【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27年3月19日(2015.3.19)

【公表番号】特表2014-518543(P2014-518543A)

【公表日】平成26年7月31日(2014.7.31)

【年通号数】公開・登録公報2014-041

C 0 7 D 211/58 (2006.01)

【出願番号】特願2013-555559(P2013-555559)

【国際特許分類】

_	U	,	U	211/30	(2000.01)
A	6	1	Κ	31/4468	(2006.01)
A	6	1	P	3/04	(2006.01)
A	6	1	P	3/06	(2006.01)
A	6	1	P	3/08	(2006.01)
A	6	1	P	3/00	(2006.01)
A	6	1	P	35/00	(2006.01)
A	6	1	P	9/04	(2006.01)
A	6	1	P	43/00	(2006.01)
A	6	1	P	1/16	(2006.01)
A	6	1	P	11/00	(2006.01)
A	6	1	P	1/04	(2006.01)
A	6	1	P	9/10	(2006.01)
A	6	1	P	9/00	(2006.01)
Α	6	1	P	9/12	(2006.01)
Α	6	1	P	1/14	(2006.01)
A	6	1	P	<i>25/36</i>	(2006.01)
A	6	1	Κ	45/00	(2006.01)
F]					
C	0	7	D	211/58	CSP
Α	6	1	Κ	31/4468	
A A	6 6	1 1	K P	31/4468 3/04	
Α	6	1	Р	3/04	
A A	6 6	1 1	P P	3/04 3/06	
A A A	6 6 6	1 1 1	P P P	3/04 3/06 3/08	
A A A	6 6 6	1 1 1	P P P	3/04 3/06 3/08 3/00	
A A A A	6 6 6 6	1 1 1 1	P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00	1 0 5
A A A A	6 6 6 6	1 1 1 1 1	P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04	1 0 5 1 1 1
A A A A A	6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1	P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00	
A A A A A A	6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1	P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00	
A A A A A A A	6 6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1 1	P P P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00 43/00 1/16	
A A A A A A A A	6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1 1	P P P P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00 43/00 1/16 11/00	
A A A A A A A A A	6 6 6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1 1 1	P P P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00 43/00 1/16 11/00 1/04	
A	6 6 6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	P P P P P P P P	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00 43/00 1/16 11/00 1/04 9/10	
A A A A A A A A A A A	6 6 6 6 6 6 6 6 6 6	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	PPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPPP	3/04 3/06 3/08 3/00 35/00 9/04 43/00 43/00 1/16 11/00 1/04 9/10 9/00	1 1 1

【手続補正書】

A 6 1 P

A 6 1 P

A 6 1 K

1/14

25/36

45/00

【提出日】平成27年1月30日(2015.1.30)

【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

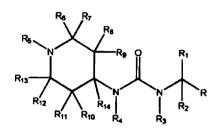
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、或いはその医薬的に許容され得る塩

【化1】



式(I)

(式中: R は、アリール、アリールアルキル、炭素環、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキルから成る群から選定され、任意に 1 つ以上の独立した R 1 0 3 置換基により置換され;

R₁は、水素、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アルコキシアルキル、 - C (O) R¹⁰¹、 - C (O) OR ¹⁰¹、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキルから成る群から選定され、それぞれ任意に1つ以上の独立したR¹⁰³置換基により独立して置換され;

R $_2$ は、水素であり、または R $_1$ 及び R $_2$ は、これらを連結している原子と一緒になって、任意に 1 つ以上の R 1 0 3 置換基により独立して置換される縮合または非縮合の単環式、二環式または三環式複素環または炭素環を形成し:

R $_3$ は、水素、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール、ヘテロアリール、・ C (O) R 1 0 1 、 - C (O) O R 1 0 1 、 - C (O) N R 1 0 1 R 1 0 2 、 - S (O) $_2$ R 1 0 2 、 - S R 1 0 1 及び - S (O) $_2$ N R 1 0 1 R 1 0 2 から成る群から選定され、任意に 1 つ以上の独立した R 1 0 3 置換基により置換され;

R $_4$ は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、・OR 1 0 3 、NR 1 0 1 R 1 0 2 、・C (O) R 1 0 1 、・C (O) OR 1 0 1 、・C (O) NR 1 0 1 R 1 0 2 、・アルキルNR 1 0 1 R 1 0 2 、・S (O) $_2$ R 1 0 2 、・S R 1 0 1 及び・S (O) $_2$ NR 1 0 1 R 1 0 2 から成る群から選定され、任意に1つ以上の独立したR 1 0 3 置換基により置換され;またはR $_3$ 及びR $_4$ は、R $_3$ 及びR $_4$ を連結している原子と一緒になって、任意に1つ以上のR 1 0 3 置換基により独立して置換される縮合または非縮合の単環式、二環式または三環式複素環または炭素環を形成し

R $_5$ は、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、オキシド(= O)、 - C(O)R 1 0 1 1 1 1 0 2

^{1 0 2}、 - S R ^{1 0 1} 及び - S (O) ₂ N R ^{1 0 1} R ^{1 0 2} から成る群から選定され; R $_6$ 、 R $_7$ 、 R $_8$ 、 R $_9$ 、 R $_1$ $_0$ 、 R $_1$ $_1$ 、 R $_1$ $_2$ 、 R $_1$ $_3$ 及び R $_1$ $_4$ は、それぞれ水素 、シアノ、・NO $_2$ 、・OR 1 0 1 、ヒドロキシ、アミノ、アルキル、アルケニル、シク ロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、アリールアルキル 、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ ールアルキル、 - C (O) R ^{1 0 1}、 - C (O) O R ^{1 0 1}、 - C (O) N R ^{1 0 1} R ¹ $-NR^{101}R^{102}$, $-NR^{101}S(O)_2R^{102}$, $-NR^{101}C(O)$ R ^{1 0 2}、 - S (O) ₂ R ^{1 0 2}、 - S R ^{1 0 1} 及び - S (O) ₂ N R ^{1 0 1} R ^{1 0 2} か ら成る群から独立して選定され、それぞれ任意に1つ以上の独立した R ^{1 0 3} 置換基によ り独立して置換され;または R 。、 R ,、 R 。、 R 。、 R _{1 0} 、 R _{1 1} 、 R _{1 2} 、 R _{1 3} 及びR14から成る群から選定される任意の2つ以上の置換基は、これらを連結している 原子と一緒になって、任意に1つ以上の R ^{1 0 3} 置換基により独立して置換される縮合ま たは非縮合の単環式、二環式または三環式複素環または炭素環を形成し;並びに R^{1} 0 1 0 1 0 2 0 0 0 1 0ヒドロキシ、アミノ、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、 アルコキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシク ロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、 - C (O) R 1 0 4 1 - C (O) N R ^{1 0 4} R ^{1 0 5} 、 - N R ^{1 0 4} R ^{1 0 5} - C (O) O R ^{1 0 4} $^{1\ 0\ 4}\ S\ (O\)\ _{2}\ R\ ^{1\ 0\ 5}\ ,\ -\ N\ R\ ^{1\ 0\ 4}\ C\ (O\)\ R\ ^{1\ 0\ 5}\ ,\ -\ S\ (O\)\ _{2}\ R\ ^{1\ 0\ 4}\ ,\ -$ SR¹⁰⁴及び - S(O)₂NR¹⁰⁴R¹⁰⁵から成る群から独立して選定され、それ ぞれ任意に1つ以上の独立したR¹⁰³置換基により独立して置換され;またはR¹⁰¹ 、 R ^{1 0 2} は、これらを連結している原子と一緒になって、任意に1つ以上の R ^{1 0 3} 置 換基により独立して置換される縮合または非縮合の単環式、二環式または三環式複素環ま たは炭素環を形成し;並びに

