

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-520466(P2007-520466A)

【公表日】平成19年7月26日(2007.7.26)

【年通号数】公開・登録公報2007-028

【出願番号】特願2006-546009(P2006-546009)

【国際特許分類】

C 0 7 C	233/29	(2006.01)
C 0 7 D	295/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/4453	(2006.01)
C 0 7 D	211/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
C 0 7 D	211/46	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
C 0 7 D	211/52	(2006.01)
C 0 7 D	211/22	(2006.01)
C 0 7 D	211/48	(2006.01)
C 0 7 D	211/58	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
C 0 7 D	211/62	(2006.01)
C 0 7 D	207/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
C 0 7 D	309/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/351	(2006.01)
C 0 7 D	221/20	(2006.01)
C 0 7 D	309/04	(2006.01)
C 0 7 D	207/12	(2006.01)
C 0 7 D	213/36	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
C 0 7 D	233/56	(2006.01)
A 6 1 K	31/4164	(2006.01)
C 0 7 D	231/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
C 0 7 D	249/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)
C 0 7 D	209/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
C 0 7 D	263/56	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
C 0 7 D	217/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
C 0 7 D	211/60	(2006.01)
C 0 7 D	487/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4985 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/495 (2006.01)  
 C 0 7 D 265/30 (2006.01)  
 C 0 7 D 215/38 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/47 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/50 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/24 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/22 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/20 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 7/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 279/12 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/54 (2006.01)  
 C 0 7 C 237/20 (2006.01)  
 C 0 7 C 233/44 (2006.01)  
 C 0 7 C 311/13 (2006.01)  
 C 0 7 C 255/24 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 233/29 C S P  
 C 0 7 D 295/14 Z  
 A 6 1 K 31/40  
 A 6 1 K 31/4453  
 C 0 7 D 211/14  
 A 6 1 K 31/445  
 C 0 7 D 211/46  
 C 0 7 D 401/12  
 A 6 1 K 31/4545  
 C 0 7 D 211/52  
 C 0 7 D 211/22  
 C 0 7 D 211/48  
 C 0 7 D 211/58

A 6 1 K	31/454	
C 0 7 D	211/62	
C 0 7 D	207/08	
A 6 1 K	31/5375	
A 6 1 K	31/167	
C 0 7 D	309/14	
A 6 1 K	31/351	
C 0 7 D	221/20	
C 0 7 D	309/04	
C 0 7 D	207/12	
C 0 7 D	213/36	
A 6 1 K	31/4406	
C 0 7 D	233/56	
A 6 1 K	31/4164	
C 0 7 D	231/12	B
A 6 1 K	31/415	
C 0 7 D	249/08	5 1 5
A 6 1 K	31/4196	
C 0 7 D	209/08	
A 6 1 K	31/404	
C 0 7 D	263/56	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/18	
C 0 7 D	217/04	
A 6 1 K	31/472	
C 0 7 D	211/60	
C 0 7 D	487/08	
A 6 1 K	31/407	
C 0 7 D	487/04	1 4 0
A 6 1 K	31/4985	
C 0 7 D	295/14	A
A 6 1 K	31/495	
C 0 7 D	265/30	
C 0 7 D	215/38	
A 6 1 K	31/47	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	1/14	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	5/50	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	25/18	

A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/20  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 15/10  
 A 6 1 P 25/08  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 5/00  
 A 6 1 P 7/12  
 C 0 7 D 279/12  
 A 6 1 K 31/54  
 C 0 7 C 237/20  
 C 0 7 C 233/44  
 C 0 7 C 311/13  
 C 0 7 C 255/24

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月11日(2007.12.11)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

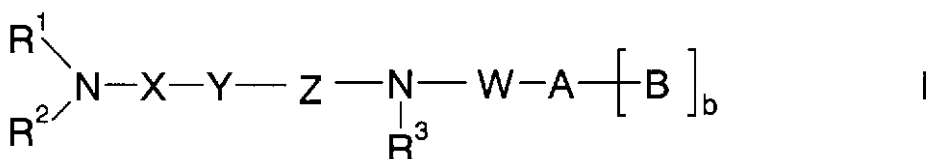
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 I のアミド化合物、その互変異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、その混合物又は塩。

