ 、および
- (12) アリールオキシ

から選択され；

R^d が独立に、水素、C ₁ - ₆ アルキル、C ₂ - ₆ アルケニル；C ₂ - ₆ アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキル - C ₁ - ₆ アルキル；シクロヘテロアルキル；シクロヘテロアルキル - C ₁ - ₆ アルキル；アリール；ヘテロアリール；アリール - C ₁ - ₆ アルキル；およびヘテロアリール - C ₁ - ₆ アルキルから選択され；R^d における前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールが、独立に R^e から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；

各 R^e が、ハロゲン、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシおよびヒドロキシから選択され；

m が 1 および 2 から選択され；

n が 0、1、2、3 および 4 から選択され；

p が 0、1 および 2 から選択される、請求項 3 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】

R¹ が、

- (1) 水素および
 - (2) 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いメチル
- からなる群から選択され；

R² が、

- (1) メチル、
- (2) エチル、
- (3) n - プロピル、
- (4) イソプロピル、
- (5) t - ブチル、
- (6) n - ブチル、
- (7) シクロプロピル、
- (8) シクロブチル、
- (9) シクロペンチル、
- (10) シクロヘキシル、

(11) ヘテロシクロアルキル - C_{0-6} アルキルであって、前記ヘテロシクロアルキル部分がアゼチジニル、ピロリジニルおよびピリジルから選択されるもの、および

- (12) フェニル - C_{0-6} アルキル
- からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が、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；上記のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルおよびアリール部分が、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；

あるいは R^1 および R^2 が、それらが結合している窒素原子とともに、未置換であるか R^b 置換基で置換されたアゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、モルホリニル、1 - チア - 4 - アザシクロヘキシル、2, 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 2] オクタニル、アザシクロヘブチル、2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘブチル、2, 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘブチル、2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘブチル、7 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘブチル、2, 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 2] オクチル、2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクチル、および 3 - アザビシクロ [3 . 2 . 2] ノニル、2, 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノニル、2, 7 - ジアザスピロ [4 . 5] デシル、2, 7 - ジアザスピロ [4 . 6] ウンデシル、1, 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノニル、2, 6 - ジアザスピロ [4 . 5] デシル、2, 6 - ジアザスピロ [4 . 6] - ウンデシルから選択される 4 ~ 11 員の複素環を形成しており；

R^3 が、

- (1) 水素、
- (2) ハロゲン、
- (3) メチル、
- (4) エチル、
- (5) プロピルおよび
- (6) トリフルオロメチル

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が、独立に R^a から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていても良く；

R^4 が、

- (1) 水素、
- (2) メチル、
- (3) エチル、
- (4) プロピル、
- (5) トリフルオロメチル、
- (6) - CO_2H 、
- (7) - CO_2CH_3 および
- (8) - $CO_2CH_2CH_3$

からなる群から選択され；

上記のアルキル部分が独立に 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；

あるいは R^3 および R^4 が、それらが結合している環炭素原子とともに、未置換であるかオキソまたはヒドロキシで置換されているシクロヘキシル環を形成しており；

R^5 が水素であり；

R^6 が、

(1) - R^7 、

(2) - ヘテロアリール - R^7 、

(3) - $CON(R^7)(CH_3)$ 、

(4) - CH_2CONHR^7 、

(5) - $CH_2CON(R^7)(CH_3)$ 、

(6) - $CH_2NHC(O)R^7$ 、

(7) - $NHC(O)R^7$ 、

(8) - $(CH_2)_nNHC(O)(CH_2)_nSR^7$ 、

(9) - $(CH_2)_nNHC(O)N(CH_3)(R^7)$ 、

(10) - $(CH_2)_nNHC(O)NH(R^7)$ 、

(11) - $(CH_2)_nNH SO_2 R^7$ 、

(12) - $NH(R^7)$ 、

(13) - $N(COCH_3)(R^7)$ 、

(14) - $(CH_2)_nNH(R^7)$ 、および

(15) - $(CH_2)_nN(COCH_3)(R^7)$

からなる群から選択され；

$(CH_2)_n$ 中の水素原子の1個もしくは2個が R^a で置換されていても良く；

R^7 が、各場合において独立に、

(1) 水素、

(2) C_{1-6} アルキル、

(3) フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、インドリル、キナゾリニル、キノリニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ジヒドロインダニル、ベンゾイソジアゾリル、スピロシクロヘキシルインドリニル、スピロ - (ジヒドロベンゾチオフェニル) ピペリジニル、スピロ - インドリニルピペリジニル、インドリニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾトリアゾリル、1,3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾジオキサソリル、テトラヒドロナフチル、2,3 - ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾピラニルおよび1,4 - ベンゾジオキサニルから選択されるアリール、

(4) ピロリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピリジル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、フラニル、トリアジニル、チエニル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、フロ[2,3-b]ピリジル、キノリル、インドリル、イソキノリル、キナゾリニル、ベンゾイソジアゾリル、トリアゾロピリミジニル、5,6,7,8 - テトラヒドロキノリニル、2,1,3 - ベンゾチアジアゾリルおよびチエノピリジニルから選択されるヘテロアリール、

(5) シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、テトラヒドロナフチル、デカヒドロナフチル、インダニル、ピシクロ[2.2.2]オクタニル、テトラヒドロナフチルおよびジヒドロインダニルから選択されるシクロアルキル、

(6) アゼチジニル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、イミダゾリジニル、モルホリニル、1 - チア - 4 - アザ - シクロヘキサン、2,5 - ジアザピシクロ[2.2.2]オクタニル、2,3 - ジヒドロフロ[2,3-b]ピリジル、ベンゾオキサジニル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、ジヒドロインドリル、インドリル、インドリニル、イソインドリニル、1,3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾジオキサソリル、ヘキサヒドロチエノピリジニル、チエノピリジニル、アザ

シクロヘブチル、4, 4 - スピロ [2 , 3 - ジヒドロベンゾチオフェン - 3 , 3 - イル] ピペリジニルおよび 4 , 4 - スピロ [インドリ - 3 , 3 - イル] ピペリジニルから選択されるヘテロシクロアルキル、

(7) アリール C_{1-3} アルキル (前記アリール部分は、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、インドリル、キナゾリニル、キノリニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ジヒドロインダニル、ベンゾイソジアゾリル、スピロシクロヘキシルインドリニル、スピロ - (ジヒドロベンゾチオフェニル) ピペリジニル、スピロ - インドリニルピペリジニル、インドリニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾトリアゾリル、1, 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾジオキサソリル、テトラヒドロナフチル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾピラニルおよび 1, 4 - ベンゾジオキサニルから選択される)

(8) ヘテロアリール C_{1-3} アルキル (前記ヘテロアリール部分は、ピロリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピリジル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、フラニル、トリアジニル、チエニル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、フロ [2 , 3 - b] ピリジル、キノリル、インドリル、イソキノリル、キナゾリニル、ベンゾイソジアゾリル、トリアゾロピリミジニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリニル、2, 1, 3 - ベンゾチアジアゾリルおよびチエノピリジニルから選択される)、

(9) シクロアルキル C_{1-3} アルキル (前記シクロアルキル部分は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘブチル、テトラヒドロナフチル、デカヒドロナフチル、インダニル、ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタニル、テトラヒドロナフチルおよびジヒドロインダニルから選択される)、

(10) ヘテロシクロアルキル C_{1-3} アルキル (前記ヘテロシクロアルキル部分は、アゼチジニル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、イミダゾリジニル、モルホリニル、1 - チア - 4 - アザ - シクロヘキサン、2, 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 2] オクタニル、2, 3 - ジヒドロフロ [2 , 3 - b] ピリジル、ベンゾオキサジニル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、ジヒドロインドリル、インドリル、インドリニル、イソインドリニル、1, 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾジオキサソリル、ヘキサヒドロチエノピリジニル、チエノピリジニル、アザシクロヘブチル、4, 4 - スピロ [2 , 3 - ジヒドロベンゾチオフェン - 3 , 3 - イル] ピペリジニルおよび 4 , 4 - スピロ [インドリ - 3 , 3 - イル] ピペリジニルから選択される)、

(11) アリール C_{2-3} アルケニル (前記アリール部分は、フェニル、ナフチル、インダニル、インデニル、インドリル、キナゾリニル、キノリニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ジヒドロインダニル、ベンゾイソジアゾリル、スピロシクロヘキシルインドリニル、スピロ - (ジヒドロベンゾチオフェニル) ピペリジニル、スピロ - インドリニルピペリジニル、インドリニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾトリアゾリル、1, 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾジオキサソリル、テトラヒドロナフチル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、ジヒドロベンゾピラニルおよび 1, 4 - ベンゾジオキサニルから選択される)、

(12) ヘテロアリール C_{2-3} アルケニル (前記ヘテロアリール部分は、ピロリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピリジル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、フラニル、トリアジニル、チエニル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、フロ [2 , 3 - b] ピリジル、キノリル、インドリル、イソキノリル、キナゾリニル、ベンゾイソジアゾリル、トリアゾロピリミジニル、5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリニル、2, 1, 3 - ベンゾチアジアゾリルおよびチエノピリジニルから選択される)、

(1 3) シクロアルキル C_{2-3} アルケニル (前記シクロアルキル部分は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、テトラヒドロナフチル、デカヒドロナフチル、インダニル、ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタニル、テトラヒドロナフチルおよびジヒドロインダニルから選択される)、および

(1 4) ヘテロシクロアルキル C_{2-3} アルケニル (前記ヘテロシクロアルキル部分は、アゼチジニル、ピリジル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、イミダゾリジニル、モルホリニル、1 - チア - 4 - アザ - シクロヘキサン、2 , 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 2] オクタニル、2 , 3 - ジヒドロフロ [2 , 3 - b] ピリジル、ベンゾオキサジニル、テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、ジヒドロインドリル、インドリル、インドリニル、イソインドリニル、1 , 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾフラニル、ベンゾジオキサソリル、ヘキサヒドロチエノピリジニル、チエノピリジニル、アザシクロヘプチル、4 , 4 - スピロ [2 , 3 - ジヒドロベンゾチオフェン - 3 , 3 - イル] ピペリジニルおよび 4 , 4 - スピロ [インドリ - 3 , 3 - イル] ピペリジニルから選択される) からなる群から選択され ;

前記アルキル部分が、 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 ; 前記アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分が独立に、 R^b から選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており ; 含硫黄複素環が、硫黄原子上でモノ酸化またはジ酸化されていても良く ;

