

【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26年2月27日(2014.2.27)

【公表番号】特表2013-517279(P2013-517279A)

【公表日】平成25年5月16日(2013.5.16)

【年通号数】公開・登録公報2013-024

【出願番号】特願2012-549065(P2012-549065)

【国際特許分類】

C 0 7 D	409/12	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/06	(2006.01)
A 6 1 P	33/06	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 409/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/427

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/06

A 6 1 P 33/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4196

C 0 7 D 417/14 C S P

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 413/14

【手続補正書】

【提出日】平成26年1月10日(2014.1.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

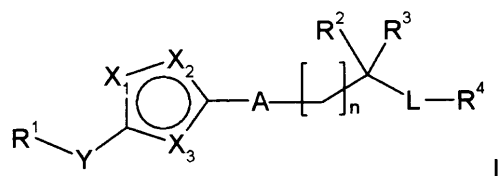
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0011】

本発明は、新規HDA C阻害剤に関する。具体的には、本発明は、式Iに記載の化合物又はその塩、特に薬学上許容される塩に関し：

【化1】



〔式中、

R^1 は、ハロ（ $C_1 - C_4$ ）アルキルであって、ここで、前記ハロ（ $C_1 - C_4$ ）アルキルは少なくとも2つのハロ基を含有し（ R^1 は、ジハロ（ $C_1 - C_4$ ）アルキルであり）、

Y は結合であり、且つ X_1 はOであり、 X_2 はN又はCHであり、且つ X_3 はN又はNHであるか、

あるいは、Y は -C(O)- であり、且つ X_1 及び X_2 はCH又はNであり、 X_3 はO又はSであるか、

あるいは、Y は -C(O)- であり、且つ X_1 はOであり、 X_2 はCH又はNであり、且つ X_3 はCH又はNであり、

n は0～4であり、

A は、-C(=O)NR^X-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)C(=O)NR^X-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)NR^XC(=O)NR^X-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)NR^XC(=O)-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)SO₂-、-SO₂NR^X-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)SO₂NR^X-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)NR^XSO₂-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)NHCH(CF₃)-、-CH(CF₃)NH-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)CH(CF₃)NH-、-CH(CF₃)-、-(($C_1 - C_6$)アルキル)CH(CF₃)-、又は-(($C_1 - C_6$)アルキル)NR^X-であり、

n が0である場合、 R^2 及び R^3 は、独立して、H、並びに置換されていてもよい（ $C_1 - C_4$ ）アルキル、アリール（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-、及び（ $C_3 - C_7$ ）シクロアルキル（ $C_1 - C_4$ ）アルキルから選択され、

n が1～4である場合、 R^2 及び R^3 は、独立して、H、フルオロ、及び置換されていてもよい（ $C_1 - C_4$ ）アルキル、アリール（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-、及び（ $C_3 - C_7$ ）シクロアルキル（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-であり、ここで、n が1であり、 R^2 がFであり、且つ R^3 がHである場合、A は -C(=O)NR^X-、-NR^XC(=O)NR^X-、-SO₂NR^X-、-NHCH(CF₃)-、-CH(CF₃)NH-、-CH(CF₃)-、-（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-、-NR^X-、又は-（ $C_1 - C_3$ ）アルキル-NR^X-であり、且つ

n が1～4である場合、 R^2 は、-NR^AR^B-、-（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-NR^AR^B-、-CONR^AR^B-、-（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-CONR^AR^B-、-CO₂H-、-（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-CO₂H-、ヒドロキシル、ヒドロキシ（ $C_1 - C_4$ ）アルキル-

、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ、及び $(C_1 - C_3)$ アルコキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル - から選択され、且つ R^3 は、H並びに置換されていてもよい $(C_1 - C_4)$ アルキル、アリール $(C_1 - C_4)$ アルキル -、及び $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $(C_1 - C_4)$ アルキル - から選択され、

ここで、任意の R^2 及び R^3 の前記置換されていてもよい $(C_1 - C_4)$ アルキル、アリール $(C_1 - C_4)$ アルキル -、及び $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $(C_1 - C_4)$ アルキル - のアリール、シクロアルキル、及び各 $(C_1 - C_4)$ アルキルの部分は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $-NR^A R^A$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル) $NR^A R^A$ 、及びヒドロキシルから選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよいが、