【化 1】



(式中、

$R^1$ 、 $R^2$ は、相互独立的に、H、 $C_{1-8}$ -アルキル若しくは $C_{3-7}$ -シクロアルキル基(任意に基 $R^{11}$ で一置換若しくは多置換されていてもよく、5、6若しくは7員シクロアルキル基の3位若しくは4位の-CH<sub>2</sub>-基を-O-、-S-若しくは-NR<sup>13</sup>-と置き換えてよい)、又はフェニル若しくはピリジニル基(任意に基 $R^{12}$ で一置換若しくは多置換されていてもよく、及び/又はニトロで一置換されていてもよい)を意味し、或いは

$R^1$ と $R^2$ が $C_{2-8}$ -アルキレンブリッジを形成し、このとき、

- 1若しくは2個の-CH<sub>2</sub>-基を相互独立的に-CH=N-若しくは-CH=CH-と置き換えてよく、及び/又は

- 1若しくは2個の-CH<sub>2</sub>-基を相互独立的に-O-、-S-、-SO-、-(SO<sub>2</sub>)-、-C=N-O-R<sup>18</sup>、-CO-、-C(=CH<sub>2</sub>)-若しくは-NR<sup>13</sup>-と置き換えてよく(ヘテロ原子が直接一緒に結合せず、かつ基-C=N-O-R<sup>18</sup>又は-CO-が直接基 $R^1R^2N$ -に結合しないように)、

同時に、前記アルキレンブリッジでは、1個以上のH原子を $R^{14}$ と置き換えてよく、かつ前記アルキレンブリッジは、1個又は2個の同一若しくは異なる炭素環式若しくはヘテロ環式基Cyで置換されていてもよく(該アルキレンブリッジと基Cyとの結合が、

- 単結合若しくは二次結合によって、

- スピロ環式環系を形成する共通のC原子によって、
- 縮合二環式環系を形成する2個の共通の隣接C原子及び/又はN原子によって、又は
- 架橋環系を形成する3個以上のC原子及び/又はN原子によって生じるように)、

R<sup>3</sup>は、H、C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル-C<sub>1-4</sub>-アルキル又はフェニル-C<sub>1-3</sub>-アルキルを意味し、

Xは、単結合又はC<sub>1-8</sub>-アルキレンブリッジを意味し、このとき、

- 基R<sup>1</sup>R<sup>2</sup>N-に直接結合していない-CH<sub>2</sub>-基を-C≡CH-若しくは-C(3重結合)C-と置き換えてよく、及び/又は
- 基R<sup>1</sup>R<sup>2</sup>N-に直接結合していない1個の-CH<sub>2</sub>-基又は2個の非隣接-CH<sub>2</sub>-基を相互独立的に-O-、-S-、-(SO)-、-(SO<sub>2</sub>)-、-CO-若しくは-NR<sup>4</sup>-と置き換えてよく(各場合、2個のO、S若しくはN原子又はO原子とS原子と一緒に直接結合しないように)、

同時に、該ブリッジXがR<sup>1</sup>に結合して、R<sup>1</sup>とXに結合しているN原子を含めてヘテロ環式基を形成してもよく、該ブリッジXがさらにR<sup>2</sup>に結合して、R<sup>2</sup>とXに結合しているN原子を含めてヘテロ環式基を形成してもよく、かつ

該アルキレンブリッジの2個のC原子又は1個のC原子と1個のN原子が、さらなるC<sub>1-4</sub>-アルキレンブリッジと一緒に結合していてもよく、かつ

C原子がR<sup>10</sup>で置換されていてもよく、及び/又は1若しくは2個のC原子が、各場合、C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>2-6</sub>-アルケニル、C<sub>2-6</sub>-アルキニル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル-C<sub>1-3</sub>-アルキル、C<sub>4-7</sub>-シクロアルケニル及びC<sub>4-7</sub>-シクロアルケニル-C<sub>1-3</sub>-アルキルから選択される1個の置換基又は2個の同一若しくは異なる置換基で置換されていてもよく(2個のアルキル及び/又はアルケニル置換基と一緒に結合して炭素環式環系を形成していてもよい)、かつ

