

【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19年9月20日(2007.9.20)

【公表番号】特表2003-528810(P2003-528810A)

【公表日】平成15年9月30日(2003.9.30)

【出願番号】特願2001-515309(P2001-515309)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/136	(2006.01)
A 6 1 K	31/137	(2006.01)
A 6 1 K	31/155	(2006.01)
A 6 1 K	31/166	(2006.01)
A 6 1 K	31/17	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/275	(2006.01)
A 6 1 K	31/397	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/4025	(2006.01)
A 6 1 K	31/4035	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)
A 6 1 K	31/4164	(2006.01)
A 6 1 K	31/4174	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/4188	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/436	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/4375	(2006.01)
A 6 1 K	31/4409	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/4453	(2006.01)
A 6 1 K	31/4468	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/497	(2006.01)
A 6 1 K	31/498	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/517	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/5415	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 P	1/14	(2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)  
A 6 1 P 31/18 (2006.01)  
A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
C 0 7 D 205/04 (2006.01)  
C 0 7 D 207/08 (2006.01)  
C 0 7 D 207/09 (2006.01)  
C 0 7 D 207/12 (2006.01)  
C 0 7 D 207/14 (2006.01)  
C 0 7 D 209/46 (2006.01)  
C 0 7 D 211/20 (2006.01)  
C 0 7 D 211/22 (2006.01)  
C 0 7 D 211/42 (2006.01)  
C 0 7 D 211/48 (2006.01)  
C 0 7 D 211/58 (2006.01)  
C 0 7 D 211/60 (2006.01)  
C 0 7 D 211/70 (2006.01)  
C 0 7 D 213/74 (2006.01)  
C 0 7 D 213/75 (2006.01)  
C 0 7 D 215/18 (2006.01)  
C 0 7 D 215/22 (2006.01)  
C 0 7 D 215/38 (2006.01)  
C 0 7 D 215/46 (2006.01)  
C 0 7 D 217/26 (2006.01)  
C 0 7 D 233/02 (2006.01)  
C 0 7 D 233/06 (2006.01)  
C 0 7 D 233/20 (2006.01)  
C 0 7 D 233/22 (2006.01)  
C 0 7 D 233/50 (2006.01)  
C 0 7 D 233/61 (2006.01)  
C 0 7 D 235/06 (2006.01)  
C 0 7 D 239/06 (2006.01)  
C 0 7 D 239/14 (2006.01)  
C 0 7 D 239/42 (2006.01)  
C 0 7 D 239/84 (2006.01)

## 【 F I 】

A 6 1 K 31/136  
A 6 1 K 31/137  
A 6 1 K 31/155  
A 6 1 K 31/166  
A 6 1 K 31/17  
A 6 1 K 31/18  
A 6 1 K 31/275  
A 6 1 K 31/397  
A 6 1 K 31/40  
A 6 1 K 31/4025  
A 6 1 K 31/4035  
A 6 1 K 31/407  
A 6 1 K 31/4164  
A 6 1 K 31/4174

A 6 1 K	31/4178	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/4188	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/436	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4375	
A 6 1 K	31/4409	
A 6 1 K	31/445	
A 6 1 K	31/4453	
A 6 1 K	31/4468	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/47	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/495	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 K	31/498	
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/5375	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/5415	
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 P	1/14	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	205/04	
C 0 7 D	207/08	
C 0 7 D	207/09	
C 0 7 D	207/12	
C 0 7 D	207/14	
C 0 7 D	209/46	
C 0 7 D	211/20	
C 0 7 D	211/22	
C 0 7 D	211/42	
C 0 7 D	211/48	
C 0 7 D	211/58	
C 0 7 D	211/60	
C 0 7 D	211/70	
C 0 7 D	213/74	
C 0 7 D	213/75	
C 0 7 D	215/18	
C 0 7 D	215/22	
C 0 7 D	215/38	

C 0 7 D 215/46  
 C 0 7 D 217/26  
 C 0 7 D 233/02  
 C 0 7 D 233/06  
 C 0 7 D 233/20  
 C 0 7 D 233/22  
 C 0 7 D 233/50  
 C 0 7 D 233/61 1 0 2  
 C 0 7 D 235/06  
 C 0 7 D 239/06  
 C 0 7 D 239/14  
 C 0 7 D 239/42 Z  
 C 0 7 D 239/84

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月3日(2007.8.3)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

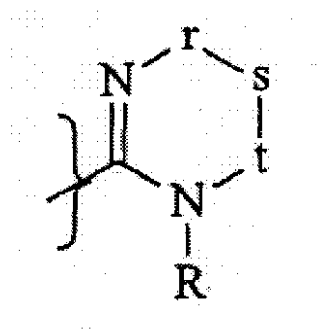
【請求項1】 哺乳類におけるMC4-R関連状態を治療する方法であって、哺乳類に有効量のMC4-R結合化合物を投与して、前記MC4-R関連状態が治療されるようにする段階を包含し、前記化合物が次式(I)で表され、

## B-Z-E

(I)

上記式において、Bはアンカー部分であり、Zは中央部分であり、EはMC4-R相互作用部分である、治療方法。

【請求項2】 Eが、次式(XIII)であり、



(XIII)

上記式において、

rは共有結合、CH、CH<sub>2</sub>、CR<sup>1</sup>、CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、又はHであり、

tは、CH、CH<sub>2</sub>、CR<sup>3</sup>、CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、又はHであり、

sは、CH、CH<sub>2</sub>、アルケニル、CHR<sup>5</sup>、又は、CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>であるか、この位置には何も無く、

Rは水素、アルキル、アルケニル、アリールアルキル、ベンゾカルボニル、アリールアルキルカルボニル、アルキルカルボニルであって、任意にA、B、L<sub>1</sub>、L<sub>2</sub>、R<sup>1</sup>、R

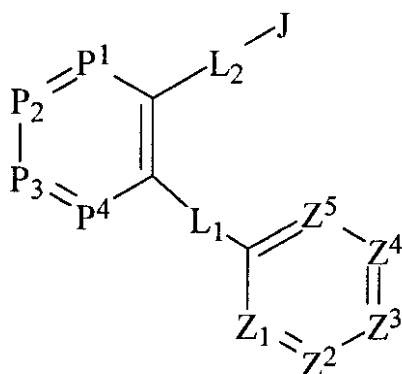
<sup>2</sup>、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  又は  $R^6$  に連結されて環を形成し、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、及び  $R^6$  は、それぞれ、ハロゲン、チオール、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、複素環、アリール、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノであり、任意に連結されて  $R$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、又は  $R^6$  と共に環を形成する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】  $R$  が、 $H$ 、アルキル、ベンゾカルボキシ、アルキルカルボキシ、又はアリールアルキルカルボキシである、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】  $r$  が共有結合である、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 5】 哺乳類における  $MC4-R$  関連状態を治療する方法であって、哺乳類に有効量の  $MC4-R$  結合化合物を投与して、前記  $MC4-R$  関連状態が治療されるようにする段階を包含し、前記化合物が  $MC4-R$  アンタゴニストであり、且つ次式 (VI) で表され、



(VI)

上記式において、

$P^1$ 、 $P^2$ 、 $P^3$ 、 $P^4$ 、及び  $P^5$  は、任意に炭素、硫黄、又は窒素と置換され、更に、 $P^1$ 、 $P^2$ 、 $P^3$ 、 $P^4$  及び  $P^5$  の何れかが共有結合であってよく、

$Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、 $Z^4$ 、及び  $Z^5$  は、任意に、置換炭素又は窒素であり、

$L_1$  は、共有結合、 $C_1 - C_6$  枝分れ又は枝なしアルキルであって、一つ又は二つの炭素が、酸素、硫黄、又は窒素原子と任意に置換され、

$L_2$  は、共有結合、 $C_1 - C_6$  枝分れ又は枝なしアミノ、エーテル、チオエーテル、又はアルキルであり、

$J$  は、未置換もしくは置換の含窒素複素環、又は置換もしくは未置換のアミノ基、及び薬学的に容認可能なそれらの塩である、治療方法。

【請求項 6】  $P^1$ 、 $P^2$ 、 $P^3$ 、 $P^4$ 、及び  $P^5$  は、それぞれ、置換もしくは未置換の炭素である、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】  $P^1$  及び  $P^3$  は、 $CH$  である、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】  $P^2$  及び  $P^4$  は、 $CH$ 、 $CF$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、又は、 $CI$  である、請求項 5、6、及び 7 の何れかに記載の方法。

【請求項 9】  $Z^3$  及び  $Z^4$  は、それぞれ  $CH$  である、請求項 5 乃至 8 の何れかに記載の方法。

【請求項 10】  $Z^1$  は  $CH$  であるか、 $Z^2$  に共有連結してナフチル環を形成する、請求項 5 乃至 9 の何れかに記載の方法。

【請求項 11】  $Z^2$  は、 $CH$ 、 $C - (C - CH)$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、 $CI$ 、 $CF$  であるか、 $Z^1$  に共有連結してナフチル環を形成する、請求項 5 乃至 9 の何れかに記載の方法。

【請求項 12】  $Z^5$  は、 $CH$  又は  $C - アルコキシ$  である、請求項 5 乃至 11 の何れかに記載の方法。

【請求項 13】  $L^2$  は共有結合である、請求項 5 乃至 12 の何れかに記載の方法。

【請求項 14】 J は、置換もしくは未置換のピペラジニル、イミドアゾピリジニル、ピロロイミダゾリル、ピロリル、アゼチジニル、アザパニル、ジアザパニル、ピリミジニル、ピリジニル、モルホニリル、又はピペリジニルである、請求項 5 乃至 13 の何れかに記載の方法。

【請求項 15】 前記化合物が、

- 2 - [ 2 - ( 4 - ベンジルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - クロロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - プロモ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - プロモ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 , - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシ - 5 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - ( 2 - ベンジルスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - ( 2 - ペンタデシスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - ( 2 - シクロヘキシルメチルスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テト

ラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テト  
 ラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 4 - ビス - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ]  
 - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 3 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ビス - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ]  
 - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5  
 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - ( 2 - ベンジルスルファニル - フェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール  
 、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 6 - ジフルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒ  
 ドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] -  
 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - ピリミジン - 1 - イル } - エタノン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a ,  
 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7  
 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 4 - [ 2 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルスルファ  
 ニルメチル ] - キノリン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - ピリジン - 3 - イル  
 ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - シクロペンチルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 5 - イルメチルスルファ  
 ニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 5 - イル  
 メチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - フルオロ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 ,  
 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 1 - メチル - 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1

, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルオキシメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5, 5 - ジメチル - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5, 5 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
2 - [ 2 - ( 2, 6 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - プロモ - 6 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 5 - プロモ - 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
2 - [ 5 - プロモ - 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 4 - プロモ - 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - プロモ - 5 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - メチル - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - クロロ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - チオフェン - 3 - イル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ビフェニル - 2 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ヨード - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - フルオロ - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 4, 4' - ジメトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 9H - フルオレン - 9 - イルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 3' - クロロ - 4' - フルオロ - 4 - メトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 1 - ナフタレン - 1 - イル - エチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - フルオロ - フェニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
2 - ( 2 - ベンズヒドリルスルファニル - フェニル ) - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ -



ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2' - フルオロ - 4' - メトキシ - [ 1, 1' : 4', 1' ] テルフェニル - 3' - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンズアミジン、

2 - [ 4 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - エチニル - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - シクロベンチルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - エトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - プロポキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

[ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジエチル - アミン、

1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペラジン、

C - { 4 - [ 3 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - キノキサリン - 2 - イル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、

2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - メチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルオキシメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

[ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジメチル - アミン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - イソプロポキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 - エトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 - プロポキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

4 - メトキシ - 3 - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルスルファニルメチル ] - ベンゾニトリル、

1 - { 4 - メトキシ - 3 - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルスルファニルメチル ] - フェニル } - エタノン、

2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペリジン、

C - { 4 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、

1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、

1 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、

3 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ

ニル] - 1, 5, 6, 7, 8, 8a - ヘキサヒドロ - イミダゾ [ 1, 5 - a ] ピリジン、  
 3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ  
 ニル] - 5, 6, 7, 7a - テトラヒドロ - 1H - ピロロ [ 1, 2 - c ] イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( ベンゾ [ b ] チオフェン - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル] - 1  
 , 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - 3 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒド  
 ロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルアミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニ  
 ル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル] - 1, 4, 5,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル] -  
 5, 6 - ジヒドロ - 4H - ピリミジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ブタン - 1 - オン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル] -  
 5, 6 - ジヒドロ - 4H - ピリミジン - 1 - イル } - 2 - フェニル - エタノン、  
 2 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピリジン - 2 - イル  
 ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 N - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル] - グアニ  
 ジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - イソプロポキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニ  
 ル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - シクロペンチルオキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) -  
 フェニル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピ  
 リミジン - 2 - イル ) - フェニル] - アミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニルメチル ) - フェニル] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2 - イル  
 ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル] - 1  
 , 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) -  
 フェニル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) -  
 フェニル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - 3 - クロロ -  
 フェニル] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 1H - ピロール - 2 - イル] - 1,  
 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - メチル - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒ  
 ドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニル] - アミン、  
 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル] - 1, 4, 5, 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 - ブロモ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( 2 - o - トリルスルファニルメチル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ  
 - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジクロロ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 ,  
 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( 3 - アミノ - プロピルアミノ ) - 6 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスル  
 ファニル ) - ベンゾニトリル、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジエチル -  
 アミン、  
 4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - モルホ  
 リン、  
 3 ' - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラ  
 ヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ' ] ピピラジニル、  
 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - ピペラジン - 1 - イル  
 - 6 , 7 - ジヒドロ - キノキサリン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペリ  
 ジン、  
 C - { 4 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジ  
 ル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、  
 1 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2 - イル  
 ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - キノキサリン - 2 -  
 イル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジル ] -  
 ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 C - { 4 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2  
 - イル ] - モルホリン - 3 - イル } - メチルアミン、  
 1 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラ  
 ジン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - アゼチジン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - ピロリジン - 3 - オール、  
 [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 1 - ア  
 ザ - ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバ  
 ミン酸 1 - アザ - ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバ  
 ミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - エチルエステル、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベン  
 ジル ] - ピロリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 4 - ター - プチル - N - ナフタレン - 1 - イルメチル - N ' - ( 2 - ピペリジン - 1 - イ  
 ル - エチル ) - ベンズアミド、  
 N , N - ジメチル - N ' - ナフタレン - 2 - イルメチル - N ' - ナフタレン - 1 - イルメ  
 チル - プロパン - 1 , 3 - ジアミン、  
 N - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - N ' , N ' - ジメチル - N - ナフタレン  
 - 1 - イルメチル - プロパン - 1 , 3 - ジアミン、

1 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 3 - フェネチル - 1 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル - エチル ) - チオ尿素、  
 3 - ( 4 - ジメチルアミノ - フェニル ) - 1 - ( 3 - ジメチルアミノ - プロピル ) - 1 - ナフタレン - 1 - イルメチル - チオウレア、  
 4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジルアミノ ] - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - エチルアミン、  
 ナフタレン - 2 - スルホン酸 ( 2 - ジメチルアミノ - エチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミド、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - 2 - メトキシメチル - ピロリジン、  
 ( 2 - ヘキシルオキシ - フェニル ) - カルバミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - ピペリジン - 1 - イルメチル - エチルエステル、  
 3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシ ] - ピロリジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシメチル ] - ピロリジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - ピペリジン、  
 3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミノ ] - プロパン - 1 - オール、  
 3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミノ ] - 3 - メチル - ブタン - 1 - オール、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - オール、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 { 1 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - エチル - N - ピロリジン、  
 N - ピロールイル - [ 1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ピロリジン - 2 - イルメチル ] - アミン、  
 1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ピペリジン - 2 - カルボン酸メチルエステル、  
 ( 3 - ブロモ - ベンジル ) - ( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、  
 3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシ ] - ピペリジン、  
 ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - ( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、  
 ( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 2 - イルメチル - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシメチル ] - ピロリジン、  
 ( 3 - ブロモ - ベンジル ) - ( 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、  
 ( 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル ) - ナフタレン - 2 - イルメチル - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、  
 [ 2 - ( ナフタレン 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - ピペリジン - 1 - イルメチル - エチルエステル、

[ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 2 - ジ  
 メチルアミノ - エチルエステル、  
 1 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、  
 [ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( ナフタレン - 1 -  
 イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - アミン、  
 1 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピ  
 ペラジン、  
 N , N - ジメチル - N ' - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - N ' - ナフタレン -  
 1 - イルメチル - エタン - 1 , 2 - ジアミン、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベン  
 ジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、  
 [ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( 2 - ナフタレン -  
 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - アミン、  
 1 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラ  
 ジン、  
 { 1 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] -  
 ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベン  
 ジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 { 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イ  
 ル } - メタノール、  
 [ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( 2 - ナフタレン -  
 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - アミン、  
 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - イル  
 アミン、  
 1 - フェニル - 3 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - イソキノリ  
 ン - 4 - カルボニトリル、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 6 - エ  
 チル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 4 - メトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] -  
 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - フェニルエチニル - ベンジルスルファニル ) - フェニル  
 ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テト  
 ラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフエン -  
 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 4 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ  
 ニル ] - 4 , 4 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ  
 ニル ] - 5 , 5 - ジメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフエン - 2 - イル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - フェニル } - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 ,  
 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - フルオロ -  
 フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - 3 - フルオロ  
 - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 4 , 5 - ジヒド  
 ロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] -  
 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - プロモ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - クロロ - フ  
 ェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニ  
 ル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 4 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 3 - イル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 3 - イル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - トリフルオ  
 ロメチル - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 3 - トリフルオロメチル - フェニル  
 ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - フルオロ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] -  
 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペ  
 リジン - 2 - イル } - メタノール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ]  
 - [ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - アミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - ピペラジン、  
 5 , 5 - ジメチル - 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 4  
 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 5 , 5  
 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 5 - ジフルオロ  
 - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 5 - ジフルオロ  
 - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 3 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 2 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピ  
 リミジン - 2 - イル ) - フェニルアミン、  
 アミノ - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - アセトニトリル、  
 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - エタン - 1 , 2 - ジア  
 ミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 - メ

チル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 4 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 4 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 4 - ジフルオロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - 1 - メチル - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル ] - 4 , 4 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - メトキシ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 5 - オール、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - メトキシ - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 6 - エチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、及び薬学的に容認可能なそれらの塩、

からなるグループから選択された、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 16】 前記化合物が、約 5  $\mu$  M 又はそれ以下の IC<sub>50</sub> で前記 MC4 - R に結合する、請求項 1 乃至 15 の何れかに記載の方法。

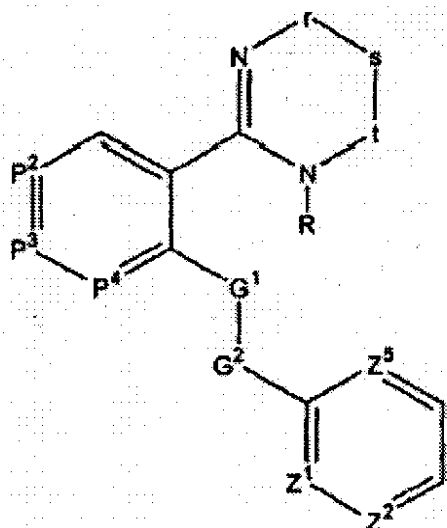
【請求項 17】 前記化合物が、約 0.1  $\mu$  M 又はそれ以下の IC<sub>50</sub> で前記 MC4 - R に結合する、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】 前記化合物が、約 0.05  $\mu$  M 又はそれ以下の IC<sub>50</sub> で前記 MC4 - R に結合する、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】 前記化合物が、前記 MC4 - R のアンタゴニストである、請求項 1 乃至 15 の何れかに記載の方法。