あるいは、 R^2 及び R^3 は、これらが結合している原子と共に、置換されていてもよい 4、5、6、又は 7 員のシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル基を形成し、ここで、前記ヘテロシクロアルキル基は、独立して、N、O、及び S から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含有し、且つ前記置換されていてもよいシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル基は、独立して、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロゲン、シアノ、アリール $(C_1 - C_4)$ アルキル -、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $(C_1 - C_4)$ アルキル -、 $-OR^Y$ 、 $-NR^Y R^Y$ 、 $-C(=O)OR^Y$ 、 $-C(=O)NR^Y R^Y$ 、 $-NR^Y C(=O)R^Y$ 、 $-SO_2 NR^Y R^Y$ 、 $-NR^Y SO_2 R^Y$ 、 $-OC(=O)NR^Y R^Y$ 、 $-NR^Y C(=O)OR^Y$ 、及び $-NR^Y C(=O)NR^Y R^Y$ から選択される 1、2 又は 3 個の置換基により置換されていてもよく、且つ、

L は、 R^4 によって置換される 5 ~ 6 員のヘテロアリール又はフェニルであり、且つ更に置換されていてもよく、

ここで、L が更に置換される場合、L は、独立して、ハロゲン、シアノ、及び $(C_1 - C_4)$ アルキルから選択される 1 又は 2 個の置換基により置換され、

R^4 は、H、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロ、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $((C_1 - C_4)$ アルキル) $((C_1 - C_4)$ アルキル) N $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $((C_1 - C_4)$ アルキル) $((C_1 - C_4)$ アルキル) N $(C_1 - C_4)$ アルキル -、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ -、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、置換されていてもよい $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、又は置換されていてもよい 5 ~ 6 員のヘテロアリールであり、

ここで、前記置換されていてもよいシクロアルキル、フェニル、ヘテロシクロアルキル、又はヘテロアリールは、独立して、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロゲン、シアノ、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ -、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、ヒドロキシル、 $-NR^A R^C$ 、及び $-(C_1 - C_4)$ アルキル) $NR^A R^C$ から選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよいが、

あるいは、L - R^4 は、共に、1, 3 - ベンゾジオキサリル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、ベンゾフラニル、テトラヒドロイソキノリル、又はイソインドリニル基を形成し、ここで、前記ベンゾフラニル、テトラヒドロイソキノリル、又はイソインドリニル基は、独立して、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロゲン、シアノ、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ -、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、ヒドロキシル、 $-NR^A R^C$ 、及び $-(C_1 - C_4)$ アルキル) $NR^A R^C$ から選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよく、ここで、各 R^A は、独立して、H 及び $(C_1 - C_4)$ アルキルから選択され、 R^B は、H、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-C(=O)(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-C(=O)O(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)NH(C_1 - C_4)$ アルキル、 $-C(=O)N((C_1 - C_4)$ アルキル) $((C_1 - C_4)$ アルキル)、 $-SO_2(C_1 - C_4)$ アルキルであるか、あるいは、 R^A 及び R^B は、

これらが結合している原子と共に、N、O及びSから選択される1個の更なるヘテロ原子を含有してもよく、且つ(C₁ - C₄)アルキルにより置換されていてもよい4～6員の複素環を形成し、

R^Cは、H、(C₁ - C₄)アルキル、フェニル、5～6員のヘテロシクロアルキル、又は5～6員のヘテロアリールであるか、あるいは、R^A及びR^Cは、これらが結合している原子と共に、N、O及びSから選択される1個の更なるヘテロ原子を含有してもよく、且つ(C₁ - C₄)アルキルにより置換されていてもよい4～8員の複素環を形成し、

各R^Xは、独立して、H、(C₁ - C₆)アルキル、及び置換されていてもよい(C₂ - C₆)アルキルから選択され、ここで、前記置換されていてもよい(C₂ - C₆)アルキルは、ヒドロキシル、シアノ、アミノ、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)アルキル)NH-、又は((C₁ - C₄)アルキル)((C₁ - C₄)アルキル)N-により置換されていてもよく、且つ、

各R^Yは、独立して、H、(C₁ - C₄)アルキル、フェニル、及び-(C₁ - C₄)アルキルフェニルから選択されるが、

但し、Yが-C(O)-であり、且つAが-C(=O)NR^X-又は-SO₂NR^X-である場合、R²及びR³のうちの少なくとも1つはHではない(R²及びR³のうちの一方又は両方のいずれかがHではない)、