各 R^a が独立に、

- (1) - OR^d 、
- (2) - $NHSO_2CH_3$ 、
- (3) - NO_2 、
- (4) ハロゲン、
- (5) - $S(O)_mCH_3$ 、
- (6) - SCH_3 、
- (7) - SCF_3 、
- (8) - $S(O)_2OR^d$ 、
- (9) - $S(O)_pN(R^d)_2$ 、
- (10) - $N(CH_3)_2$ 、
- (11) - NH_2 、
- (12) - $O(CR^dR^d)_nN(R^d)_2$ 、
- (13) - $C(O)R^d$ 、
- (14) - CO_2H 、
- (15) - CO_2CH_3 、
- (16) t - ブチルオキシカルボニル、
- (17) - $CO_2(CR^dR^d)_nCON(R^d)_2$ 、
- (18) - $OC(O)R^d$ 、
- (19) - CN 、
- (20) - $C(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) - $NR^dC(O)R^d$ 、
- (22) - $OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (23) - $NR^dC(O)OR^d$ 、
- (24) - $NR^dC(O)N(R^d)_2$ 、
- (25) - $CR^d(N-OR^d)$ 、
- (26) - CF_3 、
- (27) シクロアルキル、
- (28) シクロヘテロアルキル、および
- (29) オキソ

から選択され ;

各 R^b が独立に、

- (1) R^a 、
- (2) $-Sn(CH_3)_3$ 、
- (3) C_{1-6} アルキル、
- (4) C_{2-6} アルケニル、
- (5) ヘテロアリール、
- (6) アリール、および
- (7) アリール - C_{1-10} アルキル

から選択され；

R^a および R^b におけるアルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリール部分が、1～4個の R^c 置換基で置換されていても良く；

各 R^c が独立に、

- (1) ハロゲン、
- (2) アミノ、
- (3) カルボキシ、
- (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) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、および
- (12) アリールオキシ

から選択され

R^d が独立に、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル； C_{2-6} アルキニル；シクロアルキル；シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；シクロヘテロアルキル；シクロヘテロアルキル - C_{1-6} アルキル；アリール；ヘテロアリール；アリール - C_{1-6} アルキル；およびヘテロアリール - C_{1-6} アルキルから選択され； R^d における前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールおよびアリールが、独立に R^e から選択される1～2個の置換基で置換されていても良く；

各 R^e が、ハロゲン、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシおよびヒドロキシから選択され；

mが1および2から選択され；

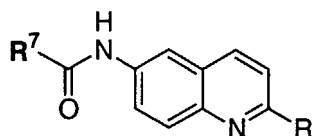
nが0、1、2、3および4から選択され；

pが0、1および2から選択される、請求項4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6】

下記構造式を有する請求項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。

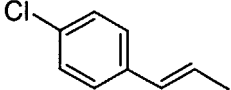
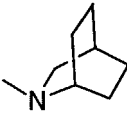
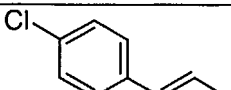
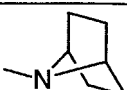
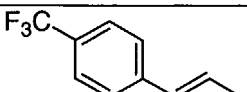
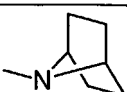
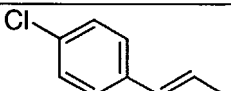
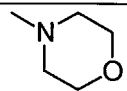
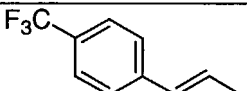
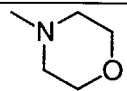
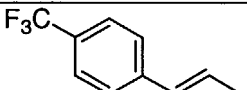
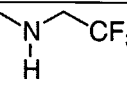
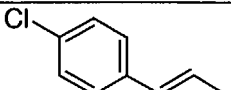
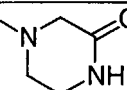
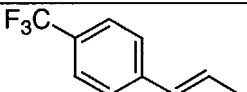
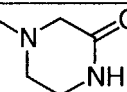
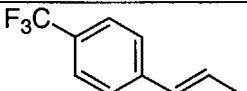
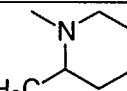
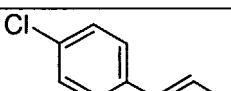
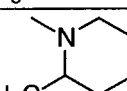
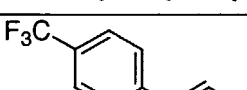
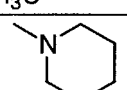
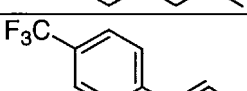
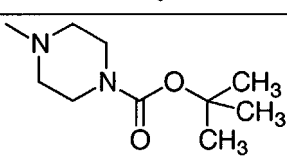
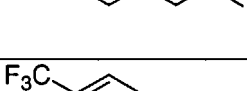
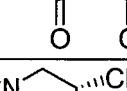
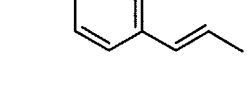
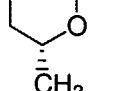
【化2】

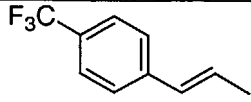
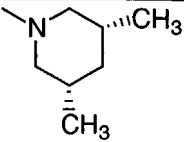
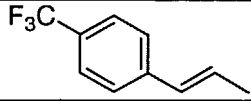
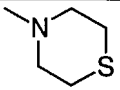
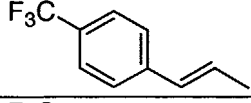
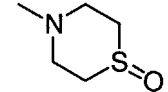
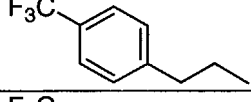
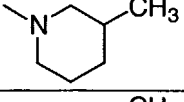
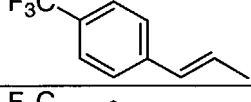
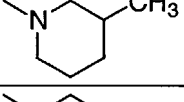
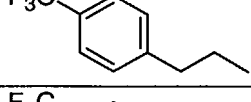
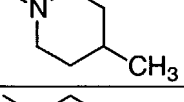
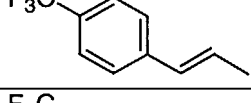
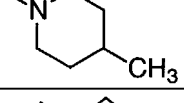
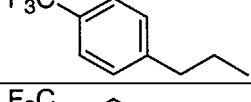
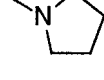
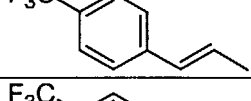
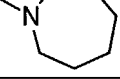
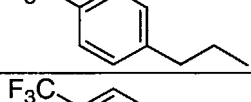
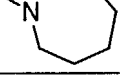
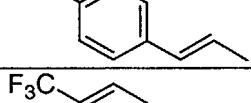
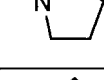
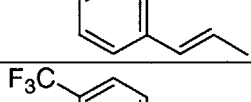
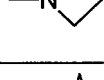
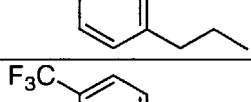
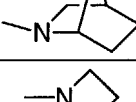
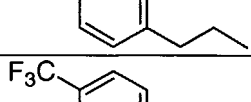
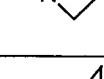
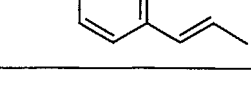
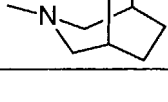


[式中、 R^7 および R は下記の表に示した通りである。]

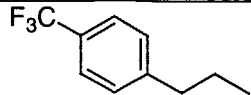
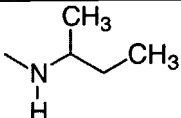
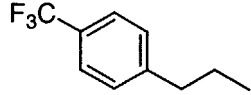
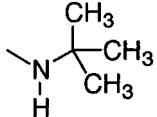
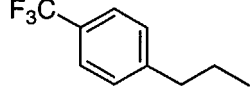
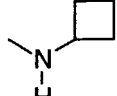
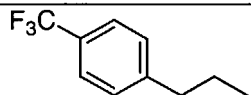
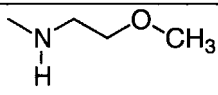
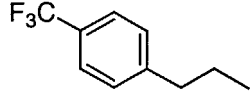
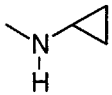
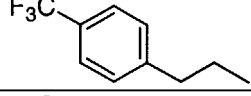
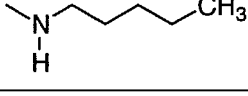
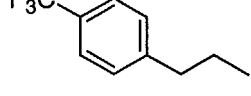
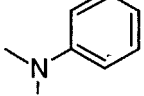
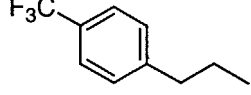
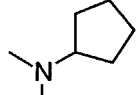
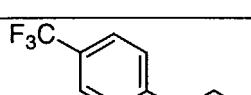
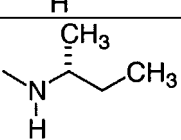
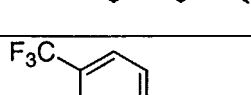
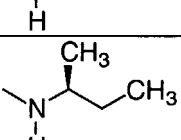
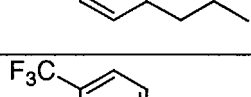
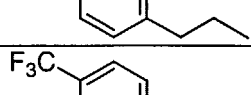
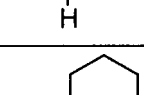
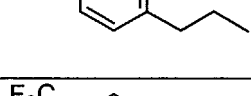
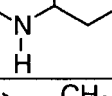
【表 1】

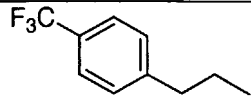
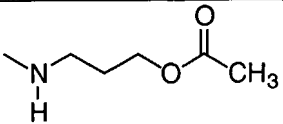
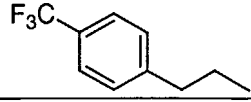
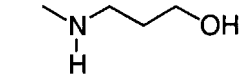
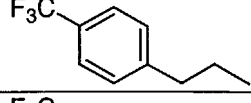
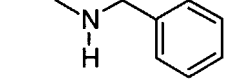
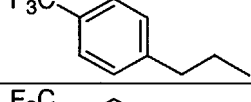
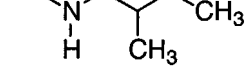
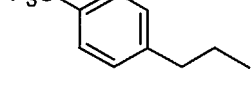
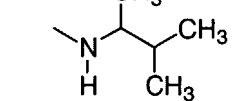
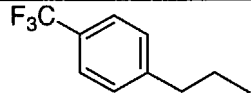
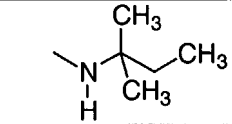
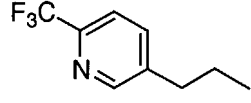
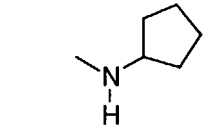
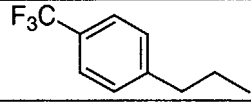
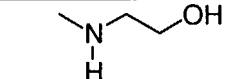
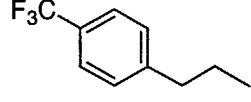
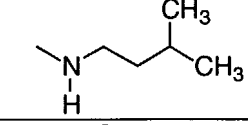
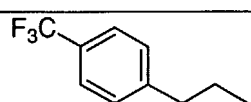
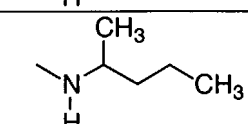
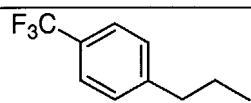
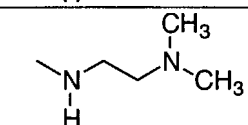
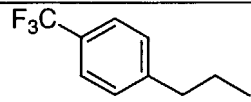
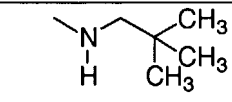
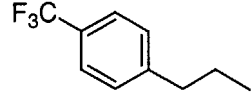
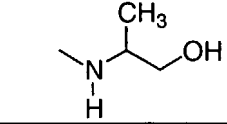
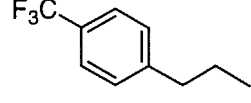
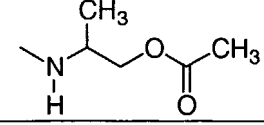
実施例番号	<u>R</u> ⁷	R = NR ¹ R ²
1		
2		
3		
4		
5		
6		
7		
8		
9		
10		
11		

