

【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】令和4年3月7日(2022.3.7)

【国際公開番号】WO2019/162702

【公表番号】特表2021-514963(P2021-514963A)

【公表日】令和3年6月17日(2021.6.17)

【出願番号】特願2020-544648(P2020-544648)

【国際特許分類】

C 0 7 D 251/34(2006.01)

10

A 6 1 K 31/53(2006.01)

A 6 1 K 31/5377(2006.01)

C 0 7 D 405/12(2006.01)

C 0 7 D 401/04(2006.01)

C 0 7 D 405/04(2006.01)

C 0 7 D 417/04(2006.01)

C 0 7 D 409/04(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 P 25/28(2006.01)

A 6 1 P 25/24(2006.01)

20

A 6 1 P 25/16(2006.01)

A 6 1 P 25/00(2006.01)

A 6 1 P 25/14(2006.01)

A 6 1 P 9/00(2006.01)

A 6 1 P 3/04(2006.01)

A 6 1 P 3/10(2006.01)

A 6 1 P 3/00(2006.01)

A 6 1 P 19/10(2006.01)

A 6 1 P 27/10(2006.01)

A 6 1 P 27/06(2006.01)

30

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 9/12(2006.01)

A 6 1 P 27/00(2006.01)

A 6 1 P 25/22(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 251/34 F C S P

A 6 1 K 31/53

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 401/04

40

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 409/04

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 9/00

50

A 6 1 P 3 / 0 4  
 A 6 1 P 3 / 1 0  
 A 6 1 P 3 / 0 0  
 A 6 1 P 1 9 / 1 0  
 A 6 1 P 2 7 / 1 0  
 A 6 1 P 2 7 / 0 6  
 A 6 1 P 2 7 / 0 2  
 A 6 1 P 9 / 1 2  
 A 6 1 P 2 7 / 0 0  
 A 6 1 P 2 5 / 2 2  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

10

## 【 手 続 補 正 書 】

【 提 出 日 】 令 和 4 年 2 月 2 5 日 ( 2 0 2 2 . 2 . 2 5 )

## 【 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

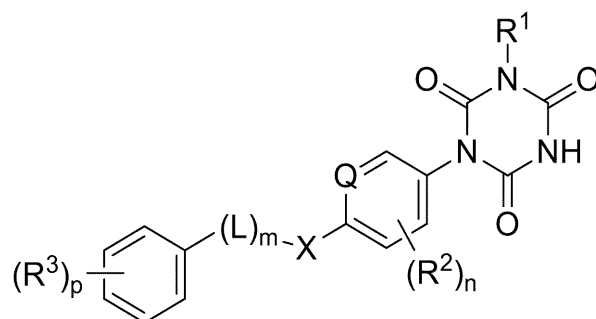
【 補 正 の 内 容 】

【 特 許 請 求 の 範 囲 】

20

【 請 求 項 1 】

式 I の 化 合 物



30

〔 式 中 〕

R<sup>1</sup> は、メチル；1つ以上の G<sup>1</sup> 基で任意に置換されたフェニル；または1つ以上の G<sup>2</sup> 基で任意に置換された5～9員のヘテロアリール基を表し、

G<sup>1</sup> は、ハロ；1つ以上の G<sup>a1</sup> 基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の G<sup>a2</sup> 基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ；-N(R<sup>a1</sup>)R<sup>a2</sup>；-C(O)N(R<sup>a3</sup>)

R<sup>a4</sup>、1つ以上の G<sup>a3</sup> 基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；1つ以上の G<sup>a4</sup> 基で任意に置換された5～6員のヘテロアリール基；C<sub>1</sub>-4アルキル基または

C<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ原子で任意に置換されており、または任意の2つの G<sup>1</sup> 基が一緒に結合して、5～6員のヘテロシクリル環を形成してもよく、これは、1つ以上の G<sup>a5</sup> 基で任意に置換されてもよく、

G<sup>2</sup> は、ハロ；1つ以上の G<sup>a6</sup> 基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の G<sup>a7</sup> 基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ；-N(R<sup>a5</sup>)R<sup>a6</sup>；-C(O)N(R<sup>a7</sup>)

R<sup>a8</sup>、1つ以上の G<sup>a8</sup> 基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；C<sub>1</sub>-4アルキル基またはC<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ基で任意に置換され、

n は、0、1、または2を表し、

R<sup>2</sup> は、ハロ；シアノ；-N(R<sup>a9</sup>)R<sup>a10</sup>；1つ以上の G<sup>a9</sup> 基で任意に置換され

