

【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12月25日(2008.12.25)

【公表番号】特表2008-519833(P2008-519833A)

【公表日】平成20年6月12日(2008.6.12)

【年通号数】公開・登録公報2008-023

【出願番号】特願2007-541137(P2007-541137)

【国際特許分類】

C 07 D 231/56	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 K 31/416	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 B 61/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 231/56	C S P D
A 61 P 25/00	
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/28	
A 61 P 9/00	
A 61 P 1/04	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/22	
A 61 K 31/416	
C 07 D 231/56	F
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/454	
C 07 D 405/12	
C 07 D 401/12	
C 07 D 409/12	
C 07 D 413/12	
A 61 K 31/4439	

A 6 1 K 31/506
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年11月6日(2008.11.6)

【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

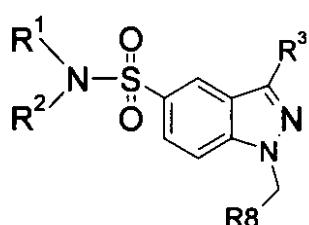
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



I

の化合物、その医薬上許容しうる塩。

式中、

R^1 は、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル- C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^1 の定義に用いた C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル- C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び- NR^4R^5 から選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており； C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル及び C_{3-6} ヘテロシクリル- C_{1-6} アルキルから選ばれる1つ又はそれ以上の置換基を有し；

R^2 は、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル- C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^2 の定義に用いた C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル- C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び- NR^4R^5 から選ばれる1つ

又はそれ以上の基によって場合により置換されており； C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル及び C_{3-6} ヘテロシクリル- C_{1-6} アルキルから選ばれる1つ又はそれ以上の置換基を有し；

場合により R^1 及び R^2 は、それらが結合しているNと一緒にになって3-10員の芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環を形成することができ；ここにおいて該芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロゲン、アミノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ-C₁₋₆アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、カルボニル、カルバモイル、アセチル、アセチルアミノ及びヒドロキシから独立して選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R^3 は、水素、ハロゲン、アミノ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 R^4R^5 N-、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール及び C_{3-6} ヘテロシクロアルキルから選ばれ、ここにおいて R^3 の定義に用いたアミノ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 R^4R^5 N-、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール及び C_{3-6} ヘテロシクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び-NR⁴R⁵から選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

ここにおいて R^4 及び R^5 は、-H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、及び別の二価の R^4 又は R^5 と一緒にになって環又は環の一部を形成することができる二価の C_{1-6} 基から独立して選ばれ、ここにおいて該環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル及びヒドロキシから選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；そして

R^8 は、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール-C₁₋₆アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル、 C_{6-10} アリール-C(=O)-C₁₋₆アルキル、 C_{1-10} ヒドロカルビルアミノ、 C_{6-10} アリール-C(=O)-、又は C_{3-6} ヘテロシクリル-C(=O)-から選ばれ；ここにおいて R^8 の定義に用いた C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール-C₁₋₆アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル、 C_{6-10} アリール-C(=O)-C₁₋₆アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C(=O)-C₁₋₆アルキル、 C_{1-10} ヒドロカルビルアミノ、 C_{6-10} アリール-C(=O)-、又は C_{3-6} ヘテロシクリル-C(=O)-は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ及び-NR⁴R⁵から選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されている。

【請求項2】

式Iにおいて、

R^1 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-6} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、フェニル、フェニル-C₁₋₄アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル又は C_{1-4} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^1 の定義に用いた C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-6} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル-C₁₋₆アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル-C₁₋₆アルキル、フェニル、フェニル-C₁₋₄アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル又は C_{1-4} アルコキシカルボニルは、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{1-4} アルコキシ、アミノ、オキソ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール-C₁₋₄アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル-C₁₋₄ア

