

【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2005-518365(P2005-518365A)

【公表日】平成17年6月23日(2005.6.23)

【年通号数】公開・登録公報2005-024

【出願番号】特願2003-547372(P2003-547372)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/4706 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (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 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (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 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (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 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 215/48 (2006.01)

C 0 7 D 219/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 215/42 C S P

A 6 1 K 31/4706

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/473

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K	31/519	
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	9/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/30	
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	215/48	
C 0 7 D	219/10	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	413/04	
C 0 7 D	487/04	1 4 6

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月10日(2005.6.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

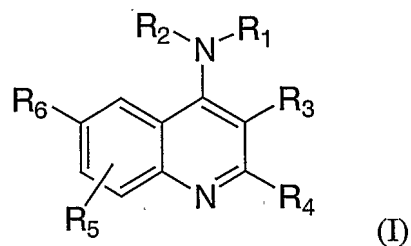
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記構造式(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 が、それらが結合している窒素原子と一体となって、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い、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 4～10 員の架橋もしくは非架橋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 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) $-(CH_2)_n - \text{アリーール} - R^7$ 、
- (3) $-(CH_2)_n - \text{ヘテロアリーール} - R^7$ 、
- (4) $-(CH_2)_n - \text{ヘテロシクロアルキル} - R^7$ 、
- (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) $-(CH_2)_n NR^7SO_2R^7$ 、
- (14) $-(CH_2)_n S(O)_pR^7$ 、
- (15) $-(CH_2)_n SO_2N(R^7)_2$ 、
- (16) $-(CH_2)_n OR^7$ 、
- (17) $-(CH_2)_n OC(O)R^7$ 、
- (18) $-(CH_2)_n OC(O)OR^7$ 、
- (19) $-(CH_2)_n OC(O)N(R^7)_2$ 、
- (20) $-(CH_2)_n N(R^7)_2$ 、および
- (21) $-(CH_2)_n NR^7SO_2N(R^7)_2$

からなる群から選択され；

$(CH_2)_n$ における水素原子のうちの 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) アリーール、
- (4) ヘテロアリーール、
- (5) シクロアルキル、
- (6) ヘテロシクロアルキル、
- (7) アリーール $C_1 - 3$ アルキル、
- (8) ヘテロアリーール $C_1 - 3$ 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) アリーール $C_2 - 3$ アルケニル、
- (12) ヘテロアリーール $C_2 - 3$ 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；前記アリーール、ヘテロアリーール、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) $-NR^dS(O)_mR^d$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) ハロゲン、
- (5) $-S(O)_mR^d$ 、
- (6) $-SR^d$ 、
- (7) $-S(O)_2OR^d$ 、
- (8) $-S(O)_pN(R^d)_2$ 、
- (9) $-N(R^d)_2$ 、
- (10) $-O(CR^dR^d)_nN(R^d)_2$ 、
- (11) $-C(O)R^d$ 、
- (12) $-CO_2R^d$ 、
- (13) $-CO_2(CR^dR^d)_nCON(R^d)_2$ 、
- (14) $-OC(O)R^d$ 、
- (15) $-CN$ 、
- (16) $-C(O)N(R^d)_2$ 、
- (17) $-NR^dC(O)R^d$ 、
- (18) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (19) $-NR^dC(O)OR^d$ 、
- (20) $-NR^dC(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) $-CR^d(N-OR^d)$ 、
- (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 は独立に、

- (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) 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) $-\text{CF}_3$ 、
- (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；

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は、独立に R^a から選択される 1～3 個の置換基で置換されていても良く；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 1～3 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一体となって、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い、未置換であるか R^b 置換基で置換されている 4～10 員の架橋もしくは非架橋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 1～3 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 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 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) $-NH(CH_3)$ 、および
 (10) $-N(CH_3)_2$

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) $-(CH_2)_n-C\equiv N$ 、
 (6) $-(CH_2)_n-CO-N(R^7)_2$ 、
 (7) $-(CH_2)_n-CO_2R^7$ 、
 (8) $-(CH_2)_n-COR^7$ 、
 (9) $-(CH_2)_n-NR^7C(O)R^7$ 、
 (10) $-(CH_2)_n-NR^7C(O)(CH_2)_nSR^7$ 、
 (11) $-(CH_2)_n-NR^7CO_2R^7$ 、
 (12) $-(CH_2)_n-NR^7C(O)N(R^7)_2$ 、
 (13) $-(CH_2)_n-NR^7SO_2R^7$ 、
 (14) $-(CH_2)_n-S(O)_pR^7$ 、
 (15) $-(CH_2)_n-SO_2N(R^7)_2$ 、
 (16) $-(CH_2)_n-OR^7$ 、
 (17) $-(CH_2)_n-OC(O)R^7$ 、
 (18) $-(CH_2)_n-OC(O)OR^7$ 、
 (19) $-(CH_2)_n-OC(O)N(R^7)_2$ 、
 (20) $-(CH_2)_n-N(R^7)_2$ 、および
 (21) $-(CH_2)_n-NR^7SO_2N(R^7)_2$

からなる群から選択され；

$(CH_2)_n$ 中の水素原子のうちの 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) $-NR^dS(O)_mR^d$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) ハロゲン、
- (5) $-S(O)_mR^d$ 、
- (6) $-SR^d$ 、
- (7) $-S(O)_2OR^d$ 、
- (8) $-S(O)_pN(R^d)_2$ 、
- (9) $-N(R^d)_2$ 、
- (10) $-O(CR^dR^d)_nN(R^d)_2$ 、
- (11) $-C(O)R^d$ 、
- (12) $-CO_2R^d$ 、
- (13) $-CO_2(CR^dR^d)_nCON(R^d)_2$ 、
- (14) $-OC(O)R^d$ 、
- (15) $-CN$ 、
- (16) $-C(O)N(R^d)_2$ 、
- (17) $-NR^dC(O)R^d$ 、
- (18) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (19) $-NR^dC(O)OR^d$ 、
- (20) $-NR^dC(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) $-CR^d(N-OR^d)$ 、
- (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；

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、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 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、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 に記載の化合物ならびに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 および R^2 が、それらが結合している窒素原子と一体となって、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い、未置換であるか R^b 置換基で置換された 4～10 員の架橋もしくは非架橋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) $-OCH_3$ 、
- (7) $-NH_2$ 、
- (8) $-CO_2R^7$ および
- (9) $-C(O)NH_2$

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) $-OCH_3$ 、
- (12) $-NH_2$ 、
- (13) $-CO_2R^7$ および
- (14) $-C(O)NH_2$

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 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 5～7 員の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) $-NH(CH_3)$ 、および
- (10) $-N(CH_3)_2$

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) $-(CH_2)_n C \equiv N$ 、
- (6) $-(CH_2)_n CON(R^7)_2$ 、
- (7) $-(CH_2)_n CO_2 R^7$ 、
- (8) $-(CH_2)_n COR^7$ 、
- (9) $-(CH_2)_n NR^7 C(O)R^7$ 、
- (10) $-(CH_2)_n NR^7 C(O)(CH_2)_n SR^7$ 、
- (11) $-(CH_2)_n NR^7 CO_2 R^7$ 、
- (12) $-(CH_2)_n NR^7 C(O)N(R^7)_2$ 、
- (13) $-(CH_2)_n NR^7 SO_2 R^7$ 、
- (14) $-(CH_2)_n S(O)_p R^7$ 、
- (15) $-(CH_2)_n SO_2 N(R^7)_2$ 、
- (16) $-(CH_2)_n OR^7$ 、
- (17) $-(CH_2)_n OC(O)R^7$ 、
- (18) $-(CH_2)_n OC(O)OR^7$ 、
- (19) $-(CH_2)_n OC(O)N(R^7)_2$ 、
- (20) $-(CH_2)_n N(R^7)_2$ 、および
- (21) $-(CH_2)_n NR^7 SO_2 N(R^7)_2$