R ^{1 0 4} 及び R ^{1 0 5} は、それぞれ水素、シアノ、・N O ₂ 、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキルから成る群から独立して選定される)。

【請求項2】

Rが、アリールまたはヘテロアリールである、請求項1に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項3】

Rが、フェニルまたはナフタレンであり、任意に水素、クロロ、フルオロ、ブロモ、トリフルオロメチル、シアノ、メトキシ、エトキシ、メチル及びエチルから成る群から独立して選定される1~6個の置換基により独立して置換される、請求項<u>1又は2のいずれか</u>に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項4】

R₁が、アルキル、シクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールアルキル及びヘテロアリールアルキルから成る群から選定される、請求項1~<u>3</u>のいずれか1項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項5】

R₃が、水素、アルキルまたはシクロアルキルである、請求項1~<u>4</u>のいずれか1項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項6】

R₄が、メチル、エチル、ベンジル、またはメチル、フルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノ及びヒドロキシから成る群から独立して選定される 1~5個の置換基により置換されるベンジルである、請求項 1~<u>5</u>のいずれか 1 項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項7】

R $_5$ がメチルである、請求項 1 \sim $\underline{6}$ のいずれか 1 項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項8】

R $_6$ 、 R $_7$ 、 R $_8$ 、 R $_9$ 、 R $_1$ $_0$ 、 R $_1$ $_1$ 、 R $_1$ $_2$ 、 R $_1$ $_3$ 及び R $_1$ $_4$ が、それぞれ水素、アルキル、シクロアルキル、 - C (O) O R 1 0 1 、及び - アルキル O R 1 0 3 から成る群から独立して選定される、請求項 1 $^ _7$ のいずれか 1 項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項9】

R $_8$ 及び R $_9$ が、それぞれ独立して水素、メチル、エチル、 - C (= O) O E t 、または - C H $_2$ O H である、請求項 1 \sim $\underline{8}$ のいずれか 1 項に記載された化合物、或いは医薬的に許容され得るその塩または付加物。

【請求項10】

【表1-1】

GA1	Me	1-メチル-3-((R)-1- (ナフタレン-1-イル)エチル)-1-(1,3,3-トリメチ ルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA2	Me Me Me Me N Me	1-メチル-3-((S)-1- (ナフタレン-1-イル)エチル) -1-(1, 3, 3-トリメチル ピペリジン-4-イル) 尿素、
GA3	Me	1ーメチルー3ー(1ー(ナフタレンー1ーイル)エチル)-1- (1,3,3ートリメチルピペリジンー4ーイル)尿素、
GA4	Me Me Me OMe OMe	3-(1-(4-メトキシナフタレン-1-イル)エチル)-1- メチル-1-(1, 3, 3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA5	Me Me Me O Me	1 - ベンジル-3-((R)-1 -(ナフタレン-1-イル)エチル)-1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA6	Me Me CI N H CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(3-メトキシベンジル)-1-(1,3 ,3-トリメチルピペリジン-4 -イル)尿素、
GA7	Me Me CI CI F	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(2-フルオロベンジル)-1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA8	Me Me CI CI Me CI OMe	3-(1-(2,3-ジクロロー 4-メトキシフェニル)エチル) -1-メチル-1-(1,3,3- トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、

【表1-2】

GA9	Me Me CI N N N H	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-メチルー 1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA10	Me N Me O Me CI CI MeO OMe	3-((R)-1-(2,3-ジ クロロー4-メトキシフェニル) エチル)-1-(1,3-ジメチ ルピペリジン-4-イル)-1- (3-メトキシベンジル) 尿素、
GA11	Me Me O Me CI CI	1 - ベンジルー3 - (1 - (2, 3 - ジクロロフェニル)プロピル) - 1 - (1, 3, 3 - トリメチ ルピペリジン-4 - イル)尿素、
GA12	Me Me CI CI N H	3-((S)-1-(2,3-ジ クロロフェニル)エチル)-1- メチル-1-(1,3,3-トリ メチルピペリジン-4-イル)尿 素、
GA13	Me Me CI N Me CI Me Me	3-((R)-1-(2,3-ジ クロロフェニル)エチル)-1- メチルー1-(1,3,3-トリ メチルピペリジン-4-イル)尿 素、
GA14	Me Me CI N H CI Me	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-メチルー 1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA15	Me Me Me	1 - ベンジル-3 - ((S) - 1 - (ナフタレン-1 - イル) エチ ル) - 1 - (1, 3, 3 - トリメ チルピペリジン-4 - イル) 尿素 、

【表1-3】

GA16	Me Me Me	1 — ベンジルー3-((R)-1 -(ナフタレンー1-イル)エチ ル)-1-(1,3,3-トリメ
	N N N	チルピペリジン-4-イル)尿素 、
GA17	Me Me Me O Me	1 - ベンジル-3 - (1 - (ナフタレン-1 - イル)エチル)-1 - (1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA18	Me Me Me CI CI Me CI Me CI Me CI Me CI Me	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)プロピル)-1-メチル-1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA19	Me Me Me Me F F Me H	3-(1-(2,3-ジフルオロフェニル)エチル)-1-メチル -1-(1,3,3-トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA20	Me Me CI CI	1 - ベンジルー3 - (1 - (2, 3 - ジクロロフェニル)エチル) - 1 - (1, 3, 3 - トリメチル ピペリジンー4 - イル)尿素、
GA21	Me Me Me Me F F F	1 ーベンジルー3 ー (1 ー (2, 3 ージフルオロフェニル) エチル) ー1 ー (1, 3, 3 ートリメチ ルピペリジンー4 ーイル) 尿素、
GA22	Me Me Me O Me OMe	1 - ベンジルー3 - (1 - (4 - メトキシナフタレン-1 - イル) エチル)-1 - (1, 3, 3 - ト リメチルピペリジン-4 - イル) 尿素、