ルキル及び - NR⁴R⁵から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R²は、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₃₋₁₀シクロアルキル - C₁₋₆アルキル、C₄₋₈シクロアルケニル - C₁₋₆アルキル、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₆アルキル又はC₁₋₄アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいてR²の定義に用いたC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₃₋₁₀シクロアルキル - C₁₋₆アルキル、C₄₋₈シクロアルケニル - C₁₋₆アルキル、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₆アルキル又はC₁₋₄アルコキシカルボニルは、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₁₋₄アルコキシ、アミノ、オキソ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリール - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₄アルキル及び - NR⁴R⁵から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R¹及びR²は、それらが結合しているNと一緒にになって 3 - 6 員の芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環を形成することができ；ここにおいて該芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環は、水素、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、ハロゲン、アミノ、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ - C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、カルボニル、カルバモイル、アセチル、アセチルアミノ及びヒドロキシから独立して選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R³は、水素、ハロゲン、アミノ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₃₋₅ヘテロアリール、R⁴R⁵N - 、C₃₋₆シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル - C₁₋₄アルキル、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₄アルキルから選ばれ；ここにおいてR³の定義に用いたアミノ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₃₋₅ヘテロアリール、R⁴R⁵N - 、C₃₋₆シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル - C₁₋₄アルキル、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₄アルキルは、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、ハロゲン、C₁₋₄アルコキシ、アミノ、ニトロ、シアノ、オキソ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、C₁₋₆シクロアルキル - C₁₋₆アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₆アルキル、及び - NR⁴R⁵から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

ここにおいてR⁴及びR⁵は、 - H、C₁₋₄アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、及び別の二価のR⁴又はR⁵と一緒にになって環又は環の一部を形成することができる二価のC₁₋₆基から独立して選ばれ、ここにおいて該環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル及びヒドロキシから選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；そして

R⁸は、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₆₋₁₀アリール、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₄アルキルから選ばれ；ここにおいてR⁸の定義に用いたC₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₆₋₁₀アリール、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₄アルキルは、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、ニトロ、オキソ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び - NR⁴R⁵から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式 I において、

R¹は、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₈シクロアルキル、C₄₋₆シクロアルケニル、C₄₋₈シクロアルケニル - C₁₋₆アルキル、C₃₋₈シクロアルキル - C₁₋₄アルキル、フェニル、フェニル - C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル - C₁₋₆アルキル、

リル - C_{1-4} アルキル又は C_{1-2} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^1 の定義に用いた C_{1-6} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{4-6} シクロアルケニル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル、フェニル、フェニル - C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル又は C_{1-2} アルコキシカルボニルは、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン、 C_{1-4} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ヒドロキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル、 C_{6-8} アリール、 C_{6-8} アリール - C_{1-4} アルキルから選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{4-6} シクロアルケニル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル、フェニル、フェニル - C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル又は C_{1-2} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^2 の定義に用いた C_{1-6} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{4-6} シクロアルケニル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル - C_{1-4} アルキル、フェニル、フェニル - C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル又は C_{1-2} アルコキシカルボニルは、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン、 C_{1-4} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ヒドロキシ、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-4} アルキル、 C_{6-8} アリール、 C_{6-8} アリール - C_{1-4} アルキルから選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

R^1 及び R^2 は、それらが結合しているNと一緒にあって1,2,3,6 - テトラヒドロ - ピリジニル、1,2,3 - オキサジアゾリル、1,2,3 - チアジアゾリル、1,2,3 - トリアゾリル、1,2,4 - オキサジアゾリル、1,2,4 - チアジアゾリル、1,2,4 - トリアゾリル、1,3,4 - オキサジアゾリル、1,3,4 - チアジアゾリル、1,3,4 - トリアゾリル、1,3 - ジオキサン二ル、1,3 - ジオキセバニル、1,4 - ベンゾジオキサン二ル、1,4 - ジヒドロピリジニル、1,4 - ジオキサン二ル、2,3,4,7 - テトラヒドロ - 1H - アゼビニル、2,3 - ジヒドロベンゾフラニル、2,3 - ジヒドロフラニル、2,3 - ジヒドロピラニル、2,5 - ジヒドロフラニル、4,7 - ジヒドロ - 1,3 - ジオキセビニル、アゼチジニル、アジリジニル、ベンゾフラニル、クロマニル、クロメニル、ジオキサン二ル、ジオキソラニル、フラザニル、フリル、ヘキサメチレンホモピペラジニル、イミダゾリジニル、インダゾリル、インドリジニル、イソベンゾフラニル、イソクロマニル、イソインドリニル、イソキノリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、モルホリニル、ナフチリジニル、オキサゾリル、オキセタニル、オキシジル、オキシラニル、フェノキサチニル、フタラジニル、フェニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ブリニル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリジニル、キナゾリニルキノリニル、キノキサリニルスルホラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロキノリニル、テトラゾリル、チアントレニル、チアゾリル、チエニル、チエタニル、チラニル、チオモルホリニル、チオファニル、チオピラニル、トリアジニル及びキサンテニルから選ばれる基を形成することができ；