からなる群から選択され；

$(CH_2)_n$ 中の水素原子のうちの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) $-NR^d S(O)_m R^d$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) ハロゲン、
- (5) $-S(O)_m R^d$ 、

- (6) $-SR^d$ 、
- (7) $-S(O)_2OR^d$ 、
- (8) $-S(O)_pN(R^d)_2$ 、
- (9) $-N(R^d)_2$ 、
- (10) $-O(CR^dR^d)_nN(R^d)_2$ 、
- (11) $-C(O)R^d$ 、
- (12) $-CO_2R^d$ 、
- (13) $-CO_2(CR^dR^d)_nCON(R^d)_2$ 、
- (14) $-OC(O)R^d$ 、
- (15) $-CN$ 、
- (16) $-C(O)N(R^d)_2$ 、
- (17) $-NR^dC(O)R^d$ 、
- (18) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (19) $-NR^dC(O)OR^d$ 、
- (20) $-NR^dC(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) $-CR^d(N-OR^d)$ 、
- (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；

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、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 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、これらは独立に R^a から選択される1～3個の置換基で置換されていても良く；

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一体となって、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い、未置換であるか R^b 置換基で置換された4～10員の架橋もしくは非架橋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) -CO₂H、
- (9) -CO₂CH₃、
- (10) -CO₂CH₂CH₃、および
- (11) -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1～3個の置換基で置換されていても良く；

R^4 が、

- (1) C_{1-8} アルキル、
- (2) トリフルオロメチル、
- (3) シクロアルキル、

- (4) シクロヘテロアルキル、
- (5) アリール、
- (6) ヘテロアリール、
- (7) $-\text{NH}_2$ 、
- (8) $-\text{CO}_2\text{H}$ 、
- (9) CO_2CH_3 および
- (10) $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$

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；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、未置換であるかオキソまたはヒドロキシで置換されている 5～7 員のシクロアルキル環を形成しており； 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) $-(\text{CH}_2)_n-\text{R}^7$ 、
- (2) $-(\text{CH}_2)_n-\text{アリール}-\text{R}^7$ 、
- (3) $-(\text{CH}_2)_n-\text{ヘテロアリール}-\text{R}^7$ 、
- (4) $-(\text{CH}_2)_n-\text{ヘテロシクロアルキル}-\text{R}^7$ 、
- (5) $-(\text{CH}_2)_n\text{CON}(\text{R}^7)_2$ 、
- (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；

$(\text{CH}_2)_n$ 中の水素原子のうちの 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) $-NH SO_2 CH_3$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) ハロゲン、
- (5) $-S(O)_m CH_3$ 、
- (6) $-SR^d$ 、
- (7) $-S(O)_2 OR^d$ 、
- (8) $-S(O)_p N(R^d)_2$ 、
- (9) $-N(R^d)_2$ 、
- (10) $-O(CR^d R^d)_n N(R^d)_2$ 、
- (11) $-C(O)R^d$ 、
- (12) $-CO_2 R^d$ 、
- (13) $-CO_2 (CR^d R^d)_n CON(R^d)_2$ 、
- (14) $-OC(O)R^d$ 、
- (15) $-CN$ 、
- (16) $-C(O)N(R^d)_2$ 、
- (17) $-NR^d C(O)R^d$ 、
- (18) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (19) $-NR^d C(O)OR^d$ 、
- (20) $-NR^d C(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) $-CR^d (N-OR^d)$ 、
- (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_{1-6} 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、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 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 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】

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) メチル、
- (3) エチル、
- (4) n -プロピル、
- (5) イソプロピル、
- (6) t -ブチル、
- (7) n -ブチル、
- (8) シクロプロピル、
- (9) シクロブチル、
- (10) シクロペンチル、
- (11) シクロヘキシル、
- (12) 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

選択されるヘテロシクロアルキル- C_{0-6} アルキル、および

- (13) フェニル- C_{0-3} 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一体となって、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、アザシクロヘプチル、2-オキサ-5-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、2-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、7-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、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]ノニルから選択される4～10員の架橋もしくは非架橋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) $-OCH_3$ 、
- (7) $-NH_2$ 、
- (8) $-CO_2H$ 、
- (9) $-CO_2CH_3$ 、および
- (10) $-CO_2CH_2CH_3$

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るも良く；

R^4 が独立に、

- (1) C_{1-8} アルキル、
- (2) トリフルオロメチル、
- (3) シクロブチル、
- (4) シクロペンチル、
- (5) シクロヘキシル、
- (6) フェニル、
- (7) $-CO_2H$ 、
- (8) $-CO_2CH_3$ および
- (9) $-CO_2CH_2CH_3$

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るも良く；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るも良く；

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) $-CONHR^7$ 、
- (4) $-CON(R^7)(CH_3)$ 、
- (5) $-CH_2CONHR^7$ 、
- (6) $-CH_2CON(R^7)(CH_3)$ 、
- (7) $-CH_2NHC(O)R^7$ 、
- (8) $-NHC(O)R^7$ 、
- (9) $-(CH_2)_nNHC(O)(CH_2)_nSR^7$ 、
- (10) $-(CH_2)_nNHC(O)N(CH_3)(R^7)$ 、
- (11) $-(CH_2)_nNHC(O)NH(R^7)$ 、
- (12) $-(CH_2)_nNH SO_2 R^7$ 、

- (13) $-\text{NH}(\text{R}^7)$ 、
 (14) $-\text{N}(\text{COCH}_3)(\text{R}^7)$ 、
 (15) $-(\text{CH}_2)_n\text{NH}(\text{R}^7)$ 、および
 (16) $-(\text{CH}_2)_n\text{N}(\text{COCH}_3)(\text{R}^7)$

からなる群から選択され；

$(\text{CH}_2)_n$ 中の水素原子のうちの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、スピロー（ジヒドロベンゾチオフェニル）ピペリジニル、スピロー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、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-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン、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、スピロー（ジヒドロベンゾチオフェニル）ピペリジニル、スピロー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、

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)、

(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、アザシクロヘプチル、4, 4-スプロ〔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-スプロ〔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、スピロー(ジヒドロベンゾチオフェニル)ピペリジニル、スピロー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)、