Wが単結合を意味し、同時に

Zが-C(3重結合)C-C(=O)-、-CR<sup>7a</sup>=CR<sup>7c</sup>-C(=O)-若しくは-CR<sup>7a</sup>R<sup>7b</sup>-CR<sup>7c</sup>R<sup>7d</sup>-C(=O)-を意味するか、又は

Wが-C(=O)-C(3重結合)C-を意味し、同時に

Zが単結合を意味し; かつ

Yは、Cyについて与えられる1つの意味を有し、

同時に、XがYに結合して、Yに縮合した炭素環式基若しくはヘテロ環式基を形成していてもよく、及び/又は

任意に、R<sup>1</sup>がYに結合して、基X及びR<sup>1</sup>とXに結合しているN原子を含めて、Yに縮合したヘテロ環式基を形成していてもよく、かつ

Aは、Cyについて与えられる1つの意味を有し、このときインデックスbが値0を有する場合、基Cyは、ブリッジWに対してオルト位の置換基としてアミノ基を持たず;

Bは、Cyについて与えられる1つの意味を有し、

bは、値0又は1を意味し、

Cyは、以下の意味:

- 飽和3~7員炭素環式基、
  - 不飽和4~7員炭素環式基、
  - フェニル基、
  - ヘテロ原子としてN、O若しくはS原子を有する飽和4~7員若しくは不飽和5~7員ヘテロ環式基、
  - ヘテロ原子として2個以上のN原子又は1若しくは2個のN原子と1個のO若しくはS原子を有する飽和若しくは不飽和5~7員ヘテロ環式基、
  - N、O及び/又はSから選択される1個のヘテロ原子又は2個以上の同一若しくは異なるヘテロ原子を有する芳香族ヘテロ環式5若しくは6員基;
- の1つから選択される炭素環式基若しくはヘテロ環式基を表し、同時に、上記4、5、6若しくは7員基は2個の共通の隣接C原子によってフェニル環又

はピリジン環に縮合していてもよく、かつ

上記5、6若しくは7員基では、1個の $-CH_2-$ 基又は2個の非隣接 $-CH_2-$ 基を相互独立的に $-CO-$ 、 $-C(=CH_2)-$ 、 $-(SO)-$ 若しくは $-(SO_2)-$ 基と置き換えてよく、かつ

上記飽和6若しくは7員基は、イミノ、 $N-(C_{1-4}-アルキル)-$ イミノ、メチレン、 $C_{1-4}-アルキル-$ メチレン又はジ $-(C_{1-4}-アルキル)-$ メチレンブリッジとの架橋環系として存在してもよく、かつ

上記環式基は、1個若しくは2個以上のC原子のところで $R^{20}$ にて一置換若しくは多置換されていてもよく、フェニル基の場合はさらにニトロで一置換されていてもよく、及び/又は1個以上のNH基が $R^{21}$ で置換されていてもよく、

$R^4$ は、 $R^{17}$ について与えられる1つの意味を有し、又は $C_{2-6}-アルケニル$ 若しくは $C_{3-6}-アルキニル$ を意味し、

$R^{7a}$ 、 $R^{7c}$ は、H、F、Cl、 $C_{1-4}-アルキル$ 又は $CF_3$ を意味し、

$R^{7b}$ 、 $R^{7d}$ は、H、F、 $C_{1-4}-アルキル$ を意味し( $R^{7b}$ 及び $R^{7d}$ がアルキル基を意味するときは $R^{7b}$ と $R^{7d}$ と一緒に結合してシクロプロピル基を形成していてもよい)；

