

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第4870562号  
(P4870562)

(45) 発行日 平成24年2月8日(2012.2.8)

(24) 登録日 平成23年11月25日(2011.11.25)

(51) Int. Cl.	F I
A 6 1 K 31/4535 (2006.01)	A 6 1 K 31/4535
A 6 1 P 3/10 (2006.01)	A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 15/00 (2006.01)	A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 43/00 (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 K 45/00 (2006.01)	A 6 1 K 45/00

請求項の数 3 (全 44 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2006-525836 (P2006-525836)	(73) 特許権者	309025524
(86) (22) 出願日	平成16年9月13日 (2004.9.13)		メルク セローノ ソシエテ アノニム
(65) 公表番号	特表2007-505088 (P2007-505088A)		スイス国, ボー, 1 2 6 7 クワンサン,
(43) 公表日	平成19年3月8日 (2007.3.8)		サントル アンデュストリエル
(86) 国際出願番号	PCT/EP2004/052143	(74) 代理人	100099759
(87) 国際公開番号	W02005/025558		弁理士 青木 篤
(87) 国際公開日	平成17年3月24日 (2005.3.24)	(74) 代理人	100077517
審査請求日	平成19年7月12日 (2007.7.12)		弁理士 石田 敬
(31) 優先権主張番号	03102742.8	(74) 代理人	100087871
(32) 優先日	平成15年9月12日 (2003.9.12)		弁理士 福本 積
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)	(74) 代理人	100087413
			弁理士 古賀 哲次
		(74) 代理人	100111903
			弁理士 永坂 友康

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 糖尿病の治療のためのスルホンアミド誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

不適当なグルコース耐性、インスリン抵抗性、又は多嚢胞性卵巣症候群 ( P C O S ) の治療のための、4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド、又はその医薬的に許容される塩を含んで成る医薬組成物。

【請求項 2】

更に、インスリン、アルドースレダクターゼ阻害剤、アルファ - グルコシダーゼ阻害剤、スルホニル尿素剤、ピグアニド、チアゾリジン、P P A R アゴニスト、G S K - 3 阻害剤から成る群から選択される、少なくとも1つの補足的薬剤を含んで成る、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記補足的薬剤が、速効型インスリン、中間型インスリン、持続型インスリン、中間型及び速効型インスリンの組み合わせ、ミナルレスタット、トルレスタット、ソルビニル、メトソルビニル、ゾボルレスタット、エパルレスタット、ゼナレスタット、イミレスタット、ポナルレスタット、O N O - 2 2 3 5、G P - 1 4 4 7、C T - 1 1 2、B A L - A R I 8、A D - 5 4 6 7、Z D 5 5 2 2、M - 1 6 2 0 9、N Z - 3 1 4、M - 7 9 1 7 5、S P R - 2 1 0、A D N 1 3 8、若しくはS N K - 8 6 0、ミグリトール、アカルボース、グリピジド、グリブリド、クロルプロパミド、トルブタミド、トラザミド、又はグリメピリドから成る群から選択される、請求項 2 に記載の医薬組成物。

## 【発明の詳細な説明】

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は、糖尿病II型、不適當なグルコース耐性、インスリン抵抗性、肥満、多嚢胞性卵巣症候群（PCOS）を含んで成る、インスリン抵抗性又は高血糖により媒介される代謝性疾患の治療のためのスルホンアミド誘導体に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

糖尿病は、化学的に上昇した血糖値（高血糖）の存在により定義される重度の代謝性疾患である。糖尿病の語は、多様な異なる高血糖状態を包含する。これらの状態は1型（インスリン依存性糖尿病又はIDDM）、及び2型（非インスリン依存性糖尿病又はNIDDM）糖尿病を含む。1型糖尿病を伴う患者に存在する高血糖は、生理的範囲中の血糖を維持するために不十分に欠乏した、低下した、又は存在しないインスリンレベルにある。慣習的には、1型糖尿病は、非経口経路により、補充用量のインスリン投与により治療される。

10

## 【0003】

2型糖尿病は、老化により増加する一般的な疾患である。これは、インスリンに対する低下した感受性、及び循環インスリン濃度における代償的な上昇により、最初に特徴づけられ、後者は、正常な血糖値を維持することが必要とされる。

## 【0004】

20

グルコース不耐性の対象中のインスリン抵抗性の有病率は周知である。Reavenら(American Journal of Medicine、60、80(1976))は、グルコースとインスリンの継続的注入（インスリン/グルコース固定技術）、及びインスリン抵抗性が、非肥満、非ケトーシスの対象の多様なグループに存在することを示すために経口グルコース耐性試験を使用した。これらの対象は、グルコース耐性の境界～顕著な空腹時高血糖の範囲であった。これらの実験中の糖尿病グループは、インスリン依存性（IDDM）及び非インスリン依存性（NIDDM）の対象の両方を含んだ。持続性のインスリン抵抗性を伴う同時発生は、より簡単に測定される高インスリン血症であり、これは、対象の血漿中の循環性血漿インスリン濃度の正確な測定により計測することができる。高インスリン血症は、インスリン抵抗性の結果として、例えば、肥満及び/又は糖尿病（NIDDM）の対象、及び/又はグルコース不耐性の対象、又は内分泌臓によるホルモンの正常な生理学的放出と比較して過剰なインスリンの注射により、IDDMの患者に存在する。

30

## 【0005】

高インスリン血症及びインスリン抵抗性と肥満の関係は、多くの実験的、臨床的、及び疫学的実験により確立されてきた(Stout、Metabolism、34、7(1985))。

## 【0006】

高インスリン血症及びインスリン抵抗性と多嚢胞性卵巣症候群（PCOS）の関係もまた周知である (Diamanti-Kandarakis et al.; Therapeutic effects of metformin on insulin resistance and hyperandrogenism in polycystic ovary syndrome、European Journal of Endocrinology 138、209-274(1998)、Andrea Dunaif; Insulin Resistance and the Polycystic Ovary Syndrome : Mechanism and Implications for Pathogenesis ; Endocrine Reviews 18(6)、774-800(1997))。

40

## 【0007】

II型糖尿病は、現在、血糖降下剤として、スルホリル尿素、ピグアナイド、例えば、メトホルミン、及びチアゾリデンジオン、例えば、トログリタゾン、ロシグリタゾン、又はピオグリタゾンで治療される。

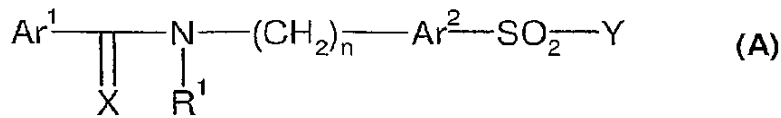
## 【0008】

本発明の化合物は、WO 01 / 23378、WO 02 / 28856、及びWO 02 / 26733 (Applied Research Systems ARSNV)に開示されており、ここで式(A)のスルホンアミド誘導体は、特に神経疾患、自己免疫疾患、癌、及び循環器疾患の治療のために記

50

載されている：

【化 1】



【発明の開示】

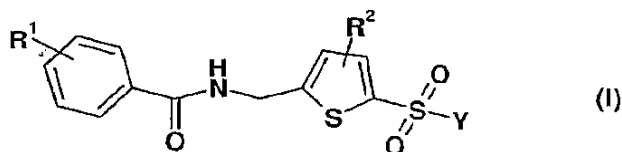
10

【0009】

本発明の概要

本発明は、糖尿病II型、不適当なグルコース耐性、インスリン抵抗性、肥満、多嚢胞性卵巣症候群（PCOS）を含んで成る、インスリン抵抗性又は高血糖により媒介される代謝性疾患の治療のための医薬の製造のための式（I）のスルホンアミド誘導体の使用に関する。

【化 2】



20

【0010】

発明の詳細な説明

以下のパラグラフは、本発明の化合物を構成する多様な化学部分の定義を供し、そして、他に広い定義を設定しない限り、本明細書及びクレームを通して一律に適用することが意図される。

30

【0011】

「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル」は、1 - 6の炭素原子を有するアルキル基を意味する。当該語は、基、例えば、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、tert - ブチル、n - ヘキシル等により代表される。

【0012】

「アリール」は、1つの環（例えば、フェニル）又は複数の縮合環（例えば、ナフチル）を有する6 - 14の炭素原子の不飽和芳香族炭素環式基を意味する。好ましくは、アリールは、フェニル、ナフチル、フェナントレニル等を含む。

【0013】

「C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルアリール」は、アリール置換基、例えば、ベンジル、フェネチル等を有するC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル基を意味する。

40

【0014】

「ヘテロアリール」は、単環式ヘテロ芳香族、又は二環式又は三環式融合環を有するヘテロ芳香族基を意味する。ヘテロ芳香族基の好ましい例は、任意的に置換されたピリジル、ピノリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - トリアジニル、1, 2, 3 - トリアジニル、ベンゾフリル、[2, 3 - ジヒドロ]ベンゾフリル、イソベンゾフリル、ベンゾチエニル、ベンゾトリアゾリル、イソベンゾチエニル、インドリル、イソイン

50

ドリル、3H-インドリル、ベンズイミダゾリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジル、ベンゾチアゾリル、ベンゾキサゾリル、キノリニジル、キナゾリニル、フタラジニル、キノキサリニル、チノリニル、ナフチリジニル、ピリド[3,4-b]ピリジル、ピリド[3,2-b]ピリジル、ピリド[4,3-b]ピリジル、キノリル、イソキノリル、テトラゾリル、5,6,7,8-テトラヒドロキノリル、5,6,7,8-テトラヒドロイソキノリル、プリニル、プテリジニル、カルバゾリル、キサントニル、又はベンゾキノリルを含む。

## 【0015】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリール」は、2-フリルメチル、2-チエニルメチル、2-(1H-インドール-3-イル)エチル等を含む $C_1 - C_6$ -アルキル基ヘテロアリール置換基を意味する。

10

## 【0016】

「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」は、好ましくは2~6の炭素原子を有し、且つ少なくとも1又は2のアルケニル不飽和部位を有するアルケニル基を意味する。好ましいアルケニル基は、エチニル(-CH=CH<sub>2</sub>)、n-2-プロペニル(アリル、-CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>)等を含む。

