

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成26年2月13日 (2014.2.13)

【公表番号】特表2013-515039(P2013-515039A)

【公表日】平成25年5月2日 (2013.5.2)

【年通号数】公開・登録公報2013-021

【出願番号】特願2012-545304(P2012-545304)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/455

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 401/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/12

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 33/06

A 6 1 P 33/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 31/18

## 【手続補正書】

【提出日】平成25年12月17日(2013.12.17)

## 【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

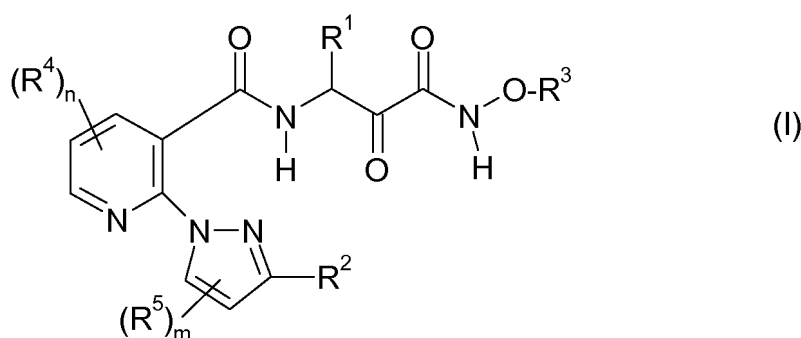
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



〔式中、

$R^1$  は  $C_1 - C_{10}$ -アルキル、 $C_2 - C_{10}$ -アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ -アルキニル、ここに、言及された最後の3つの基は部分的または完全にハロゲン化されていても良く、および/または1、2または3個の置換基  $R^{1a}$  を有しても良く、

$C_3 - C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、ここに、言及された最後の2つの基のシクロアルキル部位における  $CH_2$  基はO、NHまたはSによって置き換えられていても良く、または2つの隣接するC原子は二重結合を形成しても良く、ここに、該シクロアルキル部位はさらに1、2、3または4個の基  $R^{1b}$  を有しても良く、

アリール、ヘタリール、アリール- $C_1 - C_6$ -アルキル、アリール- $C_2 - C_6$ -アルケニル、ヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル、またはヘタリール- $C_2 - C_6$ -アルケニル、ここに、言及された最後の6つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていなくても良く、または1、2、3または4個の同一または異なる基  $R^{1c}$  を有しても良く；

ここに、

$R^{1a}$  は、相互に独立して、OH、SH、COOH、CN、 $OCH_2COOH$ 、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_7$ -シクロアルキルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $COOR^{a1}$ 、 $CONR^{a2}R^{a3}$ 、 $SO_2NR^{a2}R^{a3}$ 、 $-NR^{a2}-SO_2-R^{a4}$ 、 $NR^{a2}-CO-R^{a5}$ 、 $SO_2-R^{a4}$  および  $NR^{a6}R^{a7}$  から選択され、

$R^{1b}$  は、相互に独立して、OH、SH、COOH、CN、 $OCH_2COOH$ 、ハロゲン、場合により1、2または3個の置換基  $R^{1d}$  を有しても良いフェニル、

$C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、ここに、言及された最後の3つの置換基におけるアルキル部位は部分的または完全にハロゲン化されていて良く、および/または1、2または3個の置換基  $R^{1a}$  を有しても良く、

$COOR^{b1}$ 、 $CONR^{b2}R^{b3}$ 、 $SO_2NR^{b2}R^{b3}$ 、 $NR^{b2}-SO_2-R^{b4}$

$4$ 、 $\text{NR}^{\text{b}2} - \text{CO} - \text{R}^{\text{b}5}$ 、 $\text{SO}_2 - \text{R}^{\text{b}4}$  および  $\text{NR}^{\text{b}6} \text{R}^{\text{b}7}$

から選択され、

加えて、2つの $\text{R}^{\text{1b}}$ 基は、一緒になって、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキレン基を形成しても良く、またはシクロアルキルの隣接するC原子に結合した2つの $\text{R}^{\text{1b}}$ 基は、これらの基が結合している炭素原子と一緒に、ベンゼン環を形成しても良く、

$\text{R}^{\text{1c}}$ は、相互に独立して、OH、SH、ハロゲン、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、CN、 $\text{COOH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキルチオ、ここに、言及された最後の4つの置換基におけるアルキル部位は部分的または完全にハロゲン化されていても良く、および/または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1a}}$ を有しても良く、