【請求項 20】 前記化合物が、前記 MC4 - R のアゴニストである、請求項 1 乃至 15 の何れかに記載の方法。

【請求項 21】 次式 (IX) で表される MC4 - R 結合化合物であって、



(IX)

$P^2$  が、 $CH$ 、 $CF$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、 $C$ -アルキル、 $C$ -アルコキシ、 $C-CN$ 、 $C-OH$ 、又は $CI$ であり、

$P^3$  が、 $CH$ 、 $CF$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、 $C$ -アルキル、 $C$ -アルコキシ、 $C-CN$ 、 $C-OH$ 、又は $CI$ であり、

$P^4$  が、 $CH$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、 $CF$ 、 $C$ -アルキル、 $C$ -アルコキシ、 $C-CN$ 、 $C-OH$ 、又は $CI$ であり、

$G^1$  及び  $G^2$  が、それぞれ独立に、 $CH_2$ 、 $S$ 、又は $O$ であり、

$r$  が、共有結合又は $CH_2$ であり、

$t$  が、 $CH_2$ 、 $CR^3$ 、又は $CR^3R^4$ であり、

$s$  が、 $CH_2$ 、 $CHR^5$ 、又は $CR^5R^6$ であり、

$R$  が水素又はアルキルであり、

$Z^1$  が $CH$ であるか、又は $Z^2$  に共有連結してナフチル環を形成し、

$Z^2$  は、 $CH$ 、 $C-(C-CH)$ 、 $CCl$ 、 $CBr$ 、 $CI$ 、 $CF$ であるか、 $Z^1$  に共有連結してナフチル環を形成し、

$Z^5$  は $CH$ 又は $C-OMe$ であり、

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、及び $R^6$  は、メチル又はエチル、又は薬学的に容認可能なそれらの塩である、 $MC4-R$ 結合化合物。

【請求項 22】  $Z^1$  は $CH$ であり、 $Z^2$  は $CBr$ であり、 $Z^5$  は $C-OMe$ である、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】  $P^2$  は $CH$ である、請求項 21 又は 22 に記載の化合物。

【請求項 24】  $P^4$  は $CCl$ 又は $CF$ である、請求項 21 乃至 23 の何れかに記載の化合物。

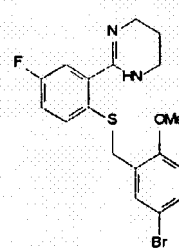
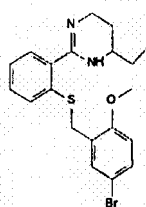
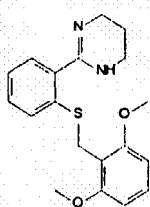
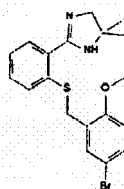
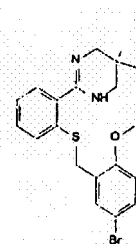
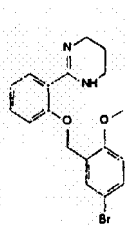
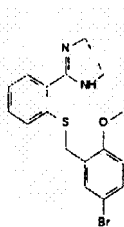
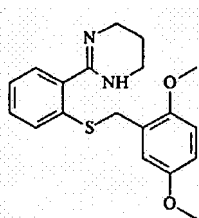
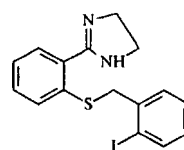
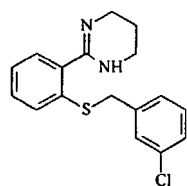
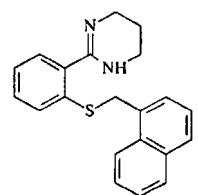
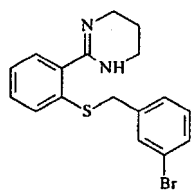
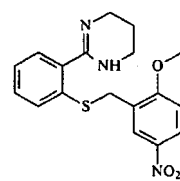
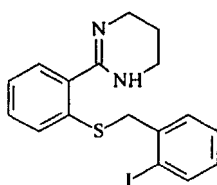
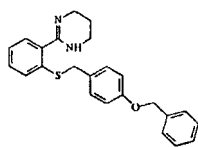
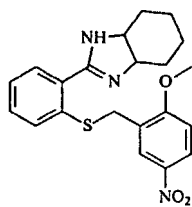
【請求項 25】  $G^1$  及び  $G^2$  が、それぞれ $CH_2$ である、請求項 21 乃至 24 の何れかに記載の化合物。

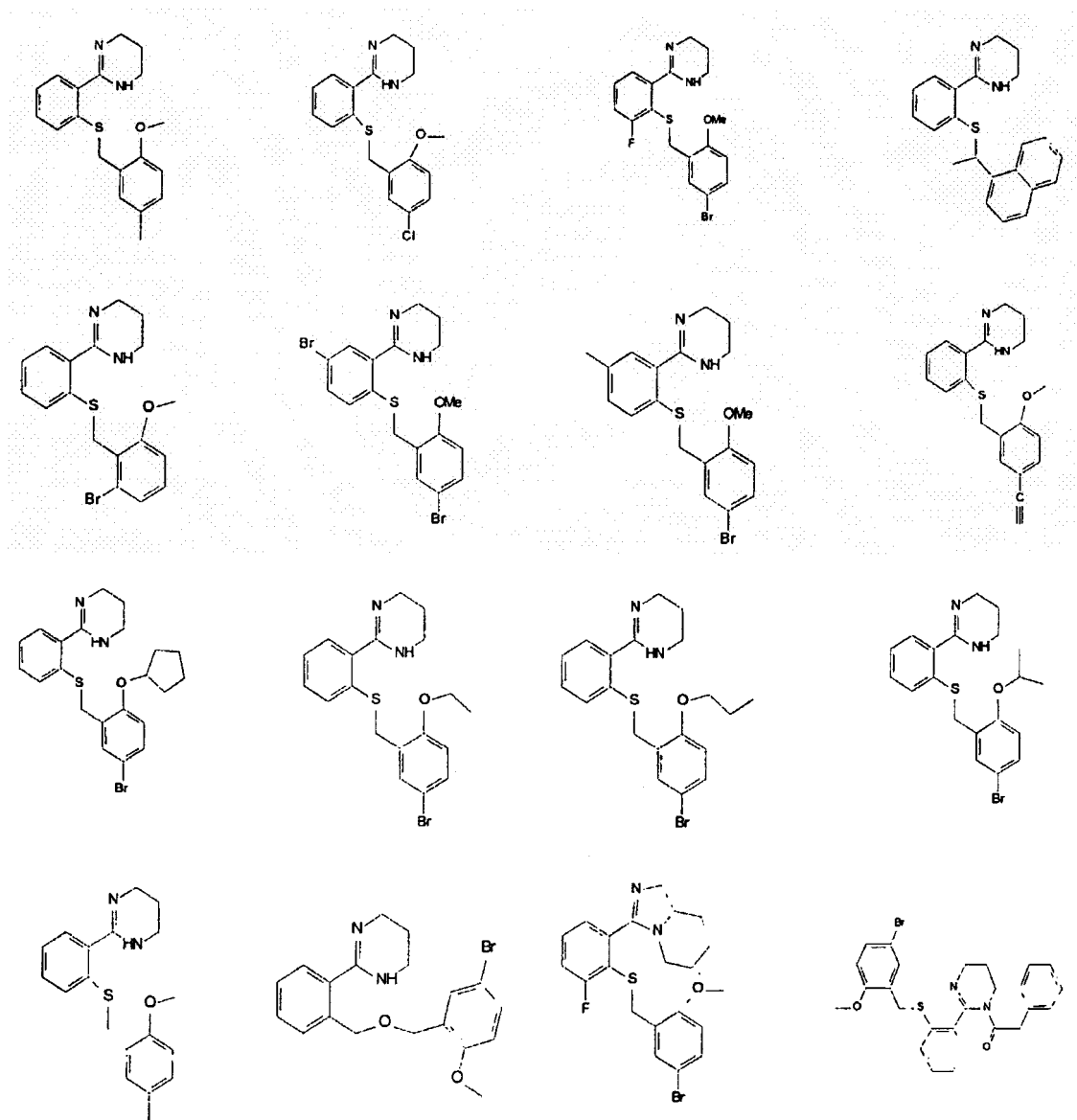
【請求項 26】  $G^1$  及び  $G^2$  が、合わせて $-CH_2-S-$ 又は $-S-CH_2-$ である、請求項 21 乃至 24 の何れかに記載の方法。

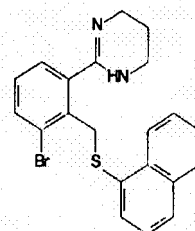
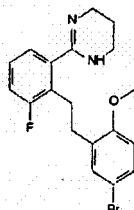
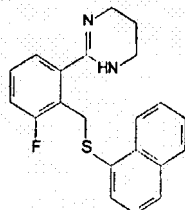
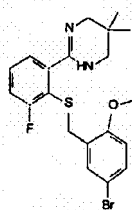
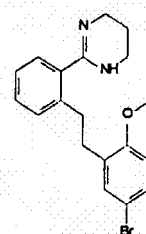
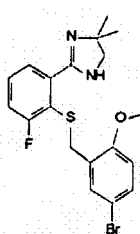
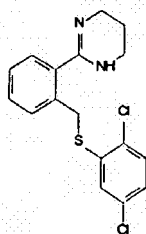
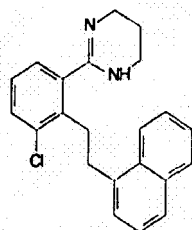
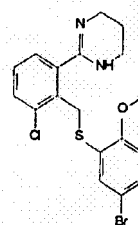
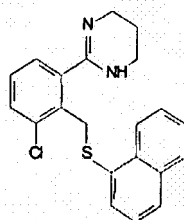
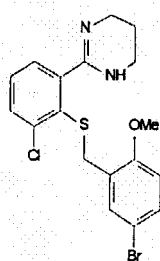
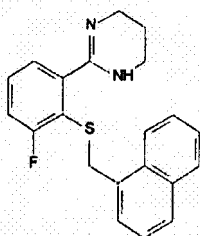
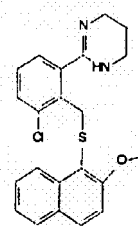
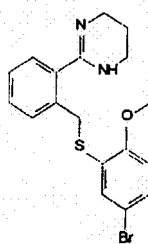
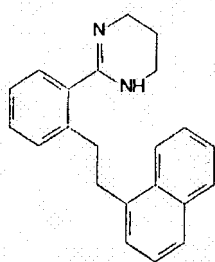
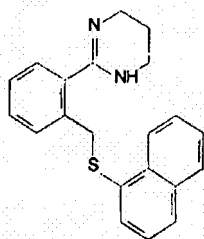
【請求項 27】  $Z^1$  及び  $Z^2$  が連結してナフチル環を形成する、請求項 21 乃至 26 の何れかに記載の方法。