## 【0017】

「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリール」は、2-フェニルビニル等を含むアリール置換基を有する $C_2 - C_6$ -アルケニル基を意味する。

## 【0018】

「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリール」は、2-(3-ピリジニル)ビニル等を含むヘテロアリール置換基を有する $C_2 - C_6$ -アルケニル基を意味する。

20

## 【0019】

「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」は、好ましくは2~6の炭素原子を有し、且つ少なくとも1~2のアルキニル不飽和部位を有するアルキニル基を意味し、好ましいアルキニル基は、エチニル(-C≡CH)、プロパルギル(-CH<sub>2</sub>C≡CH)等を含む。

## 【0020】

「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリール」は、フェニルエチニル等を含むアリール置換基を有する $C_2 - C_6$ -アルキニル基を意味する。

## 【0021】

「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリール」は、2-チエニルエチニル等を含むヘテロアリール置換基を有する $C_2 - C_6$ -アルキニル基を意味する。

30

## 【0022】

「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」は、単環(例えば、シクロヘキシル)又は複数の縮合環(例えば、ノルボルニル)を有する3~8の炭素原子の飽和炭素環式基を意味する。好ましいシクロアルキルは、シクロペンチル、シクロヘキシル、ノルボルニル等を含む。

## 【0023】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」は、シクロヘキシルメチル、シクロペンチルプロピル等を含むシクロアルキル置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキルを意味する。

## 【0024】

「ヘテロシクロアルキル」は、上の定義に従う $C_3 - C_8$ -シクロアルキル基を意味する。ここで1~3の炭素原子は、O、S、NR(Rは水素又は $C_1 - C_6$ アルキルと定義される)から成る群から選択されるヘテロ原子により置換されている。好ましいヘテロシクロアルキルは、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、1-メチルピペラジン、モルホリン等を含む。

40

## 【0025】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」は、2-(1-ピロリジニル)エチル、4-モルホリニルメチル、(1-メチル-4-ピペリジニル)メチル等を含むヘテロシクロアルキル置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

## 【0026】

50

「カルボニル」は、 $-C(O)OH$ 基を意味する。

【0027】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル」は、2-カルボニルエチル等を含むカルボキシ置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0028】

「アシル」は、 $-C(O)R$ 基を意味し、ここで、Rは、H、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリール」、「ヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

10

【0029】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルアシル」は、2-アセチルエチル等を含むアシル置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキルを意味する。

【0030】

「アリールアシル」は、2-アセチルフェニル等を含むアシル置換基を有するアリール基を意味する。

【0031】

「ヘテロアリールアシル」は、2-アセチルピリジル等を含むアシル置換基を有するヘテロアリール基を意味する。

20

【0032】

「 $C_3 - C_8$ - (ヘテロ)シクロアルキルアシル」は、アシル置換基を有する3員~8員のシクロアルキル又はヘテロシクロアルキル基を意味する。

【0033】

「アシルオキシ」は、 $-OC(O)R$ 基を意味し、ここで、Rは、H、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリール」、「ヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

30

【0034】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルアシルオキシ」は、2-(アセチルオキシ)エチル等を含むアシルオキシ置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0035】

「アルコキシ」は、 $-OR$ 基を意味し、ここで、Rは、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリール」、「ヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

40

【0036】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルアルコキシ」は、2-エトキシエチル等を含むアルコキシ置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0037】

「アルコキシカルボニル」は、 $-C(O)OR$ 基を意味し、ここで、Rは、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリール」、「ヘテロアリール」、「

50

「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

【0038】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルアルコキシカルボニル」は、2 - (ベンジルオキシカルボニル) エステル等を含むアルコキシカルボニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

【0039】

「アミノカルボニル」は、 $-C(O)NRR'$  基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

10

【0040】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルアミノカルボニル」は、2 - (ジメチルアミノカルボニル) エチル等を含むアミノカルボニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

20

【0041】

「アシルアミノ」は、 $-NRC(O)R'$  基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」である。

【0042】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルアシルアミノ」は、2 - (プロピオニルアミノ) エチル等を含むアリルアミノ置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

30

【0043】

「ウレイド」は、 $-NRC(O)NR'R''$  基を意味し、ここで各R、R'、R''は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」であり、そしてここでR'及びR''は、窒素原子と一緒に結合して、任意的に3~8員のヘテロ環式アルキル環を形成しうる。

40

【0044】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルウレイド」は、2 - (N'-メチルウレイド) エチル等を含むウレイド置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

【0045】

「カルバメート」は、 $-NRC(O)OR'$  基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリ

50

ール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」である。

【0046】

「アミノ」は、 $-NRR'$ 基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」であり、そしてR及びR'は、窒素原子と一緒に結合して、任意的に3～8員ヘテロシクロアルキル環を形成しうる。

10

【0047】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルアミノ」は、2-(1-ピロリジニル)エチル等を含むアミノ置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0048】

「アンモニウム」は、正に帯電した $-N^+RR'R''$ 基を意味し、ここで各R、R'、R''は、独立に、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」であり、そしてR及びR'は、窒素原子と一緒に結合して、任意的に3～8員ヘテロシクロアルキル環を形成しうる。

20

【0049】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルアンモニウム」は、2-(1-ピロリジニル)エチル等を含むアンモニウム置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0050】

「ハロゲン」は、フッ素、塩素、臭素、及びヨウ素原子を意味する。

30

【0051】

「スルホニルオキシ」は、 $-OSO_2 - R$ 基を意味し、ここでRは、H、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、ハロゲンで置換された「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、例えば、 $-OSO_2 - CF_3$ 基、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロシクロアルキル」から選択される。

40

【0052】

「 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニルオキシ」は、2-(メチルスルホニルオキシ)エチル等を含むスルホニルオキシ置換基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル基を意味する。

【0053】

「スルホニル」は、 $-SO_2 - R''$ 基を意味し、ここでRは、H、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、ハロゲンで置換された「 $C_1 - C_6$ -アルキル」、例えば、 $-SO_2 - CF_3$ 基、「 $C_2 - C_6$ -アルケニル」、「 $C_2 - C_6$ -アルキニル」、「 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$ -アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$ -アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$ -アルケニルヘテロアリーール」、

50

「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、 「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、 「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、 「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」から選択される。

## 【0054】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル」は、2 - (メチルスルホニル)エチル等を含むスルホニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

## 【0055】

「スルフィニル」は、「 $-S(O) - R$ 」基を意味し、ここでRは、H、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、ハロゲンで置換された「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、例えば、 $-SO - CF_3$ 基、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」から選択される。

## 【0056】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル」は、2 - (メチルスルフィニル)エチル等を含むスルフィニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

## 【0057】

「スルファニル」は、 $-S - R$ 基を意味し、ここでRは、H、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、ハロゲンで置換された「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、例えば、 $-SO - CF_3$ 基、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。好ましくは、スルファニル基は、エチルスルファニル、エチルスルファニル等を含む。

## 【0058】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニル」は、2 - (エチルスルファニル)エチル等を含むスルファニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

## 【0059】

「スルホニルアミノ」は、 $-NRSO_2 - R'$ 基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

## 【0060】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニルアミノ」は、2 - (エチルスルホニルアミノ)エチル等を含むスルホニルアミノ置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

## 【0061】

「アミノスルホニル」は、 $-SO_2 - NRR'$ 基を意味し、ここで各R、R'は、独立に、水素、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「アリーール」、「ヘテロアリーール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルアリーール」又は「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニルヘテロアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルアリーール」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニルヘテロアリーール」、

10

20

30

40

50

「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、 「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」を含む。

【0062】

「 $C_1 - C_6$  - アルキルアミノスルホニル」は、2 - (シクロヘキシルアミノスルホニル)エチル等を含むアミノスルホニル置換基を有する $C_1 - C_6$  - アルキル基を意味する。

【0063】

「置換された又は置換されていない」：個々の置換基の定義により制約されない限り、「アルキル」、「アルケニル」、「アルキニル」、「アリール」、及び「ヘテロアリール」等の上記に示される基は、「 $C_1 - C_6$  - アルキル」、「 $C_2 - C_6$  - アルケニル」、「 $C_2 - C_6$  - アルキニル」、「シクロアルキル」、「ヘテロシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロアリール」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルシクロアルキル」、「 $C_1 - C_6$  - アルキルヘテロシクロアルキル」、「アミノ」、「アンモニウム」、「アシル」、「アシルオキシ」、「アシルアミノ」、「アミノカルボニル」、「アルコキシカルボニル」、「ウレイド」、「カルバメート」、「アリール」、「ヘテロアリール」、「スルフィニル」、「スルホニル」、「アルコキシ」、「スルファニル」、「ハロゲン」、「カルボキシ」、トリハロメチル、シアノ、ヒドロキシ、メルカプト、ニトロ等から成る群から選択される1～5つの置換基で任意的に置換されていてよい。あるいは上記置換基は、また、特に近接官能置換基に係る場合、近接置換基が閉環した条件、例えば、ラクタム、ラクトン、環式無水物だけでなく、例えば、保護基を得るために、閉環により形成されたアセタール、チオアセタール、アミナールを含んで成ってよい。

【0064】

「医薬的に受容可能な塩、又は複合体」は、所望の生物活性を維持する、以下に認識される式(I)の化合物の塩又は複合体を意味する。このような塩の例は、制限することなく、無機酸(例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸、硝酸等)で形成される酸付加塩、及び有機酸、例えば、酢酸、シュウ酸、酒石酸、コハク酸、リンゴ酸、フマル酸、マレイン酸、アスコルビン酸、安息香酸、タンニン酸、パモイン酸(pamoic acid)、アルギン酸、ナフタレンスルホン酸、ナフタレンジスルホン酸、メタンスルホン酸、及びポリガラクトロン酸で形成される塩を含む。上記化合物はまた、特に、式 $NR R' R'' + Z^-$ (式中、 $R$ 、 $R'$ 、 $R''$ は独立に水素、アルキル、又はベンジル、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキルであり、 $Z$ は、塩素、臭素、ヨウ素、 $-O-$ アルキル、トルエンスルホナート、メチルスルホナート、スルホナート、ホスフェート、又はカルボキシエート(例えば、ベンゾアート、スクシネート、アセテート、グリコレート、マルケート、マレート、フマレート、シトレート、タルトレート、アスコルベート、シンナモエート、マンデロエート、及びジフェニルアセテート)を含むカウンターイオンである)の四級アンモニウム塩を含む、当業者に既知な医薬的に受容可能な四級塩として投与することができる。