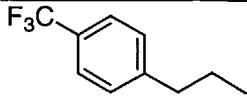
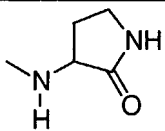
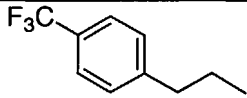
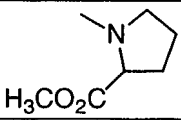
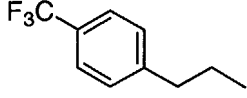
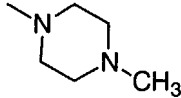
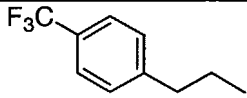
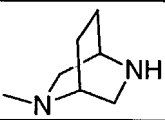
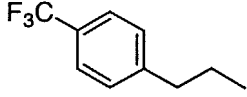
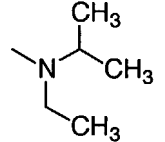
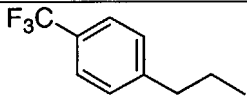
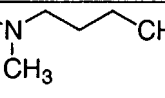
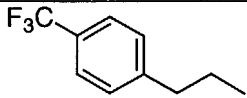
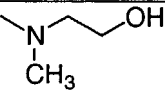
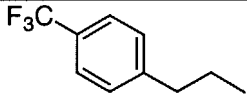
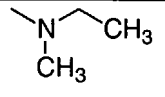
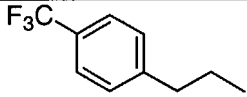
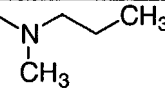
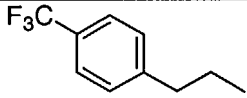
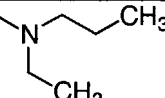
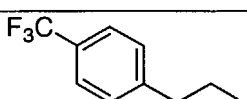
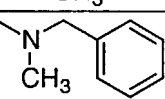
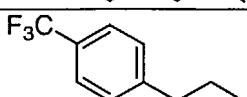
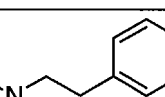
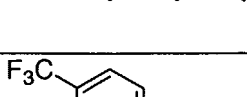
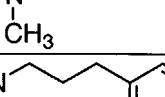
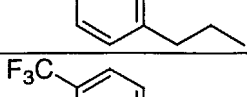
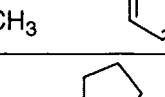
12		
13		
14		
15		
16		
17		
18		
19		
20		
21		
22		
23		
24		
25		

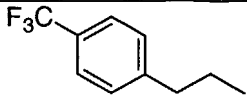
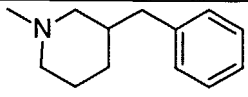
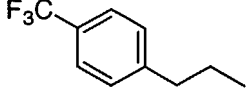
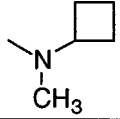
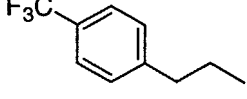
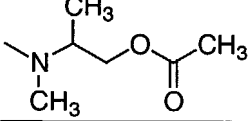
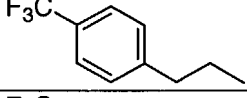
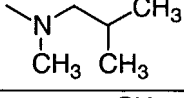
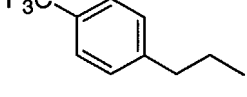
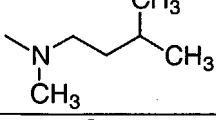
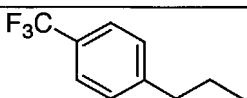
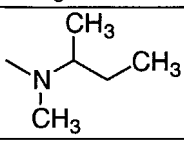
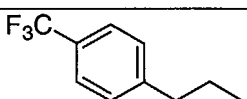
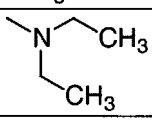
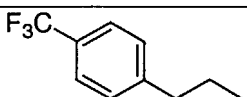
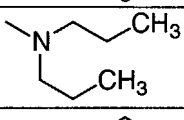
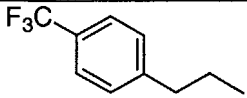
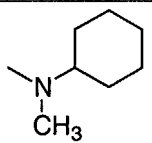
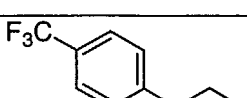
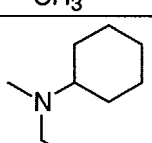
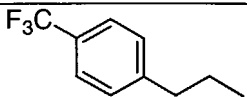
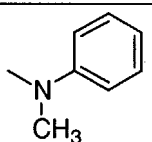
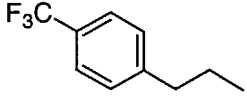
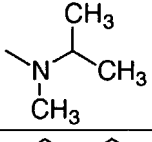
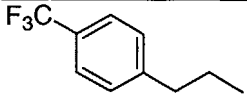
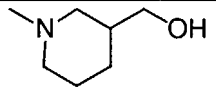
26		
27		
28		
29		
30		
31		
32		
33		
34		
35		
36		
37		
38		
39		
40		

41		
42		
43		
44		
45		
46		
47		
48		
49		
50		
51		
52		
53		
54		
55		

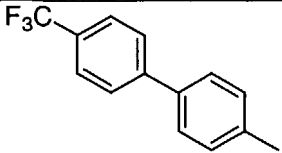
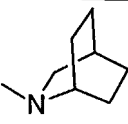
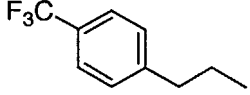
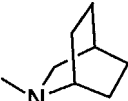
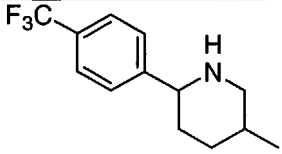
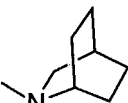
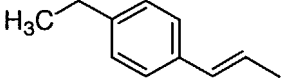
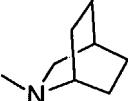
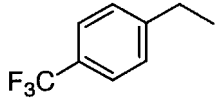
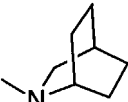
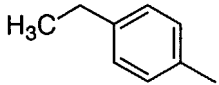
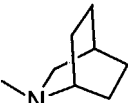
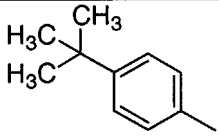
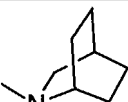
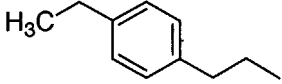
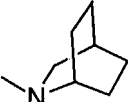
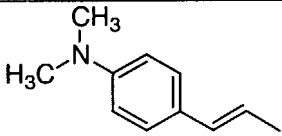
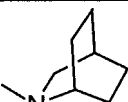
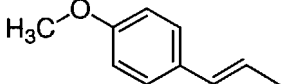
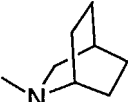
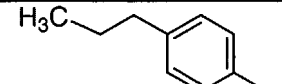
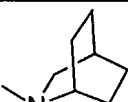
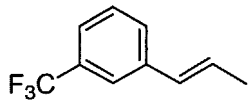
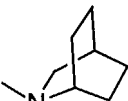
56		
57		
58		
59		
60		
61		
62		
63		
64		
65		
66		
67		
68		

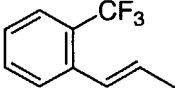
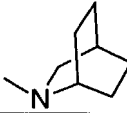
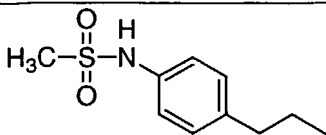
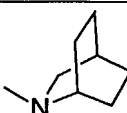
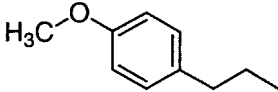
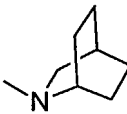
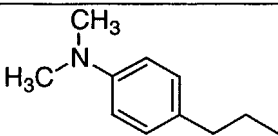
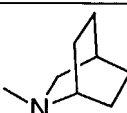
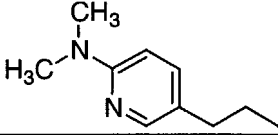
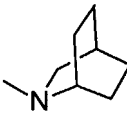
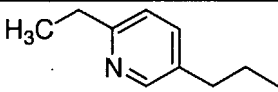
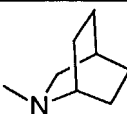
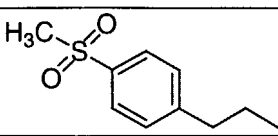
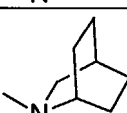
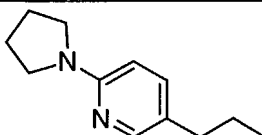
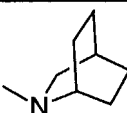
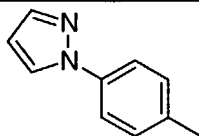
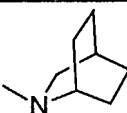
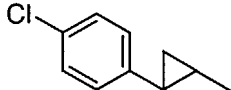
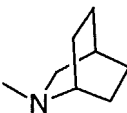
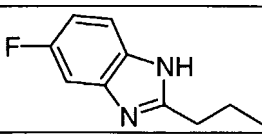
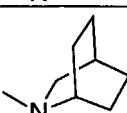
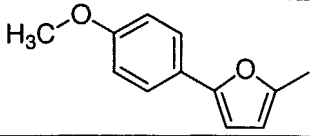
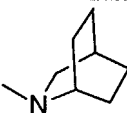
69		
70		
71		
72		
73		
74		
75		
76		
77		
78		
79		
80		
81		
82		