(13) 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

(14) 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-スプロ〔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-スプロ〔インドリ-3, 3-イル〕ピペリジニルから選択される)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) $-NH SO_2 CH_3$ 、
- (3) $-NO_2$ 、
- (4) ハロゲン、
- (5) $-S(O)_m CH_3$ 、
- (6) $-SCH_3$ 、
- (7) $-SCF_3$ 、
- (8) $-S(O)_2 OH$ 、
- (9) $-S(O)_p N(R^d)_2$ 、
- (10) $-N(CH_3)_2$ 、
- (11) $-NH_2$ 、
- (12) $-O(CR^d R^d)_n N(R^d)_2$ 、
- (13) $-C(O)R^d$ 、
- (14) $-CO_2 H$ 、
- (15) $-CO_2 CH_3$ 、
- (16) t -ブチルオキシカルボニル、
- (17) $-CO_2 (CR^d R^d)_n CON(R^d)_2$ 、
- (18) $-OC(O)R^d$ 、
- (19) $-CN$ 、
- (20) $-C(O)N(R^d)_2$ 、
- (21) $-NR^d C(O)R^d$ 、
- (22) $-OC(O)N(R^d)_2$ 、
- (23) $-NR^d C(O)OR^d$ 、
- (24) $-NR^d C(O)N(R^d)_2$ 、
- (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) フェニル、および
- (7) フェニル- 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、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 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；

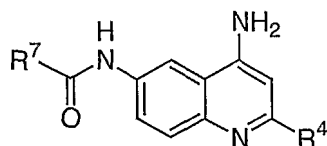
n が 0、1、2、3 および 4 から選択され；

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】

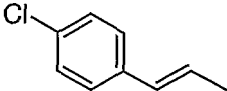
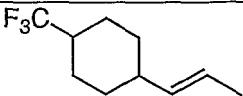
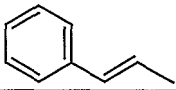
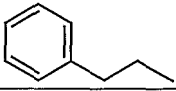
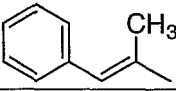
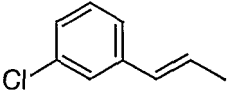
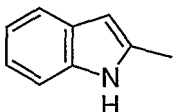
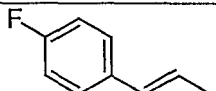
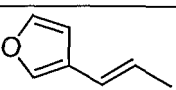
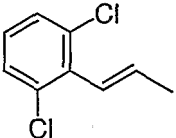
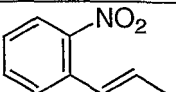
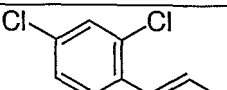
下記構造式を有する請求項 1 に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

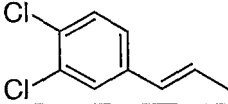
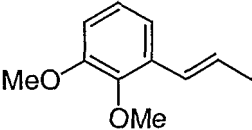
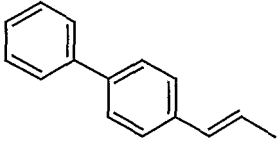
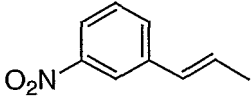
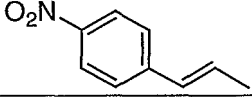
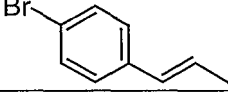
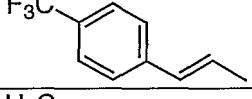
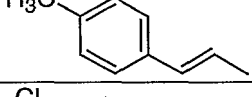
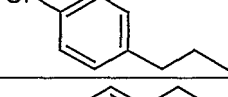
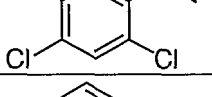
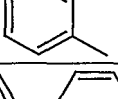
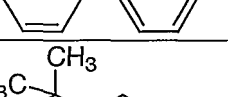
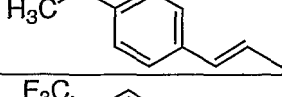
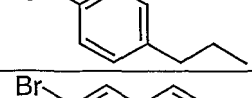
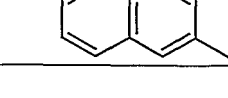
【化 2】

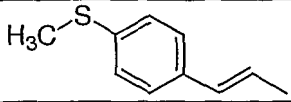
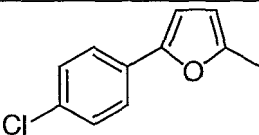
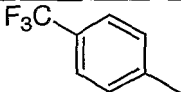
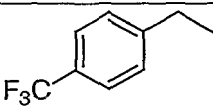
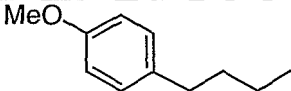
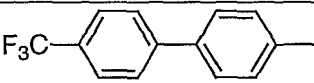
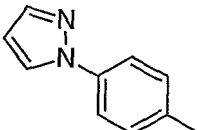
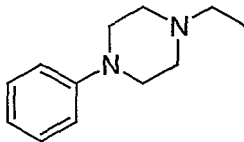
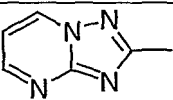
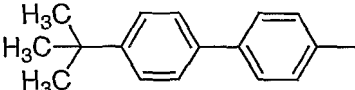
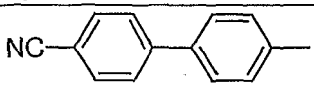
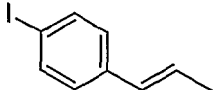
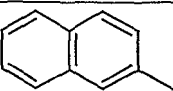
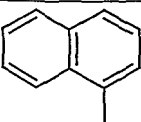
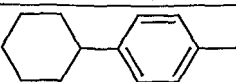


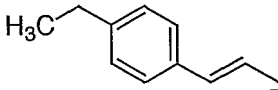
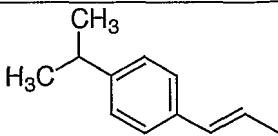
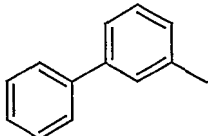
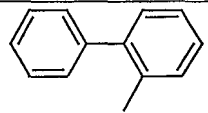
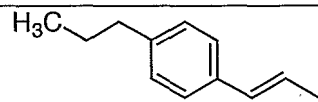
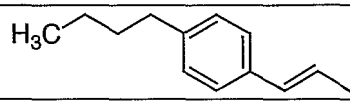
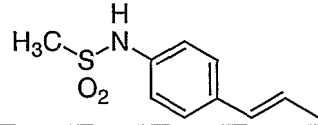
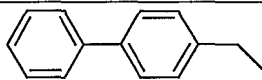
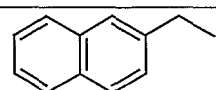
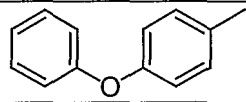
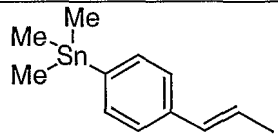
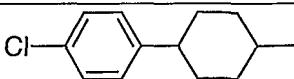
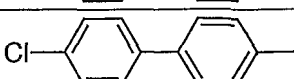
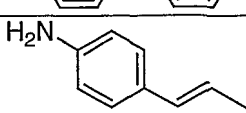
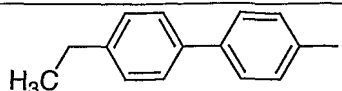
[式中、 R^4 および R^7 は下記の表に従って選択される。]