【0065】

「医薬的に活性な誘導体」は、レシipientに対して投与され、本明細書中に開示される活性を直接的に又は間接的に供するいずれかの化合物を意味する。

【0066】

「鏡像体過剰率」( $ee$ )は、不斉合成、即ち、非ラセミ出発物質、及び/又は試薬、又は少なくとも1つの鏡像選択的な工程を含んで成る合成により得られ、それによって、少なくとも約52%  $ee$ における過剰の鏡像異性体が産出する製品を意味する。

【0067】

このたび、糖尿病II型、不適当なグルコース耐性、インスリン抵抗性、肥満、多嚢胞性卵巣症候群(PCOS)を含んで成る、インスリン抵抗性又は高血糖により媒介される代謝性疾患の治療に適当な式Iに従うスルホンアミドが発見された。

【0068】

式Iに従う化合物において、当該置換基は以下である：

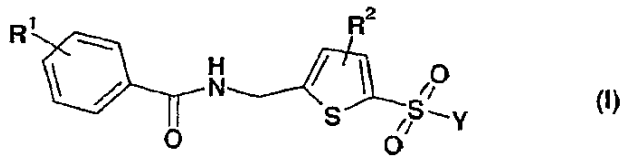
10

20

30

40

## 【化3】



Yは、少なくとも1つの窒素原子（ヘテロ環）を含む、置換されていない又は置換されている4～12員の飽和した環式又は二環式アルキル環であり、これにより上記環中の1つの窒素原子は式Iのスルホニル基と結合を形成し、これによりスルホンアミドを供する。

10

## 【0069】

R<sup>1</sup>は、水素、置換されていない又は置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、置換されていない又は置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、置換されていない又は置換されているC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、置換されていない又は置換されているC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、アミノ、スルファニル、スルフィニル、スルホニル、スルホニルオキシ、スルホンアミド、アシルアミノ、アミノカルボニル、置換されていない又は置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、置換されていない又は置換されているアリール、置換されていない又は置換されているヘテロアリール、カルボキシ、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、ヒドラジドを含んで成る、又はこれらから成る群から選択される。

20

## 【0070】

より具体的には、R<sup>1</sup>は、水素、ハロゲン（例えば、塩素）、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル（例えば、メチル又はエチル）、又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ（例えば、メトキシ又はエトキシ）から成る群から選択される。最も好ましくは、ハロゲン、特に塩素である。

## 【0071】

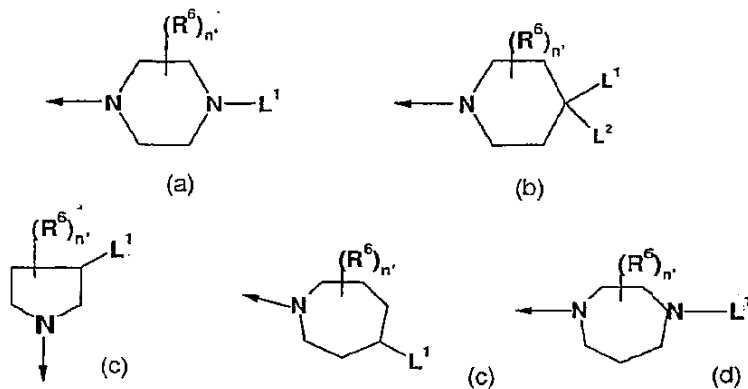
R<sup>2</sup>は、水素、COOR<sup>3</sup>、-CONR<sup>3</sup>R<sup>3'</sup>、OH、OH又はアミノ基で置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、ヒドラジドカルボニル基、スルファート、スルホナート、アミン又はアンモニウム塩を含んで成る、又はこれらから成る群から選択される。ここでR<sup>3</sup>、R<sup>3'</sup>は独立に、H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、アリール、ヘテロアリール、アリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、ヘテロアリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルから成る群から選択される。

30

## 【0072】

ある態様に従い、上記環式アミンYは、以下の一般式(a)～(d)のいずれかを有する：

## 【化4】



10

ここで  $L^1$  及び  $L^2$  は独立に、置換されていない又は置換されている  $C_1 - C_6$  - アルキル、置換されていない又は置換されている  $C_2 - C_6$  - アルケニル、置換されていない又は置換されている  $C_2 - C_6$  - アルキニル、任意的に 1 ~ 3 つのヘテロ原子を含み、且つアール又はヘテロアールと任意的に融合されている置換されていない又は置換されている  $C_4 - C_8$  - シクロアルキルから成る群から互いに選択されている。

20

## 【0073】

あるいは、 $L^1$  及び  $L^2$  は独立に、置換されていない又は置換されているアール、置換されていない又は置換されているヘテロアール、置換されていない又は置換されているアール -  $C_1 - C_6$  - アルキル、置換されていない又は置換されているヘテロアール -  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $-C(O)-OR^3$ 、 $-C(O)-R^3$ 、 $-C(O)-NR^{3'}$ 、 $R^3$ 、 $-NR^{3'}$ 、 $R^3$ 、 $-NR^{3'}$ 、 $C(O)R^3$ 、 $-NR^{3'}$ 、 $C(O)NR^{3'}$ 、 $R^3$ 、 $-(SO)R^3$ 、 $-(SO_2)R^3$ 、 $-NSO_2R^3$ 、 $-SO_2NR^{3'}$ 、 $R^3$  から成る群から選択される。

## 【0074】

あるいは、 $L^1$  及び  $L^2$  は一緒に、4 ~ 8 員の置換されていない又は置換されている飽和環式アルキル又はヘテロアルキル環を形成してもよい。

30

## 【0075】

$R^3$  及び  $R^{3'}$  は、独立に、H、置換されていない又は置換されている  $C_1 - C_6$  - アルキル、置換されていない又は置換されている  $C_2 - C_6$  - アルケニル、置換されていない又は置換されているアール、置換されていない又は置換されているヘテロアール、置換されていない又は置換されているアール -  $C_1 - C_6$  - アルキル、置換されていない又は置換されているヘテロアール -  $C_1 - C_6$  - アルキルから成る群から選択される。

## 【0076】

$R^6$  は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、OH、ハロゲン、ニトロ、シアノ、スルホニル、オキソ (=O) から成る群から選択され、そして  $n'$  は 0 ~ 4、好ましくは 1 又は 2 の整数である。ある態様において、 $R^6$  は水素である。

40

## 【0077】

更なる具体的な態様において、 $R^6$  は H であり、 $L^2$  は H であり、 $L^1$  は  $-NR^{3'}$ 、 $R^3$  であり、ここで  $R^{3'}$  及び  $R^3$  の少なくとも 1 つは水素ではなく、直鎖又は分岐鎖  $C_4 - C_{18}$  - アルキル、アール -  $C_1 - C_{18}$  - アルキル、ヘテロアール -  $C_2 - C_{18}$  - アルキル、 $C_3 - C_{12}$  - シクロアルキル又は - ビシクロ若しくはトリシクロアルキルで置換された  $C_1 - C_{14}$  - アルキルであり、ここで上記アルキル鎖は 1 ~ 3 つの O 又は S 原子を含む。

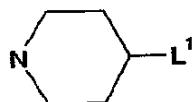
## 【0078】

より具体的な態様において、 $L^1$  は  $-NHR^3$  であり；ここで  $R^3$  は、任意的にシクロヘキシル基又はベンジル基で置換された、直鎖又は分岐鎖の  $C_4 - C_{12}$  - アルキル、好ましくは  $C_6 - C_{12}$  - アルキルである。

50

## 【 0 0 7 9 】

より更に具体的な態様において、Yはピペリジン基であり、  
【化5】



L<sup>1</sup>は - NHR<sup>3</sup>であり；ここでR<sup>3</sup>は直鎖又は分岐鎖のC<sub>4</sub> - C<sub>12</sub> - アルキル、好ましくは C<sub>8</sub> - C<sub>12</sub> - アルキル、又はベンジル基である。 10

## 【 0 0 8 0 】

式Iの化合物の具体例は以下を含む：

- 4 - クロロ - N - [ 5 - ( ピペラジン - 1 - スルホニル ) - チオフェン - 2 - イル - メチル ] - ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { 5 - [ 4 - ( 3 - トリフルオロメタンスルホニル - フェニルアミノ ) - ピペリジン - 1 - スルホニル ] - チオフェン - 2 - イルメチル } - ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - ピリジン - 2 - イルピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - フルオロベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 20
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロフェニル } ピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - ニトロフェニル } ピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フロイル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - ヒドロキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イルエチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソエチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ピリジン - 4 - イルメチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - チエン - 2 - イルエチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

## 【 0 0 8 1 】

- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 , 5 - ジメトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 40
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( シクロヘキシルメチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - メトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - { [ 5 - [ ( 4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フェニルエチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 50

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - フルオロベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - シアノフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - クロロ - 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イルプロピル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

10

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 6 - メチルピリジン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - ヒドロキシ - 4 - フェニルピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - ベンゾイルピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

【 0 0 8 2 】

20

N - ( { 5 - [ ( 4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - オキソ - 1 - フェニル - 1 , 3 , 8 - トリアザスピロ [ 4 . 5 ] デク - 8 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 2 - ( メチルアニリノ ) - 2 - オキソエチル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヒドロキシ ( ジフェニル ) メチル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - シアノピラジン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

30

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 5 - ニトロピリジン - 2 - イル } ピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

40

メチル 5 - { 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - イル } - 7 - ( トリフルオロメチル ) チエノ [ 3 , 2 - b ] ピリジン - 3 - カルボキシラート

エチル 2 - { 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - イル } - 5 - シアノ - 6 - メチルニコチナート

【 0 0 8 3 】

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 5 - シアノ - 4 , 6 - ビス ( ジメチルアミノ ) ピリジン - 2 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