$R^{10}$ は、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルコキシ$ 、 $C_{1-4}-アルコキシ-C_{1-3}-アルキル$ 、カルボキシ、 $C_{1-4}-アルコキシカルボニル$ 、アミノ、 $C_{1-4}-アルキル-アミノ$ 、ジ $-(C_{1-4}-アルキル)-アミノ$ 、シクロ- $C_{3-6}-アルキレンイミノ$ 、アミノ- $C_{1-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルキル-アミノ-C_{1-3}-アルキル$ 、ジ $-(C_{1-4}-アルキル)-アミノ-C_{1-3}-アルキル$ 、シクロ- $C_{3-6}-アルキレンイミノ-C_{1-3}-アルキル$ 、アミノ- $C_{1-3}-アルコキシ$ 、 $C_{1-4}-アルキル-アミノ-C_{1-3}-アルコキシ$ 、ジ $-(C_{1-4}-アルキル)-アミノ-C_{1-3}-アルコキシ$ 、シクロ- $C_{3-6}-アルキレンイミノ-C_{1-3}-アルコキシ$ 、アミノカルボニル、 $C_{1-4}-アルキル-アミノカルボニル$ 、ジ $-(C_{1-4}-アルキル)-アミノカルボニル$ 又はシクロ- $C_{3-6}-アルキレンイミノ-カルボニル$ を意味し、

$R^{11}$ は、 $C_{2-6}-アルケニル$ 、 $C_{2-6}-アルキニル$ 、 $R^{15}-O-$ 、 $R^{15}-O-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-O-CO-$ 、 $R^{15}-CO-O-$ 、 $R^{16}R^{17}N-$ 、シアノ、 $R^{18}R^{19}N-CO-$ 又はCyを意味し、

$R^{12}$ は、 $R^{20}$ について与えられる1つの意味を有し、

$R^{13}$ は、 $R^{17}$ について与えられる1つの意味を有し(但し、カルボキシを除く)、

$R^{14}$ は、ハロゲン、 $C_{1-6}-アルキル$ 、 $C_{2-6}-アルケニル$ 、 $C_{2-6}-アルキニル$ 、 $R^{15}-O-$ 、 $R^{15}-O-CO-$ 、 $R^{15}-CO-$ 、 $R^{15}-CO-O-$ 、 $R^{16}R^{17}N$ 、 $R^{18}R^{19}N-CO-$ 、 $R^{15}-O-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-O-CO-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-O-CO-NH$ 、 $R^{15}-SO_2-NH$ 、 $R^{15}-O-CO-NH-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-SO_2-NH-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-CO-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{15}-CO-O-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{16}R^{17}N-C_{1-3}-アルキル$ 、 $R^{18}R^{19}N-CO-C_{1-3}-アルキル$ 又はCy- $C_{1-3}-アルキル$ を意味し、

$R^{15}$ は、H、 $C_{1-4}-アルキル$ 、 $C_{3-7}-シクロアルキル$ 、 $C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル$ 、フェニル、フェニル- $C_{1-3}-アルキル$ 、ピリジニル又はピリジニル- $C_{1-3}-アルキル$ を意味し、

$R^{16}$ は、H、 $C_{1-6}-アルキル$ 、 $C_{3-7}-シクロアルキル$ 、 $C_{3-7}-シクロアルキル-C_{1-3}-アルキル$ 、 $C_{4-7}-シクロアルケニル$ 、 $C_{4-7}-シクロアルケニル-C_{1-3}-アルキル$ 、ヒドロキシ- $C_{2-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルコキシ-C_{2-3}-アルキル$ 、アミノ- $C_{2-6}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルキル-アミノ-C_{2-6}-アルキル$ 、ジ $-(C_{1-4}-アルキル)-アミノ-C_{2-6}-アルキル$ 又はシクロ- $C_{3-6}-アルキレンイミノ-C_{2-6}-アルキル$ を意味し、