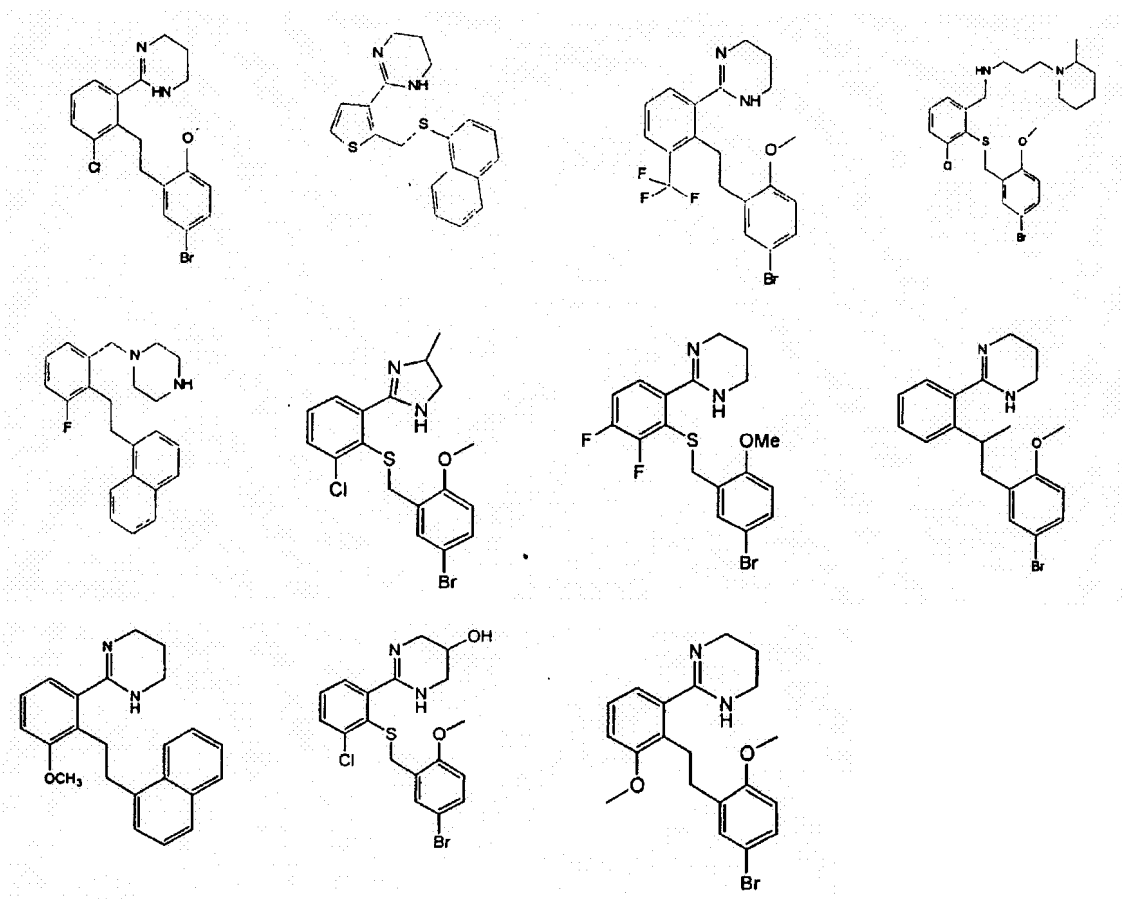
【請求項 28】  $MC4-R$ 結合化合物であって、





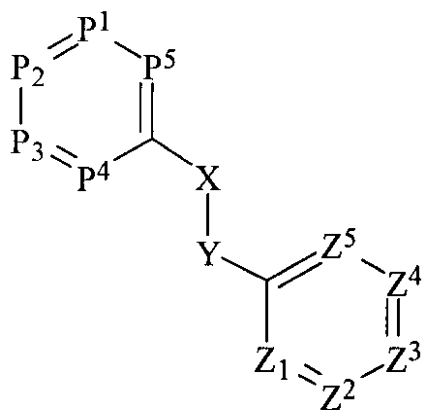






からなるグループから選択された、MC4-R結合化合物。

【請求項29】 次式(VII)で示されるMC4-R結合化合物であって、



(VII)

上記式において、

$X = Y =$

$\text{CH}_2$

$X = \text{S}$ 、 $Y = \text{CH}_2$

$X = \text{CH}_2$ 、 $Y =$

$\text{S}$  または

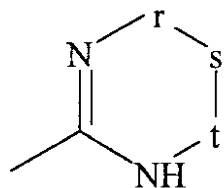
$X = \text{O}$ 、 $Y = \text{CH}_2$

であって、

さらに上記式において、

$Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、 $Z^4$ 、及び $Z^5$ は、 $\text{CH}$ 、 $\text{N}$ 、又は置換炭素であり、

$P^1$ 、 $P^2$ 、 $P^3$ 、及び $P^4$ は、CH、N又は置換炭素であり、  
 $P^5$ は、C - Jであって、Jは次式(XIII)で表される部分であり、



(XIII)

上記式において、

rは、共有結合、CH、CH<sub>2</sub>、CR<sup>1</sup>、CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、又はHであり、

tは、CH、CH<sub>2</sub>、CR<sup>3</sup>、CR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、又はHであり、

sは、CH、CH<sub>2</sub>、CHR<sup>5</sup>、CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、又は不存在であり、

Rは、水素、アルキル、アルケニル、アリールアルキル、ベンゾカルボニル、アリールアルキルカルボニル、アルキルカルボニルであり、任意にR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、又はR<sup>6</sup>に連結されて一つかそれ以上の環を形成し、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、及びR<sup>6</sup>は、それぞれ、ハロゲン、チオール、アルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、複素環、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、アリールであり、任意に連結されてR、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、又はR<sup>6</sup>と環を形成する、MC<sub>4</sub>-R結合化合物。

【請求項30】  $P^1$ 、 $P^2$ 、 $P^3$ 、及び $P^4$ は、それぞれ、置換もしくは未置換の炭素である、請求項29に記載の化合物。

【請求項31】  $P^1$ はCHである、請求項31に記載の化合物。

【請求項32】  $P^2$ 、 $P^3$ 、及び $P^4$ は、それぞれ、置換炭素である、請求項29に記載の化合物。

【請求項33】  $P^2$ 、 $P^3$ 及び $P^4$ は、CH、CF、Cl、Br、C - アルキル、C - アルキオキシ、又はCIからなるグループから選択される、請求項29に記載の化合物。

【請求項34】 Z<sup>3</sup>及びZ<sup>4</sup>は、それぞれCHである、請求項29に記載の化合物。

【請求項35】 Z<sup>1</sup>はCHである、請求項29に記載の化合物。

【請求項36】 Z<sup>1</sup>はZ<sup>2</sup>に共有結合してナフチル環を形成する、請求項29に記載の化合物。

【請求項37】 Z<sup>2</sup>は、CH、C - (C - CH)、CCl、CBr、CI、及びCFである、請求項29に記載の化合物。

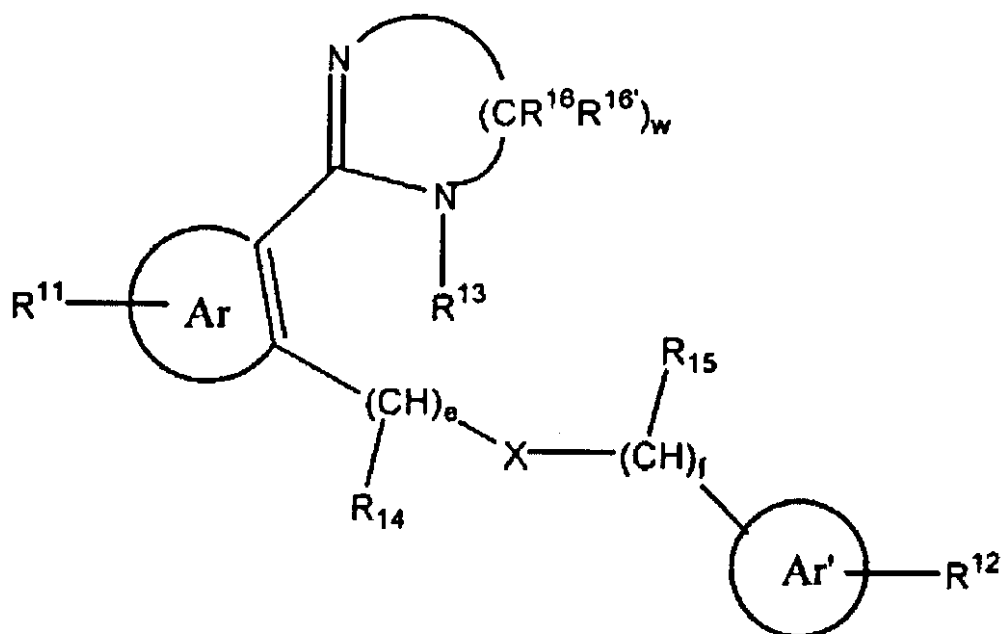
【請求項38】 L<sub>2</sub>は共有結合である、請求項29に記載の化合物。