50

- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 6 - メチル - 2 - ( トリフルオロメチル ) キノリン - 4 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- t e r t - ブチル 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - カルボキシラート
- 2 - { 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - イル } - 8 - エチル - 5 - オキソ - 5 , 8 - ジヒドロピリド [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - カルボン酸
- 7 - { 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - イル } - 1 - エチル - 6 - フルオロ - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロ [ 1 , 8 ] ナフチリジン - 3 - カルボン酸 10
- 7 - { 4 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペラジン - 1 - イル } - 1 - エチル - 6 - フルオロ - 4 - オキソ - 1 , 4 - ジヒドロキノリン - 3 - カルボン酸
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 2 - イルカルボニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 E ) - 3 - フェニルプロブ - 2 - エニル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - フェニルプロピル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 20
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - [ [ 4 - ( 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - t e r t - ブチルベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - フルオロフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 【 0 0 8 4 】
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - ヒドロキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 - シアノピリジン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- t e r t - ブチル 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イルカルバメート
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - フェニルピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( ピペリジン - 1 - イルスルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 40
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 - ナフチル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - ヒドロキシ - 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - メチルフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 50

- N - [ ( 5 - { [ ( 1 R , 4 R ) - 5 - ベンジル - 2 , 5 - ジアザピシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ビンジルオキシ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- 【 0 0 8 5 】
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - クロロジベンゾ [ b , f ] [ 1 , 4 ] オキサゼピン - 1 1 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 5 - { [ 4 - ( 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) アセトアミド 10
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - アセチルフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 , 5 - ジクロロピリジン - 4 - イル ) ピペラジン - スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - メトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 20
- N - ( { 5 - [ ( 4 - ベンジル - 4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - tert - ブチル - 1 H - インドール - 5 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( フェニルアセチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( テトラヒドロフラン - 2 - イルカルボニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 6 - クロロピリジン - 2 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- 【 0 0 8 6 】
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - フェノキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド 40
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ベンジル ( メチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル } メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 - チエン - 2 - イル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタメチルベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( フェニルアセチル ) - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 50

- ル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 5 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - アニリノピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - フェニル - 1 , 2 , 4 - チアジアゾール - 5 - イル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フェニルエチル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 10  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - ヘプチルピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - オクチルピペラジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド  
 【 0 0 8 7 】  
 2 - ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) - N - ( 4 - クロロフェニル ) アセトアミド 20  
 2 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 2 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - カルボン酸  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 - クロロ - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 メチル 1 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - カルボキシラート  
 メチル 1 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 6 - カルボキシラート 30  
 メチル 2 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 2 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - カルボキシラート  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 6 - クロロ - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 40  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 7 - アザ - 1 H - ベンズイミダゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド  
 1 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 5 - カルボン酸  
 1 - { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } - 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 6 - カルボン酸  
 【 0 0 8 8 】  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - アミノ - 9 H - プリン - 9 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ]

- スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (9H - プリン - 9 - イル)ピペリジン - 1 - イル]  
 スルホニル)チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 N - [(5 - {[4 - (6 - アミノ - 9H - プリン - 9 - イル)ピペリジン - 1 - イル]  
 スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {6 - ニトロ - 1H - ベンズイミダゾール - 1 - イル  
 }ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {5 - ニトロ - 1H - ベンズイミダゾール - 1 - イル  
 }ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル)ピペ  
 リジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド 10  
 N - [(5 - {[4 - (1H - ベンズイミダゾール - 1 - イル)ピペリジン - 1 - イル]  
 スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - プロピルアニリノ]ピペリジン - 1 - イル}ス  
 ルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - (トリフルオロメチル)アニリノ]ピペリジン  
 - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - (ジメチルアミノ)アニリノ]ピペリジン - 1  
 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 メチル3 - ({1 - [(5 - {[4 - (クロロベンゾイル)アミノ] - メチル}チエン - 20  
 2 - イル)スルホニル] - ピペリジン - 4 - イル)アミノ) - ベンゾアート  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - (メチルスルファニル)アニリノ]ピペリジン  
 - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {3 - ニトロアニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スル  
 ホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 【0089】  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (2 - メトキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]ス  
 ルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 3 - ({1 - [(5 - {[4 - (クロロベンゾイル)アミノ]メチル}チエン - 2 - イル  
 )スルホニル]ピペリジン - 4 - イル}アミノ)ベンズアミド 30  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [2 - (トリフルオロメチル)アニリノ]ピペリジン  
 - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {2 - ニトロ - 4 - [(トリフルオロメチル)スルホ  
 ニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベン  
 ズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (4 - クロロアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スル  
 ホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [4 - (トリフルオロメチル)アニリノ]ピペリジン  
 - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {4 - [(トリフルオロメチル)スルホニル]アニリ  
 ノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド 40  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {2 - ニトロアニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スル  
 ホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 N - {[5 - ({4 - [4 - (アミノカルボニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}ス  
 ルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [4 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル)アニリノ]  
 ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル)ベンズアミド  
 N - [(5 - {[4 - (3 - クロロアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン  
 - 2 - イル)メチル] - 3 - ニトロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (3 - クロロアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スル 50

- ホニル)チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (3 - メトキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 【0090】  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - (メチルスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 N - ({5 - [(4 - {3 - [アミノ(イミノ)メチル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル) - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {3 - [(2 - ヒドロキシエチル)スルホニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド 10  
 N - [(5 - {[4 - (2 - アミノアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (2 - ヒドロキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (4 - ヒドロキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {3 - (トリフルオロメチル)スルファニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (3 - トルイジノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド 20  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {[3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル]アミノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [3 - (1, 3 - オキサゾール - 5 - イル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル)ベンズアミド  
 N - [(5 - {[4 - (3 - tert - ブチルアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (2 - プロピルアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [(2, 2 - ジオキシド - 1, 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾチエン - 5 - イル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド 30  
 【0091】  
 4 - クロロ - N - [(5 - ([4 - (2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (4 - プロピルアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - ({3 - ニトロピリジン - 2 - イル}アミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 N - {[5 - ({4 - [(3 - アミノピリジン - 2 - イル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 4 - クロロベンズアミド 40  
 N - [(5 - {[4 - ([1, 1' - ビフェニル] - 3 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 N - [(5 - {[4 - (3 - ベンジルアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [(5 - {[4 - (ピリミジン - 2 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - {[5 - ({4 - [4 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ({5 - [(4 - {[4 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル] 50

]アミノ)ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - シクロヘキシル - 4 - ヒドロキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( ブチルアミノ)スルホニル]アニリノ)ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル) - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - エチルアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

10

【 0 0 9 2 】

N - { [ 5 - ( 4 - [ 3 - ( アミノスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( キノリン - 5 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( キノリン - 8 - イルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルフェノキシ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

20

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 E ) - 3 - フェニルプロブ - 2 - エノイル]ピペラジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - ニトロベンゾイル}ピペラジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - ベンゾイルピペラジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル) - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル)ベンゾイル]ピペラジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( ジメチルアミノ)ベンゾイル]ピペラジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

30

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フルオロベンゾイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロベンゾイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - フルオロベンゾイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - ナフトイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 - ナフトイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

40

【 0 0 9 3 】

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロベンゾイル}ピペラジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ピリジン - 3 - イルカルボニル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 1 , 3 - ベンゾキサジアゾール - 5 - イルカルボニル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゾイル)ピペラジン

50

- 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [( 5 - { [ 4 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - ヘプタノイルピペラジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [( 5 - { [ 4 - (キノリン - 8 - イルスルホニル)ピペラジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル)スルホニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - ニトロベンズアミド 10  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル)スルホニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル)メチル)ベンズアミド  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - ニトロベンズアミド  
 【 0 0 9 4 】  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - ニトロベンズアミド  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - ニトロベンズアミド 20  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 { 3 - [ (トリフルオロメチル)スルホニル]アニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル)メチル)ベンズアミド  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - ニトロベンズアミド  
 N - [( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル] - 4 - ニトロベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - [( 5 - { [ 4 - ( 3 - メトキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (トリフルオロメチル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド 30  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (ジメチルアミノ)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - ニトロベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (メチルスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (メチルスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (メチルスルファニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (アミノスルホニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - ニトロベンズアミド 40  
 メチル 3 - { [ 1 - ( { 5 - [ ( { 3 - ニトロベンゾイル}アミノ)メチル] - チエン - 2 - イル}スルホニル) - ピペリジン - 4 - イル]アミノベンゾアート  
 【 0 0 9 5 】  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (アミノカルボニル)アニリノ]ピペリジン - 1 - イル}スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - ニトロベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - ニトロアニリノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - [( 5 - { [ 4 - ( 2 - メトキシアニリノ)ピペリジン - 1 - イル}スルホニル]チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 2 - (トリフルオロメチル)アニリノ]ピペリジン 50

- 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( アミノカルボニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - ニトロベンズアミド 10  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { 4 - ( 3 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル ) ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( ジメチルアミノ ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - ニトロベンズアミド 20  
 【 0 0 9 6 】  
 4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( メチルスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( メチルスルファニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル ) ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( アミノスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - ニトロベンズアミド 30  
 3 - { [ 1 - ( { 5 - [ ( { 4 - ニトロベンゾイル } アミノ ) メチル ] チエン - 2 - イル } スルホニル ) ピペリジン - 4 - イル ] アミノ } ベンズアミド  
 3 - { [ 1 - ( { 5 - [ ( { 4 - ニトロベンゾイル } アミノ ) メチル ] チエン - 2 - イル ] スルホニル ) ピペリジン - 4 - イル ] アミノ } ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ) ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 40  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( アミノカルボニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - ニトロベンズアミド 50

## 【 0 0 9 7 】

- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - ニトロベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ アミノ ( イミノ ) メチル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( 2 - ヒドロキシエチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - アニリノピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( 2 - ヒドロキシエチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - ニトロベンズアミド 10
- N - ( { 5 - [ ( 4 - アニリノピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - ニトロベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ アミノ ( イミノ ) メチル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - ニトロベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 3 - ニトロピリジン - 2 - イル } アミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド 20
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 2 - ジオキシド - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾチエン - 5 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル } メチル } - 3 - ニトロベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド

## 【 0 0 9 8 】

- 3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド 30
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - tert - ブチルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( 1 , 3 - オキサゾール - 5 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル } メチル } ベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フェニルエチル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド 40
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - ベンジルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( モルホリン - 4 - イルスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル } メチル } ベンズアミド
- 3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルフェノキシ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド
- 4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ピリミジン - 2 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド 50

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - ニトロベンズアミド

4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 3 - ニトロピリジン - 2 - イル } アミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド

4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

【 0 0 9 9 】

4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - tert - ブチルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド

4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( 1 , 3 - オキサゾール - 5 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フェニルエチル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 4 - ニトロベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( [ 1 , 1 ' - ピフェニル ] - 3 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - ベンジルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - ニトロベンズアミド

4 - ニトロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( モルホリン - 4 - イルスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

N - [ 4 - ( 2 - アミノアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド

3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ピリミジン - 2 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - ニトロベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロ - 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド

3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - フェニルプロピル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

3 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリミジン - 2 - イル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

【 0 1 0 0 】

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - シクロヘキシル - 4 - ヒドロキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( ブチルアミノ ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - ニトロベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - エチルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド

3 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

10

20

30

40

50

- 4 - ニトロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルフェノキシ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - ニトロベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル - 3 - メトキシベンズアミド
- 2 - ヒドロキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド 10
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 2 - ヒドロキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - ニトロベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 【 0 1 0 1 】
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル ) ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( ジメチルアミノ ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 20
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( メチルスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( メチルスルファニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( アミノスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- メチル 3 - ( { 1 - [ ( 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] - メチル } チエン - 2 - イル ) スルホニル ] - ピペリジン - 4 - イル ) アミノ ) - ベンゾアート 30
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( アミノカルボニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 2 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル ) ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 40
- 【 0 1 0 2 】
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( アミノカルボニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - 1 [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド 50

3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニ  
 リノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ アミノ ( イミノ ) メチル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イ  
 ル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ] メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( 2 - ヒドロキシエチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリ  
 ジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド  
 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニ  
 リノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - ( ( 5 - [ ( 4 - アニリノピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル }  
 メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 10  
 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] ア  
 ニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { 4 - ( 4 - ヒドロキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チ  
 エン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド  
 3 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] アニ  
 リノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 【 0 1 0 3 】  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] アニ  
 リノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - ヒドロキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル }  
 チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド 20  
 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ピリミジン - 2 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 -  
 イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イ  
 ル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 3 - ニトロピリジン - 2 - イル } アミノ ) ピペリジン - 1 - イ  
 ル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 2 - ジオキシド - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 - ベンゾチエン -  
 5 - イル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } -  
 3 - メトキシベンズアミド 30  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イルアミノ ) ピペリジ  
 ン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド  
 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ]  
 スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ]  
 スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - tert - プチルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホ  
 ニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - クロロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル  
 ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メト  
 キシベンズアミド 40  
 【 0 1 0 4 】  
 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( 1 , 3 - オキサゾール - 5 - イル ) アニリ  
 ノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド  
 N - [ ( 5 - { [ 4 - ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 -  
 イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド  
 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルフェノキシ ) ピペリジン - 1 - イル  
 ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド  
 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( モルホリン - 4 - イルスルホニル ) アニリ  
 ノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 50

- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - フェニルエチル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - ベンジルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - フェニルプロピル ) ピペラジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリミジン - 2 - イル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - シクロヘキシル - 4 - ヒドロキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド 10
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( ブチルアミノ ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - エチルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 【 0 1 0 5 】
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 5 - ニトロ - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボキサミド 20
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 2 - チオキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 , 4 - ジヒドロキシベンズアミド 30
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ピリジン - 2 - カルボキサミド
- N - [ ( 5 - ( [ 4 - ( ヘキシルオキシ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - ヘプタノイルピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - プロピルアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 2 - フリル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 2 - フリル ) メチル ] ベンズアミド 40
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 3 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 2 - フリル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( ジメチルアミノ ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - ( メチルスルホニル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド
- 【 0 1 0 6 】 50

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (メチルスルファニル) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル) スルホニル) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 3 - (アミノスルホニル) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル) - 2 - フリル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド  
 メチル 3 - ( { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - フリル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } アミノ ) ベンゾアート  
 3 - ( { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - フリル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - イル } アミノ ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 2 - メトキシアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル [ スルホニル ] - 2 - フリル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [ 5 - ( { 4 - [ 2 - (トリフルオロメチル) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル) - 2 - フリル ] メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 2 - ニトロアニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( 4 - クロロアニリノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 2 - フリル ) メチル ] ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - (トリフルオロメチル) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 4 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) ベンズアミド  
 N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - (アミノカルボニル) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル) - 2 - フリル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ 4 - ( 1 , 3 - ジチオラン - 2 - イル ) アニリノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) - 2 - フリル ] メチル } ベンズアミド  
 【 0 1 0 7 】  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ アミノ (イミノ) メチル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) ベンズアミド  
 N - ( { 5 - [ ( 4 - アニリノピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] - 2 - フリル } メチル ) - 4 - クロロベンズアミド  
 4 - ニトロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルファニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] 2 - フリル } メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N ( { 5 - [ ( 3 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ } ピロリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド  
 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) ベンズアミド  
 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] - アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チオフェン - 3 - カルボン酸  
 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - { [ 4 - ( オクチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チオフェン - 3 - カルボン酸  
 N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チオフェン - 3 - カルボキサミド  
 N - ( { 4 - (ヒドラジドカルボニル) - 5 - [ ( 4 - { 3 - [ (トリフルオロメチル) スルホニル ] アニリノ } - ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド

10

20

30

40

50

5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] - アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チオフェン - 3 - カルボキサミド

【 0 1 0 8 】

N - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] - 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チオフェン - 3 - カルボキサミド

N - ( { 4 - ( ヒドロキシメチル ) - 5 - [ ( 4 - { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルホニル ] アニリノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド

10

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - トリフルオロメチルベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - [ [ 4 - ( 1 , 3 - チアゾール - 2 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘブチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ペンチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル } メチル ] ベンズアミド

20

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ドデシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - シクロヘキシルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 1 R ) - 1 - シクロヘキシルエチル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

30

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 R , 2 R , 4 S ) - ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イルアミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - プロポキシエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 - アダマンチルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピリジン - 2 - イルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

40

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - エチルヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド

4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) プロピル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド

【 0 1 0 9 】

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( オクチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘブチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン -

50

- 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( オクチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ペンチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ドデシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - シクロヘキシルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 10
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 1 R ) - 1 - シクロヘキシルエチル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 R , 2 R , 4 S ) - ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イルアミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - プロポキシエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 - アダマンチルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 20
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 , 3 - ジエトキシプロピル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - { 4 - [ ( 3 - モルホリン - 4 - イルプロピル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピリジン - 2 - イルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - エチルヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 30
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) プロピル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘプチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( オクチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 6 - { [ 4 - ( ペンチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド 40
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- 【 0 1 1 0 】**
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ドデシルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル)メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - シクロヘキシルエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 1 R ) - 1 - シクロヘキシルエチル ] アミノ } アゼパン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 50

- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 R , 2 R , 4 S ) - ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イルアミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - プロポキシエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 - アダマンチルメチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - モルホリン - 4 - イルプロピル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 10
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピリジン - 2 - イルエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - エチルヘキシル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) プロピル ] アミノ } アゼパン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 20
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘプチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( オクチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ペンチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ドデシルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( [ 4 - [ ( 2 - ( シクロヘキシルエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 R , 2 R , 4 S ) - ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イルアミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - プロポキシエチル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - エチルヘキシル ) アミノ ] アゼパン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 40
- 【 0 1 1 1 】
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) アゼパン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 2 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] エチル } アミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 2 - ( 4 - メチルフェニル ) エチル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 1 S , 2 R ) - 2 - フェニルシクロプロピル 50

]アミノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル)ベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 1 - ナフチルメチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - フェニルプロピル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 2 - ( 4 - ヒドロキシフェニル)エチル]アミノ}ピペリジン - 1 - イル)スルホニル]チエン - 2 - イル}メチル) - 3 - メトキシベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - フェニルプロピル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - メトキシベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - ヒドロキシエチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - メトキシベンズアミド

3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ノニルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( デシルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( エチルアミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル)チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - [ 1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イルエチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - メトキシベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル] - 3 - イルメチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル} - 3 - メトキシベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( [ 4 - [ ( 2 - チエン - 2 - イルエチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 4 - [ ( トリフルオロメチル)スルホニル]ベンジル}アミノ)ピペリジン - 1 - イル]スルホニル}チエン - 2 - イル)メチル]ベンズアミド

3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ (キノリン - 4 - イルメチル)アミノ]ピペリジン - 1 - イル)スルホニル)チエン - 2 - イル]メチル}ベンズアミド

N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イルメチル)アミノ] - 1 - ピペリジニル)スルホニル) - 2 - チエニル]メチル} - 3 - メトキシベンズアミド

4 - クロロ - N - ( [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 - { [ ( トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]エチル)アミノ] - 1 - ピペリジニル)スルホニル) - 2 - チエニル]メチル}ベンズアミド

【 0 1 1 2 】

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - (プロピルアミノ) - 1 - ピペリジニル]スルホニル} - 2 - チエニル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 4 - [ ( トリフルオロメチル)スルホニル]ベンジル}アミノ) - 1 - ピペリジニル]スルホニル} - 2 - チエニル)メチル]ベンズアミド

4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 , 4 - ジヒドロキシベンジル)アミノ] - 1 - ピペリジニル)スルホニル) - 2 - チエニル]メチル}ベンズアミド

メチル [ { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル)アミノ]メチル} - 2 - チエニル)スルホニル] - 4 - ピペリジニル} (ヘキシル)アミノ]アセテート

t e r t - ブチル [ { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル)アミノ]メチル} - 2 - チエニル)スルホニル] - 4 - ピペリジニル} (ヘキシル)アミノ]アセテート