$R^{17}$ は、 $R^{16}$ について与えられる1つの意味を有し、又はフェニル、フェニル- $C_{1-3}-アルキル$ 、ピリジニル、ジオキサラン-2-イル、 $-CHO$ 、 $C_{1-4}-アルキルカルボニル$ 、カルボキシ、ヒドロキシカルボニル- $C_{1-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルコキシカルボニル$ 、 $C_{1-4}-アルコキシカルボニル-C_{1-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルキルカルボニルアミノ-C_{2-3}-アルキル$ 、 $N-(C_{1-4}-アルキルカルボニル)-N-(C_{1-4}-アルキル)-アミノ-C_{2-3}-アルキル$ 、 $C_{1-4}-アルキルスルホニル$ 、 $C_{1-4}-アルキルスルホニルアミノ-C_{2-3}-アルキル$ 若しくは $N-(C_{1-4}-アルキルスルホニル)-N(C_{1-4}-アルキル)-アミノ-C_{2-3}-アルキル$ を意味し、

R<sup>18</sup>、R<sup>19</sup>は、相互独立的にH又はC<sub>1-6</sub>-アルキルを意味し、

R<sup>20</sup>は、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>2-6</sub>-アルケニル、C<sub>2-6</sub>-アルキニル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル、C<sub>3-7</sub>-シクロアルキル-C<sub>1-3</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、R<sup>22</sup>-C<sub>1-3</sub>-アルキルを意味し、又はR<sup>22</sup>について与えられる1つの意味を有し、

R<sup>21</sup>は、C<sub>1-4</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>2-3</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ-C<sub>2-6</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルキル-アミノ-C<sub>2-6</sub>-アルキル、ジ-(C<sub>1-4</sub>-アルキル)-アミノ-C<sub>2-6</sub>-アルキル、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキレンイミノ-C<sub>2-6</sub>-アルキル、フェニル-C<sub>1-3</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルキル-カルボニル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ-カルボニル又はC<sub>1-4</sub>-アルキルスルホニルを意味し、

R<sup>22</sup>は、フェニル-C<sub>1-3</sub>-アルコキシ、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキレンイミノ-C<sub>2-4</sub>-アルコキシ、OHC-、HO-N=HC-、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ-N=HC-、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキルチオ、カルボキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、C<sub>1-4</sub>-アルキルアミノカルボニル、ジ-(C<sub>1-4</sub>-アルキル)-アミノカルボニル、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキル-アミノ-カルボニル、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキレンイミノ-カルボニル、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキレンイミノ-C<sub>2-4</sub>-アルキル-アミノカルボニル、フェニル-アミノ-カルボニル、C<sub>1-4</sub>-アルキル-スルホニル、C<sub>1-4</sub>-アルキル-スルフィニル、C<sub>1-4</sub>-アルキル-スルホニルアミノ、アミノ、C<sub>1-4</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1-4</sub>-アルキル)-アミノ、C<sub>1-4</sub>-アルキル-カルボニル-アミノ、シクロ-C<sub>3-6</sub>-アルキレンイミノ、フェニル-C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ、N-(C<sub>1-4</sub>-アルキル)-フェニル-C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、フェニルカルボニルアミノ、フェニルカルボニルメチルアミノ、ヒドロキシアルキルアミノカルボニル、(4-モルフォリニル)カルボニル、(1-ピロリジニル)カルボニル、(1-ピペリジニル)カルボニル、(ヘキサヒドロ-1-アゼピニル)カルボニル、(4-メチル-1-ピペラジニル)カルボニル、メチレンジオキシ、アミノカルボニルアミノ又はアルキルアミノカルボニルアミノ-を意味し、

同時に、上記基及び遊離基、特にA、B、W、X、Y、Z、R<sup>1</sup>~R<sup>4</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>7c</sup>、R<sup>7d</sup>、R<sup>10</sup>~R<sup>22</sup>では、各場合、1個以上のC原子がさらにFで一置換若しくは多置換されていてもよく、及び/又は各場合、1若しくは2個のC原子が相互独立的にCl若しくはBrでさらに一置換されていてもよく、及び/又は各場合、1個以上のフェニル環が、群F、Cl、Br、I、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、アミノ、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ、ジ-(C<sub>1-3</sub>-アルキル)-アミノ、アセチルアミノ、アミノカルボニル、シアノ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、アミノ-C<sub>1-3</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>1-3</sub>-アルキル及びジ-(C<sub>1-3</sub>-アルキル)-アミノ-C<sub>1-3</sub>-アルキルから選択される1、2若しくは3個の置換基をさらに含んでよく、及び/又はニトロで一置換されていてもよく、かつ