更に、式Iの化合物又はその塩を含んでなる医薬組成物、式Iの化合物又はその塩とHDACとを接触させることによりHDACを阻害する方法、並びに式Iの化合物又はその塩あるいは式Iの化合物又はその塩を含んでなる医薬組成物を被験体に投与することを含んでなる、HDACの阻害により媒介される疾患又は障害を有する被験体を治療する方法に関する。

【手続補正2】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

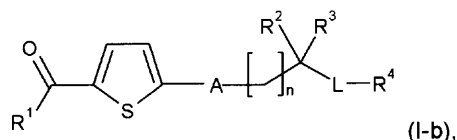
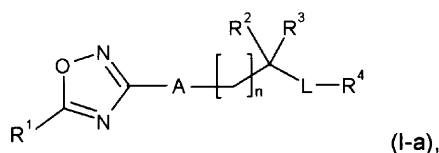
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I-a)または式(I-b)に記載の化合物又はその塩：

【化1】



〔式中、

R¹は、CHF₂又はCF₃であり、

nは0～4であり、

Aは、-C(=O)NR^X-、-((C₁ - C₆)アルキル)C(=O)NR^X-、-((C₁ - C₆)アルキル)NR^XC(=O)NR^X-、-((C₁ - C₆)アルキル)NR^XC(=O)-、-((C₁ - C₆)アルキル)SO₂-、-SO₂NR^X-、-((C₁ - C₆)アルキル)SO₂NR^X-、-((C₁ - C₆)アルキル)NR^XSO₂-、-((C₁ - C₆)アルキル)NHCH(CF₃)-、-CH(CF₃)NH-、-

($C_1 - C_6$) アルキル) $CH(CF_3)NH-$ 、 $-CH(CF_3)-$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル) $CH(CF_3)-$ 、又は $-(C_1 - C_6)$ アルキル) NR^X- であり、
 n が 0 である場合、 R^2 及び R^3 は、独立して、 H 、並びに置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル、アリール ($C_1 - C_4$) アルキル-、及び ($C_3 - C_7$) シクロアルキル ($C_1 - C_4$) アルキル- から選択され、

n が 1 ~ 4 である場合、 R^2 及び R^3 は、独立して、 H 、フルオロ、及び置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル、アリール ($C_1 - C_4$) アルキル-、及び ($C_3 - C_7$) シクロアルキル ($C_1 - C_4$) アルキル- から選択され、ここで、 n が 1 であり、 R^2 が F であり、且つ R^3 が H である場合、 A は $-C(=O)NR^X-$ 、 $-NR^XC(=O)NR^X$ 、 $-SO_2NR^X-$ 、 $-NHCH(CF_3)-$ 、 $-CH(CF_3)NH-$ 、 $-CH(CF_3)-$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル-、 $-NR^X-$ 、又は $-(C_1 - C_3)$ アルキル- NR^X- であり、且つ

n が 1 ~ 4 である場合、 R^2 は、 $-NR^AR^B$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル- NR^AR^B 、 $-CONR^AR^B$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル- $CONR^AR^B$ 、 $-CO_2H$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル- CO_2H 、ヒドロキシル、ヒドロキシ ($C_1 - C_4$) アルキル-、($C_1 - C_3$) アルコキシ、及び ($C_1 - C_3$) アルコキシ ($C_1 - C_4$) アルキル- から選択され、且つ R^3 は、 H 並びに置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル、アリール ($C_1 - C_4$) アルキル-、及び ($C_3 - C_7$) シクロアルキル ($C_1 - C_4$) アルキル- から選択され、

ここで、 R^2 及び R^3 の前記置換されていてもよい ($C_1 - C_4$) アルキル、アリール ($C_1 - C_4$) アルキル-、及び ($C_3 - C_7$) シクロアルキル ($C_1 - C_4$) アルキル- のアリール、シクロアルキル、及び各 ($C_1 - C_4$) アルキルの部分のいずれかは、独立してハロゲン、シアノ、($C_1 - C_4$) アルキル、ハロ ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、ハロ ($C_1 - C_4$) アルコキシ、 $-NR^AR^A$ 、 $-(C_1 - C_4)$ アルキル) NR^AR^A 、及びヒドロキシルから選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよいが、