ここにおいて R^1 及び R^2 一緒に定義に用いた1,2,3,6 - テトラヒドロピリジニル、1,2,3 - オキサジアゾリル、1,2,3 - チアジアゾリル、1,2,3 - トリアゾリル、1,2,4 - オキサジアゾリル、1,2,4 - チアジアゾリル、1,2,4 - トリアゾリル、1,3,4 - オキサジアゾリル、1,3,4 - チアジアゾリル、1,3,4 - トリアゾリル、1,3 - ジオキサン二ル、1,3 - ジオキセバニル、1,4 - ベンゾジオキサン二ル、1,4 - ジヒドロピリジニル、1,4 - ジオキサン二ル、2,3,4,7 - テトラヒドロ - 1H - アゼビニル、2,3 - ジヒドロベンゾフラニル、2,3 - ジヒドロフラニル、2,3 - ジヒドロピラニル、2,5 - ジヒドロフラニル、4,7 - ジヒドロ - 1,3 - ジオキセビニル、アゼチジニル、アジリジニル、ベンゾフラニル、クロマニル、クロメニル、ジオキサン二ル、ジオキソラニル、フラザニル、フリル、ヘキサメチレンホモピペラジニル、イミダゾリジニル、インダゾリル、インドリジニル、イソベンゾフラニル、イソクロマニル、イソインドリニル、イソキノリニル、イソチアゾリル、イソオキサゾリル、モルホリニル、ナフチリジニル、オキサゾリル、オキセタニル、オキシジル、オキシラニル、フェノキサ

チイニル、フタラジニル、フェニル、ピペラジニル、ピペリジニル、プリニル、ピラニル、ピラジニル、ピラゾリジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリジニル、キナゾリニルキノリニル、キノキサリニルスルホラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロキノリニル、テトラゾリル、チアントレニル、チアゾリル、チエニル、チエタニル、チラニル、チオモルホリニル、チオファニル、チオピラニル、トリアジニル及びキサンテニルは、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、水素、ハロゲン、アミノ、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₂アルキル、C₁₋₃アルコキシカルボニル、カルボニル、カルバモイル、アセチル、アセチルアミノ及びヒドロキシから選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R³は、水素、ハロゲン、アミノ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル-C₁₋₄アルキルから選ばれ、ここにおいてR³の定義に用いたアミノ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクリル又はC₃₋₆ヘテロシクリル-C₁₋₄アルキルは、C₁₋₆アルキル、ハロゲン、C₁₋₂アルコキシ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、C₃₋₆ヘテロシクリル、C₃₋₆ヘテロシクリル-C₁₋₆アルキル及び-NR⁴R⁵から選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

ここにおいてR⁴及びR⁵は、-H、C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、及び別の二価のR⁴又はR⁵と一緒にになって環又は環の一部を形成することができる二価のC₁₋₄基から独立して選ばれ；ここにおいて該環は、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル及びヒドロキシから選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；そして

R⁸は、フェニル、アリル、フェニル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₃₋₆シクロアルキル、及びC₄₋₆シクロアルケニルから選ばれ、ここにおいてR⁸の定義に用いたフェニル、フェニル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルケニル-C₁₋₄アルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル-C₁₋₄アルキル、C₆₋₁₀アリール、C₃₋₆シクロアルキル、及びC₄₋₆シクロアルケニルは、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、アミノ、シアノ、オキソ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び-NR⁴R⁵から選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

式Iにおいて、

R¹は、水素、メチル、エチル、プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、t-ペンチル、ヘキシル、プロペニル、ブテニル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、フェニルメチル、2-フェニルエチル、ピリミジニル、フラニルメチル、ピリジニルメチル、ピラジニルメチル又はメトキシカルボニルから選ばれ；ここにおいてR¹の定義に用いたエチル、プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、t-ペンチル、ヘキシル、プロペニル、ブテニル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、フェニルメチル、2-フェニルエチル、ピリミジニル、フラニルメチル、ピリジニルメチル、ピラジニルメチル又はメトキシカルボニルは、C₁₋₃アルキル、ハロゲン、C₁₋₃アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ヒドロキシ、ピロリジニル及びフェニルメチルから選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

R²は、水素、メチル、エチル、プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、t-ペンチル、ヘキシル、プロペニル、ブテニル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、テトラヒドロチオフェニル

、フェニル、フェニルメチル、2-フェニルエチル、ピリミジニル、フラニルメチル、ピリジニルメチル、ピラジニルメチル又はメトキシカルボニルから選ばれ；ここにおいてR²の定義に用いたエチル、プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、t-ペンチル、ヘキシル、プロペニル、ブテニル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、テトラヒドロチオフェニル、フェニル、フェニルメチル、2-フェニルエチル、ピリミジニル、フラニルメチル、ピリジニルメチル、ピラジニルメチル又はメトキシカルボニルは、C₁₋₃アルキル、ハロゲン、C₁₋₃アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ヒドロキシ、ピロリジニル及びフェニルメチルから選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