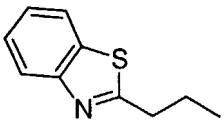
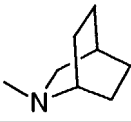
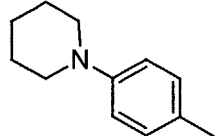
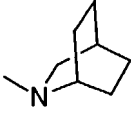
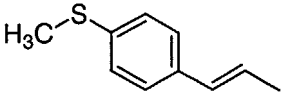
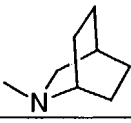
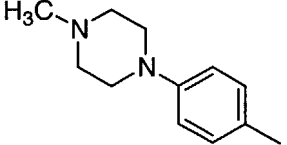
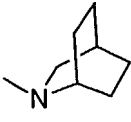
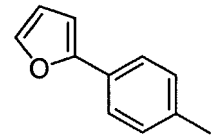
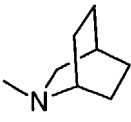
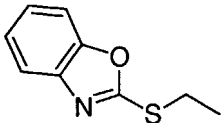
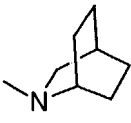
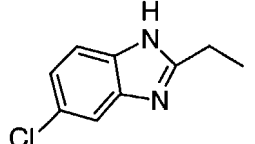
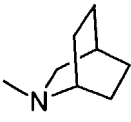
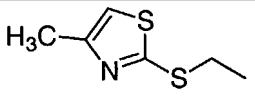
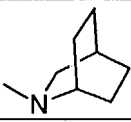
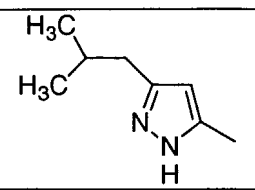
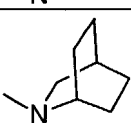
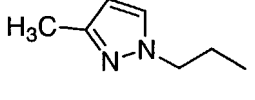
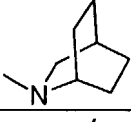
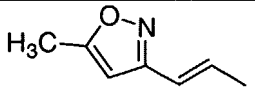
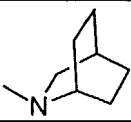
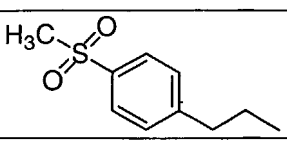
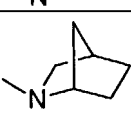
83		
84		
85		
86		
87		
88		
89		
90		
91		
92		
93		
94		
95		
96		

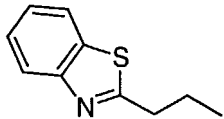
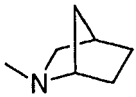
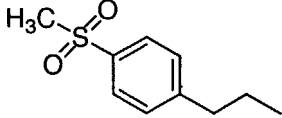
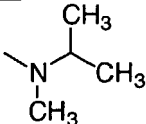
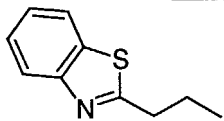
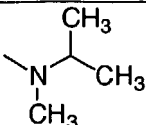
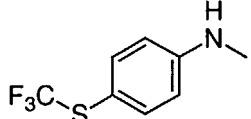
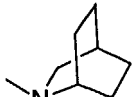
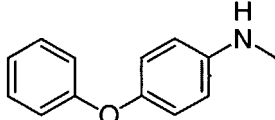
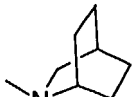
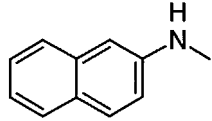
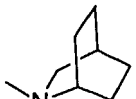
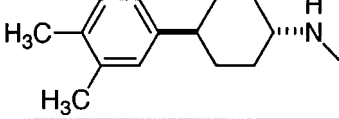
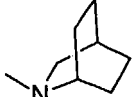
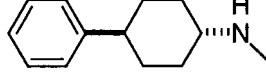
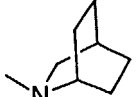
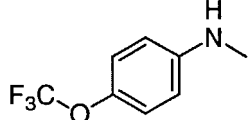
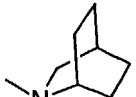
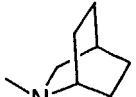
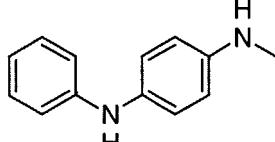
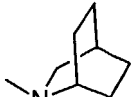
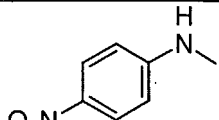
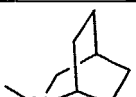
97		
98		
99		
100		
101		
102		
103		
104		
105		
106		
107		
108		
109		

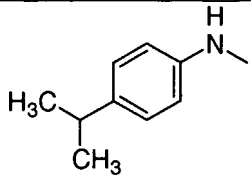
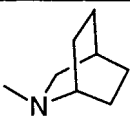
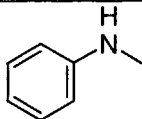
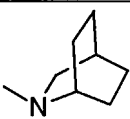
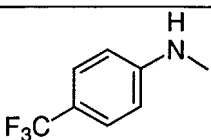
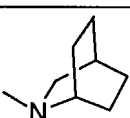
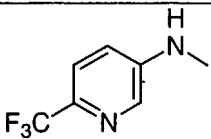
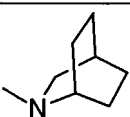
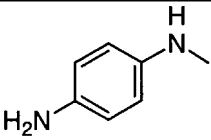
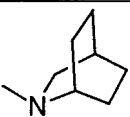
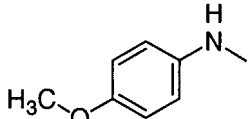
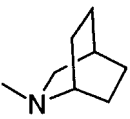
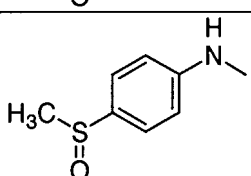
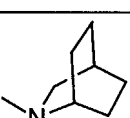
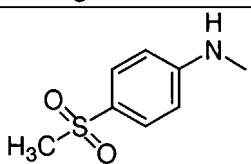
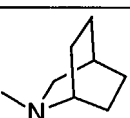
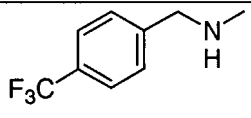
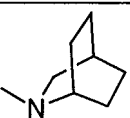
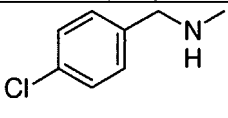
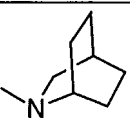
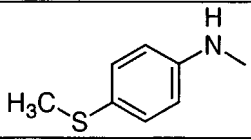
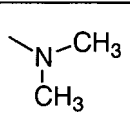
110		
111		
112		
113		
114		
115		
116		
117		
118		
119		
120		
121		
122		

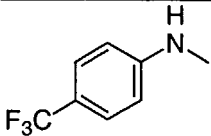
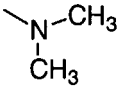
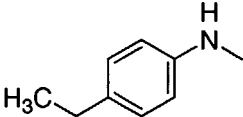
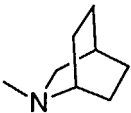
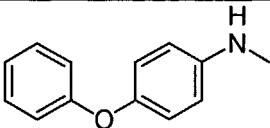
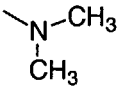
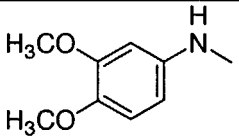
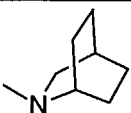
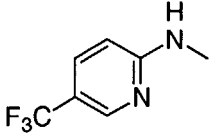
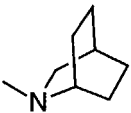
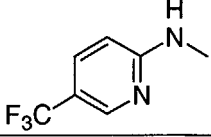
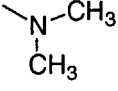
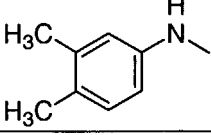
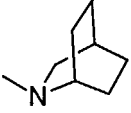
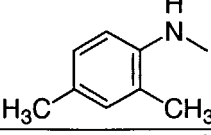
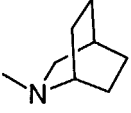
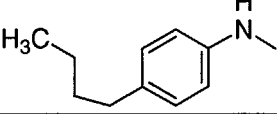
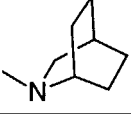
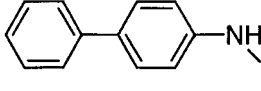
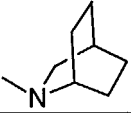
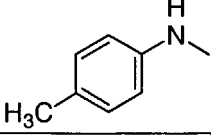
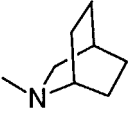
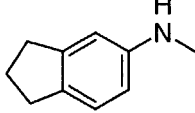
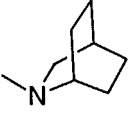
123		
124		
125		
126		
127		
128		
129		
130		
131		
132		
133		
134		

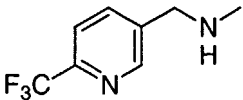
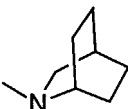
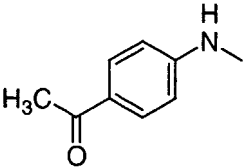
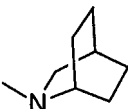
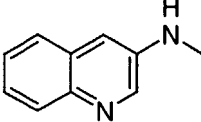
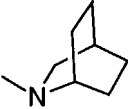
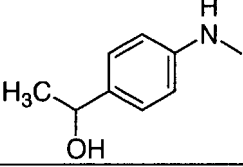
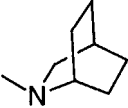
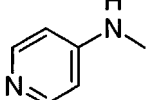
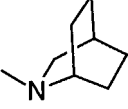
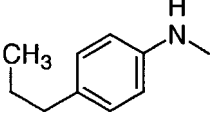
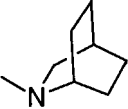
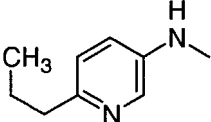
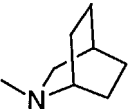
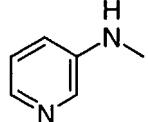
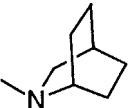
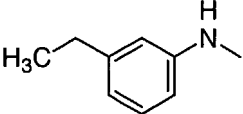
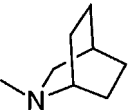
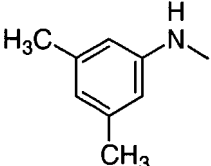
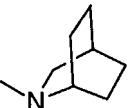
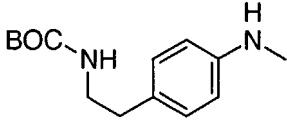
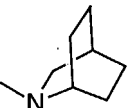
135		
136		
137		
138		
139		
140		
141		
142		
143		
144		
145		
146		