【表1-4】

GA23	Me Me Cl	3 - (1 - (2, 3 - ジクロロ - 4 - メトキシフェニル) エチル)
	N N CI	│ ─ 1 ─ メチル─ 1 ─ (1、3、3 │ │ ─ トリメチルピペリジン─ 4 ─ イ │
ļ	OMe	ル)尿素、
GA24	Me Me Cl	3-(1-(2,3-ジクロロフ
	Me Cl	 ェニル)エチル)-1-メチル-
	Me Cl	1- (1, 2, 2, 5, 5ーペン
	Me H	┃タメチルピペリジン―4-イル) ┃
	Me ''	
GA25	Me	メチル2-(3-メチル-3-(
"""	Me Me O OMe	1.3.3ートリメチルピペリジ
		ン-4-イル) ウレイド) -2-
	, H H	/ ・ ・ ・
1	Me 🤍	
GA26	Me Me OH	3-(2-ヒドロキシ-1-(ナ
	Me N Me OH	フタレンー1ーイル)エチル)-
		1ーメチルー1ー(1、3、3ー
	∴ H	トリメチルピペリジンー4ーイル
	Me '') 尿素、
		7 #3-26-5
GA27	Me .	1-(4-クロロベンジル)-3
GA27	Me Me O Me CI	1- (4-クロロベンジル) -3 - (1- (2 3-ジクロロフェ
GA27		ー(1-(2、3-ジクロロフェ
GA27	N N N CI	- (1- (2, 3-ジクロロフェ ニル) エチル)-1- (1, 3, 3
GA27	L L L L L L	- (1- (2, 3-ジクロロフェ ニル) エチル)-1- (1, 3, 3 -トリメチルピペリジン-4-イ
GA27	N N N CI	- (1- (2, 3-ジクロロフェ ニル) エチル)-1- (1, 3, 3
GA27	CI	ー(1-(2、3-ジクロロフェ ニル)エチル)-1-(1、3、3 -トリメチルピペリジン-4-イ ル)尿素、
GA27	CI N H CI	- (1- (2, 3-ジクロロフェ ニル) エチル)-1- (1, 3, 3 -トリメチルピペリジン-4-イ
	CI	ー(1-(2、3-ジクロロフェ ニル)エチル)-1-(1、3、3 -トリメチルピペリジン-4-イ ル)尿素、
	Me N Et Et O Me	- (1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、
	CI N H CI	ー (1- (2, 3-ジクロロフェニル) エチル) - 1- (1, 3, 3 - トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1- (3, 3-ジエチル-1-メチルピペリジン-
	Me N Et Et O Me	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル)
	Me N Et Et O Me	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル) -3-((S)-1-
	Me N H CI	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル) 尿素、
GA28	Me N H CI	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル)
GA28	Me N H CI	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジェチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル) 尿素、
GA28	Me N H CI	ー(1-(2, 3-ジクロロフェニル) エチル) ー1-(1, 3, 3 ートリメチルピペリジンー4-イル) 尿素、 1-ベンジルー1-(3, 3-ジェチルー1-メチルピペリジンー4-イル) ー3-((S) -1-(ナフタレンー1-イル) エチル) 尿素、 1-ベンジルー1-(3, 3-ジェチルー1-メチルピペリジンー4-イル) ー3-((R) -1-
GA28	Me N H CI	ー (1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジェチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジェチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((R)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル)
GA28	Me N H CI	ー(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イル)尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジエチル-1-メチルピペリジン-4-イル)-3-((R)-1-
GA28	Me N H CI	ー (1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)ー1-(1,3,3 ートリメチルピペリジン-4-イル)尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジェチル-1-メチルピペリジン-4-イル)ー3-((S)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル) 尿素、 1-ベンジル-1-(3,3-ジェチル-1-メチルピペリジン-4-イル)ー3-((R)-1-(ナフタレン-1-イル)エチル)

【表1-5】

		4 33 32 11 4 40 0 32
GA30	Me N Et O Me	1ーベンジルー1ー(3, 3ージ エチルー1ーメチルピペリジンー
		4 ーイル) - 3 -(1 -(ナフタ
	H U	レンー1ーイル)エチル)尿素、 │ │
GA31	Me N OBn OBn	3-(2-(ベンジルオキシ)-
	Me N OBn	1-(ナフタレン-1-イル)エ
	$N \longrightarrow N \longrightarrow$	チル)-1-メチル-1-(1,
İ	Me H	3, 3ートリメチルピペリジン- 4ーイル)尿素、
GA32	O _{N c} OEt	エチル 4ー(1ーベンジルー3ー
UAUZ	Me ~ Me	(1-(2, 3-ジクロロフェニ
<u> </u>	N O Me CI	ル) エチル) ウレイド)ー1,3-
	N N N C	ジメチルピペリジンー3ーカルボ
		ン酸塩、
GA33	Me Me CI	3-((R)-1-(2, 3-ジ
	Me Me Cl	クロロフェニル)エチル)-1-
	N N N N N N C I	(3-メトキシベンジル) -1-
	MeO H	【 (1, 3, 3ートリメチルピペリ 】 【 ジンー4ーイル)尿素、
		フンー4ーイル)冰糸、
GA34	Me Me CI	3- (2-シクロプロピル-1-
	Me N CI	(2, 3ージクロロフェニル) エ
	$N \longrightarrow N \longrightarrow CI$	チル)-1-(3-メトキシベン
	MeO. H	ジル)−1−(1,3,3−トリ メチルピペリジン−4−イル)尿
		メナルピペリンジー4-1ル/冰 素、
CASE	Me	3- (1- (2, 3-ジクロロフ
GA35	Me Me CI	s = (1 = (2, 3 =) / 1
		ドロキシベンジル) - 1 - (1,
	HO N N N	3.3ートリメチルピペリジンー
	HO	4ーイル)尿素、
GA36	HO	1ーベンジルー3ー(1ー(2、
	Me N Me CI	3-ジクロロフェニル) エチル) -1-(3-(ヒドロキシメチル
	$\bigcup_{N} \bigcup_{N} \bigcup_{C} C$	- - (3 - (とドロギング)ル) - 1,3 - ジメチルピペリジンー
		4ーイル) 尿素、
L		<u> </u>

【表1-6】

GA37	Me Me OH OH	1-ベンジル-3-(1-(2, 3-ジヒドロキシフェニル) エチ ル) -1-(1, 3, 3-トリメ
	j H U	チルピペリジン-4-イル)尿素 、
GA38	Me Me O Me CI	3-((R)-1-(2,3-ジ クロロフェニル)エチル)-1- (3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンジル)-1-(1,3,3 -トリメチルピペリジン-4-イ ル)尿素、
GA39	Me Me Me F F F Me OMe	3-(1-(2,3-ジフルオロ -4-メトキシフェニル)エチル)-1-メチルー1-(1,3, 3-トリメチルピペリジンー4- イル) 尿素、
GA40	Me Me Me F F F Me OH	3-(1-(2,3-ジフルオロ -4-ヒドロキシフェニル)エチ ル)-1-メチル-1-(1,3 ,3-トリメチルピペリジン-4 -イル)尿素、
GA41	Me N Me CI CI	4 - (1 - ベンジル-3 - (1 - (2,3-ジクロロフェニル)エ チル)ウレイド)- 1,3-ジメチ ルピペリジン-3-カルボン酸、
GA42	O OEt Me O Me CI N N H CI CI	エチル 4-(3-(1-(2,3) ージクロロフェニル)エチル)- 1-メチルウレイド)-1,3-ジ メチルピペリジン-3-カルボン 酸塩、
GA43	Me N Me CI CI Me Me H	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(3-(ヒドロキシメチル)-1,3-ジメチルピペリジン-4-イル)-1 ーメチル尿素、