50

た 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環 ; もしくは 1 つ以上の  $G a 1 0$  基で任意に置換されたフェニル基を表し、後者の 2 つの基は、式 I の化合物中の関連するフェニル基に O 原子を介して任意に結合されており ; または  $C 1 - 6$  アルキル基、 $C 1 - 6$  アルコキシ基、もしくは  $- S ( O ) q C 1 - 6$  アルキル基を表し、後者の 3 つの基は、1 つ以上のフルオロ、 $= O$ 、ヒドロキシ、 $C 1 - 2$  アルコキシもしくは  $- N ( R a 1 1 ) R a 1 2$  基で任意に置換され、かつ / もしくは 1 つ以上の  $G a 1 1$  基で任意に置換された 4 ~ 7 員ヘテロシクリル環で任意に置換されており ; または 1 つ以上の  $G a 1 2$  基で任意に置換されたフェニル基を表し、

$q$  は、0、1、または 2 を表し、

$Q$  は、 $- N -$ 、 $- C H -$  を表し、

$X$  は、 $- C ( R 4 ) R 5 -$ 、 $- O -$ 、 $- S -$ 、または  $- N ( R 6 ) -$  を表し、

$m$  は、0 または 1 を表し、

$L$  は、 $- C ( R 7 ) R 8 -$  を表し、

$p$  は、0 ~ 1 を表し、

$R 3$  はハロ ; ヒドロキシ ; シアノ ; または  $C 1 - 4$  アルキルもしくは  $C 1 - 4$  アルコキシを表し、各アルキル基もしくはアルコキシ基は、1 つ以上のフルオロ基で任意に置換されており、

$R 4$ 、 $R 5$ 、 $R 6$ 、 $R 7$  および  $R 8$  は、それぞれ独立して、 $H$  または  $C 1 - 2$  アルキルを表し、

$R a 1$ 、 $R a 2$ 、 $R a 3$ 、 $R a 4$ 、 $R a 5$ 、 $R a 6$ 、 $R a 7$ 、 $R a 8$ 、 $R a 9$ 、 $R a 1 0$ 、 $R a 1 1$ 、および  $R a 1 2$  は、それぞれ独立して、 $H$  もしくは  $C 1 - 3$  アルキルを表し、または

$R a 1$  および  $R a 2$ 、 $R a 3$  および  $R a 4$ 、 $R a 5$  および  $R a 6$ 、 $R a 7$  および  $R a 8$ 、 $R a 9$  および  $R a 1 0$ 、ならびに  $R a 1 1$  および  $R a 1 2$  は、独立して、それらが結している原子と共に、一緒に結合して、4 ~ 7 員のヘテロシクリル環を形成してもよく、 $G a 1$ 、 $G a 2$ 、 $G a 4$ 、 $G a 6$ 、 $G a 7$ 、 $G a 1 0$ 、および  $G a 1 2$  はそれぞれ独立して、 $C 1 - 2$  アルキルまたはハロを表し、

$G a 3$ 、 $G a 5$ 、 $G a 8$ 、 $G a 9$ 、および  $G a 1 1$  はそれぞれ独立して、 $C 1 - 2$  アルキル、ハロまたは  $= O$  を表し、

$R 2$  基はまた、 $R 4$ 、 $R 5$ 、 $R 6$ 、 $R 7$  または  $R 8$  のうちのいずれか 1 つと一緒に結合して、4 ~ 7 員のヘテロシクリル環、または 5 ~ 6 員のヘテロアリアル環を形成してもよく、前記ヘテロシクリルまたはヘテロアリアル環は、 $G 3$  から選択される 1 つ以上の置換基によって任意に置換されており、

$G 3$  は、ハロ、 $C 1 - 2$  アルキルまたは  $C 1 - 2$  アルコキシを表す ]

またはその薬学的に許容される塩であって、

$R 1$  がメチルを表し、 $m$  が 0 であり、かつ、

( i )  $X$  が  $O$  または  $S$  を表す場合、 $n$  および  $p$  は、両方が 0 を表すものではなく、

( i i )  $X$  が  $O$  を表し、かつ

$R 2$  が、トリアジン環に対して 3 位にある単一のフルオロ基を表す場合、 $R 3$  は、ベンゼン環の結合点に対して 4 位にある単一の  $- C F 3$  基を表すものではなく、