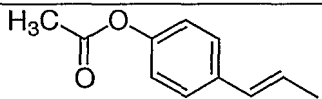
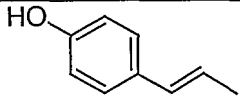
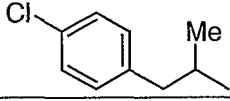
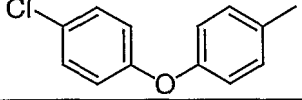
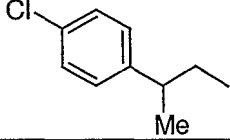
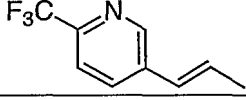
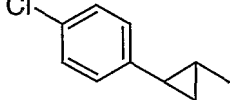
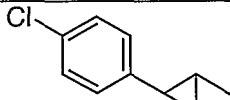
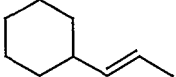
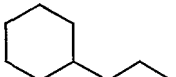
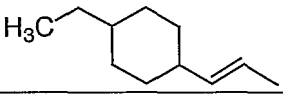
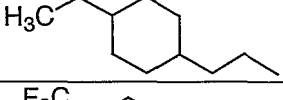
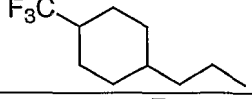
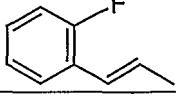
【表 1】

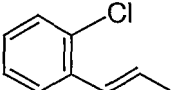
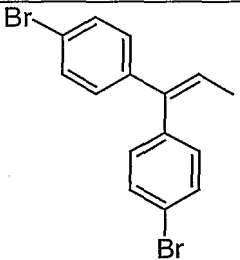
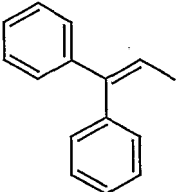
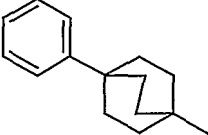
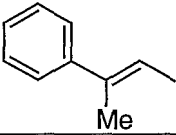
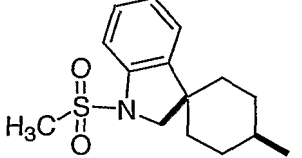
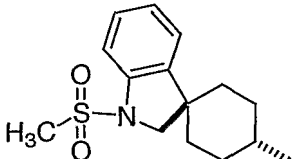
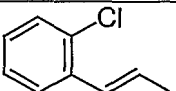
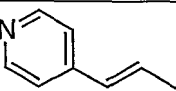
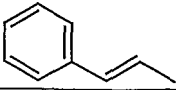
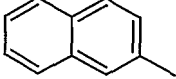
実施例番号	<u>R⁷</u>	<u>R⁴</u>
1		-n-プロピル
2		-n-プロピル
3		-n-プロピル
4		-n-プロピル
5		-n-プロピル
6		-n-プロピル
7		-n-プロピル
8		-n-プロピル
9		-n-プロピル
10		-n-プロピル
11		-n-プロピル
12		-n-プロピル

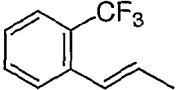
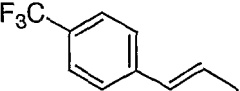
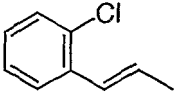
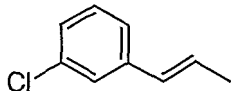
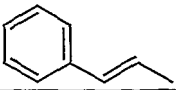
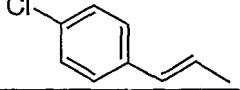
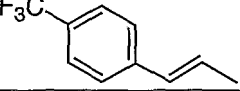
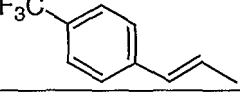
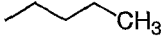
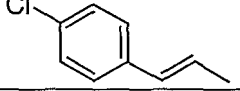
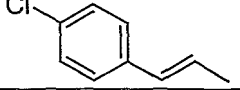
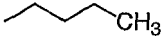
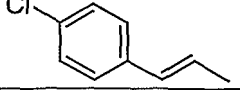
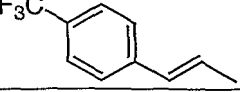
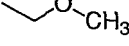
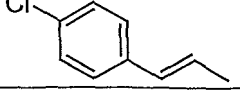
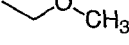
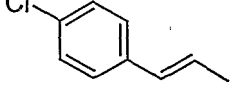
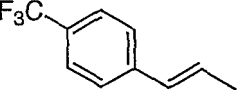
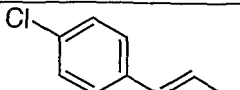
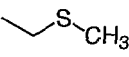
13		-n-プロピル
14		-n-プロピル
15		-n-プロピル
16		-n-プロピル
17		-n-プロピル
18		-n-プロピル
19		-n-プロピル
20		-n-プロピル
21		-n-プロピル
22		-n-プロピル
23		-n-プロピル
24		-n-プロピル
25		-n-プロピル
26		-n-プロピル
27		-n-プロピル

28		-n-プロピル
29		-n-プロピル
30		-n-プロピル
31		-n-プロピル
32		-n-プロピル
33		-n-プロピル
34		-n-プロピル
35		-n-プロピル
36		-n-プロピル
37		-n-プロピル
38		-n-プロピル
39		-n-プロピル
40		-n-プロピル
41		-n-プロピル
42		-n-プロピル

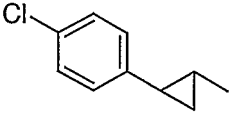
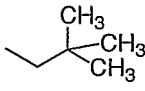
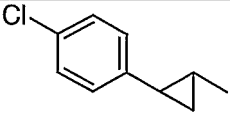
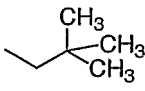
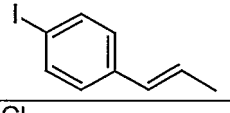
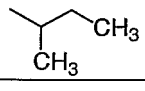
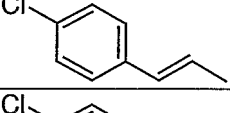
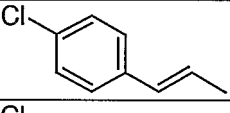
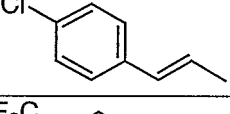
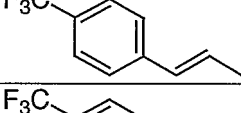
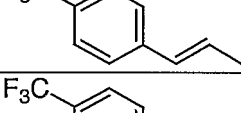
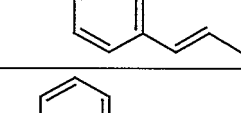
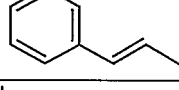
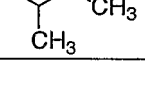
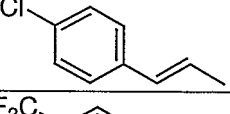
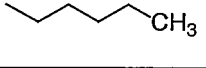
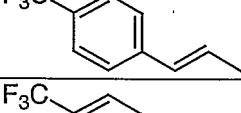
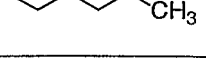
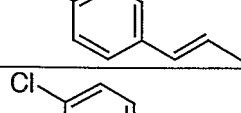
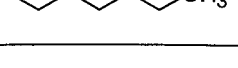
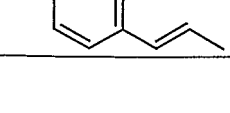
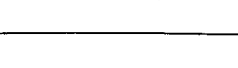
43		-n-プロピル
44		-n-プロピル
45		-n-プロピル
46		-n-プロピル
47		-n-プロピル
48		-n-プロピル
49		-n-プロピル
50		-n-プロピル
51		-n-プロピル
52		-n-プロピル
53		-n-プロピル
54		-n-プロピル
55		-n-プロピル
56		-n-プロピル
57		-n-プロピル