【表1-7】

GA44	Me Me CI CI Me CI Me CI	4-(3-(1-(2, 3-ジクロロフェニル) エチル) -1-メチルウレイド) -1,3,3-トリメチルピペリジン 1-オキシド、
GA45	Me Me Me Me O Me	3 - (1 - (ベンゾ[d][1、 3]ジオキソールー5 - イル)エ チル) - 1 - ベンジルー1 - (1 、3、3 - トリメチルピペリジン - 4 - イル)尿素、
GA46	Me N O Me N N H	1-エチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-3-(1 -(ナフタレン-1-イル)エチル)尿素、
GA47	Me N O Me OMe	3-(1-(4-メトキシナフタレン-1-イル)エチル)-1- メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA48	Me N O N OH OH OH Me	3- (2-ヒドロキシ-1- (ナ フタレン-1-イル) エチル) - 1-メチル-1- (1-メチルピ ペリジン-4-イル) 尿素、
GA49	Me N O N OH OH OMe	3 - (2 - ヒドロキシ- 1 - (4 - メトキシナフタレン- 1 - イル)エチル)- 1 - メチル- 1 - (1 - メチルピペリジン- 4 - イル)尿素、
GA50	Me N O Me	1 - (1 - メチルピペリジン- 4 - イル)- 3 - (1 - (ナフタレ ン- 1 - イル)エチル)- 1 - (ピリジン- 3 - イルメチル)尿素、
GA51	Me N O Me	1 ーシクロペンチルー1ー(1ー メチルピペリジンー4ーイル)ー 3 ー(1 ー(ナフタレンー1ーイ ル)エチル)尿素、

【表1-8】

GA52	HN O Me N H Me	1ーメチルー3ー(1ー(ナフタ レンー1ーイル)エチル)-1- (ピペリジンー4ーイル)尿素、
GA53	Me N O Me N O N H Me Me	1 - (1 - アセチルピペリジン- 4 - イル) - 1 - メチル-3 - (1 - (ナフタレン-1 - イル)エ チル)尿素、
GA54	MeO ₂ S N O Me N H	1 - メチル - 1 - (1 - (メチル スルホニル)ピペリジン - 4 - イ ル) - 3 - (1 - (ナフタレン - 1 - イル)エチル)尿素、
GA55	O Me N H	1 - メチル - 3 - (1 - (ナフタ レン - 1 - イル)エチル) - 1 - (1 - (ピリジン - 3 - イルメチ ル) ピペリジン - 4 - イル)尿素、
GA56	Me N O Me	1 - シクロヘキシル-1-(1- メチルピペリジン-4-イル)- 3-(1-(ナフタレン-1-イ ル)エチル)尿素、
GA57	Me N O Me	1 - (シクロヘキシルメチル) - 1 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) - 3 - (1 - (ナフタレ ン - 1 - イル)エチル)尿素、
GA58	Me N O Me N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1 - イソプロピルー1 - (1 - メ チルピペリジン-4 - イル)-3 - (1 - (ナフタレン-1 - イル)エチル)尿素、
GA59	Me N O Me N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1 — (2 ーメトキシエチル) — 1 — (1 ーメチルピペリジンー4 ー イル) — 3 — (1 — (ナフタレン — 1 ーイル)エチル)尿素、
GA60	Me N O Me N N H Me	1 - (1 - エチルピペリジン - 4 - イル) - 1 - メチル - 3 - (1 - (ナフタレン - 1 - イル)エチ ル) 尿素、

【表1-9】

GA61	Me O Me N N H	1-エチル-4-(1-メチル- 3-(1-(ナフタレン-1-イ ル)エチル)ウレイド)ピペリジ ン 1-オキシド、
GA62	Me N O Me	1-(シクロプロピルメチル)- 1-(1-メチルピペリジン-4 -イル)-3-(1-(ナフタレ ン-1-イル)エチル)尿素、
GA63	Me N O Me N H MeO	3 - (1 - (2 - メトキシナフタ レン - 1 - イル)エチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチルピペリ ジン - 4 - イル)尿素、
GA64	Me N O Me N H N N	1 - メチル- 1 - (1 - メチルピ ペリジン- 4 - イル)- 3 - (1 - (キノリン- 4 - イル)エチル) 尿素、
GA65	Boc N O Me N H	tertーブチル 4ー(1ーメチ ルー3ー(1ー(ナフタレンー1 ーイル)エチル)ウレイド)ピペ リジンー1ーカルボン酸塩、
GA66	O Me N Me N H Me	1 - (1 - ホルミルピペリジン- 4 - イル) - 1 - メチル-3 - (1 - (ナフタレン-1 - イル)エ チル) 尿素、
GA67	Me N O OMe OMe N H Me	3 - (2 - メトキシ- 1 - (ナフ タレン- 1 - イル)エチル) - 1 - メチル- 1 - (1 - メチルピペ リジン- 4 - イル)尿素、
GA68	Me N O N H	3-(3-メトキシ-1-(ナフタレン-1-イル)プロピル)- 1-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA69	Me N O N Me N Me Me	1ーメチルー1ー(1ーメチルピペリジンー4ーイル)ー3ー(1 ー(ナフタレンー1ーイル)プロピル)尿素、

【表1-10】

GA70	Me N O Me	1ーメチルー1ー(1ーメチルピ ペリジンー4ーイル)-3-(1
	N N N N	- (キノリン-5-イル) エチル
	Me H)尿素,
GA71	Me N O Me Me	1ーメチルー1ー(1ーメチルピ
		ペリジンー4ーイル)-3-(2
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	│-(ナフタレンー1-イル)プロ │ │パン-2-イル)尿素、
GA72	Me	3-(1-(2-クロロキノリン
uz	N O Me	-4-イル)エチル)-1-メチ
	N N N	ルー1ー(1-メチルピペリジン
	Me N	- 4 - イル)尿素、
	ĆI	
GA73	Me N O Me	│ (S)-1-(1-メチルピペリ │ │ ジン-4-イル)-3-(1-(│
	$N \longrightarrow N \longrightarrow$	フラーサーイル/
	H	- 1 - (ピリジン-3-イルメチ
		ル)尿素、
GA74	Me N O Me	(R) -1- (1-メチルピペリ
Grifi	O Me	ジン-4-イル)-3-(1-(
	N N N	ナフタレンー1ーイル)エチル)
		│ - 1 - (ピリジン-3-イルメチ │ │ ル)尿素、
		70/ 水赤、
GA75	Me N O Me	1-イソブチルー1-(1-メチ
		┃ ルピペリジンー4ーイル)-3- ┃ ┃ (1-(ナフタレン-1-イル)
	Me H	(1一(ケファレン 1 ~1ル) エチル)尿素、
	Me	
GA76	Me N O Me	1 - (シクロブチルメチル) - 1
		一(1ーメチルピペリジンー4ー
	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	イル)−3−(1−(ナフタレン −1−イル)エチル)尿素、
GA77	Me N O Me	1ーブチルー1ー(1ーメチルピ
		ペリジンー4ーイル)-3-(1
		ー(ナフタレンー1ーイル)エチ ル)尿素、
		/ // // // // // // // // // // // // /
	Me Me	