【請求項39】 Rは、H、アルキル、ベンゾカルボキシ、アルキルカルボキシ、又はアリールアルキルカルボキシである、請求項29に記載の化合物。

【請求項40】 sはCR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>であり、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>がそれぞれメチルである、請求項29に記載の化合物。

【請求項41】 rは共有結合である、請求項29に記載の化合物。

【請求項42】 次式(XVII)で示されるMC<sub>4</sub>-R結合化合物であって



(XVIII)

上記式において、

Ar 及び Ar' は、芳香族基であり、

R<sup>11</sup> は、置換可能な各位置に関して、水素、シアノ、アルコキシ、ニトロ、ハロゲン、アルキル、アミノ、又はアリアルオキシからなるグループから独立に選択され、

R<sup>12</sup> は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルコキシ、アセチレン基、ニトロ、アリアル、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、アシル、又はカルボニルからなるグループから選択され、

R<sup>13</sup> は、水素、アルケニル、アルキニル、アラルキル、ニトロ、シアノ、アルキル、アシル、カルボニル、又は SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> であり、更に、R<sup>16</sup> 又は R<sup>16'</sup> 基に任意に連結されていてもよく、

R<sup>16</sup> 及び R<sup>16'</sup> は、置換可能な各位置に関して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、シアノ、アリアル、複素環、カルボニル、又はアシルからなるグループからそれぞれ独立に選択され、更に、任意に、アルキル鎖を介して R<sup>13</sup> 又は別の R<sup>16</sup> 及び R<sup>16'</sup> 基に結合して、縮合又はスピロ環系を形成してもよく、

X は NR<sup>17</sup>、S、O 又は共有結合であり、

R<sup>17</sup> は、水素、アルキル、又はカルボニルであり、

R<sup>14</sup> 及び R<sup>15</sup> は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、又はアルキルからなるグループから独立に選択され、

w は、1、2、3、又は4であり、

e は、0、又は1であり、

f は、0、又は1であり、更に、X が共有結合の場合は、e 及び f の両方ともが0ではなく、且つ薬学的に容認可能なそれらの塩である、MC4-R 結合化合物。

【請求項43】 哺乳類におけるMC4-R 関連状態を治療するための医薬組成物であって、薬学的に容認可能な担体と、有効量の請求項21乃至42のいずれかに従ったMC4-R 結合化合物を含む、医薬組成物。

【請求項44】 前記MC4-R 結合化合物が、MC4-R アンタゴニストである、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項45】 前記MC4-R 関連状態が、体重減少に関連した、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項46】 前記体重減少が、老年、神経性食欲不振、HIV 悪液質、又は癌性悪

液質の結果である、請求項 4 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】 前記 M C 4 - R 結合化合物が請求項 2 1 乃至 2 8 のいずれかに従った化合物である、請求項 4 3 乃至 4 6 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 4 8】 前記 M C 4 - R 結合化合物が、

- 2 - [ 2 - ( 4 - ベンジルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - クロロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - プロモ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - プロモ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - { 2 - [ 2 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシ - 5 - イル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピリミジン、
- 2 - ( 2 - ベンジルスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - ( 2 - ペンタデシスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - ( 2 - シクロヘキシルメチルスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、
- 2 - [ 2 - ( 3 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 4 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テト  
 ラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 4 - ビス - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ]  
 - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 3 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 3 , 5 - ビス - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ]  
 - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5  
 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - ( 2 - ベンジルスルファニル - フェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール  
 、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 6 - ジフルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメトキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒ  
 ドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] -  
 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - ピリミジン - 1 - イル } - エタノン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a ,  
 4 , 5 , 6 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ヨード - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 3 a , 4 , 5 , 6 , 7  
 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 4 - [ 2 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルスルフ  
 アニルメチル ] - キノリン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - ニトロ - ベンジルスルファニル ) - ピリジン - 3 - イル  
 ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テ  
 トラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - シクロペンチルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 5 - イルメチルスルファ  
 ニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [ 1 , 4 ] ジオキシン - 5 - イル  
 メチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - フルオロ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 ,  
 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 1 - メチル - 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1  
 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、



2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 , 5  
- ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルオキシ ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルオキシメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テト  
ラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5 , 5  
- ジメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5 , 5  
- ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
2 - [ 2 - ( 2 , 6 - ジメトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 ,  
6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - ブロモ - 6 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
, 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 5 - ブロモ - 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニ  
ル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
2 - [ 5 - ブロモ - 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニ  
ル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 4 - ブロモ - 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニ  
ル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - ブロモ - 5 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
, 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - メチル - フェニ  
ル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
- テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - クロロ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
, 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - チオフェン - 3 - イル - ベンジルスルファニル ) - フェ  
ニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( ビフェニル - 2 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
- テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ヨード - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4  
, 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - フルオロ - フェ  
ニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ  
ニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 4 , 4 ' - ジメトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェ  
ニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 9 H - フルオレン - 9 - イルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6  
- テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 3 ' - クロロ - 4 ' - フルオロ - 4 - メトキシ - ビフェニル - 3 - イルメチ  
ルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 1 - ナフタレン - 1 - イル - エチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 ,  
5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 5 - フルオロ - フェ  
ニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
2 - ( 2 - ベンズヒドリルスルファニル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ -  
ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2' - フルオロ - 4' - メトキシ - [ 1, 1' : 4', 1'' ] テルフェ  
 ニル - 3' - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ  
 - ピリミジン、  
 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンズアミジン、  
 2 - [ 4 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - エチニル - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1,  
 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - 1, 4,  
 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - シクロペンチルオキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニ  
 ル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - エトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4,  
 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - プロポキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1,  
 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジエチル -  
 アミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペラ  
 ジン、  
 C - { 4 - [ 3 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - キノキサリン  
 - 2 - イル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - メチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4,  
 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルオキシメチル ) - フェニル ] - 1, 4,  
 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジメチル -  
 アミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - イソプロポキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - エトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] -  
 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - プロポキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ]  
 - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 4 - メトキシ - 3 - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) -  
 フェニルスルファニルメチル ] - ベンゾニトリル、  
 1 - { 4 - メトキシ - 3 - [ 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イ  
 ル ) - フェニルスルファニルメチル ] - フェニル } - エタノン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6  
 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペリ  
 ジン、  
 C - { 4 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジ  
 ル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリ  
 ジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジル ] -  
 ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 3 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェ  
 ニル ] - 1, 5, 6, 7, 8, 8a - ヘキサヒドロ - イミダゾ [ 1, 5 - a ] ピリジン、

3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 5 , 6 , 7 , 7 a - テトラヒドロ - 1 H - ピロロ [ 1 , 2 - c ] イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( ベンゾ [ b ] チオフェン - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - 3 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルアミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - ピリミジン - 1 - イル } - 3 - メチル - ブタン - 1 - オン、  
 1 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - ピリミジン - 1 - イル } - 2 - フェニル - エタノン、  
 2 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピリジン - 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 N - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - グアニジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - イソプロポキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - シクロペンチルオキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - [ 2 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニル ] - アミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 1 H - ピロール - 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - メチル - [ 2 - ( 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニル ] - アミン、  
 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - クロロ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ブロモ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6

- テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( 2 - o - トリルスルファニルメチル - フェニル ) - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ  
 - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジクロロ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 ,  
 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - ( 3 - アミノ - プロピルアミノ ) - 6 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスル  
 ファニル ) - ベンゾニトリル、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - 1 , 4  
 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ジエチル -  
 アミン、  
 4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - モルホ  
 リン、  
 3 ' - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラ  
 ヒドロ - 2 H - [ 1 , 2 ' ] ピピラジニル、  
 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - ピペラジン - 1 - イル  
 - 6 , 7 - ジヒドロ - キノキサリン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペリ  
 ジン、  
 C - { 4 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジ  
 ル ] - モルホリン - 2 - イル } - メチルアミン、  
 1 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2 - イル  
 ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - キノキサリン - 2 -  
 イル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - ベンジル ] -  
 ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 C - { 4 - [ 3 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ピラジン - 2  
 - イル ] - モルホリン - 3 - イル } - メチルアミン、  
 1 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラ  
 ジン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - アゼチジン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジ  
 ル ] - ピロリジン - 3 - オール、  
 [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 1 - ア  
 ザ - ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバ  
 ミン酸 1 - アザ - ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 [ 2 - ( 2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバ  
 ミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - エチルエステル、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベン  
 ジル ] - ピロリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 4 - ター - ブチル - N - ナフタレン - 1 - イルメチル - N ' - ( 2 - ピペリジン - 1 - イ  
 ル - エチル ) - ベンズアミド、  
 N , N - ジメチル - N ' - ナフタレン - 2 - イルメチル - N ' - ナフタレン - 1 - イルメ  
 チル - プロパン - 1 , 3 - ジアミン、  
 N - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - N ' , N ' - ジメチル - N - ナフタレン  
 - 1 - イルメチル - プロパン - 1 , 3 - ジアミン、  
 1 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 3 - フェネチル - 1 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イル -

エチル) - チオ尿素、

3 - ( 4 - ジメチルアミノ - フェニル ) - 1 - ( 3 - ジメチルアミノ - プロピル ) - 1 - ナフタレン - 1 - イルメチル - チオウレア、

4 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジルアミノ ] - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - エチルアミン、

ナフタレン - 2 - スルホン酸 ( 2 - ジメチルアミノ - エチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミド、

1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - 2 - メトキシメチル - ピロリジン、

( 2 - ヘキシルオキシ - フェニル ) - カルバミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - ピペリジン - 1 - イルメチル - エチルエステル、

3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシ ] - ピロリジン、

2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシメチル ] - ピロリジン、

2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - ピペリジン、

3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミノ ] - プロパン - 1 - オール、

3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルアミノ ] - 3 - メチル - ブタン - 1 - オール、

1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - オール、

{ 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 2 - イル } - メタノール、

{ 1 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、

2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ピロリジン - 1 - イル ] - エチル - N - ピロリジン、