R¹及びR²は、それらが結合しているNと一緒にシクロヘキシル、1,2,3,6-テトラヒドロピリジニル、ピペリジニル、ピロリジニル、ピロリニル、ピペラジニル又はモルホリニルから選ばれる基を形成することができ；ここにおいてR¹及びR²一緒に定義に用いたシクロヘキシル、1,2,3,6-テトラヒドロピリジニル、ピペリジニル、ピロリジニル、ピロリニル、ピペラジニル又はモルホリニルは、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、水素、ハロゲン、アミノ、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルコキシ-C₁₋₂アルキル、C₁₋₃アルコキシカルボニル、カルボニル、カルバモイル、アセチル、アセチルアミノ及びヒドロキシから選ばれる1つまたはそれ以上の基によって場合により置換されており；

R³は、水素、CI、ジエチルアミノ、シクロヘキシルメチルアミノ、ピペリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、ピロリジニル、t-ブチル、n-ブチル、2-メチル-2-ブチル、イソペンチル、2-メトキシ-2-プロピル、2-ヒドロキシル-プロピル、1-メチル-プロピル、1,1-ジメチルプロピル、1,1-ジメチル-3-ブテン-1-イル、エチル、2-プロピル及び-NR⁴R⁵から選ばれ；ここにおいてR³の定義に用いたジエチルアミノ、シクロヘキシルメチルアミノ、ピペリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、ピロリジニル、t-ブチル、n-ブチル、2-メチル-2-ブチル、イソペンチル、2-メトキシ-2-プロピル、2-ヒドロキシル-プロピル、1-メチル-プロピル、1,1-ジメチル-プロピル、1,1-ジメチル-3-ブテン-1-イル、エチル、2-プロピル及び-NR⁴R⁵は、水素及びメチルから選ばれる1つ又はそれ以上の基で場合により置換されており；

ここにおいてR⁴及びR⁵は、-H、C₁₋₃アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル及び別の二価のR⁴又はR⁵と一緒にモルホリニル及びピペラジニルから選ばれる基を形成することができる二価のC₁₋₄基から独立して選ばれ；ここにおいてモルホリニル及びピペラジニルは、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル及びヒドロキシから選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；そして

R⁸は、フェニル、アリル、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロブチル、シクロプロピル、シクロヘキシル、シクロペンチル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフラニル、1-ピペリジニル、N-メチル-2-ピペリジニル及びベンジルから選ばれ；ここにおいてR⁸の定義に用いたフェニル、シクロヘキシル、シクロペンチル、シクロブチル、シクロプロピル、シクロヘキシル、シクロペンチル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフラニル、1-ピペリジニル、N-メチル-2-ピペリジニル及びベンジルは、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、フッ素、塩素、アミノ、シアノ、オキソ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ及びトリフルオロメチルから選ばれる1つまたはそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

1-[(3-クロロフェニル)メチル]-N-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-3-(1-ピロリジニル)-1H-インダゾール-5-スルホンアミド、N-(シクロプロピルメチル)-3-(ジエチルアミノ)-1-[(4-フルオロフェニル)メチル]-N-プロピル-1H-インダゾール-5-スルホンアミド、N-(シクロプロピルメチル)-1-[(2,6-ジクロロフェニル)メチル]-3-(ジエチルアミノ)-N-プロピル-1H-インダゾール-5-スルホンアミド、3-(ジエチルアミノ)-1-[(4-フルオロフェニル)メチル]-N,N-ジプロピル-1H-インダゾール-5-スルホンアミド、4-[[1-[(2,6-ジクロロフェニル)メチル]-N-プロピル-1H-インダゾール-5-スルホンアミド、1-[(2,6-ジクロロフェニル)メチル]-N-プロピル-1H-インダゾール-5-スルホニル]-,1-ピペラジンカルボン酸，エチル

エステル、1 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - N,N - ジプロピル - 1H - インダゾール - 5 - スルホンアミド、1 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - ピペリジン - 1 - イル - N,N - ジプロピル - 1H - インダゾール - 5 - スルホンアミド、3 - [(シクロヘキシリルメチル)アミノ] - 1 - (4 - フルオロベンジル) - N,N - ジプロピル - 1H - インダゾール - 5 - スルホンアミドから選ばれる化合物及びその医薬上許容しうる塩。