あるいは、 R^2 及び R^3 は、これらが結合している原子と共に、置換されていてもよい 4、5、6、又は 7 員のシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル基を形成し、ここで、前記ヘテロシクロアルキル基は、独立して N 、 O 、及び S から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含有し、且つ前記置換されていてもよいシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル基は、独立して ($C_1 - C_4$) アルキル、ハロ ($C_1 - C_4$) アルキル、ハロゲン、シアノ、アリール ($C_1 - C_4$) アルキル-、($C_3 - C_7$) シクロアルキル ($C_1 - C_4$) アルキル-、 $-OR^Y$ 、 $-NR^YR^Y$ 、 $-C(=O)OR^Y$ 、 $-C(=O)NR^YR^Y$ 、 $-NR^YC(=O)R^Y$ 、 $-SO_2NR^YR^Y$ 、 $-NR^YSO_2R^Y$ 、 $-OC(=O)NR^YR^Y$ 、 $-NR^YC(=O)OR^Y$ 、及び $-NR^YC(=O)NR^YR^Y$ から選択される 1、2 又は 3 個の置換基により置換されていてもよく、且つ、

L は、 R^4 によって置換されている 5 ~ 6 員のヘテロアリール又はフェニルであり、且つ更に置換されていてもよく、

ここで、 L が更に置換される場合、 L は、独立してハロゲン、シアノ、及び ($C_1 - C_4$) アルキルから選択される 1 又は 2 個の置換基により置換され、

R^4 は、 H 、($C_1 - C_4$) アルキル、ハロ、ハロ ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキル) ($C_1 - C_4$) アルキル) $N(C_1 - C_4)$ アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキル) ($C_1 - C_4$) アルキル) $N(C_1 - C_4)$ アルキル-、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ-、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、置換されていてもよい ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよい 5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、又は置換されていてもよい 5 ~ 6 員のヘテロアリールであり、

ここで、前記置換されていてもよいシクロアルキル、フェニル、ヘテロシクロアルキル、又はヘテロアリールは、独立して ($C_1 - C_4$) アルキル、ハロゲン、シアノ、ハロ ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ-、ハ

口 (C₁ - C₄) アルコキシ、ヒドロキシル、-NR^AR^C、及び - ((C₁ - C₄) アルキル) NR^AR^C から選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよいが、

あるいは、L - R⁴ は、共に、1, 3 - ベンゾジオキソリル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシニル、ベンゾフラニル、テトラヒドロイソキノリル、又はイソインドリニル基を形成し、ここで、前記ベンゾフラニル、テトラヒドロイソキノリル、又はイソインドリニル基は、独立して (C₁ - C₄) アルキル、ハロゲン、シアノ、ハロ (C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルキルチオ -、ハロ (C₁ - C₄) アルコキシ、ヒドロキシル、-NR^AR^C、及び - ((C₁ - C₄) アルキル) NR^AR^C から選択される 1、2 又は 3 個の基により置換されていてもよく、ここで、各 R^A は、独立して、H 及び (C₁ - C₄) アルキルから選択され、R^B は、H、(C₁ - C₄) アルキル、ハロ (C₁ - C₄) アルキル、-C(=O)(C₁ - C₄) アルキル、-C(=O)O(C₁ - C₄) アルキル、-C(=O)NH₂、-C(=O)NH(C₁ - C₄) アルキル、-C(=O)N((C₁ - C₄) アルキル)((C₁ - C₄) アルキル)、-SO₂(C₁ - C₄) アルキルであるか、あるいは、R^A 及び R^B は、これらが結合している原子と共に、N、O 及び S から選択される 1 個の更なるヘテロ原子を含有してもよく、且つ (C₁ - C₄) アルキルにより置換されていてもよい 4 ~ 6 員の複素環を形成し、

R^C は、H、(C₁ - C₄) アルキル、フェニル、5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキル、又は 5 ~ 6 員のヘテロアリールであるか、あるいは、R^A 及び R^C は、これらが結合している原子と共に、N、O 及び S から選択される 1 個の更なるヘテロ原子を含有してもよく、且つ (C₁ - C₄) アルキルにより置換されていてもよい 4 ~ 8 員の複素環を形成し、

各 R^X は、独立して、H、(C₁ - C₆) アルキル、及び置換されていてもよい (C₂ - C₆) アルキルから選択され、ここで、前記置換されていてもよい (C₂ - C₆) アルキルは、ヒドロキシル、シアノ、アミノ、(C₁ - C₄) アルコキシ、(C₁ - C₄) アルキル) NH -、又は ((C₁ - C₄) アルキル)((C₁ - C₄) アルキル) N - により置換されていてもよく、且つ、