N - ピロールイル - [ 1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ピロリジン - 2 - イルメチル ] - アミン、

1 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ピペリジン - 2 - カルボン酸メチルエステル、

( 3 - ブロモ - ベンジル ) - ( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、

3 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシ ] - ピペリジン、

( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジル ) - ( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、

( 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イルメチル ) - ナフタレン - 2 - イルメチル - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、

2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジルオキシメチル ] - ピロリジン、

( 3 - ブロモ - ベンジル ) - ( 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル ) - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、

( 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル ) - ナフタレン - 2 - イルメチル - ナフタレン - 1 - イルメチル - アミン、

[ 2 - ( ナフタレン 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 2 - ピペリジン - 1 - イル - 1 - ピペリジン - 1 - イルメチル - エチルエステル、

[ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - カルバミン酸 2 - ジ

メチルアミノ - エチルエステル、

1 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、  
[ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - アミン、

1 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、

N , N - ジメチル - N ' - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - N ' - ナフタレン - 1 - イルメチル - エタン - 1 , 2 - ジアミン、

{ 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、

1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、

[ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - アミン、

1 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペラジン、

{ 1 - [ 3 - クロロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、

{ 1 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、

{ 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、

[ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - アミン、

1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、

1 - フェニル - 3 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - イソキノリン - 4 - カルボニトリル、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 6 - エチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 4 - メトキシ - ピフェニル - 3 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - フェニルエチニル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 3 - ( 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 2 , 5 - ジメトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 4 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 4 , 4 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、

2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 3 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 2 - イル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

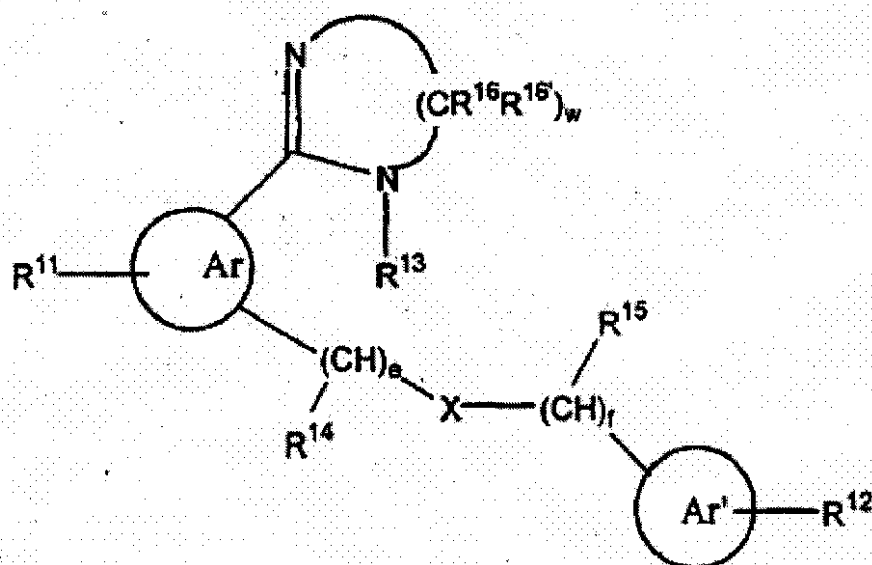
2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - プロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、

2 - [ 3 - クロロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 ,

5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - フルオロ - フェニル } - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニルスルファニルメチル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - ブロモ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - クロロ - フェニル } - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - メトキシ - 5 - トリフルオロメチル - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 4 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 3 - イル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - チオフェン - 3 - イル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - トリフルオロメチル - フェニル } - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 3 - トリフルオロメチル - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 6 - フルオロ - ナフタレン - 1 - イルメチルスルファニル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 { 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - ベンジル ] - ピペリジン - 2 - イル } - メタノール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - [ 3 - ( 2 - メチル - ピペリジン - 1 - イル ) - プロピル ] - アミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - ピロリジン - 3 - イルアミン、  
 1 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - ベンジル ] - ピペラジン、  
 5, 5 - ジメチル - 2 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 5, 5 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3, 5 - ジフルオロ - フェニル ] - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3, 5 - ジフルオロ - フェニル ] - 5, 5 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、  
 3 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - 2 - ( 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 2 - イル ) - フェニルアミン、  
 アミノ - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - アセトニトリル、  
 1 - [ 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - エタン - 1, 2 - ジアミン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 4 - メチル - 4, 5 - ジヒドロ - 1H - イミダゾール、

2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - フェニル ] - 4 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 4 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 , 4 - ジフルオロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - フルオロ - 2 - ( ナフタレン - 1 - イルスルファニルメチル ) - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - 1 - メチル - エチル ] - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル ] - 4 , 4 - ジメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル ] - 5 , 5 - ジメチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 3 - メトキシ - 2 - ( 2 - ナフタレン - 1 - イル - エチル ) - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - 3 - クロロ - フェニル ] - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン - 5 - オール、  
 2 - { 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - フェニル ) - エチル ] - 3 - メトキシ - フェニル } - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、  
 2 - [ 2 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ベンジルスルファニル ) - フェニル ] - 6 - エチル - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - ピリミジン、及び薬学的に容認可能なそれらの塩、  
 からなるグループから選択される、請求項 43 に記載の医薬組成物。

【請求項 49】 哺乳類における MC4 - R 関連状態を治療する方法であって、哺乳類に有効量の MC4 - R 結合化合物を投与して、前記 MC4 - R 関連状態が治療されるようにする段階を包含し、前記化合物が次式 (X) で表され、



(X)

上記式において、

$Ar$  及び  $Ar'$  は、芳香族基であり、



$R^{11}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、シアノ、ハロゲン、アルキル、アミノ、又はアリールオキシからなるグループから独立に選択され、

$R^{12}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルコキシ、アセチレン基、ニトロ、アリール、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、アシル、又はカルボニルからなるグループから選択され、

$R^{13}$  は、水素、アルケニル、アルキニル、アラルキル、ニトロ、シアノ、アルキル、アシル、カルボニル、又は  $SO_2CH_3$  であり、更に、 $R^{16}$  又は  $R^{16'}$  基に任意に連結されていてよく、

$R^{16}$  及び  $R^{16'}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環、カルボニル、又は、アシルからなるグループから独立に選択され、更に、任意に、アルキル鎖を介して  $R^{13}$  又は別の  $R^{16}$  及び  $R^{16'}$  基に結合して、縮合又はスピロ環系を形成してもよく、

X は  $NR^{17}$ 、S、O 又は共有結合であり、

$R^{17}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アシル、複素環、又はカルボニルであり、

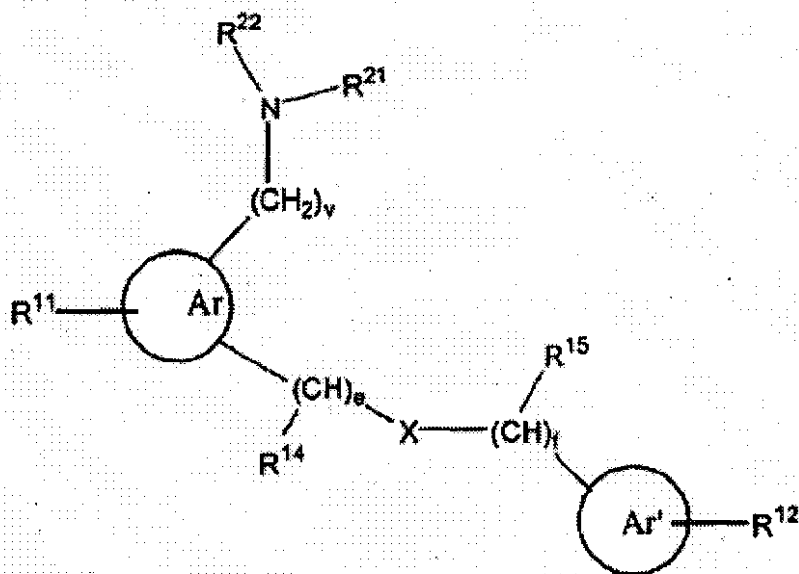
$R^{14}$  及び  $R^{15}$  は、それぞれ独立に、水素、アルキル、アルケニル、ヘテロ芳香族、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、又はアリールからなるグループから独立に選択され、

w は、0、1、2、3、又は4であり、

e は、0、1、2、又は3であり、

f は、0、1、2、又は3、及び薬学的に容認可能なそれらの塩である、治療方法。

【請求項50】 哺乳類におけるMC4-R関連状態を治療する方法であって、哺乳類に有効量のMC4-R結合化合物を投与して、前記MC4-R関連状態が治療されるようにする段階を包含し、前記化合物が次式(XI)で表され、



(XI)

上記式において、

Ar 及び Ar' は、上述のような芳香族基であり、

$R^{11}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルキル、アミノ、シアノ、又はアリールオキシからなるグループから独立に選択され、

$R^{12}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルコキシ、アセチレン基、ニトロ、アリール、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、アシル、又はカルボニルからなるグループから選択され、