[ { 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル)アミノ]メチル} - 2 - チエニル)スル

10

20

30

40

50

- ホニル] - 4 - ピペリジニル) (ヘキシル) アミノ] 酢酸
- N - [(5 - {[3 - (ヘプチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル) チエン - 2 - イル) メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [(5 - {[3 - (オクチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [(5 - {[3 - (ペンチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド
- N - [(5 - {[3 - (ブチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- N - [(5 - {[3 - (ドデシルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] - 3 - メトキシベンズアミド 10
- N - {[5 - ( {[3 - [(2 - シクロヘキシルエチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( {[5 - [(3 - {[ (1 R) - 1 - シクロヘキシルエチル] アミノ} ピロリジン - 1 - イル] スルホニル] チエン - 2 - イル} メチル) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - {[5 - ( {[3 - [(1 R, 2 R, 4 S) - ビシクロ[2.2.1]ヘプト - 2 - イルアミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - {[5 - ( {[3 - [(2 - プロポキシエチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル] スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル) ベンズアミド 20
- N - {[5 - ( {[3 - [(シクロヘキシルメチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 3 - メトキシベンズアミド
- N - {[5 - ( {[3 - [(1 - アダマンチルメチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - {[5 - ( {[3 - [(3 - モルホリン - 4 - イルプロピル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - {[5 - ( {[3 - [(2 - ピリジン - 2 - イルエチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - {[5 - ( {[3 - [(2 - ピペリジン - 1 - イルエチル3アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} ベンズアミド 30
- N - {[5 - ( {[3 - [(2 - エチルヘキシル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 3 - メトキシベンズアミド
- 【0113】
- N - [(5 - {[3 - (ヘキシルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] - 3 - メトキシベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [(5 - {[3 - (ヘプチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [(5 - {[3 - (ヘキシルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [(5 - {[3 - (ペンチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} チエン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド 40
- N - [(5 - {[3 - (ブチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル) チエン - 2 - イル) メチル] - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - {[5 - ( {[3 - [(2 - シクロヘキシルエチル) アミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} ベンズアミド
- N - {[5 - ( {[3 - [(1 R, 2 R, 4 S) - ビシクロ[2.2.1]ヘプト - 2 - イルアミノ] ピロリジン - 1 - イル} スルホニル) チエン - 2 - イル] メチル} - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( {[5 - [(3 - {[ (1 - ヒドロキシシクロヘキシル) メチル] アミノ} ピロリジン - 1 - イル) スルホニル] チエン - 2 - イル} メチル) ベンズアミド 50

- N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( 1 - アダマンチルメチル ) アミノ ] ピロリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( 3 - モルホリン - 4 - イルプロピル ) アミノ ] ピロリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( 2 - ピリジン - 2 - イルエチル ) アミノ ] ピロリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエチル ) アミノ ] ピロリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( 2 - エチルヘキシル ) アミノ ] ピロリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 10
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 3 - ( オクチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド
- メチル ( 2 S ) - 1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - チエニル ) スルホニル ] - 4 - ( ヘキシルアミノ ) - 2 - ピロリジンカルボキシラート
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( ベンチルアミノ ) メチル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ 2 - ( ブチルアミノ ) エチル ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - ブチルアニリノ ) メチル ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 20
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( メチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( シクロヘキシルメチル ) ( ヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ベンジル ( ヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 【 0 1 1 4 】
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( ピリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( ピリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( ピリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ブチル ( ヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( 3 - フェニルプロピル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ヘキシル ( 2 - フェニルエチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ [ ( 5 - プロモ - 2 - フリル ) メチル ] ( ヘキシル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド 40
- ド
- 3 - メトキシ - N - ( 5 - [ ( 4 - { メチル [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル ) メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - クロロベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル ) ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - メチルベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 50

- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プロピルベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンジル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル ) メチル } ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( ジフルオロメトキシ ) ベンジル ] アミノ } ピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタメチルベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 10
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プロポキシベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プトキシベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - メトキシベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 【 0 1 1 5 】
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( ピリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( ピリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド 20
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( ピリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - tert - ブチルベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 3 - エトキシベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - フェノキシベンジル ) アミノ ] ピペリジン - 1 - イル } スルホニル ) チエン - 2 - イル ] メチル } ベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] ベンジル } アミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル ) チエン - 2 - イル ) メチル ] ベンズアミド 30
- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( メチルスルホニル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 3 , 5 - ピス ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 2 , 5 - ピス ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( エチルスルファニル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 40
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 3 - [ ( トリフルオロメチル ) スルファニル ] ベンジル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 2 , 2 - ジフルオロ - 1 , 3 - ベンゾジオキソ ] - 5 - イル ) メチル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - ヨードベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( ベンジルオキシ ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド 50

- N - { [ 5 - ( { 4 - [ (メシチルメチル) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - クロロベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - エチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - ペンチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- 【 0 1 1 6 】
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 1 - [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル [ エチル ] アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド 10
- 3 - メトキシ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - メチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - イソプロピルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - イソプチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド 20
- N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ ( 1 - ヒドロキシ - 1 ラムダ - 5 - ピリジン - 4 - イル ) メチル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イルメチル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イルメチル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プロピルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - (トリフルオロメトキシ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - (ジフルオロメトキシ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プロポキシベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - プトキシベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - キノリンイルメチル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド 40
- N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - tert - プチルベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } - 4 - クロロベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 4 - [ ( 4 - フェノキシベンジル ) アミノ ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 4 - [ (トリフルオロメチル) スルファニル ] ベンジル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド 50

- 3 - メトキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 2 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド  
 【 0 1 1 7 】
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { [ 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジンイル ] メチル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル } メチル ] ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ベンジルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 1 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] プロピル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド 10
- 3 - メトキシ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 1 - メチル - 1 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] エチル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 1 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] エチル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { 1 - メチル - 1 - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] エチル ) アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド 20
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - [ [ 2 - ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } メチル ) - 1 - ピロリジンイル ] スルホニル ) - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ ( 3 R ) - 3 - ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } メチル ) ピロリジンイル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 3 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { 3 - [ ( ヘキシルアミノ ) メチル ] - 1 - ピペリジニル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - ( { 5 - [ ( 3 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピロリジンイル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド 30
- 4 - クロロ - N - { [ 5 - ( { ( 3 R ) - 3 - [ ( ヘキシルアミノ ) メチル ] ピロリジンイル } スルホニル ) - 2 - チエニル ] メチル } ベンズアミド
- 4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 3 - ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } メチル ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド
- 2 - オキソ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - ピリジンカルボキサミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - ピリジンカルボキサミド 40
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] - 2 - ヒドロキシベンズアミド
- 2 - ヒドロキシ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) ベンズアミド
- N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] - 2 - チオキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - ピリジンカルボキサミド
- 【 0 1 1 8 】
- 2 - チオキソ - N - ( { 5 - [ ( 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - ピリジンカルボキサミド 50

N - [ ( 5 - { [ 4 - ( ブチルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - ピリジンカルボキサミド

N - ( { 5 - [ ( 4 - { エチル [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ベンジル ] アミノ } - 1 - ピペリジニル ) スルホニル ] - 2 - チエニル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド

4 - クロロ - N - [ ( 5 - { [ 4 - ( { イミノ [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] メチル } アミノ ) - 1 - ピペリジニル ] スルホニル } - 2 - チエニル ) メチル ] ベンズアミド

1 - [ ( 5 - { [ ( 4 - クロロベンゾイル ) アミノ ] メチル } - 2 - チエニル ) スルホニル ] - 4 - ( ヘキシルアミノ ) プロリン

エチル 2 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 5 - { [ ( 3 - メトキシベンゾイル ) アミノ ] メチル } チオフェン - 3 - カルボキシラート

N - { [ 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 4 - ( トリメチルシリル ) チエン - 2 - イル ] メチル } - 3 - メトキシベンズアミド

N - ( { 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } - 4 - [ ヒドロキシ ( フェニル ) メチル ] チエン - 2 - イル } メチル ) - 3 - メトキシベンズアミド

5 - [ ( 3 - メトキシ - ベンゾイルアミノ ) - メチル ] - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ ) - ピペリジン - 1 - スルホニル ] - チオフェン - 3 - カルボン酸エチルエステル

N - [ ( 4 - クロロ - 5 - { [ 4 - ( ヘキシルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } チエン - 2 - イル ) メチル ] - 3 - メトキシベンズアミド

【 0 1 1 9 】

式 ( I ) の化合物は、W O 0 1 / 2 3 3 7 8、W O 0 2 / 2 8 8 5 6、及びW O 0 2 / 2 6 7 3 3 のいずれかに記載の方法に従い得ることができる。

【 0 1 2 0 】

本発明の更なる観点は、式 ( I ) に従うスルホンアミド誘導体及び少なくとも1つの更なる薬剤 (特に、抗糖尿病剤) を含んで成る医薬組成物に関する。ある態様において、更なる糖尿病剤は、インスリン (又はインスリン擬態)、アルドースレダクターゼ阻害剤、アルファ - グルコシダーゼ阻害剤、スルホニル尿素剤、ピグアニド (例えば、メトホルミン) チアゾリジン (例えば、ピオグリチゾン、ロシグリタゾン、W O 0 2 / 1 0 0 3 9 6 を参照のこと)、又はP P A R アゴニスト若しくはG S K - 3 阻害剤を含んで成る、又はこれらから成る群から選択される。