58		-n-プロピル
59		-n-プロピル
60		-n-プロピル
61		-n-プロピル
62		-n-プロピル
63		-n-プロピル
64	 異性体 A	-n-プロピル
65	 異性体 B	-n-プロピル
66		-n-プロピル
67		-n-プロピル
68		-n-プロピル
69		-n-プロピル
70		-n-プロピル
71		-n-プロピル

72		-n-プロピル
73		-n-プロピル
74		-n-プロピル
75		-n-プロピル
76		-n-プロピル
77		-n-プロピル
78		-n-プロピル
79		-CH ₃
80		-CH ₃
81		-CH ₃
82		-CH ₃

83		
84		
85		
86		
87		
88		
89		
90		
91		
92		
93		
94		
95		
96		
97		
98		

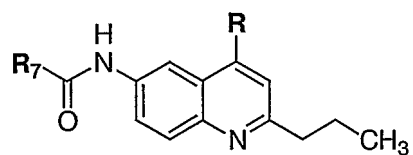
99		
100		
101		
102		
103		
104		
105		
106		
107		
108		
109		
110		
111		
112		
113		

114	 (異性体 A)	
115	 (異性体 B)	
116		
117		
118		
119		
120		
121		
122		
123		
124		
125		
126		
127		

【請求項 7】

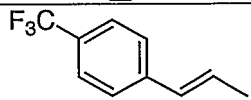
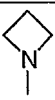
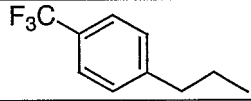
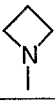
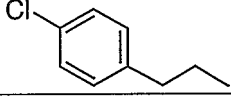
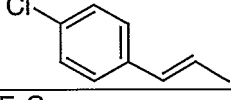
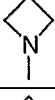
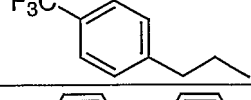
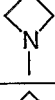
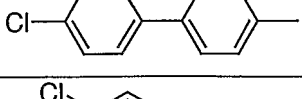
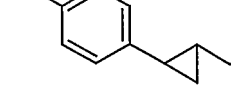
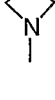
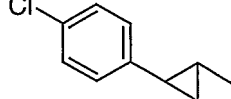
下記構造式を有する請求項 1 に記載の化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

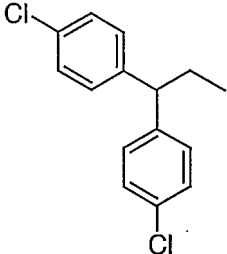
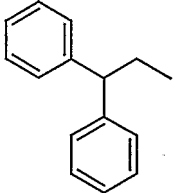
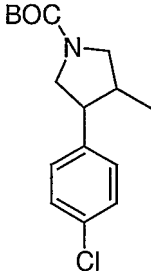
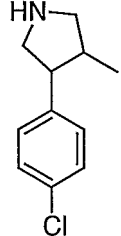
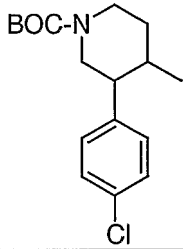
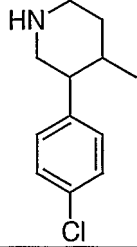
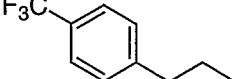
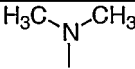
【化 3】



[式中、 $-R^7$ および $-R$ は下記の表に従って選択される。]

【表 2】

実施例番号	R ⁷	R = -NR ¹ R ²
128		
129		
130		
131		
132		
133		
134	 異性体 A	
135	 異性体 A	

136	 <chem>CC(Cc1ccc(Cl)cc1)c2ccc(Cl)cc2</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
137	 <chem>CC(C1=CC=CC=C1)C2=CC=CC=C2</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
138	 <chem>CC1(C)C(Cc2ccc(Cl)cc2)N(C1)C(=O)OC(=O)c3ccc(Cl)cc3</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
139	 <chem>CC1C(Cc2ccc(Cl)cc2)NC1</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
140	 <chem>CC1(C)C(Cc2ccc(Cl)cc2)N(C1)C(=O)OC(=O)c3ccc(Cl)cc3</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
141	 <chem>CC1C(Cc2ccc(Cl)cc2)NC1</chem>	 <chem>CN1CCCC1</chem>
142	 <chem>CC1C(Cc2ccc(Cl)cc2)NC1</chem>	 <chem>CN(C)C</chem>

143		
144		
145		
146		
147		
148		
149		
150		
151		
152		
153		
154		
155		

【請求項 8】

下記のもの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。

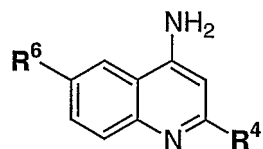
【表 3】

実施例番号	構造
-------	----

156	
157	
158	
159	
160	
161	
162	
163	
164	
165	
166	

下記構造式を有する請求項 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。

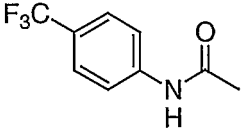
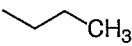
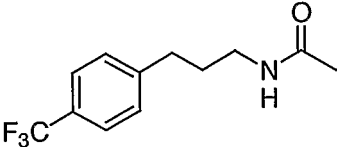
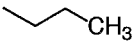
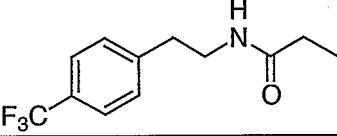
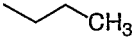
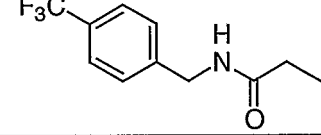
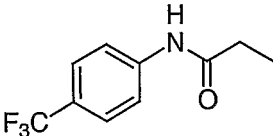
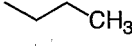
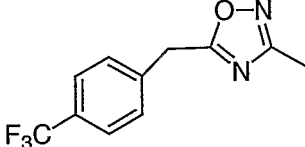
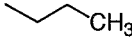
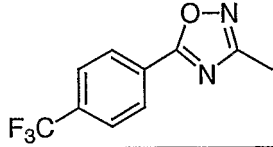
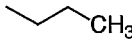
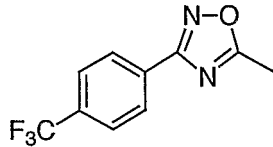
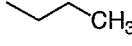
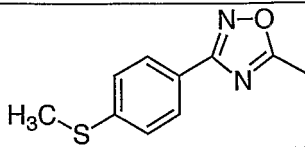
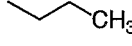
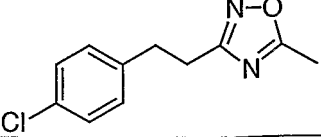
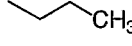
【化 4】