X は  $NR^{17}$ 、S、O 又は共有結合であり、

$R^{17}$  は、水素、アルキル、アシル、複素環、又はカルボニルであり、

$R^{14}$  及び  $R^{15}$  は、それぞれ独立に、水素、アルキル、アルケニル、又はアリールからなるグループから独立に選択され、

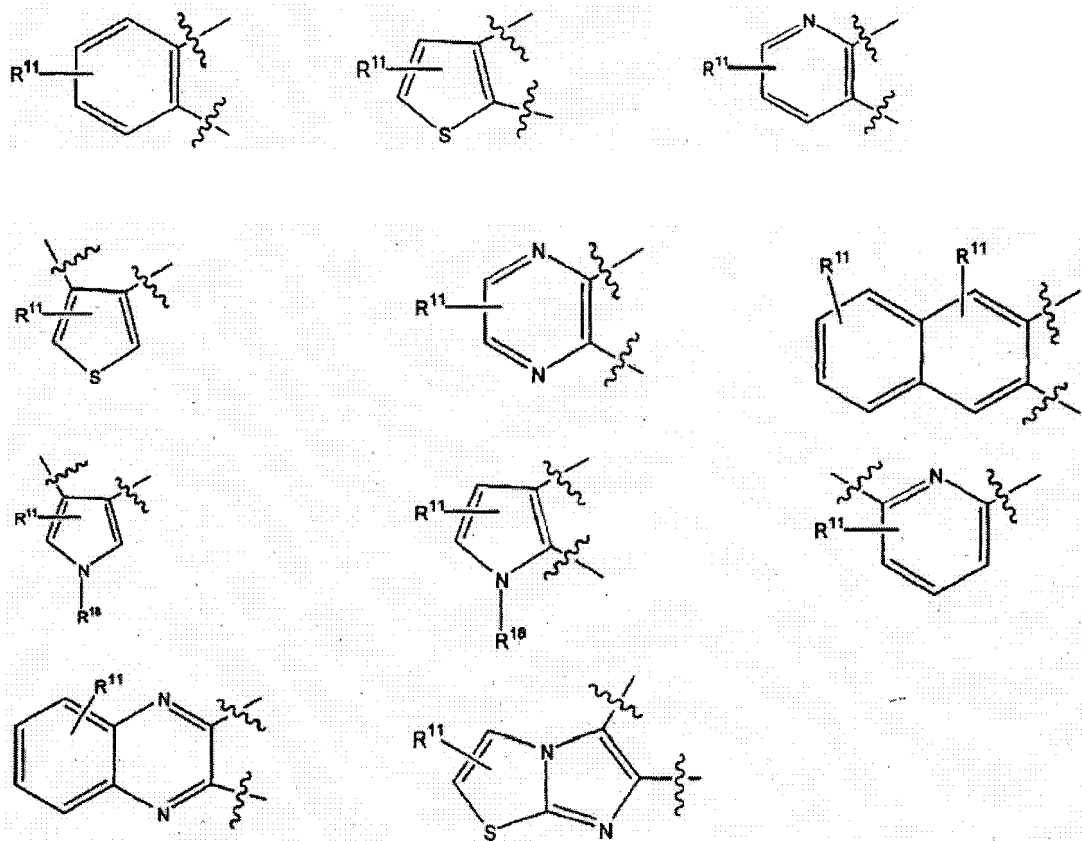
$R^{21}$  及び  $R^{22}$  は、それぞれ独立に、置換もしくは未置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、水素、又はカルボニルからなるグループから独立に選択され、更に、任意に連結されて複素環を形成し、

$v$  は 0、1、2、3、4、5、又は 6 であり、

$e$  は、0、1、2、又は 3 であり、

$f$  は、0、1、2、又は 3、及び薬学的に容認可能なそれらの塩である、治療方法。

【請求項 51】  $Ar$  が次からなるグループから選択される、



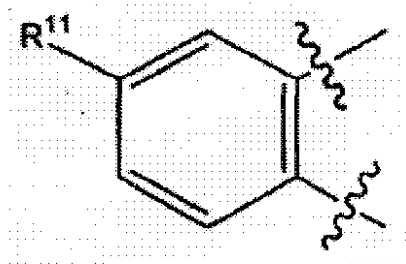
請求項 49 又は 50 に記載の方法。

【請求項 52】  $Ar$  が、



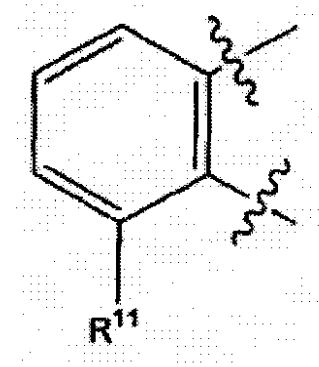
である、請求項 51 に記載の方法。

【請求項 53】  $Ar$  が、



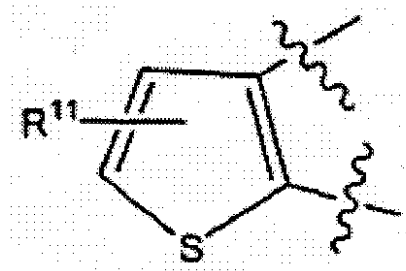
である、請求項 52 に記載の方法。

【請求項 54】 Ar が、



である、請求項 52 に記載の方法。

【請求項 55】 Ar が、



である、請求項 52 に記載の方法。

【請求項 56】  $R^{11}$  が、置換可能な各芳香族位置に関して、水素、ハロゲン、アルキル、アミノ、及びベンジルオキシからなるグループから独立に選択され、請求項 49 乃至 52 に記載の方法。

【請求項 57】  $R^{11}$  が、独立に、水素又はハロゲンである、請求項 56 に記載の方法。

【請求項 58】 前記ハロゲンは、フッ素、塩素、又は臭素である、請求項 57 に記載の方法。

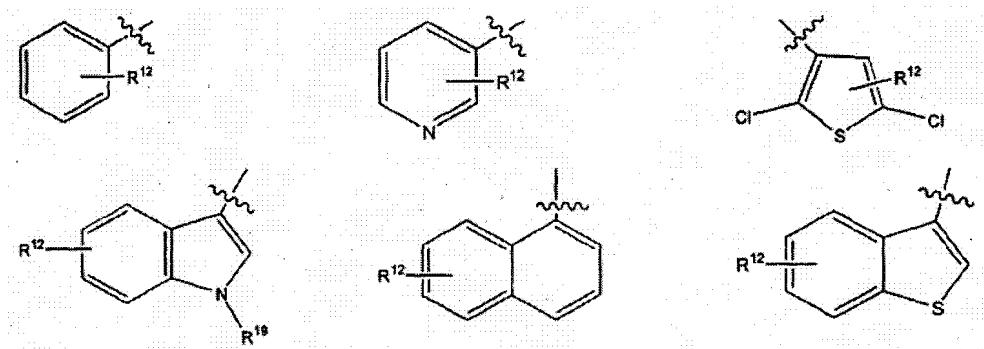
【請求項 59】 前記ハロゲンは、フッ素である、請求項 58 に記載の方法。

【請求項 60】 前記ハロゲンは、塩素である、請求項 58 に記載の方法。

【請求項 61】 前記ハロゲンは、臭素である、請求項 58 に記載の方法。

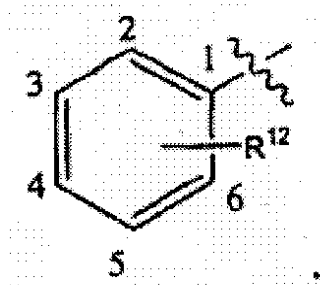
【請求項 62】 各  $R^{11}$  が水素である、請求項 56 に記載の方法。

【請求項 63】 Ar' が、



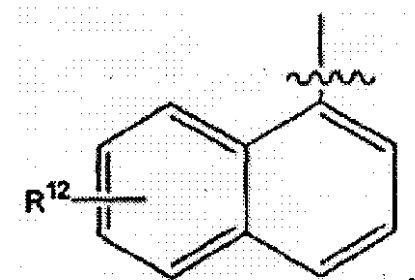
からなるグループから選択され、 $R^{1-9}$  が、水素、アルキル、アシル、アリール、アルケニル、又はアルキニルである、請求項 49 乃至 62 に記載の方法。

【請求項 64】  $Ar'$  が、



である、請求項 63 に記載の方法。

【請求項 65】  $Ar'$  が、



である、請求項 63 に記載の方法。

【請求項 66】  $R^{1-2}$  が、第 3 位置に入る、請求項 64 に記載の方法。

【請求項 67】  $R^{1-2}$  が、第 6 位置に入る、請求項 64 に記載の方法。

【請求項 68】  $R^{1-2}$  が、置換可能な各芳香族位置に関して、水素、アルコキシ、ハロゲン、又はシアノからなるグループから独立に選択される、請求項 49 乃至 67 に記載の方法。

【請求項 69】  $R^{1-2}$  が、水素、ハロゲン、又はアルコキシである請求項 68 に記載の方法。

【請求項 70】 前記アルコキシが、 $C_1 - C_{10}$  アルコキシである、請求項 69 に記載の方法。

【請求項 71】 前記  $C_1 - C_{10}$  アルコキシが、メトキシ、エトキシ、 $n$ -プロポキシ、 $i$ -プロポキシ、及びシクロペントキシからなるグループから選択される、請求項 70 に記載の方法。