【 0 1 2 1 】

本発明の方法に有用なインスリンは、速効型インスリン、中間型インスリン、持続型インスリン、並びに中間型及び速効型インスリンの混合物を含む。

【 0 1 2 2 】

本発明の方法に有用なアルドースレダクターゼ阻害剤は、当業界に既知なものを含む。これらは、制限することなく以下に挙げるものを含む：

a ) 参照として本明細書に組み入れられており、A R I - 5 0 9 を含み、ミナルレスタット (minalrestat) 又はスピロ [ イソキノリン - 4 ( 1 H ) , 3 ' - ピロリジン ] - 1 , 2 ' , 3 , 5 ' ( 2 H ) - テトロン、及びこれらの類似体としても知られる、米国特許第 4 , 9 2 7 8 3 1 号 ( Malamas ) に開示される、スピロ - イソキノリン - ピロリジンテトロン化合物。

b ) 2 - [ ( 4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル ) メチル ] - 6 - フルオロ - ( 9 C I ) ;

c ) 参照として本明細書に組み入れられており、トルレスタット (Tolrestat) を含み、グリシン、N - [ [ 6 - メトキシ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 - ナフタレニル ] チオキソメチル ] - N - メチル - ( 9 C I )、又はA Y - 2 7 7 7 3、及びこれらの類似体としても知られる米国特許第 4 , 4 3 9 , 6 1 7 号の化合物；

d ) スピロ [ 4 H - 1 - ベンゾピラン - 4 , 4 ' - イミダゾリン ] - 2 ' , 5 ' - ジオ

10

20

30

40

50

ン、6 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 、 ( 4 S ) - ( 9 C I )、又は C P 4 5 6 3 4 と  
しても知られる、ソルビニル(Sorbinil) (登録番号 6 8 3 6 7 - 5 2 - 2 ) ;

e ) メトソルビニル ( Methosorbinil ) ;

f )、1 - フタラジン酢酸、3 , 4 4 - ジヒドロ - 4 - オキソ - 3 - [ [ 5 - ( トリフル  
フルオロメチル ) - 2 - ベンゾチアゾリル ] メチル ] - ( 9 C I ) である、ゾポルレスタッ  
ト ( Zopolrestat ) (登録番号 1 1 0 7 0 3 - 9 4 - 1 ) ;

g ) 3 - チアゾリジン酢酸、5 - [ ( 2 E ) - 2 - メチル - 3 - フェニル - 2 - プロペ  
ニリデン ] - 4 - オキソ - 2 - チオキソ - 、 ( 5 Z ) - ( 9 C I ) である、エパルレスタ  
ット ( Epalrestat ) (登録番号 8 2 1 5 0 - 0 9 - 9 ) ;

h ) ゼナレスタット ( Zenarestat ) (登録番号 1 1 2 7 3 3 - 4 0 - 6 ) 又は 3 - [ ( 10  
4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル ) - メチル ] - 7 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 ,  
4 - ジオキソ - 1 ( 2 H ) - キナゾリン酢酸 ;

i ) 2 , 7 - ジフルオロスピロ ( 9 H - フルオレン - 9 , 4 ' - イミダゾリジン ) - 2  
' , 5 ' - ジオンとしても知られる、イミレスタット ( Imirestat ) ;

j ) 1 - フタラジン酢酸、3 - [ ( 4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル ) メチル ] 3 ,  
4 - ジヒドロ - 4 - オキソ - ( 9 C I ) であり、そしてスタリル又はスタチルとしても知  
られる、ポナルレスタット ( Ponalrestat ) (登録番号 7 2 7 0 2 - 9 5 - 5 ) ;

k ) 3 - チアゾリジン酢酸、5 - [ ( 2 E ) - 2 - メチル - 3 - フェニル - 2 - プロペ  
ニリデン - 4 - オキソ - 2 - チオキソ - 、 ( 5 Z ) - ( 9 C I ) である、ONO - 2 2 3  
5 ;

l ) { 3 - [ ( 4 , 5 , 7 - トリフルオロベンゾチアゾール - 2 - イル ) メチル ] - 5  
- メチルフェニル酢酸 } である、GP - 1 4 4 7 ;

m ) 5 - ( 3 - エトキシ - 4 - ペンチルオキシフェニル ) - 2 , 4 - チアゾリジンジ  
オンである、CT - 1 1 2 ;

n ) グリシン、N [ ( 7 - フルオロ - 9 - オキソ - 9 H - キサンテン - 2 - イル ) スル  
ホニル ] - N - メチル - ) 9 C I ) である、BAL - ARI 8 (登録番号 1 2 4 0 6 6 -  
4 0 - 6 ) ;

o ) 2 , 3 - ジヒドロ - 2 , 8 - ビス ( 1 - メチルエチル ) - 3 - チオキソキシ - 4 H  
- 1 , 4 - ベンゾキサジン - 4 - 酢酸の塩化物塩形態 ( 4 H - 1 , 4 - ベンゾキサジン -  
4 - 酢酸、2 , 3 - ジヒドロ - 2 , 8 - ビス ( 1 - メチルエチル ) - 3 - チオキソ - ( 9  
C I ) である、AD - 5 4 6 7 ;

p ) ( 3 ' , 5 ' - ジメチル - 4 ' - ニトロメチルスルホニル - 2 - ( 2 - トリル ) ア  
セタニリドである )、ZD 5 5 2 2 ;

q ) 3 , 4 - ジヒドロ - 2 , 8 - ジイソプロピル - 3 - チオキソ - 2 H - 1 , 4 - ベン  
ゾキサジン - 4 - 酢酸 ;

r ) 1 - [ ( 3 - プロモ - 2 - ベンゾフラニル ) スルホニル ] - 2 , 4 - イミダゾリ  
ンジオン ( M - 1 6 2 0 9 ) ;

s ) 1 - イミダゾリジン酢酸、3 - [ ( 3 - ニトロフェニル ) メチル ] - 2 , 4 , 5 -  
トリオキソ - 9 ( C I ) である、NZ - 3 1 4 (登録番号 . 1 2 8 0 4 3 - 9 9 - 2 ) ;

t ) 1 - フタラジン酢酸、3 , 4 - ジヒドロ - 4 - オキソ - 3 - [ ( 5 - トリフルオ  
ロメチル ) - 2 - ベンゾチアゾリル ] - メチル ;

u ) スピロ [ 4 H - 1 - ベンゾピラン - 4 , 4 ' - イミダゾリジン ] - 2 ' , 5 ' - ジ  
オン ; 6 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 - メチル - 、 ( 2 R , 4 S ) - ( 9 C I ) であ  
る、M - 7 9 1 7 5 ;

v ) 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - 酢酸、3 , 4 - ジヒドロ - 3 - オキソ - 4 -  
[ ( 4 , 5 , 7 - トリフルオロ - 2 - ベンゾチアゾリル ) メチル ] - ( 9 C I ) である、  
SPR - 2 1 0 ;

w ) スピロ [ ピロリジン - 3 , 6 ' ( 5 ' H ) - ピロロ [ 1 , 2 , 3 - de ] [ 1 , 4  
] ベンゾキサジン ] - 2 , 5 , 5 ' - トリオン、8 ' - クロロ - 2 ' - 3 ' - ジヒドロ -  
( 9 C I ) ( AND 1 3 8 又は 8 - クロロ - 2 ' , 3 ' - ジヒドロスピロ [ ピロリジン - 50

3, 6' (5H) - ピロロ - [ 1, 2, 3 - de ] - [ 1, 4 ] ベンゾキサジン ] 2, 5, 5' - トリオンとしても知られる) ;

x) 6 - フルオロ - 2, 3 - ジヒドロ - 2', 5' - ジオキソ - ( 2S - cis ) - スピロ [ 4H - 1 - ベンゾピラン - 4, 4' - イミダゾリジン ] - 2 - カルボキサミド ( SNK - 860 としても知られる) ;

【 0 1 2 3 】

本発明のより好ましいアルドースレダクターゼ阻害剤は、ミナルレスタット、トルレスタット、ソルビニル、メトソルビニル、ゾポルレスタット、エパルレスタット、イミレスタット、及びポナルレスタット、又はこれらの医薬的に受容可能な塩形態である。

【 0 1 2 4 】

本発明の方法に有用なアルファ - グルコシダーゼ阻害剤は、ミグリトール、又はアカルボース、又はこれらの医薬的に受容可能な塩形態を含む。

【 0 1 2 5 】

本発明の方法に有用なスルホニル尿素剤は、グリピジド、グリブリド ( グリベンクラミド )、クロルプロパミド、トルブタミド、トラザミド、及びグリメピリド、又はこれらの医薬的に受容可能な塩形態を含む。

【 0 1 2 6 】

好ましくは、上記補充性の医薬的活性剤は、速効型インスリン、中間型インスリン、持続型インスリン、中間型及び速効型インスリンの組み合わせ、ミナルレスタット、トルレスタット、ソルビニル、メトソルビニル、ゾポルレスタット、エパルレスタット、ゼナレスタット、イミレスタット、ポナルレスタット、ONO - 2235、GP - 1447、CT - 112、BAL - ARI8、AD - 5467、ZD5522、M - 16209、NZ - 314、M - 79175、SPR - 210、ADN138、若しくはSNK - 860、ミグリトール、アカルボース、グリピジド、グリブリド、クロルプロパミド、トルブタミド、トラザミド、又はグリメピリドから成る群から選択される。

【 0 1 2 7 】

慣習的に利用されるアジュバント、担体、希釈剤、又は賦形剤と一緒に本発明の化合物は、医薬組成物、及びその単位投与量とすることができ、そしてこのような形態において、固体、例えば、タブレット、又は充填カプセル、又は液体、例えば、溶液、懸濁液、乳液、エリキシル、又はこれらを充填したカプセル、経口使用のための全てのもの、又は非経口用 ( 皮下を含む ) 無菌注射溶液の形態において利用することができる。このような医薬組成物及びこれらの単位剤形の多くは、更なる活性化化合物又は原理を伴い又は伴わず、慣習的な比率における成分を含んで成ってよく、そしてこれらの単位剤形は、利用するために意図される毎日の投与量の範囲と釣り合った、いずれか適当な効量の活性成分を含んでよい。

【 0 1 2 8 】

医薬的に利用される場合、本発明のスルホンアミド誘導体は、典型的には、医薬組成物の形態において投与される。これらの組成物は、医薬業界において周知な方法により調製することができ、そして少なくとも1つの活性化化合物を含んで成る。一般的に、本発明の化合物は、医薬的な有効量において投与される。実際に投与される化合物の量は、治療すべき状態、選択される投与経路、実際に投与される化合物、個々の患者の年齢、体重、及び応答、患者の症状の重症度等を含む、関連する状況に明るい医師により一般的に決定される。