$R 2$  が、トリアジン環に対して 3 位および 5 位にある 2 つのクロロ基を表す場合、 $R 3$  は、ベンゼン環の結合点に対して 4 位にある単一の  $- O C F 3$  もしくはシアノ基を表すものではなく、

$R 2$  が、トリアジン環に対して 3 位にある単一のクロロ基を表す場合、

( a )  $p$  は、0 を表すものではない、もしくは

( b )  $p$  が 1 を表す場合、 $R 3$  は、ベンゼン環の結合点に対して 4 位にあるクロロ基を表すものではない、のいずれかであり、

$n$  が 0 を表す場合、 $R 3$  は、ベンゼン環の結合点に対して 4 位にある単一のフルオロ、クロロ、 $- C F 3$ 、シアノもしくはメチル基、または 3 位にあるクロロ基を表すものではなく、

10

20

30

40

50

( i i i ) X が S を表し、かつ

R<sup>2</sup>がトリアジン環に対して3位および5位にある2つのクロロ原子を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して2位にある単一のエチル基、3位もしくは4位にある単一のエトキシ基、または4位にある単一のクロロ、プロモ、シアノ、-CF<sub>3</sub>もしくはtert-ブチル基を表すものではなく、

R<sup>2</sup>が、トリアジン環に対して3位および5位にある2つのメチル基を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のクロロもしくはプロモ基を表すものではなく、

R<sup>2</sup>が、トリアジン環に対して2位および5位にある2つのメチル基を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のメチルもしくはtert-ブチル基を表すものではなく、

10

nが0を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のクロロ、メチル、シアノ、もしくはtert-ブチル基を表すものではない、という条件での化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

G<sup>1</sup>が、ハロ；フェニル；フェノキシ；シアノ；-N(R<sup>a1</sup>)R<sup>a2</sup>；4～7員のヘテロシクリル環；C<sub>1</sub>-4アルキル基、またはC<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基が、1つ以上のフルオロ原子で任意に置換されているか、または任意の2つのG<sup>1</sup>基と一緒に結合して、5～6員のヘテロシクリル環を形成してもよい、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項3】

G<sup>2</sup>が、ハロ；フェニル；フェノキシ；シアノ；-N(R<sup>a3</sup>)R<sup>a4</sup>；4～7員のヘテロシクリル環；C<sub>1</sub>-4アルキル基、またはC<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基が、1つ以上のフルオロ基で任意に置換されている、請求項1または請求項2に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

R<sup>2</sup>が、ハロ；シアノ；-N(R<sup>a9</sup>)R<sup>a10</sup>；4～7員のヘテロシクリル環、もしくはフェニル基を表し、後者の2つの基は、前記式Iの化合物中の前記関連するフェニル基にO原子を介して任意に結合されており；または、C<sub>1</sub>-6アルキル基、C<sub>1</sub>-6アルコキシ基を表し、後者の2つの基は、1つ以上のフルオロ、=O、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-2アルコキシもしくは-N(R<sup>a11</sup>)R<sup>a12</sup>基で任意に置換され、かつ/または4～7員のヘテロシクリル環もしくはフェニル基で任意に置換されている、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

30

【請求項5】

Qが-CH-を表す、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項6】

前記式Iの化合物において、R<sup>1</sup>が、ベンゼン環の結合点に対して3位または4位で、フルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、またはトリフルオロメトキシ置換基で任意に置換されたフェニルを表す、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

40

【請求項7】

前記式Iの化合物において、R<sup>1</sup>が、ピリジニル、インドリル、チアゾリル、ベンゾフラニル、チオフェニル基（前記チオフェニル基はメチル基で任意に置換されている）、またはピラゾリル基（前記ピラゾリル基はフェニル基で任意に置換されている）を表す、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項8】

前記式Iの化合物において、nが2である場合、R<sup>2</sup>が、C<sub>1</sub>-2アルキルまたはC<sub>1</sub>-2アルコキシを表し、それらの両方が、トリアジン環に対して2位および5位に位置する1つ以上のフルオロ基で任意に置換されている、請求項1～7のいずれか一項に記載の化