各場合、存在するカルボキシ基のH原子又はN原子に結合しているH原子をin vivo分解しうる基と置き換えてよい)、

(ここで、以下の但し書き(M1)~(M14)に記載の化合物は含まれない):

(M1) N-[4-[[[(メチルアミノ)スルホニル]メチル]フェニル]-3-[2-(ジメチルアミノ)-エチル]-1-H-インドール-5-プロパンアミドオキサレート、

(M2) 3-[2-[3-[3.6-ジヒドロ-4-(2-ナフチル)-1(2H)-ピリジニル]-2-ヒドロキシプロボキシ]フェニル]-N-メチル-N-フェニル-2-プロパンアミド、

(M3) 3-[2-[2-ヒドロキシ-3-[4-(1-ナフチル)-1-ピペリジニル]プロボキシ]フェニル]-N-メチル-N-フェニル-2-プロパンアミド、

(M4) 3-[2-[2-ヒドロキシ-3-[4-(2-ナフチル)-1-ピペリジニル]プロボキシ]フェニル]-N-メチル-N-フェニル-2-プロパンアミド、

(M5) 3-[2-[2-ヒドロキシ-3-[4-(2-ナフタリル)-1-ピペリジニル]プロボキシ]フェニル]-N-フェニル-2-プロパンアミド、

(M6) N-[4-[1-(1H-イミダゾール-1-イル)-2-メチルプロピル]フェニル]-3-フェニル-2-プロパンアミド、

【請求項 2】

【化 2】

【請求項3】

【化 3】

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{7c}$ 、 $R^{7d}$ 、 $X$ 、 $Y$ 、 $A$ 、 $B$  及び  $b$  は、請求項 1



で与えた意味を有する。)

【請求項 4】

$R^1$ 、 $R^2$ が、相互独立的に、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{3-7}$ -シクロアルキル、 $C_{3-7}$ -シクロアルキル- $C_{1-3}$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_{2-4}$ -アルキル、 $NC$ - $C_{2-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ- $C_{2-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ-カルボニル- $C_{1-4}$ -アルキル、カルボキシル- $C_{1-4}$ -アルキル、アミノ- $C_{2-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルキル-アミノ- $C_{2-4}$ -アルキル、ジ-( $C_{1-4}$ -アルキル)-アミノ- $C_{2-4}$ -アルキル、シクロ- $C_{3-6}$ -アルキレンイミノ- $C_{2-4}$ -アルキル、ピロリジン-3-イル(該NH基は $R^{13}$ で置換されていてもよい)、ピロリジニル- $C_{1-3}$ -アルキル(該NH基は $R^{13}$ で置換されていてもよい)、ピペリジン-3-イル若しくは-4-イル(該NH基は $R^{13}$ で置換されていてもよい)、ピペリジニル- $C_{1-3}$ -アルキル(該NH基は $R^{13}$ で置換されていてもよい)、テトラヒドロピラン-3-イル若しくは-4-イル、テトラヒドロピラニル- $C_{1-3}$ -アルキル、テトラヒドロフラン-3-イル、テトラヒドロフラニル- $C_{1-3}$ -アルキル、フェニル、フェニル- $C_{1-3}$ -アルキル、ピリジル若しくはピリジル- $C_{1-3}$ -アルキルを意味し、

このとき、上述した基及び遊離基中、1個以上のC原子は、Fで一置換若しくは多置換されていてもよく、及び/又は1若しくは2個のC原子、特に1個のC原子は、相互独立的に、Cl若しくはBrで一置換されていてもよく、かつ