【 0 1 2 9 】

本発明の医薬組成物は、多様な経路、例えば、経口、直腸、経皮、皮下、筋肉内、くも膜下腔内、腹腔内、及び鼻腔内により投与することができる。意図される送達経路に依存して、上記化合物は、好ましくは、注射用、局所、又は経口組成物として処方される。経口投与用の組成物は、バルク液体溶液若しくは懸濁液、又はバルク粉末の形態をとってよい。しかしながら、より一般的には、当該組成物は、正確な投与量を促進するための単位剤形において供される。「単位剤形」の語は、ヒト対象、及び他の動物のための単位用量

10

20

30

40

50

として物理的に分離した単位を意味し、各単位は、適当な医薬的賦形剤とともに、所望の治療効果を生じるためにあらかじめ測定された活性物質の量を含む。典型的な単位剤形は、液体組成物の前充填、前測定アンプル若しくはシリンジ、又は固形組成物の場合には、ピル、タブレット、カプセル等を含む。このような組成物において、スルホンアミド化合物は、通常、多様なビヒクル、又は担体であり、所望の剤形の形成を助ける残部を伴い、微量成分（約 0.1 ~ 約 50 重量%、又は好ましくは約 1 ~ 約 40 重量）である。

#### 【0130】

経口投与に適当な液体形態は、バッファー、懸濁及び分散剤、着色料、芳香剤等を伴う適当な水性又は非水性ビヒクルを含んでよい。固体は、例えば、いずれかの以下の成分又は同様の性質の化合物を含んでよい：結合剤、微結晶性セルロース、トラガカントゴム、又はゼラチン；賦形剤、例えば、スターチ、又はラクトース、崩壊剤、例えば、アルギン酸、プリモゲル、又はコーンスターチ；潤滑剤、例えば、ステアリン酸マグネシウム；滑走剤、例えば、コロイド性シリコンジオキサイド；甘味料、例えば、スクロース、又はサクカリン；又は芳香剤、例えば、ペパーミント、サリチル酸メチル、又はオレンジフレーバー。

10

#### 【0131】

注射用組成物は、典型的には、注射用無菌生理食塩水、又は当業界に既知なリン酸緩衝生理食塩水、又は他の注射用担体に基づく。上述のように、このような組成物中の式 I のスルホンアミド誘導体は、典型的には、しばしば注射用担体等の残部を伴う 0.05 ~ 10 重量%の範囲の微量成分である。

20

#### 【0132】

経口投与用又は注射用組成物のための上述の成分は、専ら代表的なものである。更なる物質、並びに加工技術等は Remington's Pharmaceutical Sciences, 20<sup>th</sup> Edition, 2000, Marck Publishing Company, Easton, Pennsylvania のパート 5 に記載され、本明細書中に参照として組み入れられている。

#### 【0133】

本発明の化合物はまた、持続放出形態において、又は持続性放出薬剤送達系から投与することができる。代表的な持続性放出物質の記載は、Remington's Pharmaceutical Sciences において見つけることができる。

#### 【実施例】

30

#### 【0134】

##### 実施例 1：医薬製剤の調製

以下の製剤例は、制限することなく、本発明に従う代表的な医薬組成物を説明する。

#### 【0135】

##### 製剤 1 - タブレット

式 I のスルホンアミド化合物は、約 1 : 2 の重量比において、乾燥粉末として、乾燥ゼラチン結合剤と混合される。微量のステアリン酸マグネシウムは、潤滑剤として添加される。当該混合物は、タブレットプレスにおいて、240 ~ 270 mg のタブレット（タブレットあたり 80 ~ 90 mg の活性スルホンアミド化合物）に形成される。

#### 【0136】

40

##### 製剤 2 - カプセル

式 I のスルホンアミド化合物は、約 1 : 1 の重量比において、乾燥粉末として、スターチ希釈剤と混合される。当該混合物は、250 mg のカプセル（カプセルあたり 125 mg の活性スルホンアミド化合物）に充填される。

#### 【0137】

##### 製剤 3 - 液体

式 I のスルホンアミド化合物（1250 mg）、スクロース（1.75 g）、及びキサンタンゴム（4 mg）を混ぜ、10 番メッシュの U.S 篩を通過させ、それから前もって水中で調製した微結晶性セルロースとカルボキシメチルセルロールの溶液（11 : 89、50 mg）と混合する。安息香酸ナトリウム（10 mg）、芳香剤、及び着色料を水で希

50

釈し、そして攪拌しながら添加する。それから、5 mL の総量を生じるために十分な水を添加する。

【0138】

#### 製剤4 - タブレット

式Iのスルホンアミド化合物は、約1:2の重量比において、乾燥粉末として、乾燥ゼラチン結合剤と混合される。微量のステアリン酸マグネシウムは、潤滑剤として添加される。当該混合物は、タブレットプレスにおいて、450~900 mgのタブレット(タブレットあたり150~300 mgの活性スルホンアミド化合物)に形成される。

【0139】

#### 製剤5 - 注射

式Iのスルホンアミド化合物を、約5 mg/mLの濃度になるように、注射用の水性媒体の緩衝無菌生理食塩水中に溶解させる。

【0140】

#### 実施例2: 生物アッセイ

##### db/dbマウスにおける生体内アッセイ

以下のアッセイは、db/dbマウスの生体内において、摂食後の血糖症のモデルにおける式(I)の試験化合物の抗糖尿病効果を測定することを目的とする。

【0141】

当該アッセイは、以下の通り行った:

全ての18匹のdb/dbマウス(約8~9週齢、IFFACREDO, l'Arbreste, Franceから得た)を20時間絶食させた。

各6匹の動物から成る3つのグループにわけた:

- ・グループ1: 当該動物は、10 mg/kgの用量のビヒクルを投与した(経口)。
- ・グループ2: 当該動物は、30 mg/kgの用量の式(I)に従う試験化合物を投与した(経口)。
- ・グループ3: 当該動物は、50 mg/kgの用量の式(I)に従う試験化合物を投与した(経口)。

【0142】

カルボキシメチルセルロース(0.5%)、ツイーン20(0.25%)、及びビヒクルとしての水中で溶解又は懸濁させた式(I)の化合物を経口投与後、上記動物に市販の餌(D04, UAR, Villemoisson/Orge, France)を自由に与えた。当該マウスの糖尿状態を、薬剤投与前の血糖値を測定することにより検証した。それから、血糖及び血清インスリンレベルを薬剤投与の4時間後に測定した。

【0143】

血糖値の測定は、グルコメーター(Precision Q. I. D., Medisense, Abbot, ref. 212.62.31)を使用して行った。

【0144】

インスリン値の測定は、ELISAキット(Crystal CHEM, Ref. INSK R020)を使用して行った。

【0145】

薬剤処理マウスの血糖及び血清インスリンの変化は、コントロールのパーセンテージとして表した(グループ1: ビヒクル処理マウス)。

【0146】

50 mg/kgの投与量における式(I)の試験化合物での動物の処理(経口)は、ビヒクルで処理した動物(グループ1)と比較して、食餌摂取により誘導された血糖値を約20~45%低下させ、当該血液インスリン値を約20~65%低下させた。

【0147】

例えば、試験化合物として4-クロロ-N-[(5-{[4-(ブチルアミノ)ピペリジン-1-イル]スルホニル}チエン-2-イル)メチル]ベンズアミド(50 mg/kg、p.o.)の使用において、血糖値において42%の低下、並びにインスリン値にお

10

20

30

40

50

いて61%の低下が測定された(ビヒクルにより処理された動物(グループ1)と比較)。

【0148】

参照

1. Reaven et al (American Journal of Medicine, 60, 80 (1976));
2. Stout, Metabolism, 34, 7 (1985)
3. Diamaanti-Kandarakis et al.; European Journal of Endocrinology 138, 269-274 (1998),
4. Andrea Dunaif; Endocrine Reviews 18 (6), 774-800 (1997)).
5. WO 01/23378;
6. WO 02/28856;
7. WO 02/26733

## フロントページの続き

- (51)Int.Cl. F I  
 C 0 7 D 409/12 (2006.01) C 0 7 D 409/12
- (74)代理人 100117019  
 弁理士 渡辺 陽一
- (74)代理人 100108903  
 弁理士 中村 和広
- (74)代理人 100127085  
 弁理士 越阪部 倫子
- (74)代理人 100134784  
 弁理士 中村 和美
- (74)代理人 100138210  
 弁理士 池田 達則
- (74)代理人 100141977  
 弁理士 中島 勝
- (74)代理人 100145436  
 弁理士 小池 慎太郎
- (74)代理人 100092624  
 弁理士 鶴田 準一
- (74)代理人 100102990  
 弁理士 小林 良博
- (74)代理人 100128495  
 弁理士 出野 知
- (74)代理人 100093665  
 弁理士 蛭谷 厚志
- (72)発明者 リュックル, トーマス  
 スイス国, セアッシュ - 1 2 2 8 プラン - レ - ワテ, シュマン デュ ビュー ビュイ, 9
- (72)発明者 ビット, ピエール - アラン  
 フランス国, エフ - 7 4 3 8 0 クランブ - サル, ルート ドゥ ボルリー, 1 9 4
- (72)発明者 ゴー - テラン, ジャン - ピエール  
 フランス国, エフ - 7 4 1 6 0 ポーモン, シュマン デ クルト, 4 2 3

審査官 井上 典之

- (56)参考文献 特表2003-510319(JP, A)  
 国際公開第2002/026733(WO, A1)  
 国際公開第2002/028856(WO, A1)  
 特表2003-510320(JP, A)  
 特表2004-523475(JP, A)  
 特表2005-504031(JP, A)  
 CURRENT OPINION IN PHARMACOLOGY, 2003年 8月, vol.3, no.4, pp.420-425  
 NATURE REVIEWS. DRUG DISCOVERY, 2003年 7月, vol.2, no.7, pp.554-565  
 ABSTRACTS OF PAPERS AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, 2003年, vol.226, no.1-2, p.MEDI 28

## (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A61K 31/  
 C07D 333/  
 C07D 405/

C07D 409/

C07D 413/

C07D 417/

C07D 471/

C07D 473/

C07D 487/

CA/REGISTRY(STN)