【表1-11】

0470	Mo .	0 /4 /0 /155
GA78	Me N O Me N N N N N N N N N N N N N N N N N N	3 - (1 - (2 - メトキシキノリ ン - 4 - イル)エチル) - 1 - メ チル - 1 - (1 - メチルピペリジ ン - 4 - イル)尿素、
	OMe	ノー4ー1ル/
GA79	Me N O Me	1 - (1 - メチルピペリジン- 4
	N	│ ーイル)-3-(1-(ナフタレ │ │ ン-1-イル)エチル)-1-(│
	j H	フー・ーイル/ エデル/ ー・一(ピリジンー2ーイルメチル)尿素
	N	
GA80	Me N O Me	1-(1-メチルピペリジン-4
		┃ ーイル)-3-(1-(ナフタレ ┃ ┃ ン-1-イル)エチル)-1-(┃
	H	ピリジンー4ーイルメチル)尿素
	N N	•
GA81	Me N O Me	(S) -1-エチル-3-(1- (2-メトキシキノリン-4-イ
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	(2~×トヤシヤノリン-4-1 ル)エチル)-1-(1-メチル
	Me H N	ピペリジンー4ーイル)尿素、
0400	OMe OMe	
GA82	Me N O Me	(R)-1-エチル-1-(1- メチルピペリジン-4-イル)-
	N N N	3-(1-(ナフタレン-1-イ
	Me	ル)エチル)尿素、
GA83	Me N O OH	3 - (2 - ヒドロキシ- 1 - (4 - メトキシナフタレン- 1 - イル
	N N N)エチル)-1-メチル-1-(
	Me '' OMe	┃ 1-メチルピペリジン-4-イル ┃ ┃)尿素、
GA84	Me N O OH	3 - (2 - ヒドロキシ - 1 - (ナ
		フタレンー1ーイル) エチル) ー
	N N N	┃ 1 −(1 − メチルピペリジン− 4 ┃ −イル)−1 −(ピリジン−3 −
		イルメチル)尿素、
GA85	Me N O OMe	3-(2-メトキシ-1-(4-
		メトキシナフタレン-1-イル) エチル)-1-メチル-1-(1
	Me H OMe	エテル)
	Olvie	尿素、

【表1-12】

GA86	Me N O Me CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(3-ヒドロキシベンジル)-1-(1- メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA87	Me N Me N Me	1 ーベンジルー1ー(1,3ージ メチルピペリジンー4ーイル)ー 3ー((R)ー1ー(ナフタレン ー1ーイル)エチル)尿素、
GA88	Me Ne Me Ne	1 - (1, 3 - ジメチルピペリジ ン- 4 - イル) - 1 - メチル - 3 - ((R) - 1 - (ナフタレン - 1 - イル)エチル)尿素、
GA89	Me N O Me OMe	3-(1-(4-メトキシナフタレン-1-イル)エチル)-1- メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA90	Me N O Me OMe	(R) -3-(1-(4-メトキ シナフタレン-1-イル) エチル)-1-メチル-1-(1-メチ ルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA91	Me N O Me OMe	(S) -3-(1-(4-メトキ シナフタレン-1-イル) エチル) -1-メチル-1-(1-メチ ルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA92	Me N O Me O Me O Me O Me	3-(1-(4,8-ジメトキシ ナフタレン-1-イル)エチル) -1-メチル-1-(1-メチル ピペリジン-4-イル) 尿素、
GA93	Me N O Me N O OMe	3-(1-(4-(メトキシメト キシ)ナフタレン-1-イル)エ チル)-1-メチル-1-(1- メチルピペリジン-4-イル)尿 素、
GA94	Me N O O CI CI Me	3-(2-(ベンジルオキシ)- 1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-メチルー1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、

【表1-13】

		, , _ , _ ,
GA95	Me N O CI CI N H	(R) -3-(2-(ベンジルオ キシ) -1-(2, 3-ジクロロ フェニル) エチル) -1-メチル -1-(1-メチルピペリジン- 4-イル) 尿素、
GA96	Me N O CI CI Me	(S) -3-(2-(ベンジルオ キシ) -1-(2, 3-ジクロロ フェニル) エチル) -1-メチル -1-(1-メチルピペリジン- 4-イル) 尿素、
GA97	Me N O Me CI CI Me Me	3ー(1ー(2.3ージクロロフェニル)エチル)ー1ーメチルー 1ー(1ーメチルピペリジンー4 ーイル)尿素、
GA98	Me N O Me CI	1 - ベンジル-3 - (1 - (2, 3 - ジクロロフェニル)エチル) -1 - (1 - メチルピペリジン- 4 - イル)尿素、
GA99	Me N O Me CI	3-(1-(2,3-ジクロロフ ェニル)エチル)-1-(3-フ ルオロベンジル)-1-(1-メ チルピペリジン-4-イル)尿素
GA100	Me N O Me CI CI	1-(2-クロロベンジル)-3 -(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチル)ポテル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA101	Me N O Me F	3-(1-(3, 5-ジフルオロフェニル) エチル) -1-メチル -1-(1-メチルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA102	Me N O Me CI	3-(1-(2-クロロフェニル) エチル) -1-メチルー1-(1-メチルピペリジン-4-イル) 尿素、

【表1-14】

GA103	Me N O Me N H H	3 - (1 - (3 - フルオロフェニ ル)エチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イ ル)尿素、
GA104	Me N O Me N H CI	3-(1-(4-クロロフェニル) エチル) -1-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA105	Me N O Me F N H H	3-(1-(2, 4-ジフルオロ フェニル)エチル)-1-メチル -1-(1-メチルピペリジン- 4-イル) 尿素、
GA106	Me N O Me Me	1ーメチルー1ー(1ーメチルピ ペリジンー4ーイル)ー3ー(1 ー(oートリル)エチル)尿素、
GA107	Me N O Me N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1-メチル-1-(1-メチルピ ペリジン-4-イル)-3-(1 -(4-(メチルスルホニル)フ ェニル)エチル)尿素、
GA108	Me N O Me CI	1-(シクロヘキシルメチル)-3 -(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチル)パパリジン-4-イル)尿素、
GA109	Me N O Me CI	1 - (シクロプロピルメチル) - 3 - (1 - (2, 3 - ジクロロフ エニル) エチル) - 1 - (1 - メチルピペリジンー4 - イル) 尿素
GA110	Me N O Me CI CI Me	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-エチルー 1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA111	Me N O Me CI CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-1-(ピリジン-3-イルメチル)尿素、

【表1-15】

GA112	Me N O Me CI	3 - (1 - (3 - クロロフェニル)エチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) 尿素、
GA113	Me N O Me CI	1ーベンジルー3ー(1ー(3ー クロロフェニル)エチル)-1- (1ーメチルピペリジンー4ーイ ル)尿素、
GA114	Me N O Me CI	1-(3-クロロベンジル)-3 -(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA115	Me N O Me CI CI OMe	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(2-メトキシベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素
GA116	Me CI CI MeO	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(3-メトキシベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素
GA117	Me N O Me CI CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(4-フルオロベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA118	Me N O Me CI CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(2-フルオロベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素