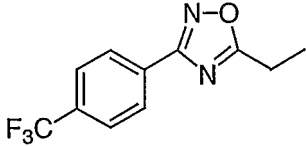
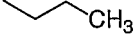
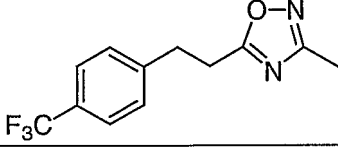
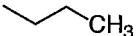
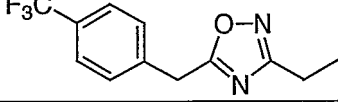
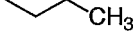
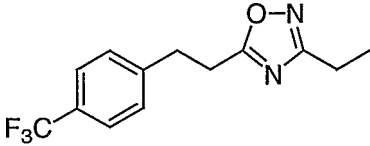
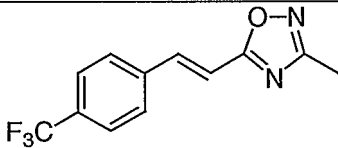
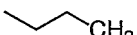
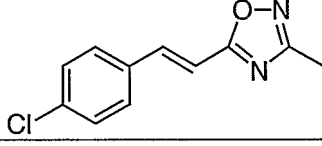
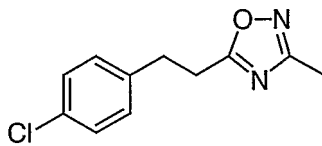
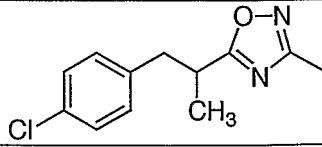
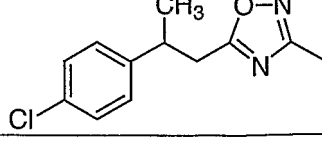


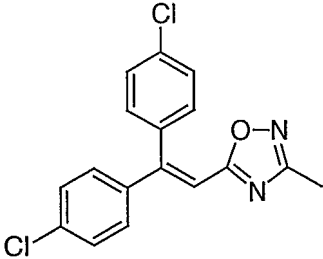
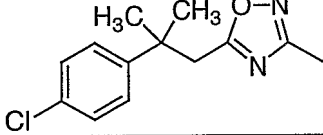
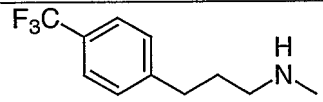
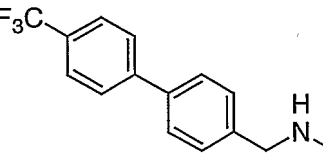
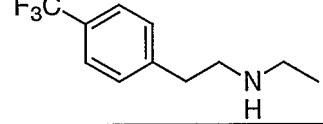
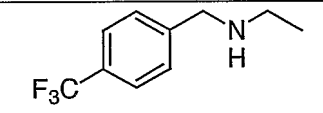
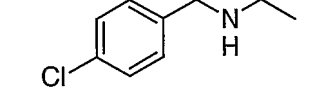
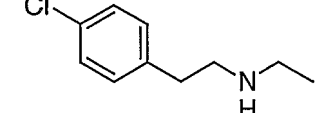
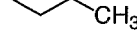
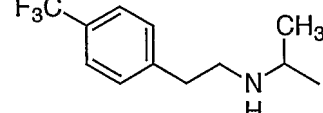
[式中、 R^6 および R^4 は下記の表に従って選択される。]

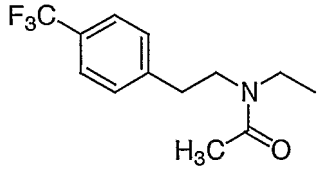
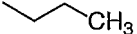
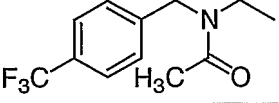
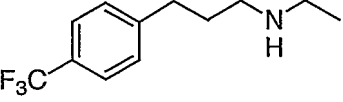
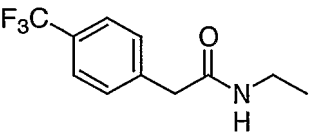
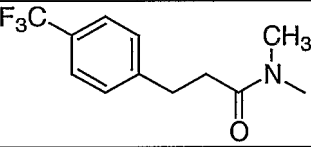
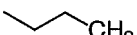
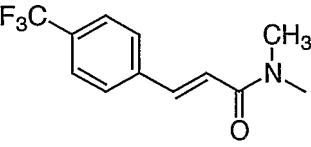
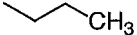
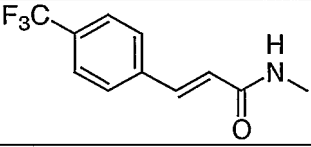
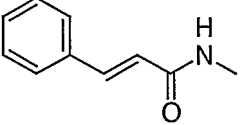
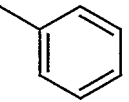
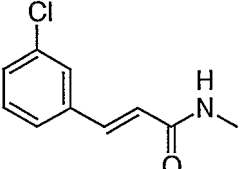
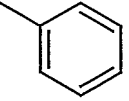
【表 4】

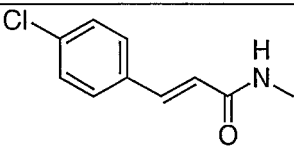
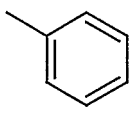
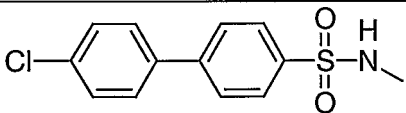
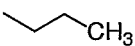
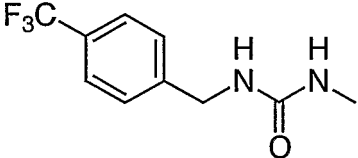
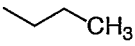
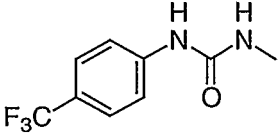
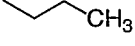
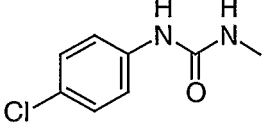
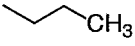
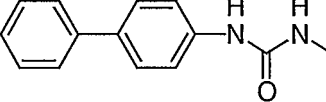
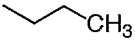
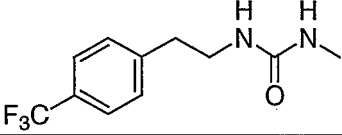
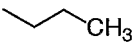
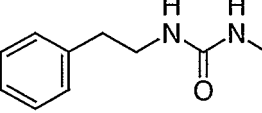
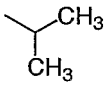
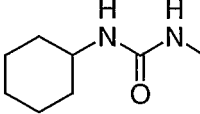
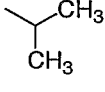
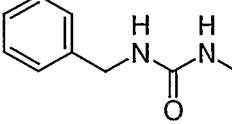
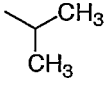
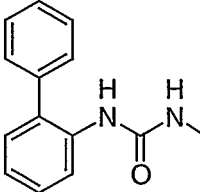
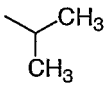
実施例番号	R^6	R^4
167		
168		
169		
170		