各 R^Y は、独立して、H、(C₁ - C₄) アルキル、フェニル、及び - (C₁ - C₄) アルキルフェニルから選択されるが、

但し、Y が -C(O)- であり、且つ A が -C(=O)NR^X - 又は -SO₂NR^X - である場合、R² 及び R³ のうちの少なくとも 1 つは H ではない]

(但し、前記化合物は、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [5 - [[メチル(フェニルメチル)アミノ]メチル] - 2 - チエニル] - エタノン、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - [5 - [[[(1R) - 1 - フェニルエチル]アミノ]メチル] - 2 - チエニル] - エタノン、N - メチル - 2 - フェニル - N - (2 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)エチル)アセトアミド、N - [2 - (3, 4 - ジメトキシフェニル)エチル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - アセトアミド、及び N - (フェニルメチル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - メタンアミンではない)。

【請求項 2】

A が、-((C₂ - C₄) アルキル)C(=O)NR^X -、-((C₂ - C₄) アルキル)SO₂NR^X -、又は -((C₂ - C₄) アルキル)NR^XC(=O) - である、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 3】

各 R^X が、独立して、H 又はメチルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物又は塩。

【請求項 4】

A が、-CH₂CH₂C(=O)NH -、-CH₂CH₂CH₂C(=O)NH -、-CH₂CH₂CH₂SO₂NH -、又は -CH₂CH₂CH₂CH₂C(=O)NH - である、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 5】

n が、0 又は 1 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 6】

R² 及び R³ が、これらが結合している原子と共に、テトラヒドロピラニル又は N - メチル - ピペリジニル基を形成する、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】

R² 及び R³ が、各々メチルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 8】

L が、R⁴ によって置換されているチアゾリル、チエニル、トリアゾリル、オキサゾリル又はフェニルであり、且つメチル基によって更に置換されていてもよい、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 9】

R⁴ が、H、メチル、フェニル、4 - クロロフェニル、4 - フルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、4 - シアノフェニル、4 - メトキシフェニル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、又はピリド - 4 - イルである、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 10】

A が、-CH₂CH₂C(=O)NH-、-CH₂CH₂CH₂C(=O)NH-、-CH₂CH₂CH₂SO₂NH-、-CH₂CH₂C(CH₃)₂C(=O)NH-、-CH₂CH₂C(CH₃)₂SO₂NH-、又は-CH₂CH₂CH₂CH₂C(=O)NH-であり、

n が、1 であり、

R² 及び R³ が、これらが結合している原子と共に、テトラヒドロピラニル又は N - メチル - ピペリジニル基を形成するか、又は R² 及び R³ がメチルであるか、又は R² が -CH₂CH₂N(CH₃)₂ であり、且つ R³ が H であるか、又は R² がヒドロキシルであり、且つ R³ が H 又はメチルであり、且つ、

L が、R⁴ によってのみ置換されているチアゾリル又はオキサゾリルであり、ここで、R⁴ は、フェニル、4 - クロロフェニル、又は 4 - フルオロフェニルである、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 11】

N - ((4 - (4 - フェニルチアゾ - ル - 2 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) メチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 2 - メチルプロピル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (4 - (ジメチルアミノ) - 2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) プチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド

N - ((4 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 2 - メチルプロピル - 2, 2 - ジメチル - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) エチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - ((4 - (2 - (4 - クロロフェニル) チアゾール - 4 - イル) - 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 2 - ヒドロキシエチル) - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 2 - メチルプロピル) - 3 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) プロパン - 1 - スルホンアミド、

N - (3 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 3 - ヒドロキシプロピル) - 3 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) プロパンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 2 - メチルプロピル) - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) エチル) - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

N - (2 - (3 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イル) - 2 - メチルプロピル) - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

3 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - N - (3 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) プロピル) プロパンアミド、

N - (2 - (3 - (4 - フルオロフェニル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イル) エチル) - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

N - (4 - (ジメチルアミノ) - 2 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) ブチル) - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

N - ((4 - (2 - (4 - フルオロフェニル) オキサゾール - 4 - イル) - 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル - 4 - (5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) チオフェン - 2 - イル) ブタンアミド、

である化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又は塩と、1 種以上の薬学上許容される賦形剤とを含んでなる、医薬組成物。