【表1-16】

GA119	Me N O Me CI	1-(4-クロロベンジル)-3 -(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA120	Me N O Me CI	3-(1-(3, 4-ジクロロフェニル) エチル) -1-メチルー 1-(1-メチルピペリジン-4- ーイル) 尿素、
GA121	Me N O Me CI CI MeO	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(4-メトキシベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA122	Me N O N H CI	3- (1-(2,3-ジクロロフェニル)プロピル)-1-エチル-1-(1-メチルピペリジンー4-イル)尿素、
GA123	Me N O Me CI CI	1 ー (シクロヘキシルメチル) ー 3 ー (1 ー (2, 3 ージクロロフ ェニル) プロピル) ー 1 ー (1 ーメ チルピペリジンー 4 ーイル) 尿素
GA124	Me N O Me F F Me H	3 - (1 - (2、3 - ジフルオロ フェニル)エチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチルピペリジン- 4 - イル)尿素、
GA125	Me N O Me F F	1 ーベンジルー3 ー(1 ー(2, 3 ージフルオロフェニル)エチル) ー 1 ー(1 ーメチルピペリジン ー 4 ーイル)尿素、
GA126	Me N O Me F F	1 - (シクロヘキシルメチル)- 3 - (1 - (2、3 - ジフルオロ フェニル)エチル) - 1 - (1 - メチルピペリジン-4 - イル)尿 素、

【表1-17】

GA127	Me N O Me CI	(R) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1- エチル-1-(1-メチルピペリ ジン-4-イル) 尿素、
GA128	Me N Me CI CI	1 ーベンジルー3 ー(1 ー(2、 3 ージクロロフェニル)エチル) -1 ー(1、3 ージメチルピペリ ジンー4 ーイル)尿素、
GA129	Me N Me CI N H CI N H H	3- (1- (2, 3-ジクロロフ ェニル) エチル) -1- (1, 3 -ジメチルピペリジン-4-イル) -1-メチル尿素、
GA130	Me N Me CI CI Me Me	(S) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1- エチルー1-(1-メチルピペリ ジン-4-イル) 尿素、
GA131	Me N O Me CI	(R) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1- エチルー1-(1-メチルピペリ ジン-4-イル) 尿素、
GA132	Me O Me CI	3-(1-(2,3-ジクロロフ ェニル)エチル)-1-エチルー 1-(1-メチルピペリジン-4 ーイル)尿素、
GA133	Me N Me CI CI MeO Me CI OMe	3-((R)-1-(2,3-ジ クロロー4-メトキシフェニル) エチル)-1-(1,3-ジメチ ルピペリジン-4-イル)-1- (3-メトキシベンジル)尿素、
GA134	Me N Me O Me CI N N N N O Me O Me O Me	3-((S)-1-(2,3-ジ クロロー4-メトキシフェニル) エチル)-1-(1,3-ジメチ ルピペリジン-4-イル)-1- (3-メトキシベンジル)尿素、

【表1-18】

GA135	Me N Me CI N N N N N N N N N N N N N N N N N N	3-(1-(2,3-ジクロロ- 4-メトキシフェニル)エチル) -1-(1,3-ジメチルピペリ ジン-4-イル)-1-(3-メ トキシベンジル)尿素、
GA136	Me N Me O Me F F MeO N H	3-(1-(2, 3-ジフルオロフェニル) エチル) -1-(1, 3-ジメチルピペリジン-4-イル) -1-(3-メトキシベンジル) 尿素、
GA137	Me N O Me CI CI	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(4-(ヒドロキシメチル)ベンジル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA138	Me CI CI MeO ₂ C	メチル 4ー((3ー(1ー(2, 3ージクロロフェニル)エチル) -1ー(1ーメチルピペリジンー 4ーイル)ウレイド)メチル)安 息香酸塩、
GA139	Me N O N CI CI Me Me	3-(2-シクロプロピル-1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-メチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA140	Me N O OHCI CI	3-(1-(2,3-ジクロロフ ェニル)-2-ヒドロキシエチル)-1-メチル-1-(1-メチ ルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA141	Me N O Me CI	(R) -1-(2-クロロベンジル) -3-(1-(2, 3-ジクロロフェニル) エチル) -1-(1-メチルピペリジン-4-イル) 尿素、

【表1-19】

04440	Ma	(S) -1-(2-クロロベンジ
GA142	Me N O Me CI CI	(S) - 1- (2-9000へ)シ ル) - 3- (1-(2, 3-ジク ロロフェニル) エチル) - 1- (1-メチルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA143	Me N O Me CI	1-(2-クロロベンジル)-3 -(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA144	Me N O Me OMe OMe OMe OMe	3-(1-(2,3-ジメトキシ フェニル)エチル)-1-メチル -1-(1-メチルピペリジン- 4-イル)尿素、
GA145	Me N O Me F F F Me OMe	3-(1-(2,3-ジフルオロ -4-メトキシフェニル)エチル)-1-メチル-1-(1-メチ ルピペリジン-4-イル) 尿素、
GA146	Me N O CI CI Me CI Me	3 - (1 - (2, 3 - ジクロロフ ェニル) - 2 - メトキシエチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチル ピペリジン - 4 - イル) 尿素、
GA147	Me N O Me CI CI NHAc	N-(2, 3-ジクロロ-4-(1-(3-メチル-3-(1-メ チルピペリジン-4-イル)ウレ イド)エチル)フェニル)アセト アミド、
GA148	Me N O Me CI CI NH ₂	3-(1-(4-アミノ-2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1 ーメチル-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA149	Me N O Me CI CI N N H O OMe	3 - (1 - (2, 3 - ジクロロー 4 - メトキシフェニル)エチル) - 1 - メチルー 1 - (1 - メチル ピペリジン - 4 - イル)尿素、

【表1-20】

CALEO		1-エチルー1-(1-メチルピ
GA150	Me N O	
	N O N H	キシ) フェニル) プロピル) 尿素
GA151	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1ーメチルー1ー(1ーメチルピ
"""		ペリジンー4ーイル)-3-(1
	,	-(ナフタレン-1-イル)-3
	Me N O	- (ピリジンー3ーイル) プロピ
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	ル)尿素、
	Me H	
GA152	0	1-メチルー1-(1-メチルピ
		ペリジンー4ーイル)-3-(3
	Me.	│ ―モルホリノー1―(ナフタレン │ │ ―1ーイル)プロピル)尿素、
	Me N O	
ļ	N N N	
	Me 🥠	
GA153	OMe	1-エチル-3-(3-(3-メ トキシフェニル)-1-(ナフタ
		トキシフェール) - 1 - () ファ レン - 1 - イル)プロピル) - 1
	Me N O	- (1-メチルピペリジン-4-
		イル)尿素、
	N N Y	
	Me	
GA154	OBn	│ 3-(3-(3-(ベンジルオキ │ シ)フェニル)-1-(ナフタレ
		ン/ フェール/
	Me N O	エチルー1ー(1ーメチルピペリ
		ジンー4ーイル)尿素、
	N, M,	
GA155	Me	1-エチル-1-(1-メチルピ
UNIOD	[` <u>`</u>	ペリジンー4ーイル)-3-(1
	<u> </u>	- (ナフタレン-1-イル)-3
	Me N O	- (ピリジン-3-イル)プロピ
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	ル)尿素、
	Me H	
L	1410	1