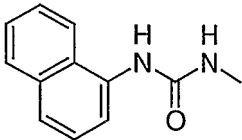
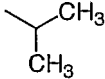
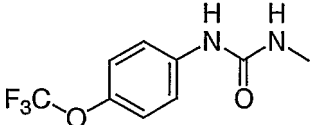
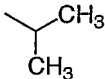
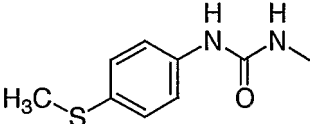
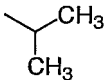
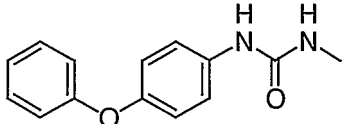
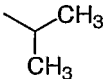
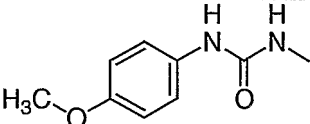
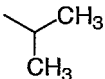
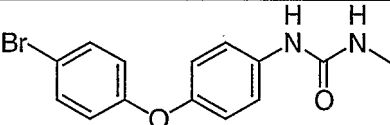
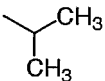
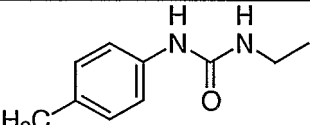
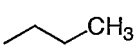
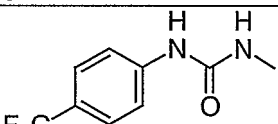
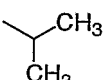
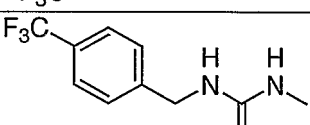
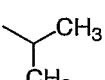
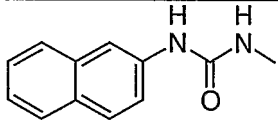
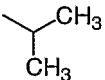
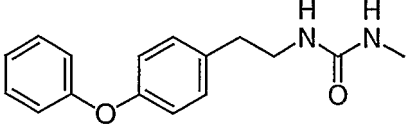
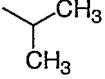
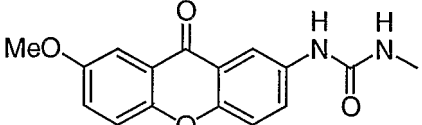
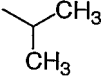
171		
172		
173		
174		
175		
176		
177		
178		
179		
180		

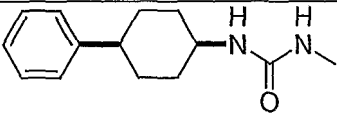
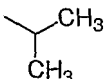
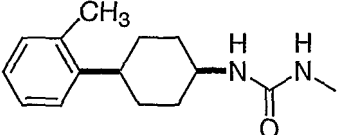
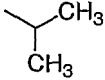
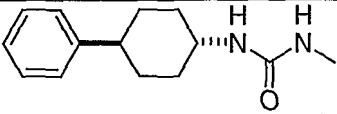
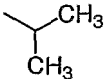
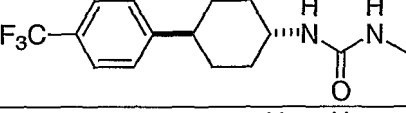
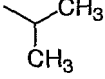
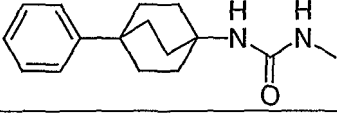
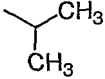
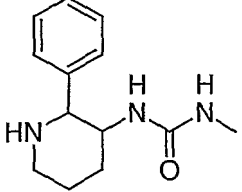
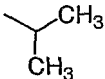
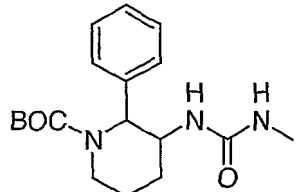
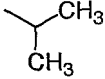
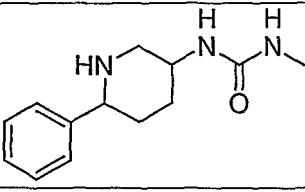
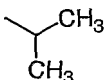
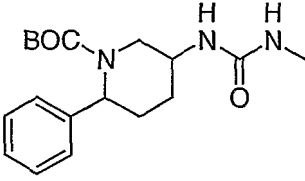
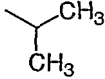
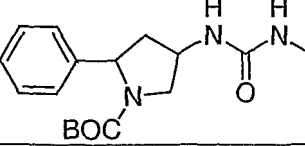
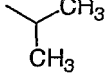
181	 <chem>CC1=NC(=O1N)C2=CC=C(C(F)(F)F)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
182	 <chem>CC1=NC(=O1N)CC2=CC=C(C(F)(F)F)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
183	 <chem>CC1=NC(=O1N)CC2=CC=C(C(F)(F)F)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
184	 <chem>CC1=NC(=O1N)CC2=CC=C(C(F)(F)F)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
185	 <chem>CC1=NC(=O1N)C=C2C=CC(C(F)(F)F)=CC=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
186	 <chem>CC1=NC(=O1N)C=C2C=CC(Cl)=CC=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
187	 <chem>CC1=NC(=O1N)CC2=CC=C(Cl)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
188	 <chem>CC1=NC(=O1N)C(C)CC2=CC=C(Cl)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>
189	 <chem>CC1=NC(=O1N)CC(C)C2=CC=C(Cl)C=C2</chem>	 <chem>CCCC</chem>

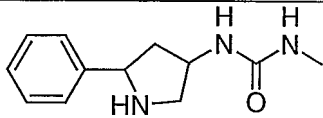
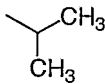
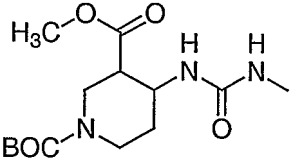
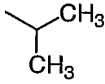
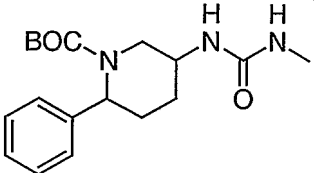
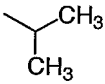
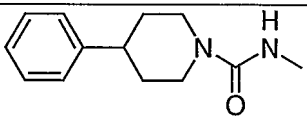
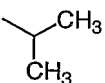
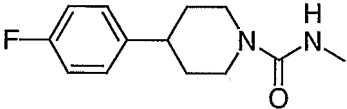
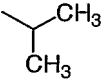
190	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
191	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
192	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
193	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
194A	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
194B	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
195	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
196	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>
197	 <chem>Cc1nc(Cc2cc(Cl)cc2)c(Cc3cc(Cl)cc3)o1</chem>	 <chem>CCCC</chem>

198		
199		
200		
201		
202		
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		

【請求項 10】

(1) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

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

(3) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(1,1'-ビフェニル-4-イル)プロプ-2-エンアミド、

(4) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(4-ブロモフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(5) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-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、

(6) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(4-メチルフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(7) N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-1,1'-ビフェニル-4-カルボキサミド、

(8) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-[4-(メチルチオ)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(9) (2E)-N-[4-(ジメチルアミノ)-2-プロピルキノリン-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、

(10) N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-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、

(11) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(4-ヨードフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(12) (2E)-N-(4-アゼチジン-1-イル)-2-プロピルキノリン-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、

(13) (2E)-N-[4-(メチルアミノ)-2-プロピルキノリン-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、

(14) (2E)-N-(4-アミノ-2-エチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(15) (2E)-N-(4-アミノ-2-ブチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(16) (2E) - N - (4-アミノ-2-エチルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(17) (2E) - N - (4-アミノ-2-ブチルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(18) N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-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) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-エチルフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(20) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-イソプロピルフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(21) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-プロピルフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(22) N - [4-アミノ-3-(ヒドロキシメチル)-2-プロピルキノリン-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、