$\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキルオキシ、ここに、言及された最後の3つの基のシクロアルキル部位は、1、2、3または4個の $\text{R}^{\text{1b}}$ 基を有しても良く、

アリール、ヘタリール、O-アリール、O- $\text{CH}_2$ -アリール、ここに、言及された最後の3つの基はアリール部位において置換されておらず、または、1、2、3または4個の $\text{R}^{\text{1d}}$ 基を有しても良く、

$\text{COOR}^{\text{c}1}$ 、 $\text{CONR}^{\text{c}2}\text{R}^{\text{c}3}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^{\text{c}2}\text{R}^{\text{c}3}$ 、 $\text{NR}^{\text{c}2} - \text{SO}_2 - \text{R}^{\text{c}4}$ 、 $\text{NR}^{\text{c}2} - \text{CO} - \text{R}^{\text{c}5}$ 、 $\text{SO}_2 - \text{R}^{\text{c}4}$ 、

$p$ が0、1、2、3、4、5または6である- $(\text{CH}_2)_p - \text{NR}^{\text{c}6}\text{R}^{\text{c}7}$ 、および $q$ が2、3、4、5または6であるO- $(\text{CH}_2)_q - \text{NR}^{\text{c}6}\text{R}^{\text{c}7}$ から選択され；ここに、

$\text{R}^{\text{a}1}$ 、 $\text{R}^{\text{b}1}$ および $\text{R}^{\text{c}1}$ は、相互に独立して、H、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロアルキル、1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1a}}$ を有する $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、または $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -ヘテロシクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、アリール、アリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ヘタリールまたはヘタリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ここに、言及された最後の4つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1d}}$ を有し；

$\text{R}^{\text{a}2}$ 、 $\text{R}^{\text{b}2}$ および $\text{R}^{\text{c}2}$ は、相互に独立して、H、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロアルキル、1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1a}}$ を有する $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、または $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -ヘテロシクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、アリール、アリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ヘタリールまたはヘタリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ここに、言及された最後の4つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1d}}$ を有し；

および

$\text{R}^{\text{a}3}$ 、 $\text{R}^{\text{b}3}$ および $\text{R}^{\text{c}3}$ は、相互に独立して、H、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -ハロアルキル、1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1a}}$ を有する $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルキル、または $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -シクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ -ヘテロシクロアルキル- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ -アルコキシ- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、アリール、アリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ヘタリールまたはヘタリール- $\text{C}_1 - \text{C}_4$ -アルキル、ここに、言及された最後の4つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{\text{1d}}$ を有し；

または

2つの基 $\text{R}^{\text{a}2}$ および $\text{R}^{\text{a}3}$ 、または $\text{R}^{\text{b}2}$ および $\text{R}^{\text{b}3}$ または $\text{R}^{\text{c}2}$ および $\text{R}^{\text{c}3}$ は、N原子と一緒に、環員としてのO、N、Sの群からの1、2または3個のさらなる異なるまたは同一のヘテロ原子を場合により有しても良い、3から7員の場合により置

換されていても良い窒素複素環を形成し、

$R^{a4}$ 、 $R^{b4}$  および  $R^{c4}$  は、相互に独立して、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、1、2 または 3 個の置換基  $R^{1a}$  を有する  $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_7$  - ヘテロシクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、アリール、アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ヘタリールまたはヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ここに、言及された最後の 4 つのラジカにおけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または 1、2 または 3 個の置換基  $R^{1d}$  を有し；

および

$R^{a5}$ 、 $R^{b5}$  および  $R^{c5}$  は、相互に独立して、 $R^{a1}$ 、 $R^{b1}$  および  $R^{c1}$  について言及された意味のうちの 1 つを有し；

$R^{a6}$ 、 $R^{b6}$  および  $R^{c6}$  は、相互に独立して、H、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、1、2 または 3 個の置換基  $R^{1a}$  を有する  $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_7$  - ヘテロシクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、CO -  $C_1 - C_6$  - アルキル、CO - O -  $C_1 - C_6$  - アルキル、SO<sub>2</sub> -  $C_1 - C_6$  - アルキル、アリール、ヘタリール、O - アリール、OCH<sub>2</sub> - アリール、アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル、CO - アリール、CO - ヘタリール、CO - (アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル)、CO - (ヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル)、CO - O - アリール、CO - O - ヘタリール、CO - O - (アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル)、CO - O - (ヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル)、SO<sub>2</sub> - アリール、SO<sub>2</sub> - ヘタリール、SO<sub>2</sub> - (アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル) または SO<sub>2</sub> - (ヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル) であり、ここに、言及された最後の 18 の基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または 1、2 または 3 個の置換基  $R^{1d}$  を有し、および