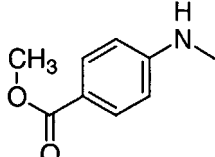
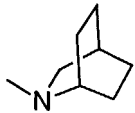
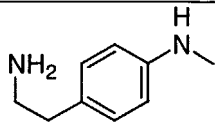
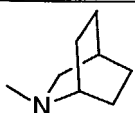
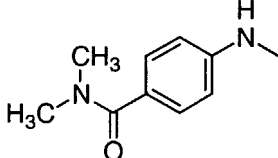
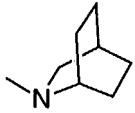
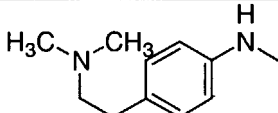
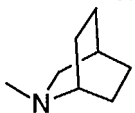
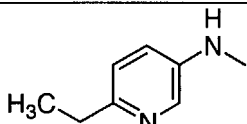
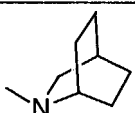
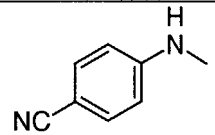
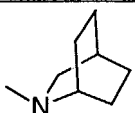
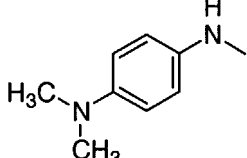
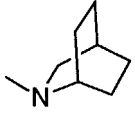
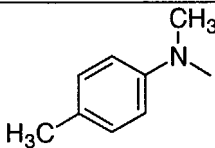
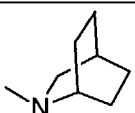
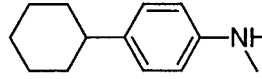
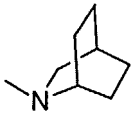
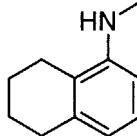
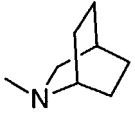
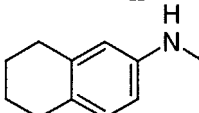
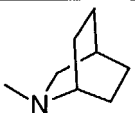
147		
148		
149		
150		
151		
152		
153		
154		
155		
156		
157		
158		

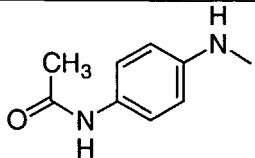
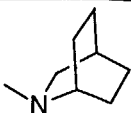
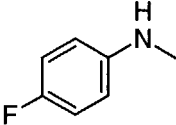
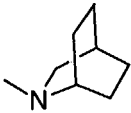
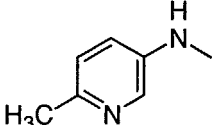
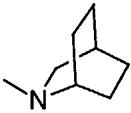
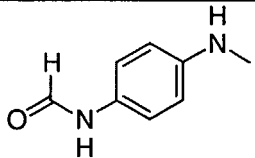
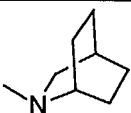
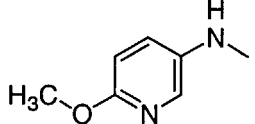
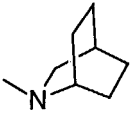
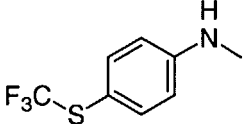
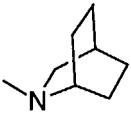
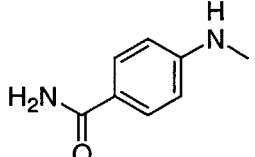
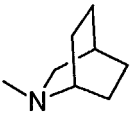
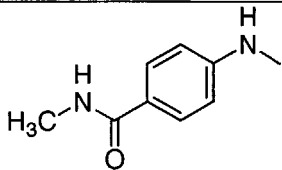
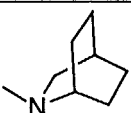
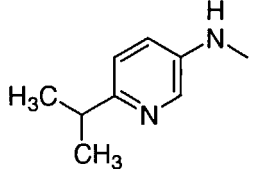
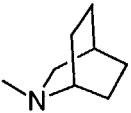
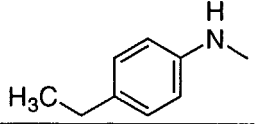
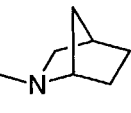
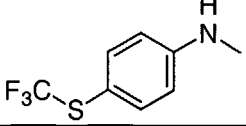
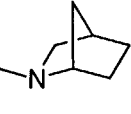
159		
160		
161		
162		
163		
164		
165		
166		
167		
168		
169		
170		

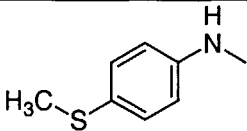
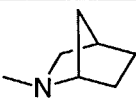
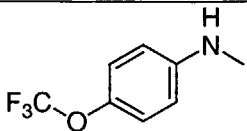
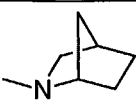
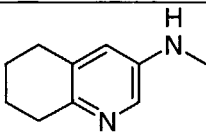
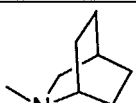
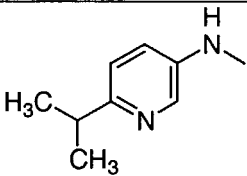
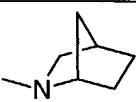
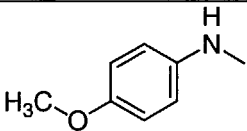
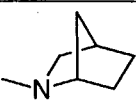
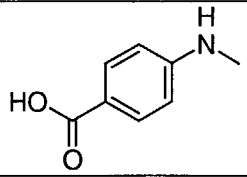
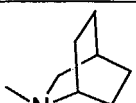
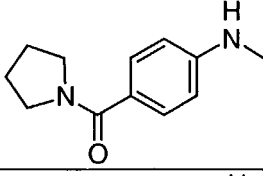
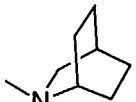
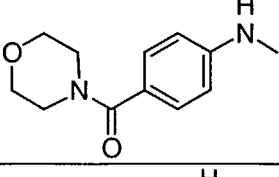
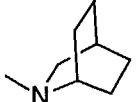
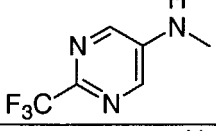
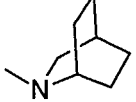
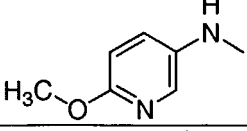
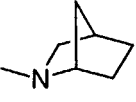
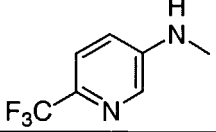
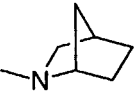
171		
172		
173		
174		
175		
176		
177		
178		
179		
180		
181		

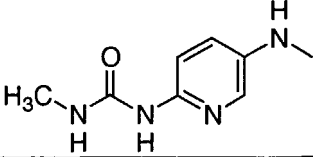
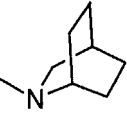
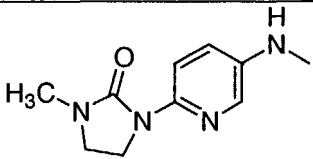
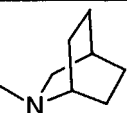
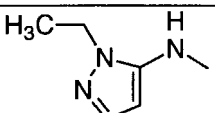
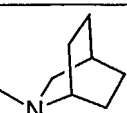
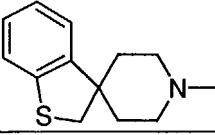
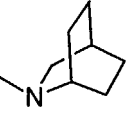
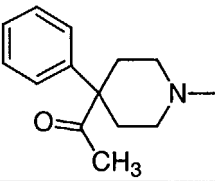
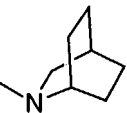
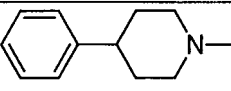
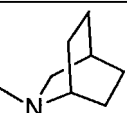
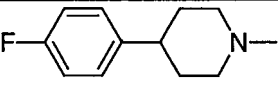
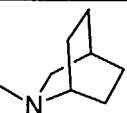
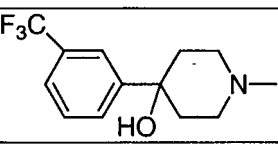
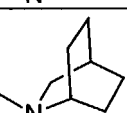
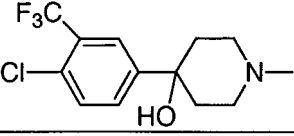
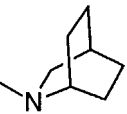
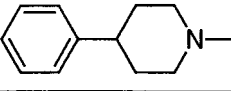
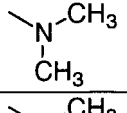
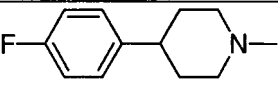
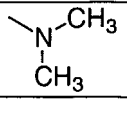
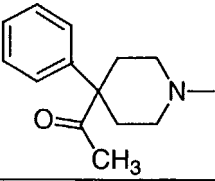
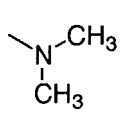
182		
183		
184		
185		
186		
185		
186		
187		
188		
189		
190		
191		

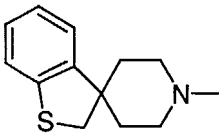
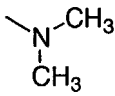
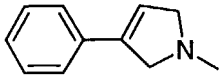
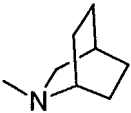
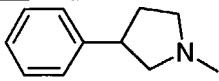
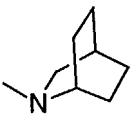
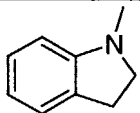
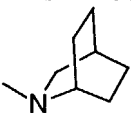
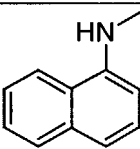
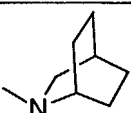
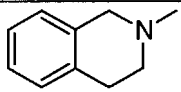
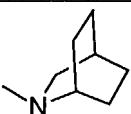
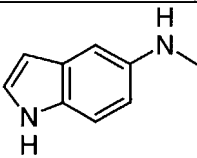
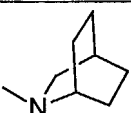
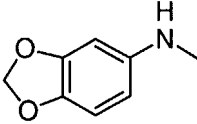
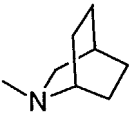
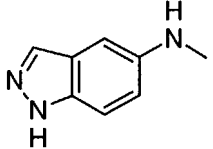
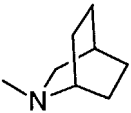
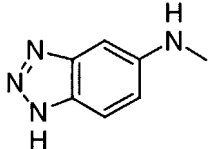
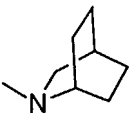
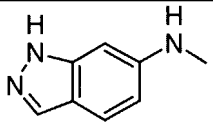
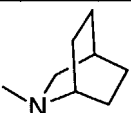
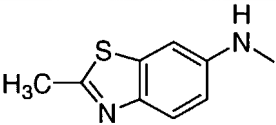
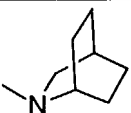
192	 <chem>CN(C)Cc1cc(C(F)(F)F)nc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
193	 <chem>CC(=O)c1ccc(NC)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
194	 <chem>CN(C)c1ccc2ccccc2n1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
195	 <chem>CC(O)(C)c1ccc(NC)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
196	 <chem>CN(C)c1ccncc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
197	 <chem>CC(C)c1ccc(NC)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
198	 <chem>CCc1cc(CN(C))nc(CCC)n1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
199	 <chem>CN(C)c1ccncc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
200	 <chem>CC(C)c1cccc(NC)c1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
201	 <chem>CC(C)c1cc(C)c(C)cc1N(C)</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
202	 <chem>CCOC(=O)NCCc1ccc(NC)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>