(23) (2E) - N [4-アミノ-2-(メトキシメチル)キノリン-6-イル] - 3 - [4-(トリフルオロメチル)フェニル] プロプ-2-エンアミド、

(24) (2E) - N - (4-アミノ-2-ヘキシルキノリン-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、

(25) (2E) - N - [4-アミノ-2-(メトキシメチル)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、

(26) (2E) - N - (4-アミノ-2-ペンチルキノリン-6-イル) - 3 - [4-(トリフルオロメチル)フェニル] プロプ-2-エンアミド、

(27) (2E) - N - (4-アミノ-2-ペンチルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(28) (2E) - N - (4-アミノ-2-ヘキシルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(29) N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4 - (4-クロロフェニル) シクロヘキサカルボキサミド、

(30) N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4' - クロロ-1, 1' - ビフェニル-4-カルボキサミド、

(31) N - [4-(メチルアミノ)-2-プロピルキノリン-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、

(32) N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4' - エチル-1, 1' - ビフェニル-4-カルボキサミド、

(33) (2E) - N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(34) (2E) - N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-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、

(35) N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-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、

(36) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 [6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル] プロプ-2-エンアミド、

(37) (2E) - N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(38) N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4' - クロロ-1, 1' - ビフェニル-4-カルボキサミド、

(39) (2E) - N - (9-アミノ-8-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、

(40) (2E) - N - [4-アミノ-2-(ヒドロキシメチル)キノリン-6-イル] - 3 - [4-(トリフルオロメチル)フェニル] プロプ-2-エンアミド、

(41) (2E)-N-(9-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(42) (2E)-N-(9-アミノ-8-ヒドロキシ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(43) (2E)-N-(9-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-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、

(44) (2E)-N-(4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(45) (2E)-N-(4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(46) (2E)-3-(4-クロロフェニル)-N-[4-(エチルアミノ)-2-プロピルキノリン-6-イル]プロプ-2-エンアミド、

(47) (2E)-N-[4-(エチルアミノ)-2-プロピルキノリン-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、

(48) (2E)-N-(4-アミノ-2-tert-ブチルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(49) (2E)-N-(4-アミノ-2-tert-ブチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(50) N-(4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-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、

(51) (2E)-N-(4-アミノ-2-ネオペンチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(52) N-(4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル)-N'-(4-フェノキシフェニル)尿素、

(53) (2E)-N-(4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル)-3-(4-エチルシクロヘキシル)プロプ-2-エンアミド、

(54) (2E)-N-(4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-6-イル)-3-(4-ヨードフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(55) N-(4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル)-N'-(4-フェニルシクロヘキシル)尿素、

(56) N-(4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル)-N'-(2-ナフチル)尿素、

(57) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロブチルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(58) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロペンチルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(59) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロヘキシルキノリン-6-イル)-3-(4-クロロフェニル)プロプ-2-エンアミド、

(60) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロブチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(61) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロペンチルキノリン-6-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]プロプ-2-エンアミド、

(62) (2E)-N-(4-アミノ-2-シクロヘキシルキノリン-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、

(63) (2E)-N-(4-アミノ-2-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]プロプ-2-エンアミド、

(64) 2-プロピル-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-4-アミン

からなる群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 11】

- (1) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (2) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-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、
- (3) (2E) - N - [4-(ジメチルアミノ) - 2-プロピルキノリン-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、
- (4) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-ヨードフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (5) (2E) - N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-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、
- (6) (2E) - N - [4-(メチルアミノ) - 2-プロピルキノリン-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、
- (7) N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-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) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-エチルフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (9) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-イソプロピルフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (10) N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4'-クロロ-1, 1'-ビフェニル-4-カルボキサミド、
- (11) N - [4-(メチルアミノ) - 2-プロピルキノリン-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、
- (12) (2E) - N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (13) (2E) - N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-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、
- (14) N - (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-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、
- (15) (2E) - N - (4-アミノ-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - [6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル] プロプ-2-エンアミド、
- (16) (2E) - N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (17) N - (4-アゼチジン-1-イル-2-プロピルキノリン-6-イル) - 4'-クロロ-1, 1'-ビフェニル-4-カルボキサミド、
- (18) (2E) - N - (9-アミノ-8-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (19) (2E) - N - (9-アミノ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロアクリジン-2-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、
- (20) (2E) - N - (4-アミノ-2-s e c-ブチルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (21) (2E) - N - (4-アミノ-2-s e c-ブチルキノリン-6-イル) - 3 - [4-(トリフルオロメチル)フェニル] プロプ-2-エンアミド、
- (22) (2E) - 3 - (4-クロロフェニル) - N [4-(エチルアミノ) - 2-プロピルキノリン-6-イル] プロプ-2-エンアミド、
- (23) (2E) - N - [4-(エチルアミノ) - 2-プロピルキノリン-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、
- (24) (2E) - N - (4-アミノ-2-t e r t-ブチルキノリン-6-イル) - 3 - (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
- (25) (2E) - N - (4-アミノ-2-t e r t-ブチルキノリン-6-イル) -

3- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] プロプ-2-エンアミド、
(26) N- (4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-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- (4-アミノ-2-イソプロピルキノリン-6-イル) -N'- (4-フェノキシフェニル) 尿素、
(28) (2E) -N- (4-アミノ-2-sec-ブチルキノリン-6-イル) -3- (4-ヨードフェニル) プロプ-2-エンアミド、
(29) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロブチルキノリン-6-イル) -3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
(30) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロペンチルキノリン-6-イル) -3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
(31) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロヘキシルキノリン-6-イル) -3- (4-クロロフェニル) プロプ-2-エンアミド、
(32) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロブチルキノリン-6-イル) -3- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] プロプ-2-エンアミド、
(33) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロペンチルキノリン-6-イル) -3- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] プロプ-2-エンアミド、
(34) (2E) -N- (4-アミノ-2-シクロヘキシルキノリン-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、
(35) (2E) -N- (4-アミノ-2-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] プロプ-2-エンアミド、
(36) 2-プロピル-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-4-アミン

から選択される請求項10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12】

MCH受容体が介在する疾患の治療または抑制のための医薬の製造における治療上有効量の請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項13】

前記疾患がMCH1R受容体が介在するものである請求項12に記載の方法。

【請求項14】

前記MCH受容体が介在する前記疾患が、肥満、糖尿病、食欲および摂食障害、心血管疾患、高血圧、異脂肪症、心筋梗塞、胆石、骨関節炎、ある種の癌、AIDS消耗、悪液質、脆弱（特に高齢者におけるもの）、過食症などの過食障害、食欲不振、躁鬱病などの精神障害、抑鬱、精神分裂病、気分障害、譫妄、痴呆、重度の能発育不全、不安、ストレス、認識障害、性機能、生殖機能、腎機能、利尿、運動機能障害、注意欠陥障害（ADD）、薬物乱用障害ならびになどの運動異常パーキンソン病、パーキンソン様症候群、トゥレット症候群、ハンチントン病、癲癇、記憶機能向上および棘筋萎縮から選択される請求項12に記載の使用。

【請求項15】

肥満の治療のための医薬の製造における請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項16】

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17】

精神分裂病、双極性障害および抑鬱から選択される状態の治療のための医薬の製造におけるMCH-1R受容体拮抗薬化合物の使用。