【請求項 6】

薬剤として使用するための請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 7】

疼痛治療の薬剤の製造における請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 8】

不安障害を治療する薬剤の製造における請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 9】

癌、多発性硬化症、パーキンソン病、ハンチントン舞蹈病、アルツハイマー病、胃腸障害及び心臓血管障害を治療する薬剤の製造における請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

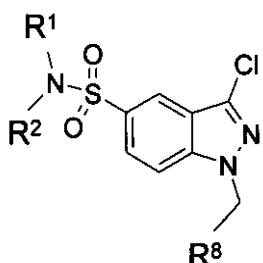
【請求項 10】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物及び医薬上許容しうる担体を含む医薬組成物。

【請求項 11】

式III：

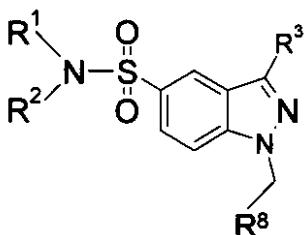
【化 2】



III

の化合物をR⁴R⁵NHの化合物と反応させて式IIの化合物を形成する工程からなる式II：

【化 3】



II

の化合物の製造方法。

式中、

R¹は、水素、C₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケニル、C₂₋₁₀アルキニル、C₃₋₁₀シクロアルキル、C₄₋₈シクロアルケニル、C₃₋₁₀シクロアルキル - C₁₋₆アルキル、C₄₋₈シクロアルケニル - C₁₋₆アルキル、C₃₋₅ヘテロアリール、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリール - C₁₋₆アルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル、C₃₋₆ヘテロシクロアルキル - C₁₋₆アルキル又はC₁₋₆アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいてR¹の定義に用いたC₁₋₁₀アルキル、C₂₋₁₀アルケ

ニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び - NR^4R^5 から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており； C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル及び C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-6} アルキルから選ばれる 1 つ又はそれ以上の置換基を有し；

R^2 は、水素、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルから選ばれ；ここにおいて R^2 の定義に用いた C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-6} アルキル又は C_{1-6} アルコキシカルボニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び - NR^4R^5 から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており； C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル及び C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-6} アルキルから選ばれる 1 つ又はそれ以上の置換基を有し；

場合により R^1 及び R^2 は、それらが結合している N と一緒にになって 3 - 10員の芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環を形成することができ；ここにおいて該芳香族、複素芳香族又はヘテロシクロアルキル環は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロゲン、アミノ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、カルボニル、カルバモイル、アセチル、アセチルアミノ及びヒドロキシから独立して選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

R^3 は、水素、ハロゲン、アミノ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 R^4R^5N - 、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール及び C_{3-6} ヘテロシクロアルキルから選ばれ、ここにおいて R^3 の定義に用いたアミノ、 C_{1-10} アルキル、 C_{2-10} アルケニル、 C_{2-10} アルキニル、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 R^4R^5N - 、 C_{3-5} ヘテロアリール、 C_{6-10} アリール及び C_{3-6} ヘテロシクロアルキルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル、ヒドロキシ、及び - NR^4R^5 から選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；

ここにおいて R^4 及び R^5 は、 - H、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、及び別の二価の R^4 又は R^5 と一緒にになって環又は環の一部を形成することができる二価の C_{1-6} 基から独立して選ばれ、ここにおいて該環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、メトキシ、エトキシ、メチル、エチル及びヒドロキシから選ばれる 1 つ又はそれ以上の基によって場合により置換されており；そして

R^8 は、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール - C(=O) - C_{1-6} アルキル、 C_{1-10} ヒドロカルビルアミノ、 C_{6-10} アリール - C(=O) - 、又は C_{3-6} ヘテロシクリル - C(=O) - から選ばれ；ここにおいて R^8 の定義に用いた C_{3-10} シクロアルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル、 C_{3-10} シクロアル

ルキル - C_{1-6} アルキル、 C_{4-8} シクロアルケニル - C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - C_{1-6} アルキル、 C_{6-10} アリール - $C(=O)$ - C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクリル - $C(=O)$ - C_{1-6} アルキル、 C_{1-10} ヒドロカルビルアミノ、 C_{6-10} アリール - $C(=O)$ - 、又は C_{3-6} ヘテロシクリル - $C(=O)$ - は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、ハロゲン、 C_{1-6} アルコキシ、アミノ、シアノ、オキソ、ニトロ、ヒドロキシ及び - NR^4R^5 から選ばれる1つ又はそれ以上の基によって場合により置換されている。