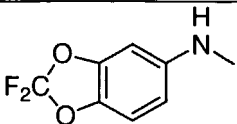
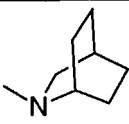
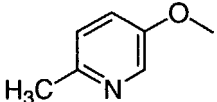
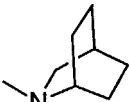
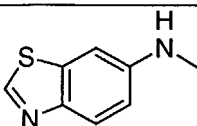
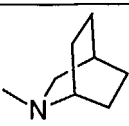
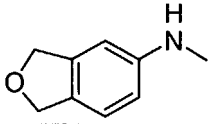
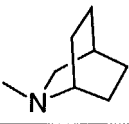
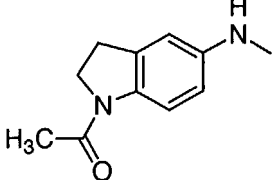
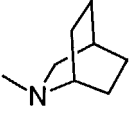
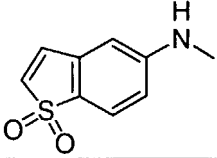
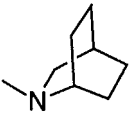
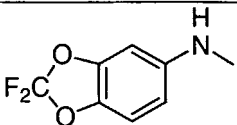
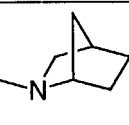
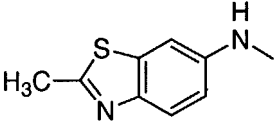
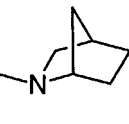
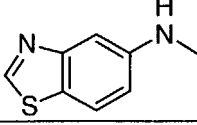
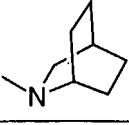
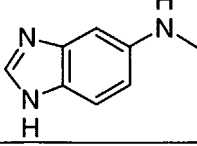
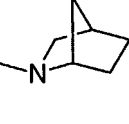
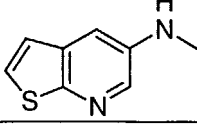
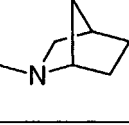
203		
204		
205		
206		
207		
208		
209		
210		
211		
212		
213		

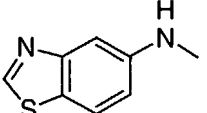
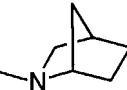
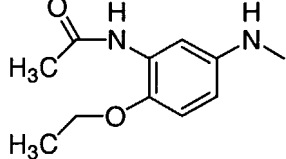
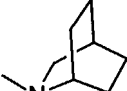
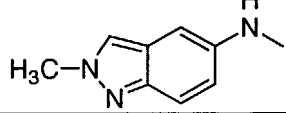
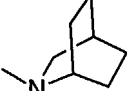
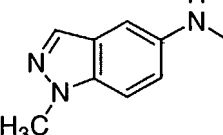
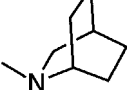
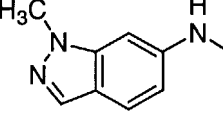
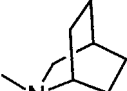
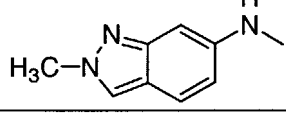
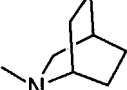
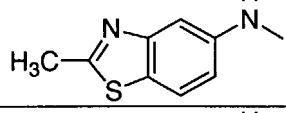
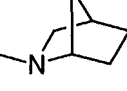
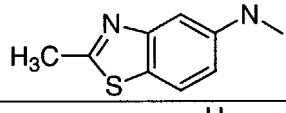
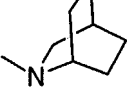
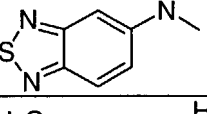
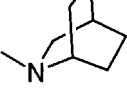
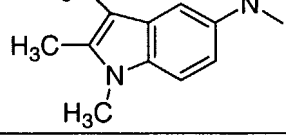
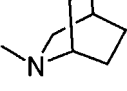
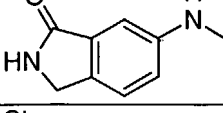
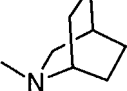
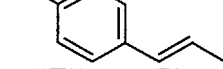
214		
215		
216		
217		
218		
219		
220		
221		
222		
223		
224		

225		
226		
227		
228		
229		
230		
231		
232		
233		
234		
235		

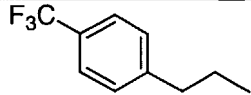
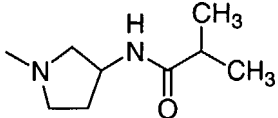
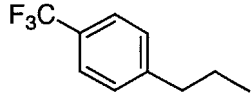
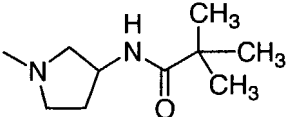
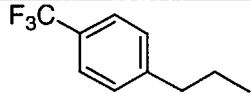
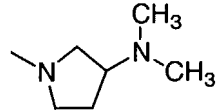
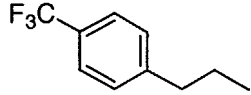
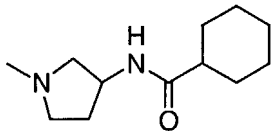
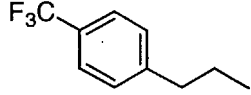
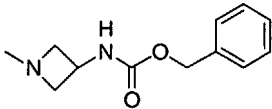
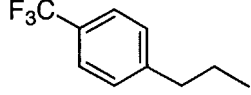
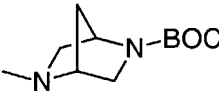
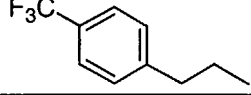
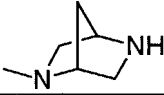
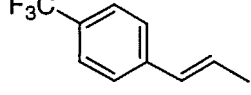
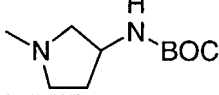
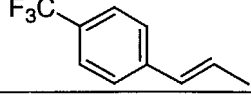
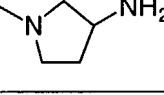
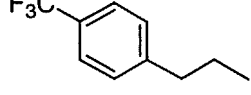
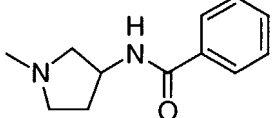
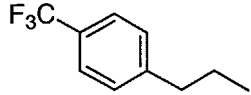
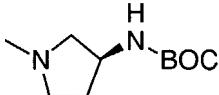
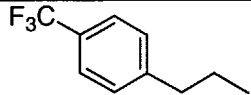
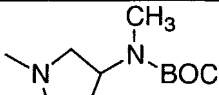
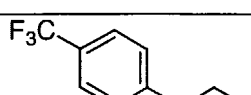
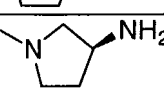
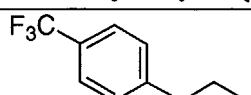
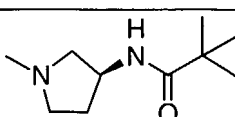
236		
237		
238		
239		
240		
241		
242		
243		
244		
245		
246		
247		

248		
249		
250		
251		
252		
253		
254		
255		
256		
257		
258		
259		

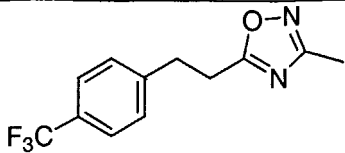
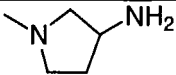
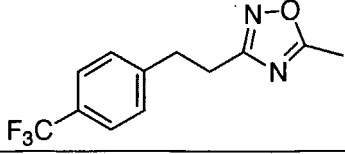
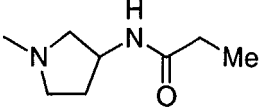
260	 <chem>CN(C)c1ccc(OC(F)F)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
261	 <chem>CN(C)c1cc(OC)cc(C)c1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
262	 <chem>CN(C)c1ccc2ncsc2c1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
263	 <chem>CN(C)c1ccc2c(c1)OCO2</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
264	 <chem>CC(=O)N1Cc2ccc(NC)cc21</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
265	 <chem>CN(C)c1ccc(S(=O)(=O)c2ccccc2)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
266	 <chem>CN(C)c1ccc(OC(F)F)cc1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
267	 <chem>CN(C)c1ccc2nc(C)s2c1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
268	 <chem>CN(C)c1ccc2ncsc2c1</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
269	 <chem>CN(C)c1ccc2c(c1)nc[nH]2</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>
270	 <chem>CN(C)c1ccc2c(c1)sc[nH]2</chem>	 <chem>CN1CCC2CCCC12</chem>

271		
272		
273		
274		
275		
276		
277		
278		
279		
280		
281		
282		

321		
322		
323		
324		
325		
326		
327		
328		
329		
330		
331		
332		
333		
334		

335		
336		
337		
338		
339		
340		
341		
342		
343		
344		
345		
346		
347		
348		

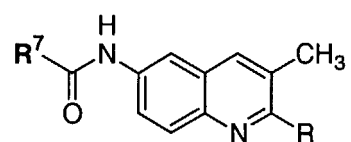
349		
350		
351		
352		
353		
354		
355		
356		
357		
358		
359		
360		

361		
362		

【請求項 7】

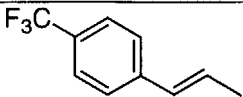
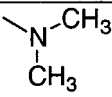
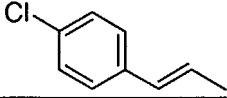
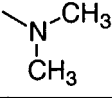
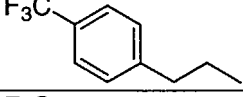
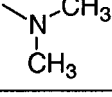
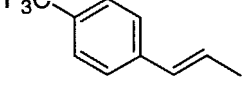
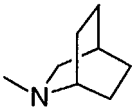
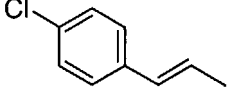
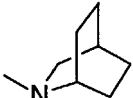
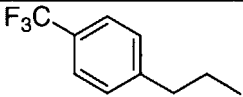
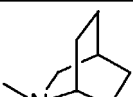
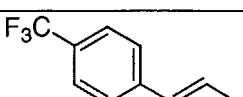
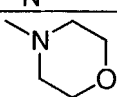
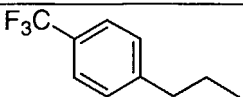
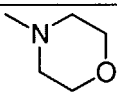
下記構造式を有する請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