$R^{a7}$ 、 $R^{b7}$  および  $R^{c7}$  は、相互に独立して、H、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、1、2 または 3 個の置換基  $R^{1a}$  を有する  $C_1 - C_6$  - アルキル、または  $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_7$  - ヘテロシクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、アリール、アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル、ヘタリールまたはヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキルであり、ここに、言及された最後の 4 つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または 1、2 または 3 個の置換基  $R^{1d}$  を有し、または

2 つの基  $R^{a6}$  および  $R^{a7}$ 、または  $R^{b6}$  および  $R^{b7}$  または  $R^{c6}$  および  $R^{c7}$  は、N 原子と一緒にあって、環員としての O、N および S の群からの 1、2 または 3 個のさらなる異なるまたは同一のヘテロ原子を場合により有しても良い 3 から 7 員の場合により置換されていても良い窒素複素環を形成し、

または隣接する C 原子に結合した 2 つの基  $R^{1b}$  または 2 つの基  $R^{1c}$  は、これらが結合している C 原子と一緒にあって、環員としての O、N および S の群からの 1、2 または 3 個の異なるまたは同一のヘテロ原子を有する、4、5、6 または 7 員の場合により置換されていても良い炭素環または場合により置換されていても良い複素環を形成し；

$R^{1d}$  はハロゲン、OH、SH、NO<sub>2</sub>、COOH、C(O)NH<sub>2</sub>、CHO、CN、NH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>COOH、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルチオ、CO -  $C_1 - C_6$  - アルキル、CO - O -  $C_1 - C_6$  - アルキル、NH -  $C_1 - C_6$  - アルキル、NHCHO、NH - C(O)C<sub>1</sub> -  $C_6$  - アルキル、および SO<sub>2</sub> -  $C_1 - C_6$  - アルキルから選択され；

$R^2$  は  $C_3 - C_7$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アル

キル、ここに、言及された最後の2つの基のシクロアルキル部位における $\text{CH}_2$ 基はO、NH、またはSによって置き換えられていても良く、または2つの隣接するC原子は二重結合を形成しても良く、ここに、該シクロアルキル部位は、加えて、1、2、3または4個の $\text{R}^{2b}$ 基を有しても良く、

アリール、O-アリール、O- $\text{CH}_2$ -アリール、ヘタリール、アリール- $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -アルキル、アリール- $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -アルケニル、ヘタリール- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルキル、またはヘタリール- $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -アルケニル、ここに、言及された最後の8つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていなくても良く、または1、2、3または4個の同一または異なる $\text{R}^{2c}$ 基を有しても良く；

ここに、

$\text{R}^{2b}$ は $\text{R}^{1b}$ について示された意味のうちの1つを有し、および

$\text{R}^{2c}$ は $\text{R}^{1c}$ に示された意味のうちの1つを有し；

$\text{R}^3$ は $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -ハロアルキルまたは $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -アルケニル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -アルキニル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -シクロアルキル- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -ヘテロシクロアルキル- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルコキシ- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、ここに、言及された最後の7つの基におけるアルキル、アルケニル、アルコキシ、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキルは置換されていないか、または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{xa}$ を有し、

アリール、アリール- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルキル、ヘタリールまたはヘタリール- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルキル、ここに、言及された最後の4つの基におけるアリールおよびヘタリールは置換されていないか、または1、2または3個の置換基 $\text{R}^{xd}$ を有し、

ここに、 $\text{R}^{xa}$ は $\text{R}^{1a}$ について示された意味のうちの1つを有し、および $\text{R}^{xd}$ は $\text{R}^{1d}$ について示された意味のうちの1つを有し；

$\text{R}^4$ および $\text{R}^5$ は、相互に独立して、ハロゲン、 $\text{NH}_2$ 、CN、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CHF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{F}$ 、O- $\text{CF}_3$ 、O- $\text{CHF}_2$ 、O- $\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{COOH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルコキシ、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルコキシ- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキルチオ、 $\text{CH}_2\text{NRR}'$ から選択され、ここに、 $\text{R}$ および $\text{R}'$ は、相互に独立して、水素および $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルキルから選択され；

$m$ は、0、1または2であり、

$n$ は、0、1または2である]