該フェニル若しくはピリジル基は、前記定義した基 $R^{12}$ で一置換若しくは多置換されていてもよく、及び/又はニトロで一置換されていてもよく、かつ

シクロアルキル環は、ヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-3}$ -アルキル、 $C_{1-3}$ -アルキル又は $C_{1-3}$ -アルキルオキシから選択される置換基で一置換若しくは多置換されていてもよく、かつ

ヒドロキシ- $C_{2-4}$ -アルキル及び $C_{1-4}$ -アルコキシ- $C_{2-4}$ -アルキルに含まれる $C_{2-4}$ -アルキルブリッジは、さらにヒドロキシ、ヒドロキシ- $C_{1-3}$ -アルキル、 $C_{1-3}$ -アルキル又は $C_{1-3}$ -アルキルオキシでさらに一置換されていてもよく、かつ

基 $R^1$ 、 $R^2$ の一方がHを意味してもよく、かつ

$R^{13}$ が請求項1で定義したとおりであることを特徴とする請求項1～3のいずれか1項に記載のアミド化合物。

【請求項 5】

$R^1$ と $R^2$ が、請求項1記載のアルキレンブリッジを形成し( $R^1R^2N$ -が、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、アゼパン、2,5-ジヒドロ-1H-ピロール、1,2,3,6-テトラヒドロ-ピリジン、2,3,4,7-テトラヒドロ-1H-アゼピン、2,3,6,7-テトラヒドロ-1H-アゼピン、ピペラジン(フリーなイミン官能は $R^{13}$ で置換されている)、ピペリジン-4-オン-オキシム、ピペリジン-4-オン-O- $C_{1-4}$ -アルキル-オキシム、モルフォリン及びチオモルフォリンから選択される基を意味するように)、

同時に、請求項1のとおり、1個以上のH原子を $R^{14}$ と置き換えてよく、及び/又は1個又は2個の同一若しくは異なる炭素環式若しくはヘテロ環式基Cyで置換されていてもよく(請求項1で規定した様式で)、

同時に、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 及びCyは、請求項1で与えた意味を有することを特徴とする請求項1～3のいずれか1項に記載のアミド化合物。

【請求項 6】

Xが、不分岐 $C_{1-4}$ -アルキレンブリッジを意味し、かつ

基YがXにC原子によって結合している場合、Xは、単結合、 $-CH_2-CH=CH-$ 、 $-CH_2-C(3重結合)C-$ 、 $C_{2-4}$ -アルキレンオキシ又は $C_{2-4}$ -アルキレン- $NR^4$ をも意味し、

同時に、該ブリッジXが $R^1$ に結合して、 $R^1$ とYに結合したN原子を含めてヘテロ環式基を形成してよく、かつ

X中、C原子は $R^{10}$ で置換されていてもよく、及び/又は1若しくは2個のC原子は、各場合、 $C_{1-6}$ -アルキル、 $C_{2-6}$ -アルケニル、 $C_{2-6}$ -アルキニル、 $C_{3-7}$ -シクロアルキル、 $C_{3-7}$ -シクロアルキル- $C_{1-3}$ -アルキル、 $C_{4-7}$ -シクロアルケニル及び $C_{4-7}$ -シクロア

ルケニル- $C_{1-3}$ -アルキルから選択される 1 個又は 2 個の同一若しくは異なる置換基で置換されていてもよく (2 個のアルキル及び / 又はアルケニル置換基と一緒に結合して炭素環式環系を形成していてもよい)、かつ

上記基及び遊離基において、1 個以上の C 原子は F で一置換若しくは多置換されていてもよく、及び / 又は 1 個若しくは 2 個の C 原子は、相互独立的に、Cl 若しくは Br で一置換されていてもよく、かつ

$R^1$ 、 $R^4$  及び  $R^{10}$  は、請求項 1 で定義したとおりであることを特徴とする請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物。