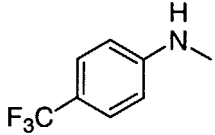
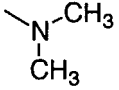
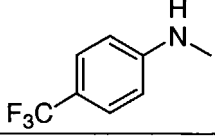
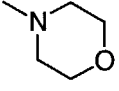
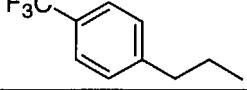
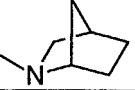
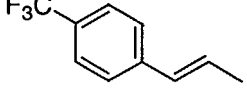
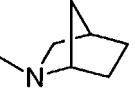
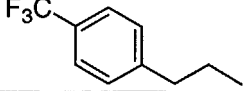
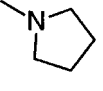
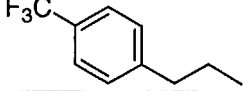
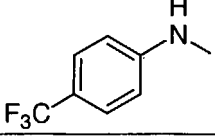
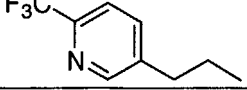
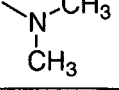
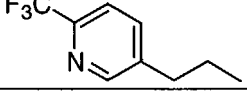
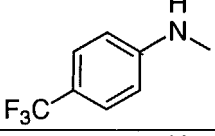
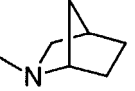
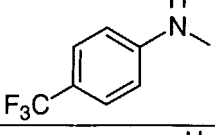
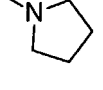
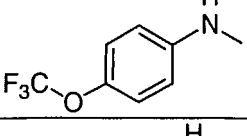
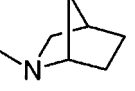
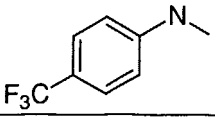
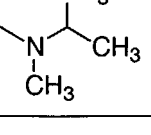
【化 3】

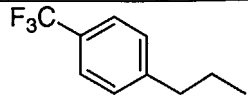
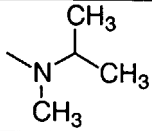
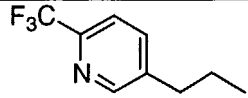
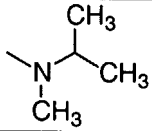
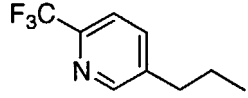
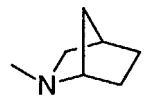
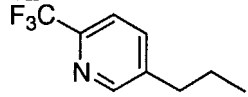
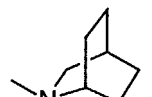
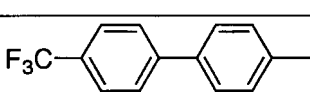
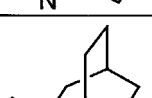
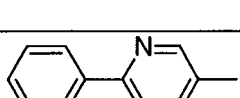
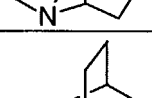
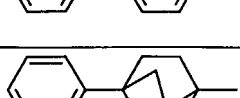
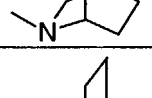


[式中、 R^7 および R は下記の表に示した通りである。]

【表 2】

実施例番号	R^7	$R = NR^1R^2$
283		
284		
285		
286		
287		
288		
289		
290		

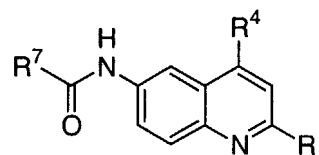
291		
292		
293		
294		
295		
296		
297		
298		
299		
300		
301		
302		
303		

304		
305		
306		
307		
308		
309		
310		

【請求項 8】

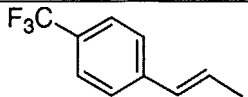
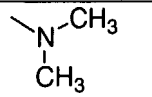
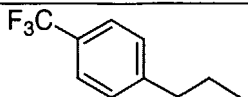
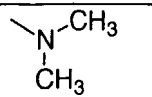
下記構造式を有する請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化 4】



[式中、 R^7 、 R^4 および R は下記の表に示した通りである。]

【表 3】

実施例番号	R^7	R^4	$R = NR^1R^2$
311		-CH ₃	
312		-CH ₃	

313		-CH ₃	
314		-CH ₃	
315		-CH ₂ CH ₃	
316		-CH ₂ CH ₃	
317		-CH ₂ CH ₃	
318		-CH ₂ CH ₃	
319		-CO ₂ CH ₃	
320		-CO ₂ CH ₃	

【請求項 9】

(1) (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - (ジメチルアミノ)キノリン - 6 - イル]プロプ - 2 - エンアミド、

(2) (2E) - N - [2 - (ジメチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロプ - 2 - エンアミド、

(3) (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - (エチルアミノ)キノリン - 6 - イル]プロプ - 2 - エンアミド、

(4) (2E) - N - [2 - (エチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロプ - 2 - エンアミド、

(5) (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - (プロピルアミノ)キノリン - 6 - イル]プロプ - 2 - エンアミド、

(6) (2E) - N - [2 - (プロピルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロプ - 2 - エンアミド、

(7) (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - (イソプロピルアミノ)キノリン - 6 - イル]プロプ - 2 - エンアミド、

(8) (2E) - N - [2 - (イソプロピルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロプ - 2 - エンアミド、

(9) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ[2.2.2]オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - クロロフェニル)プロプ - 2 - エンアミド、

(10) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ[2.2.2]オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロプ - 2 - エンアミド、

(11) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ[2.2.2]オクト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - クロロフェニル)プロプ - 2 - エンアミド、

- (12) (2E) - N - [2 - (ジメチルアミノ) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル]
- 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (13) N - [2 - (ジメチルアミノ) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (14) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- (15) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、
- (16) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、
- (17) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - エチルフェニル) プロブ - 2 - エンアミド、
- (18) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - イソプロピルフェニル) 尿素、
- (19) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - エチルフェニル) プロパンアミド、
- (20) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- (21) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、
- (22) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - メトキシフェニル) プロブ - 2 - エンアミド、
- (23) N - [2 - (ジメチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- (24) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (25) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (26) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - エチルフェニル) 尿素、
- (27) N - (2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (28) (2E) - N - (2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (29) (2E) - N - (2 - アゼチジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (30) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (31) N - (2 - アゼチジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (32) (2E) - N - [2 - (ブチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (33) (2E) - N - [2 - (イソブチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (34) N - [2 - (イソブチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (35) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エン

アミド、

(36) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) 尿素、

(37) (2 E) - N - [2 - (s e c - ブチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(38) N - [2 - (s e c - ブチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(39) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (4 - プロピルフェニル) 尿素、

(40) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(41) N - [2 - (シクロペンチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(42) N - (2 - { [(1 R) - 1 - メチルプロピル] アミノ } キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(43) (2 E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(44) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(45) N - (2 - { [(1 S) - 1 - メチルプロピル] アミノ } キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(46) N - (3 - メチル - 2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(47) (2 E) - N - (4 - エチル - 2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(48) N - [2 - (3 - メチルピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(49) N - [2 - (2 - メチルピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(50) N - { 2 - [(1 , 2 - ジメチルプロピル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(51) N - { 2 - [エチル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(52) N - { 2 - [メチル (プロピル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(53) N - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 3 - メチルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(54) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) 尿素、

(55) N - [2 - (イソプロピルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(56) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(57) N - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 3 - メチルキノリン - 6 - イル) - N ' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、

(58) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、

(5 9) N - (3 - メチル - 2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - N ' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、

(6 0) N - { 2 - [(1 - メチルブチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(6 1) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) 尿素、

(6 2) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル) 尿素、

(6 3) N - { 2 - [シクロペンチル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(6 4) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、

(6 5) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - { 4 - [(トリフルオロメチル) チオ] フェニル } 尿素、

(6 6) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(6 7) N - { 2 - [シクロブチル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(6 8) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル) プロパンアミド、

(6 9) N - { 2 - [(1 R , 4 S) - 2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(7 0) N - { 2 - [(1 S , 4 R) - 2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(7 1) (2 E) - N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(7 2) (2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } プロブ - 2 - エンアミド、

(7 3) N - [2 - (ピロリジン - 3 - イルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(7 4) N - { 2 - [3 - (アセチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(7 5) N - [2 - (3 - { [(メチルアミノ) カルボニル] アミノ } ピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(7 6) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (4 - エチルフェニル) 尿素、

(7 7) (2 E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(7 8) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - { 4 - [(トリフルオロメチル) チオ] フェニル } 尿素、

(7 9) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、

(8 0) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、

(8 1) N - { 2 - [メチル (テトラヒドロフラン - 3 - イル) アミノ] キノリン - 6

- イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 2) N - (2 - { 3 - [(メチルスルホニル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル } キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 3) N - [2 - (2 - アザピシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル) プロパンアミド、
- (8 4) N - { 2 - [s e c - ブチル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 5) N - { 2 - [3 - (プロピオニルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 6) 酢酸 2 - { メチル [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] アミノ } プロピル、
- (8 7) N - { 2 - [メチル (1 - テトラヒドロフラン - 2 - イルエチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 8) N - [2 - (3 - { [(ジメチルアミノ) カルボニル] アミノ } ピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (8 9) 2 - メチル - N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、
- (9 0) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (9 1) N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } シクロヘキサカルボキサミド、
- (9 2) N - (4 - エチルフェニル) - N ' - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } 尿素、
- (9 3) 2 , 2 - ジメチル - N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、
- (9 4) (2 E) - N - [2 - (3 - アミノピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、
- (9 5) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - N ' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、
- (9 6) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - N ' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、
- (9 7) N - { 1 - [6 - ({ [(4 - エチルフェニル) アミノ] カルボニル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } - 2 , 2 - ジメチルプロパンアミド、
- (9 8) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - N ' - (4 - エチルフェニル) 尿素、
- (9 9) t e r t - ブチルメチル { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } カーバメート、
- (1 0 0) N - (2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - N ' - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } 尿素、
- (1 0 1) N - { 2 - [(3 S) - 3 - アミノピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (1 0 2) N - { 2 - [3 - (メチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、
- (1 0 3) 2 , 2 - ジメチル - N - { (3 S) - 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフル

オロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン-2-イル]ピロリジン-3-イル}プロパンアミド、

(104) 2, 2-ジメチル-N-{(3R)-1-[6-(3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン-2-イル]ピロリジン-3-イル}プロパンアミド、

(105) N, 2, 2-トリメチル-N-{1-[6-(3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン-2-イル]ピロリジン-3-イル}プロパンアミド、

(106) N-{2-[(3S)-3-(プロピオニルアミノ)ピロリジン-1-イル]キノリン-6-イル}-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(107) (2E)-N-(2-{3-[(メチルスルホニル)アミノ]ピロリジン-1-イル}キノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロブ-2-エンアミド、

(108) (2E)-N-[2-(2-アザビシクロ[2.2.2]オクト-2-イル)キノリン-6-イル]-3-[4-(エチルチオ)フェニル]プロブ-2-エンアミド、