のカルボキサミド化合物、およびこの互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、またはこの医薬的に適する塩。

#### 【請求項2】

$m$ が0または1であって、 $m=1$ である場合、 $\text{R}^5$ がF、Cl、CN、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキルおよび $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルコキシから選択される、請求項1に記載のカルボキサミド化合物。

#### 【請求項3】

$n$ が0または1であって、 $n=1$ である場合、 $\text{R}^4$ がF、Cl、CN、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキルおよび $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルコキシから選択される、請求項1または2に記載のカルボキサミド化合物。

#### 【請求項4】

$\text{R}^3$ が、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -アルキル、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ -ハロアルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_5$ -アルケニル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_5$ -アルキニル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -シクロアルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -シクロアルキル- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -ヘテロシクロアルキル- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルコキシ- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -アルキル、アリールおよびアリール- $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ -アルキルから選択される、請求項1～3のいずれかに記載のカルボキサミド化合物。

#### 【請求項5】

$\text{R}^3$ が、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、プロペニル、ブタ-2-エニル、ブタ-3-エニル、プロピニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロプロピル-メチルおよび2-(モルホリン-4-イル)エチルから選択される、請

求項 4 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 6】

$R^3$  が、 $C_1 - C_3$  - アルキル、 $C_1 - C_3$  - ハロアルキル、 $C_3 - C_5$  - アルケニル、 $C_3 - C_5$  - アルキニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_2$  - アルコキシ -  $C_1 - C_2$  - アルキル、アリーールおよびアリーール -  $C_1 - C_3$  - アルキルから選択される、請求項 4 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 7】

$R^3$  が、メチル、エチル、プロペニル、ブタ - 2 - エニル、ブタ - 3 - エニル、プロピニル、シクロプロパニル、シクロプロパニル - メチル、フェニルおよびベンジルから選択される、請求項 6 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 8】

$R^1$  が、部分的にまたは完全にハロゲン化されていて良く、および / または 1、2 または 3 個の置換基  $R^{1a}$  を有しても良い  $C_1 - C_{10}$  - アルキル、

シクロアルキル部位が 1、2、3 または 4 個の基  $R^{1b}$  を有しても良い  $C_3 - C_7$  - シクロアルキル - メチル、

ベンジルおよびヘタリール - メチルであり、言及された最後の 2 つの基におけるフェニルおよびヘタリールは置換されていない良く、または 1、2、3 または 4 個の同一または異なる基  $R^{1c}$  を有しても良いベンジルおよびヘタリール - メチル

から選択される、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 9】

$R^1$  が、置換されていない良く、またはハロゲン、 $C_1 - C_2$  - アルキルおよび  $C_1 - C_2$  - アルコキシから選択される 1 または 2 個の同一または異なる基を有しても良いベンジルである、請求項 8 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 10】

$R^2$  が、アリーール、ヘタリール、アリーール -  $C_1 - C_6$  - アルキル、アリーール -  $C_2 - C_6$  - アルケニルおよびヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキルから選択され、ここに、言及された最後の 5 つの基におけるアリーールおよびヘタリールは置換されていない良く、または 1、2、3 または 4 個の同一または異なる基  $R^{2c}$  を有しても良い、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 11】

$R^2$  が、置換されていない良く、または 1 または 2 個の同一または異なる基  $R^{2c}$  を有しても良いフェニルである、請求項 10 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 12】

$R^2$  が、置換されていない良く、またはハロゲン、 $C_1 - C_2$  - アルキル、 $C_1 - C_2$  - アルコキシ、および  $p$  が 0、1 または 2 である -  $(CH_2)_p - NR^{c6}R^{c7}$  から選択される 1 または 2 個の同一または異なる基を有しても良いフェニルであり、ここに、

$R^{c6}$  は H および  $C_1 - C_4$  - アルキルよりなる群から選択され、および

$R^{c7}$  は H および  $C_1 - C_4$  - アルキルよりなる群から選択され、または

2 つの基  $R^{c6}$  および  $R^{c7}$  は、N 原子と一緒にあって、環員としての O、N および S の群からのさらなる異なるまたは同一のヘテロ原子を場合により有しても良い 5、6 または 7 員の飽和窒素複素環を形成し、およびここに、該窒素複素環は置換されていないか、または  $C_1 - C_4$  - アルキルから選択される 1、2 または 3 個の置換基を有する、請求項 10 に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 13】

基  $R^1$  を担持する炭素原子において S 立体配置を有する、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 14】