【表1-21】

GA156	OBn	3-(3-(3-(ベンジルオキ
unio		シ)フェニル)-1-(ナフタレ
		ンー1ーイル)プロピル)-1-
1	Me N O	(1-メチルピペリジン-4-イ
		ル)-1-(ピリジン-3-イル
	N N N	メチル)尿素、
	l H	
GA157	OBn	3-(3-(3-(ベンジルオキ
uA107		シ) フェニル) -1-(2, 3-
		ジクロロフェニル) プロピル) ー
	Me N O CI	1 メチルー1 (1 メチルピ
	1 1 1	│ペリジンー4ーイル)尿素、 │
	N H CI	
	Me —	
GA158	Me N O CI	3 - (2 - (ベンジルオキシ) -
1		1-(2.3-ジクロロフェニル
	N N N)エチル)-1-メチル-1-(
	Me H	1 - メチルピペリジン- 4 - イル
)尿素、
GA159		3-(2-(ベンジルアミノ)-
		1 (2, 3 ジクロロフェニル
	Me N O NHCI	┃)エチル)-1-メチル-1-(┃ ┃1-メチルピペリジン-4-イル ┃
		「一メテルこへリシンー4ー1ル)尿素、
	N N N CI) 冰糸、
	N N H Me	
GA160		3-(1-(2,3-ジクロロフ
	人	ェニル)-2-((3-(ヒドロ
	Me. \sim OH	キシメチル)ベンジル)オキシ)
	Me N O CI OH	エチル)-1-メチル-1-(1
	CI	ーメチルピペリジンー4ーイル)
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	「尿素、
GA161	Me. OBn	3-(2-(ベンジルオキシ)-
		1-(2,3-ジクロロフェニル
	N N N CI) エチル) -1-(2-クロロベ
-	N N N	ンジル)-1-(1-メチルピペ
		リジンー4ーイル)尿素、
	CI	

【表1-22】

GA162	Me N O CI	3-(2-(ベンジルオキシ)-
	i d d d a	1-(2.3-ジクロロフェニル)
	N N N	 エチル)-1-(4-(ヒドロキ
	H	シメチル)ベンジル)-1-(1
		-メチルピペリジン-4-イル)
	HO	尿素、
GA163	OMe	3-(1-(2, 3-ジクロロフ
		┃ェニル)−2−((4−メトキシ ┃
		ベンジル) オキシ) エチル) - 1
	Me N O O CI	ーメチルー1ー(1-メチルピペ
		リジンー4ーイル)尿素、
	N N CI	
	Me H	
GA164	N	3-(1-(2, 3-ジクロロフ
	Ĺij	ェニル)-2-(ピリジン-4-
		イルメトキシ)エチル)-1-メ
	Me N O C	チルー1-(1-メチルピペリジ
		ンー4ーイル)尿素、
	$\langle N, N, N \rangle$	
	Me H	
GA165	Me`Ņ∕ O Me Cl	3-(1-(2, 3-ジクロロー
		┃ 4 − メトキシフェニル)エチル) ┃
	N N N CI	- 1 - メトキシー 1 - (1 - メチ
	OMe HOMe	┃ルピペリジンー4ーイル)尿素、 ┃
GA166		(S) -3-(1-(2, 3-ジ
UATOO	Me N O Me CI	(3)
	$\bigcap_{N} \bigcap_{N} \bigcap_{i} C_i$	プロローなーストギンフェール/ エチル)-1-メトキシ-1-(
	OMe H	エテル)
	OMe	
CA167	Ma	
GA167	Me N O Me CI	(R) -3- (1- (2, 3-ジ
	C	クロロー4ーメトキシフェニル) ァエリン 1 メーキシ
	N N Y	エチル)-1-メトキシ-1-(
	OMe '' OMe	1 ーメチルピペリジンー4 ーイル 、
01400	Ma) 尿素、
GA168	Me N O Me	1-ヒドロキシー3ー(1ー(4
		ーメトキシナフタレンー1ーイル
	N N N) エチル) — 1 — (1 — メチルピ
	OH "OMe	ペリジンー4ーイル)尿素、

【表1 - 2 3】

GA169	Me N O Me OMe	(R)-1-ヒドロキシ-3-(1-(4-メトキシナフタレン- 1-イル)エチル)-1-(1- メチルピペリジン-4-イル)尿 素、
GA170	Me N O Me OMe	(S) -1-ヒドロキシ-3-(1-(4-メトキシナフタレン- 1-イル) エチル) -1-(1- メチルピペリジン-4-イル) 尿 素、
GA171	Me N O Me CI CI OMe	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-メトキシ-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、
GA172	Me N O Me CI	(R) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1- メトキシー1-(1-メチルピペ リジン-4-イル) 尿素、
GA173	Me N O Me CI CI OMe	(S) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1- メトキシー1-(1-メチルピペ リジン-4-イル) 尿素、
GA174	Me N O Me OMe OMe	1-メトキシ-3-(1-(4- メトキシナフタレン-1-イル) エチル)-1-(1-メチルピペ リジン-4-イル) 尿素、
GA175	Me N O Me OMe	(R) - 1 - メトキシ-3 - (1 - (4 - メトキシナフタレン-1 - イル) エチル) - 1 - (1 - メ チルピペリジン-4 - イル) 尿素
GA176	Me N O Me OMe	(S) -1-メトキシ-3-(1 -(4-メトキシナフタレン-1 -イル) エチル) -1-(1-メ チルピペリジン-4-イル) 尿素
GA177	Me N O Me CI CI OH H	3-(1-(2,3-ジクロロフェニル)エチル)-1-ヒドロキシ-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)尿素、

【表1-24】

GA178	Me Cl	(R) -3-(1-(2, 3-ジ クロロフェニル) エチル) -1-
	CI CI	ヒドロキシー1-(1-メチルピ
	OH H	ペリジンー4ーイル)尿素、
21172	<u> </u>	
GA179	Me N O Me CI	(\$) -3-(1-(2, 3-ジ
		クロロフェニル) エチル) ー 1 ー
		ヒドロキシー1ー(1ーメチルピ
	ŎН '' 🤍	ペリジンー4ーイル)尿素、
GA180	Me Ņ O Me CI	3-(1-(2,3-ジクロロー
		4 - メトキシフェニル)エチル)
		- 1 - ヒドロキシー 1 - (1 - メ
	OMe OMe	チルピペリジンー4ーイル) 尿素
		`
GA181	Me N O Me CI	(R) -3-(1-(2, 3-ジ
		クロロー4ーメトキシフェニル)
		エチル) - 1 - ヒドロキシ-1 -
	OH H OMe	(1-メチルピペリジン-4-
		イル)尿素、
GA182	Me N O Me CI	(5) -3-(1-(2, 3-ジ
		クロロー4ーメトキシフェニル)
	I H H H	エチル) - 1 - ヒドロキシ-1 -
	OH OMe	(1ーメチルピペリジンー4ー
		イル)尿素、
GA183	Me N O Me CI	3-(1-(2, 3-ジクロロ-
		4 ー (ジメチルアミノ) フェニル
	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N) エチル) ー 1 ーメチルー 1 ー (
	Ме ^п _N _Ме	1 ーメチルピペリジンー4ーイ ::
	Me	ル)尿素、
GA184	Me N O Me	3- (1- (4- ((4-メトキ
	N O Me	シベンジル) オキシ) ナフタレン
1		- 1 - イル) エチル) - 1 - メチ
	Me ''	ルー1ー(1ーメチルピペリジン
	OMe	一4-イル)尿素、
GA185	Me ^	3-(1-(4-ヒドロキシナフ
"""	O Me	•
	/	┃ タレンー1ーイル) エチル)-1 ┃ ーメチルー1ー(1ーメチルピペ
	Me H	リジンー4ーイル)尿素、
	OH	