【請求項 7】

基 Y が、二価の環式基フェニル、ピリジニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、インドリル、ジヒドロインドリル、キノリニル、ジヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、イソキノリニル、ジヒドロイソキノリニル、テトラヒドロ-イソキノリニル及びベンゾオキサゾリルの中から選択され、

同時に、上記環式基は、1 個以上の C 原子のところで  $R^{20}$  にて一置換若しくは多置換されていてもよく、フェニル基の場合、さらにニトロで一置換されていてもよく、及び / 又は 1 個以上の N 原子のところで  $R^{21}$  にて置換されていてもよく、

同時に、X が請求項 1 に記載されているように Y に結合していてもよく、かつ

X、 $R^{20}$  及び  $R^{21}$  が請求項 1 で与えた意味を有することを特徴とする請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物。

【請求項 8】

基 A が、フェニル、ピリジル又はナフチルを意味し、

同時に、上記環式基が、1 個以上の C 原子のところで  $R^{20}$  にて一置換若しくは多置換されていてもよく、かつフェニル環の場合、さらにニトロで一置換されていてもよく、及び / 又は NH 基が  $R^{21}$  で置換されていてもよく、同時に、インデックス b が値 0 を有する場合、基 A は、前記ブリッジ W に対してオルト位の置換基としてアミノ基を持たず、かつ

$R^{20}$  及び  $R^{21}$  が、請求項 1 で与えた意味を有することを特徴とする請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物。

【請求項 9】

b が値 0 を有することを特徴とする請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物。

【請求項 10】

b が値 1 を有し、かつ B が、フェニル、フラニル、チエニル及びピリジルから成る群より選択される意味を有し、

同時に、上記環式基が、1 個以上の C 原子のところで  $R^{20}$  にて一置換若しくは多置換されていてもよく、かつフェニル環の場合、さらにニトロで一置換されていてもよく、かつ

$R^{20}$  が、請求項 1 で与えた意味を有することを特徴とする請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載のアミド化合物の生理学的に許容しうる塩。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩を含み、任意に、1 種以上の生理学的に許容しうる賦形剤と一緒に含有しうる組成物。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩を含み、任意に、1 種以上の不活性な担体及び / 又は希釈剤と一緒に含有しうる医薬組成物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩 (請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む) を

含有する哺乳類の摂食行動に影響を及ぼすための組成物。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）を含有する哺乳類の体重を減らすため及び / 又は哺乳類の体重の増加を予防するための組成物。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）の、MCH 受容体拮抗活性を有する医薬組成物調製のための使用。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）の、MCH によって引き起こされ、そうでなくても原因が MCH に関係する症候及び / 又は疾患の予防及び / 又は治療に好適な医薬組成物調製のための使用。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）の、代謝障害及び / 又は摂食障害、特に肥満症、過食症、神経性過食症、悪液質、拒食症、神経性拒食症及び食欲過剰の予防及び / 又は治療に好適な医薬組成物調製のための使用。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）の、肥満症に関連する疾患及び / 又は障害、特に糖尿病（特に II 型糖尿病）、糖尿病の合併症（糖尿病性網膜症、糖尿病性神経障害、糖尿病性腎障害を含む）、インスリン抵抗性、病的糖耐性、脳出血、心機能不全、心臓血管疾患（特に動脈硬化症及び高血圧）、関節炎及び膝関節炎の予防及び / 又は治療に好適な医薬組成物調製のための使用。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 種のアミド化合物及び / 又は請求項 11 記載の塩（請求項 1 の但し書き (M1) ~ (M14) によって除外された化合物を含む）から選択される第 1 の活性物質と、

糖尿病の治療用活性物質、糖尿病合併症の治療用活性物質、肥満症の治療用活性物質（好ましくは MCH アンタゴニスト以外）、高血圧の治療用活性物質、高脂血症（動脈硬化症を含む）の治療用活性物質、関節炎の治療用活性物質、不安状態の治療用活性物質及びうつ病の治療用活性物質から成る群より選択される第 2 の活性物質を含み、

任意に 1 種以上の不活性な担体及び / 又は希釈剤と一緒に含有しうる医薬組成物。