【請求項 72】 前記  $C_1 - C_{10}$  アルコキシが、メトキシである、請求項 71 に記載の方法。

【請求項 73】 前記ハロゲンが、臭素、フッ素、ヨウ素又は塩素である、請求項 69 に記載の方法。

- 【請求項 7 4】 前記ハロゲンが、臭素である、請求項 7 3 に記載の方法。
- 【請求項 7 5】 前記ハロゲンが、フッ素である、請求項 7 3 に記載の方法。
- 【請求項 7 6】 前記ハロゲンが、塩素である、請求項 7 3 に記載の方法。
- 【請求項 7 7】 X が共有結合である、請求項 4 9 乃至 7 6 に記載の方法。
- 【請求項 7 8】 X が S である、請求項 4 9 乃至 7 6 に記載の方法。
- 【請求項 7 9】 X が O である、請求項 4 9 乃至 7 6 に記載の方法。
- 【請求項 8 0】 X が  $\text{NR}^{17}$  である、請求項 4 9 乃至 7 6 に記載の方法。
- 【請求項 8 1】  $\text{R}^{17}$  が、水素、アルキル、又はアシルである、請求項 8 0 に記載の方法。
- 【請求項 8 2】 前記アルキルが  $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキルである、請求項 8 1 に記載の方法。
- 【請求項 8 3】 前記アルキルがメチルである、請求項 8 2 に記載の方法。
- 【請求項 8 4】  $\text{R}^{17}$  が、水素である、請求項 8 1 に記載の方法。
- 【請求項 8 5】  $\text{R}^{16}$  及び  $\text{R}^{16'}$  が、各位置に関して独立に、水素及びアルキルからなるグループから選択される、請求項 4 9、又は 5 1 乃至 8 4 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 8 6】  $\text{R}^{16}$  及び  $\text{R}^{16'}$  が、水素である、請求項 8 5 に記載の方法。
- 【請求項 8 7】  $\text{R}^{16}$  及び  $\text{R}^{16'}$  の少なくとも何れかが、少なくとも一つ  $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキルである、請求項 8 5 に記載の方法。
- 【請求項 8 8】 前記  $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキルが、メチルである、請求項 8 7 に記載の方法。
- 【請求項 8 9】 前記  $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキルが、エチルである、請求項 8 7 に記載の方法。
- 【請求項 9 0】 前記  $\text{R}^{16}$  及び  $\text{R}^{16'}$  の少なくとも二つが、連結して環を形成する、請求項 4 9 又は 5 1 乃至 8 4 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 9 1】  $\text{R}^{14}$  及び  $\text{R}^{15}$  は、独立に、水素、アルキル、及びフェニルからなるグループから選択される、請求項 4 9 乃至 9 0 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 9 2】  $\text{R}^{14}$  及び  $\text{R}^{15}$  は、それぞれ水素である、請求項 9 1 に記載の方法。
- 【請求項 9 3】 前記アルキルは、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  である、請求項 9 1 に記載の方法。
- 【請求項 9 4】 前記アルキルは、メチルである、請求項 9 3 に記載の方法。
- 【請求項 9 5】 前記  $\text{R}^{13}$  基は、水素、アシル、アルキル、アシル、カルボキシ、又は  $\text{SO}_2\text{CH}_3$  である、請求項 4 9 又は 5 1 乃至 9 4 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 9 6】  $\text{R}^{13}$  は、水素である、請求項 9 5 に記載の方法。
- 【請求項 9 7】 前記  $\text{R}^{13}$  基は、任意に、置換  $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキル又はアシルである、請求項 9 5 に記載の方法。
- 【請求項 9 8】 前記アシル基は、i - プロピルカルボニル、ベンジルカルボニルである、請求項 9 7 に記載の方法。
- 【請求項 9 9】 前記アルキル基は、 $\text{C}_1 - \text{C}_{10}$  アルキルである、請求項 9 7 に記載の方法。
- 【請求項 1 0 0】 前記アルキル基は、メチルである、請求項 9 9 に記載の方法。
- 【請求項 1 0 1】 w は 2 である、請求項 4 9 又は 5 1 乃至 1 0 0 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 2】 w は 3 である、請求項 4 9 又は 5 1 乃至 1 0 0 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 3】 e は 0 である、請求項 4 9 乃至 1 0 2 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 4】 e は 1 である、請求項 4 9 乃至 1 0 2 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 5】 f は 0 である、請求項 4 9 乃至 1 0 2 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 6】 f は 1 である、請求項 4 9 乃至 1 0 2 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 7】 f は 2 である、請求項 4 9 乃至 1 0 2 の何れかに記載の方法。
- 【請求項 1 0 8】  $\text{R}^{21}$  及び  $\text{R}^{22}$  は、独立に、置換もしくは未置換のアルキル、カ

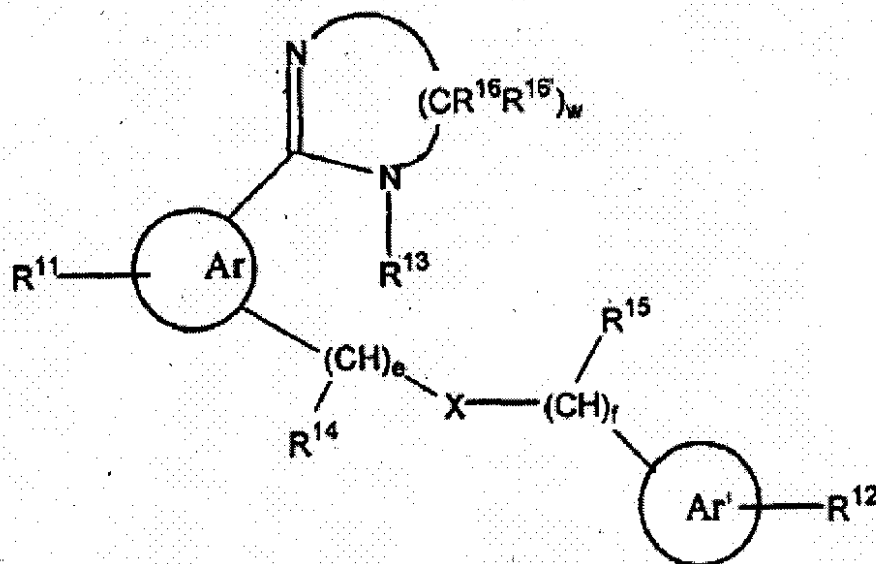
ルボニルからなるグループから選択され、更に、任意に連結されて複素環を形成する、請求項 50 乃至 84 に記載の方法。

【請求項 109】 前記複素環が、ピペラジニル又はモルホニルである、請求項 108 に記載の方法。

【請求項 110】  $v$  が、1、2、又は 3 である、請求項 50 乃至 84、108、又は 109 の何れかに記載の方法。

【請求項 111】 前記 MC4-R 関連状態が、体重減少でない、請求項 1 乃至 15、29、または 49 乃至 110 の何れかに記載の方法。

【請求項 112】 次式 (X) で表される MC4-R 結合化合物であって、



(X)

上記式において、

$Ar$  及び  $Ar'$  は、芳香族基であり、

$R^{11}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、シアノ、ハロゲン、アルキル、アミノ、又はアリールオキシからなるグループから独立に選択され、

$R^{12}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルコキシ、アセチレン基、ニトロ、アリール、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、アシル、又はカルボニルからなるグループから選択され、

$R^{13}$  は、水素、アルケニル、アルキニル、アラルキル、ニトロ、シアノ、アルキル、アシル、カルボニル、又は  $SO_2CH_3$  であり、更に、 $R^{16}$  又は  $R^{16'}$  基に任意に連結されていてよく、

$R^{16}$  及び  $R^{16'}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、複素環、カルボニル、又は、アシルからなるグループからそれぞれ独立に選択され、更に、任意に、アルキル鎖を介して  $R^{13}$  又は別の  $R^{16}$  及び  $R^{16'}$  基に結合して、縮合又はスピロ環系を形成してもよく、

$X$  は  $NR^{17}$ 、 $S$ 、 $O$  又は共有結合であり、

$R^{17}$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アシル、複素環、又はカルボニルであり、

$R^{14}$  及び  $R^{15}$  は、それぞれ独立に、水素、アルキル、アルケニル、ヘテロ芳香族、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、又はアリールからなるグループから独立に選択され、

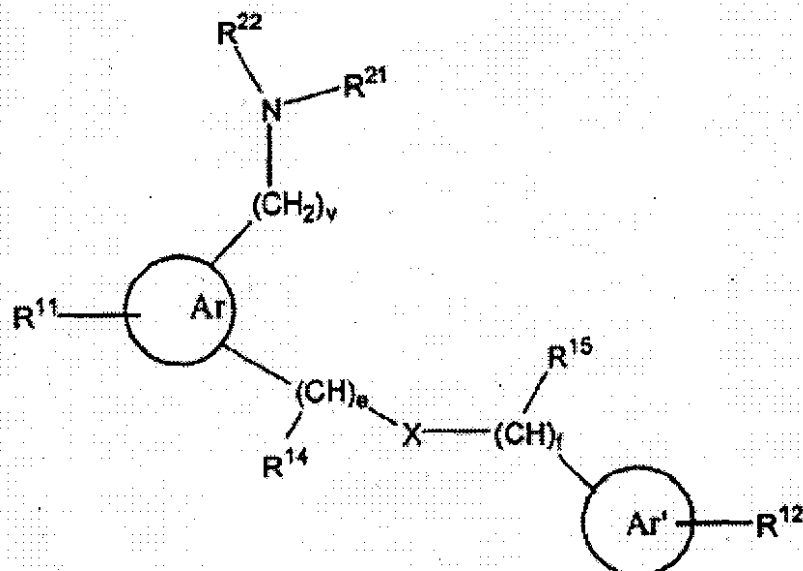
$w$  は、0、1、2、3、又は 4 であり、

$e$  は、0、1、2、又は 3 であり、

$f$  は、0、1、2、又は 3、及び薬学的に容認可能なそれらの塩である、MC4-R 結

合化合物。

【請求項 1 1 3】 次式 (X I) で表される M C 4 - R 結合化合物であって、



(X I)

上記式において、

$Ar$  及び  $Ar'$  は、上述のような芳香族基であり、

$R^{11}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルキル、アミノ、シアノ、又はアリールオキシからなるグループから独立に選択され、

$R^{12}$  は、置換可能な各位置に関して、水素、ハロゲン、アルコキシ、アセチレン基、ニトロ、アリール、アルキル、アルケニル、アルキニル、シアノ、アシル、又はカルボニルからなるグループから選択され、

$X$  は  $NR^{17}$ 、 $S$ 、 $O$  又は共有結合であり、

$R^{17}$  は、水素、アルキル、アシル、複素環、又はカルボニルであり、

$R^{14}$  及び  $R^{15}$  は、それぞれ独立に、水素、アルキル、アルケニル、又はアリールからなるグループからそれぞれ選択され、

$R^{21}$  及び  $R^{22}$  は、それぞれ独立に、置換もしくは未置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、水素、又はカルボニルからなるグループから独立に選択され、更に、任意に連結されて複素環を形成してもよく、

$v$  は 0、1、2、3、4、5、又は 6 であり、

$e$  は、0、1、2、又は 3 であり、

$f$  は、0、1、2、又は 3、及び薬学的に容認可能なそれらの塩である、M C 4 - R 結合化合物。

【請求項 1 1 4】 哺乳類における M C 4 - R 関連状態を治療するための医薬組成物であって、薬学的に容認可能な担体と、方法に関する請求項 1 乃至 20 又は 49 乃至 111 の何れかに記載された M C 4 - R 結合化合物とを包含した、医薬組成物。