【表1-25】

GA186	Me N O Me	3-(1-(4, 5-ジメトキシ
unitio0	N O Me	し 、 、 、 、 、
	N N OMe	- 1 - メチル - 1 - (1 - メチル
	Me H OMe	ピペリジンー4ーイル)尿素、
GA187		3-(1-(2, 3-ジクロロフ
	, N	ェニル)-2-(ピリジン-3-
		イルメトキシ)エチル)-1-メ
	Me N O O CI	チルー1-(1-メチルピペリジ
	CI	ンー4ーイル)尿素、
	Me H	
GA188	Me N O Me Cl	3-(1-(4-クロロベンゾ[
		┃ d][1,3]ジオキソール-5 ┃
	N N N	ーイル)エチル)-1-メチル-
	Me H	1 – (1 – メチルピペリジン – 4
04100	Mo	ーイル)尿素、
GA189	Me N O Me CI	│ 3-(1-(2-クロロ-3, 4- │ │ ジメトキシフェニル)エチル)-
	OMe	ファドインフェール/ エデル/ ー 1-メチルー1-(1-メチルピ
	Me H	ペリジンー4ーイル) 尿素、
GA190	Me ^	1-メチルー1-(1-メチルピ
UATEU	Me CI	イーステルー ー (ー / テルヒ ペリジンー4ーイル) -3-(1
	N N CI	- (2, 3, 4ートリクロロフェ
	Me H CI	ニル)エチル)尿素、
GA191	Me N O Me	1-メチル-1-(1-メチルピ
	N O Me	┃ペリジンー4ーイル)-3-(1 ┃
	, H	┃ ─ (4−(ピリジン−4−イルメ ┃
	Me ''	トキシ)ナフタレン-1-イル)
	N	エチル)尿素、
GA192		3- (1- (6-クロロー [1,
	Me N O Me	1'ービフェニル]-2-イル]
		エチル)-1-メチル-1-(1
	, N, N,	│ - メチルピペリジン-4 - イル) │ │ 尿素、
	Me ''	
GA193	N	3-(1-(3-/0-2-(
	Me N O Me	ピリジンー4ーイル)フェニル) エエリンニ1-4エリニ1-(1
	N O Me	エチル)-1-メチル-1-(1 ーメチルピペリジン-4-イル)
	$\langle N, N, N \rangle$	一ステルにベリシンー4ー1ル/ 尿素、
	Me H	#12/13 ·

【表1-26】

04404	Mo	0 /1 /0 0 55555
GA194	Me CI	3-(1-(2,3-ジクロロ- 4-メチルフェニル)エチル)-
	N N CI	4一メチルフェール/ エナル/ 一 1-メチルー1-(1-メチルピ
	N N N Mo	ペリジンー4ーイル)尿素、
GA195		3-(1-(3-クロロ-2-メ
UAT90	Me Ne Me	3
	$N \longrightarrow N \longrightarrow CI$	チルー1-(1-メチルピペリジ
	N N N H	ンー4ーイル)尿素、
GA196	ОН	3-(1-(2, 3-ジクロロフ
		ェニル)-2-((4-(ヒドロ
		キシメチル)ベンジル)オキシ)
	Me N O O CI	エチル) — 1 — メチルー 1 — (1
	【	-メチルピペリジン-4-イル)
	N N N H	尿素、
GA197	Me N O Me CI	3-(1-(2, 3-ジクロロ-
	N O Me CI	4 - メトキシフェニル)エチル)
		┃ − 1 −メチル− 1 −(1 −メチル ┃
	Me '' OMe	ピペリジンー4ーイル)尿素、
GA198	Me N O Me CI	(R) -3-(1-(2, 3-ジ
	O Me CI	クロロー4ーメトキシフェニル)
	$\langle N, N, N, N \rangle$	エチル)-1-メチル-1-(1
	Me H OMe	-メチルピペリジン-4-イル)
		尿素、
GA199	Me N O Me CI	(S) - 3 - (1 - (2, 3 - 3))
		クロロー4ーメトキシフェニル)
	N N N	┃ エチル)-1-メチル-1-(1 ┃ -メチルピペリジン-4-イル)
	Me '' OMe	ーメテルとへりシンー4ーイル/ 尿素、
GA200	Me	水糸、 3-(1-(2, 3-ジクロロー
UAZUU	Me Me CI	4 - メトキシフェニル) エチル) -
		1-メチル-1-(1, 3, 3-
	N N N	トリメチルピペリジンー4ーイル
	Me)尿素、
GA201	Me Me CI	3-((R)-1-(2, 3-ジ
	Me N Me CI	クロロー4ーメトキシフェニル)
	N N N I	エチル) -1-メチル-1-(1
	Me H	, 3, 3-トリメチルピペリジン
	OMe	-4-イル)尿素、

【表1-27】

GA202	Me Me CI CI N H O Me CI OMe	3-((S)-1-(2,3- ジクロロ-4-メトキシフェ ニル)エチル)-1-メチルー 1-(1,3,3-トリメチル ピペリジン-4-イル) 尿素、 及び
GA203	Me N O Me N O Me N O O O O O O O O O O O O O O O O O O	3 - (1 - (4 - (2 - (ベンジルオキシ) エトキシ) ナフタレン - 1 - イル) エチル) - 1 - メチル - 1 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) 尿素

から成る群から選定される化合物又はその医薬として許容される塩。

【請求項11】

3 - ((S) - 1 - (2,3 - ジクロロ - 4 - メトキシフェニル)エチル) - 1 - メチル - 1 - (1,3,3 - トリメチルピペリジン - 4 - イル)尿素(GA202)、又はその医薬として許容される塩。

【請求項12】

請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬として許容される塩、及び1つ以上の医薬として許容される賦形剤を含有する、医薬組成物。

【請求項13】

ヒト対象のグレリン受容体を作動させる(agonize)ための医薬組成物であって、治療有効量の、請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬として許容される塩を含む、当該医薬組成物。

【請求項14】

ヒト対象のグレリン受容体の発現又は活性に関連する疾患又は障害を治療するための医薬組成物であって、治療有効量の、請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬として許容される塩を含む、当該医薬組成物。

【請求項15】

前記疾患が、神経性無食欲、術後イレウス(POI)、糖尿病性胃不全まひ、オピオイド誘発性腸機能障害、過敏性腸症候群、胃炎、酸逆流性疾患、胃不全まひ、機能性消化不良、悪心、疼痛、嘔吐、便秘、消化管運動、腎不全、プラダーウィリ症候群、癌による悪液質、鬱血性心不全、及び加齢又はAIDSによる消耗からなる群から選択される、請求項14に記載の医薬組成物。