(109) tert-ブチル1-(6-{[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロブ-2-エノイル]アミノ}キノリン-2-イル)ピロリジン-3-イルカーバメート、

(110) (2E)-N-[2-(3-アミノピロリジン-1-イル)キノリン-6-イル]-3-(4-クロロフェニル)プロブ-2-エンアミド、

(111) N-{1-[6-(4-エチルフェニル)アミノ]カルボニル}アミノ)キノリン-2-イル]ピロリジン-3-イル}メタンスルホンアミド、

(112) N-{2-[3-(ジメチルアミノ)ピロリジン-1-イル]キノリン-6-イル}-N'-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]尿素、

(113) N-{2-[3-(ジメチルアミノ)ピロリジン-1-イル]キノリン-6-イル}-N'-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]尿素、

(114) N-{2-[(3R)-3-(プロピオニルアミノ)ピロリジン-1-イル]キノリン-6-イル}-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(115) N-[2-(7-メチル-2, 7-ジアザスピロ[4.4]ノン-2-イル)キノリン-6-イル]-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(116) N¹-[2-(2-アザビシクロ[2.2.2]オクト-2-イル)キノリン-6-イル]-N²-(4-エチルフェニル)エタン-1, 2-ジアミン、

(117) N-[2-(7-ベンジル-2, 7-ジアザスピロ[4.4]ノン-2-イル)キノリン-6-イル]-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(118) N-[2-(2-アザビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-4-(ジメチルアミノ)キノリン-6-イル]-4'-(トリフルオロメチル)-1, 1'-ビフェニル-4-カルボキサミド、

(119) N-[2-(2, 7-ジアザスピロ[4.4]ノン-2-イル)キノリン-6-イル]-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(120) N-{2-[イソプロピル(メチル)アミノ]キノリン-6-イル}-N'-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]尿素、

(121) N-[2-(2-アザビシクロ[2.2.2]オクト-2-イル)キノリン-6-イル]-N'-[6-(トリフルオロメチル)ピロリジン-3-イル]尿素、

(122) N-[2-(2-アザビシクロ[2.2.2]オクト-2-イル)キノリン-6-イル]-N'-(6-エチルピロリジン-3-イル)尿素、

(123) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (メチルスルホニル) フェニル] プロパンアミド、

(124) 2 , 2 - ジメチル - N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(125) 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - アミン、

(126) N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(127) 2 - メチル - N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(128) N - { 1 - [6 - (3 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド

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 10】

(1) (2E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - [2 - (ジメチルアミノ) キノリン - 6 - イル] プロブ - 2 - エンアミド、

(2) (2E) - N - [2 - (ジメチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(3) (2E) - N - [2 - (エチルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(4) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - クロロフェニル) プロブ - 2 - エンアミド、

(5) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(6) (2E) - N - [2 - (ジメチルアミノ) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(7) N - [2 - (ジメチルアミノ) - 4 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(8) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、

(9) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピロリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(10) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、

(11) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - イソプロピルフェニル) 尿素、

(12) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - エチルフェニル) プロパンアミド、

(13) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素、

(14) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素、

(15) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - メトキシフェニル) プロブ - 2 - エンアミド、

(16) N - [2 - (ジメチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (メチルチオ)フェニル] 尿素、

(17) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - エチルフェニル) 尿素、

(18) N - (2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(19) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(20) N - (2 - アゼチジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(21) N - [2 - (イソブチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(22) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(23) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - N' - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 5 - イル) 尿素、

(24) N - [2 - (sec - ブチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(25) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - N' - (4 - プロピルフェニル) 尿素、

(26) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(27) N - [2 - (シクロペンチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(28) N - (2 - { [(1R) - 1 - メチルプロピル] アミノ } キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(29) (2E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(30) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(31) N - [2 - (3 - メチルピロリジン - 1 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(32) N - [2 - (2 - メチルピロリジン - 1 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(33) N - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 3 - メチルキノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(34) N - [2 - (イソプロピルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] プロパンアミド、

(35) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(36) N - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 3 - メチルキノリン - 6 - イル) - N' - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] 尿素、

(37) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - N' - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] 尿素、

(38) N - (3 - メチル - 2 - ピロリジン - 1 - イルキノリン - 6 - イル) - N' - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] 尿素、

(39) N - { 2 - [シクロペンチル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 -

[4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(4 0) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、

(4 1) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - { 4 - [(トリフルオロメチル) チオ] フェニル } 尿素、

(4 2) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 3 - メチルキノリン - 6 - イル] - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(4 3) N - { 2 - [(1 R , 4 S) - 2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(4 4) N - { 2 - [(1 S , 4 R) - 2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] プロパンアミド、

(4 5) (2 E) - N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(4 6) (2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル) - N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル } プロブ - 2 - エンアミド、

(4 7) N - [2 - (ピロリジン - 3 - イルアミノ) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(4 8) N - { 2 - [3 - (アセチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(4 9) N - [2 - (3 - { [(メチルアミノ) カルボニル] アミノ } ピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(5 0) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - (4 - エチルフェニル) 尿素、

(5 1) (2 E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (メチルチオ) フェニル] プロブ - 2 - エンアミド、

(5 2) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - { 4 - [(トリフルオロメチル) チオ] フェニル } 尿素、

(5 3) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (メチルチオ) フェニル] 尿素、

(5 4) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - N ' - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] 尿素、

(5 5) N - { 2 - [メチル (テトラヒドロフラン - 3 - イル) アミノ] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(5 6) N - (2 - { 3 - [(メチルスルホニル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル } キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(5 7) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル) プロパンアミド、

(5 8) N - { 2 - [3 - (プロピオニルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 - イル } - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(5 9) N - [2 - (3 - { [(ジメチルアミノ) カルボニル] アミノ } ピロリジン - 1 - イル) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパンアミド、

(6 0) 2 - メチル - N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] プロパノイル } アミノ) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(6 1) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] キノリン - 6 -

イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(6 2) N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}シクロヘキサカルボキサミド、

(6 3) 2 , 2 - ジメチル - N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}プロパンアミド、

(6 4) (2 E) - N - [2 - (3 - アミノピロリジン - 1 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロブ - 2 - エンアミド、

(6 5) N - { 2 - [イソプロピル(メチル)アミノ]キノリン - 6 - イル} - N ' - [4 - (メチルチオ)フェニル]尿素、

(6 6) N - { 2 - [イソプロピル(メチル)アミノ]キノリン - 6 - イル} - N ' - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]尿素、

(6 7) N - { 1 - [6 - ({ [(4 - エチルフェニル)アミノ]カルボニル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル} - 2 , 2 - ジメチルプロパンアミド、

(6 8) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - N ' - (4 - エチルフェニル)尿素、

(6 9) N - { 2 - [(3 S) - 3 - アミノピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(7 0) N - { 2 - [3 - (メチルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(7 1) 2 , 2 - ジメチル - N - { (3 S) - 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}プロパンアミド、

(7 2) 2 , 2 - ジメチル - N - { (3 R) - 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}プロパンアミド、

(7 3) N , 2 , 2 - トリメチル - N - { 1 - [6 - ({ 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパノイル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}プロパンアミド、

(7 4) N - { 2 - [(3 S) - 3 - (プロピオニルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(7 5) (2 E) - N - (2 - { 3 - [(メチルスルホニル)アミノ]ピロリジン - 1 - イル}キノリン - 6 - イル) - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロブ - 2 - エンアミド、

(7 6) (2 E) - N - [2 - (2 - アザビシクロ[2 . 2 . 2]オクト - 2 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (エチルチオ)フェニル]プロブ - 2 - エンアミド、

(7 7) tert - ブチル 1 - (6 - { [(2 E) - 3 - (4 - クロロフェニル)プロブ - 2 - エノイル]アミノ}キノリン - 2 - イル)ピロリジン - 3 - イルカーバメート、

(7 8) (2 E) - N - [2 - (3 - アミノピロリジン - 1 - イル)キノリン - 6 - イル] - 3 - (4 - クロロフェニル)プロブ - 2 - エンアミド、

(7 9) N - { 1 - [6 - ({ [(4 - エチルフェニル)アミノ]カルボニル}アミノ)キノリン - 2 - イル]ピロリジン - 3 - イル}メタンスルホンアミド、

(8 0) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - N ' - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]尿素、

(8 1) N - { 2 - [3 - (ジメチルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - N ' - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]尿素、

(8 2) N - { 2 - [(3 R) - 3 - (プロピオニルアミノ)ピロリジン - 1 - イル]キノリン - 6 - イル} - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(8 3) N - [2 - (7 - メチル - 2 , 7 - ジアザスピロ[4 . 4]ノン - 2 - イル)

キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、
 (8 4) N¹ - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン
 - 6 - イル] - N² - (4 - エチルフェニル) エタン - 1 , 2 - ジアミン、
 (8 5) N - [2 - (7 - ベンジル - 2 , 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノン - 2 - イル
) キノリン - 6 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド

、
 (8 6) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル) - 4 - (ジ
 メチルアミノ)キノリン - 6 - イル] - 4' - (トリフルオロメチル) - 1 , 1' - ビフ
 エニル - 4 - カルボキサミド、

(8 7) N - [2 - (2 , 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノン - 2 - イル) キノリン - 6
 - イル] - 3 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]プロパンアミド、

(8 8) N - { 2 - [イソプロピル (メチル) アミノ] キノリン - 6 - イル) - N' -
 [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]尿素、

(8 9) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン -
 6 - イル] - N' - [6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル] 尿素、

(9 0) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン -
 6 - イル] - N' - (6 - エチルピリジン - 3 - イル) 尿素、

(9 1) N - [2 - (2 - アザビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 2 - イル) キノリン -
 6 - イル] - 3 - [4 - (メチルスルホニル)フェニル]プロパンアミド、

(9 2) 2 , 2 - ジメチル - N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル)
 フェニル]エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イ
 ル] ピロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(9 3) 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチル } -
 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3 - アミ
 ン、

(9 4) N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチ
 ル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3
 - イル } プロパンアミド、

(9 5) 2 - メチル - N - { 1 - [6 - (5 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル)フ
 ェニル]エチル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) キノリン - 2 - イル] ピ
 ロリジン - 3 - イル } プロパンアミド、

(9 6) N - { 1 - [6 - (3 - { 2 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチ
 ル } - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) キノリン - 2 - イル] ピロリジン - 3
 - イル } プロパンアミド

から選択される請求項 9 に記載の化合物およびそれらの製薬上許容される塩。

【請求項 1 1】

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 1 2】

処置を必要とするヒト対象者での MCH 受容体介在疾患の治療もしくは予防または抑制
 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 1 3】

処置を必要とするヒト対象者での肥満の治療、予防または抑制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。