2 - [ 3 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - N - [ 4 - ( メトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ] ピリジン - 3 -

N - ( 4 - ( エトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル )  
- 2 - ( 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ニコチンアミド、

N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - { 3 - [ 4 - ( 4 - モルホリニルメチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル



ニコチンアミド、

(2R) - N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - { 3 - [ 4 - (4 - モルホリニルメチル) フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル } ニコチンアミド、

(2S) - N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - { 3 - [ 4 - (4 - モルホリニルメチル) フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 1 - イル } ニコチンアミド、

2 - (3 - { 4 - [ (ジエチルアミノ) メチル ] フェニル } - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] ニコチンアミド、

(2R) - 2 - (3 - { 4 - [ (ジエチルアミノ) メチル ] フェニル } - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] ニコチンアミド、

(2S) - 2 - (3 - { 4 - [ (ジエチルアミノ) メチル ] フェニル } - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - N - [ 4 - (メトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] ニコチンアミド、

N - (4 - { [ (2 - メチル - 2 - プロパニル) オキシ ] アミノ } - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル) - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2R) - N - (4 - { [ (2 - メチル - 2 - プロパニル) オキシ ] アミノ } - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル) - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2S) - N - (4 - { [ (2 - メチル - 2 - プロパニル) オキシ ] アミノ } - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル) - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

N - { 4 - [ (シクロペンチルオキシ) アミノ ] - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル } - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2R) - N - { 4 - [ (シクロペンチルオキシ) アミノ ] - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル } - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2S) - N - { 4 - [ (シクロペンチルオキシ) アミノ ] - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル } - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3, 4 - ジオキソ - 2 - ブタニル ] - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2R) - N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3, 4 - ジオキソ - 2 - ブタニル ] - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2S) - N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3, 4 - ジオキソ - 2 - ブタニル ] - 2 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - (4 - フルオロ - 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2R) - N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - (4 - フルオロ - 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

(2S) - N - [ 4 - (エトキシアミノ) - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] - 2 - (4 - フルオロ - 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ニコチンアミド、

N - { 4 - [ (シクロブチルオキシ) アミノ ] - 3, 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2

( 2 S ) - 2 - [ 3 - ( 2 - フルオロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - N - [ 4 - ( メトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル ] ニコチンアミド、

( 2 S ) - 1 - ( 2 - クロロベンジル ) - N - ( 4 - ( メトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジ  
オキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ) - 5 - オキソピロリジン - 2 - カルボキサミド

よりなる群から選択されるカルボキサミド化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 15】

N - ( 4 - ( メトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ) - 2 - ( 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ニコチンアミドである化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 16】

2 - ( 4 - フルオロ - 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( メトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ) ニコチンアミドである化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 17】

N - ( 4 - ( エトキシアミノ ) - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニルブタン - 2 - イル ) - 2 - ( 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ニコチンアミドである化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 18】

N - [ 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 4 - ( プロボキシアミノ ) - 2 - ブタニル ] - 2 - ( 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ニコチンアミドである化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 19】

N - { 4 - [ ( シクロプロピルメトキシ ) アミノ ] - 3 , 4 - ジオキソ - 1 - フェニル - 2 - ブタニル } - 2 - ( 3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) ニコチンアミドである化合物、この互変異性体、この水和物、このプロドラッグ、およびこの医薬的に適する塩。

【請求項 20】

治療で用いられる、請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載のカルボキサミド化合物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 つのカルボキサミド化合物と、担体と、を含む医薬組成物。

【請求項 22】

神経変性疾患または機能低下、慢性脳供給欠乏、虚血症または外傷の結果として起こる神経変性疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋委縮性側索硬化症、ハンチントン病、多発性硬化症および神経系同時損傷、癲癇、疼痛から選択される疾患、機能低下または状態；心臓虚血症後の心臓損傷、骨格筋外傷、筋ジストロフィー、平滑筋細胞の増殖からの損傷、冠動脈血管痙攣、大脳血管痙攣、黄斑変性、目の白内障、血管形成術後の血管の再狭窄；腎臓外傷、慢性腎臓疾患；インターロイキン - I、TNF または A のレベル上昇に関連する疾患または機能低下；マラリアまたはトキソプラズマ症のような原生動物感染に関連する疾患または機能低下を治療するための、

HIV 患者を治療するための、並びに

腫瘍およびその転移の化学療法のための、

請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載のカルボキサミド化合物。