50

合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

前記式 I の化合物において、 $n$  が 1 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

前記式 I の化合物において、 $R^2$  が、1 つ以上のフルオロ、 $=O$  もしくは  $-N(R^{a7})R^{a8}$  基で任意に置換された直鎖もしくは分岐鎖  $C_{1-4}$  アルキル；またはトリアジン環に対して 3 位に位置する 1 つ以上のフルオロ、 $=O$ 、 $-N(R^{a7})R^{a8}$  もしくは  $C_{1-2}$  アルコキシ基で任意に置換された  $C_{1-5}$  アルコキシを表す、請求項 9 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 11】

前記式 I の化合物において、 $X$  が、 $-C(R^4)R^5-$ 、 $-O-$ 、または  $-N(R^6)-$  を表す、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

前記式 I の化合物において、 $X$  が、 $-O-$  を表す、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

前記式 I の化合物において、 $p$  が 1 である場合、 $R^3$  が、1 つ以上のフルオロ基で任意に置換された  $C_{1-2}$  アルキルまたは  $C_{1-2}$  アルコキシを表す、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 14】

前記式 I の化合物において、 $m$  が 0 であり、 $p$  が 0 である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

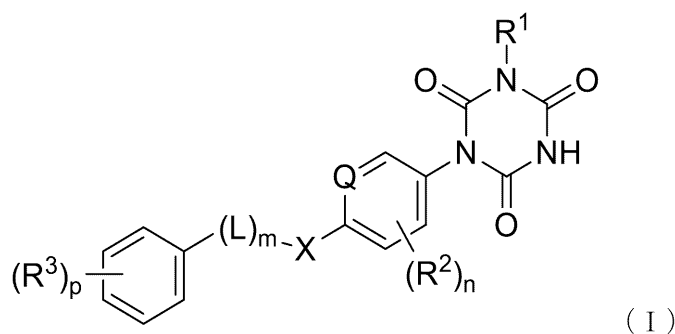
【請求項 15】

前記式 I の化合物において、 $R^1$  は、1 つ以上の  $G^1$  基で任意に置換されたフェニル；または 1 つ以上の  $G^2$  基で任意に置換された 5 ~ 9 員のヘテロアリール基を表す、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

式 I の化合物

30



40

[式中、

$R^1$  は、メチル；1 つ以上の  $G^1$  基で任意に置換されたフェニル；または 1 つ以上の  $G^2$  基で任意に置換された 5 ~ 9 員のヘテロアリール基を表し、

$G^1$  は、ハロ；1 つ以上の  $G_{a1}$  基で任意に置換されたフェニル；1 つ以上の  $G_{a2}$  基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ； $-N(R_{a1})R_{a2}$ ； $-C(O)N(R_{a3})$

$R_{a4}$ 、1 つ以上の  $G_{a3}$  基で任意に置換された 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環；1 つ以上の  $G_{a4}$  基で任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリール基； $C_{1-4}$  アルキル基または  $C_{1-4}$  アルコキシ基を表し、後者の 2 つの基は 1 つ以上のフルオロ原子で任意に置換されており、または任意の 2 つの  $G^1$  基が一緒に結合して、5 ~ 6 員のヘテロシクリル環を

50

形成してもよく、これは、1つ以上の  $G_{a5}$  基で任意に置換されてもよく、  
 $G_{2}$  は、ハロ；1つ以上の  $G_{a6}$  基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の  $G_{a7}$  基で  
 任意に置換されたフェノキシ；シアノ； $-N(R_{a5})R_{a6}$ ； $-C(O)N(R_{a7})$   
 $R_{a8}$ 、1つ以上の  $G_{a8}$  基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環； $C_{1-4}$   
 アルキル基または  $C_{1-4}$  アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ基  
 で任意に置換され、

$n$  は、0、1、または2を表し、

$R_{2}$  は、ハロ；シアノ； $-N(R_{a9})R_{a10}$ ；1つ以上の  $G_{a9}$  基で任意に置換され  
 た4～7員のヘテロシクリル環；もしくは1つ以上の  $G_{a10}$  基で任意に置換されたフェ  
 ニル基を表し、後者の2つの基は、式Iの化合物中の関連するフェニル基にO原子を介し  
 て任意に結合されており；または  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、もしくは  
 $-S(O)_q C_{1-6}$  アルキル基を表し、後者の3つの基は、1つ以上のフルオロ、 $=O$   
 、ヒドロキシ、 $C_{1-2}$  アルコキシもしくは  $-N(R_{a11})R_{a12}$  基で任意に置換され、  
 かつ/もしくは1つ以上の  $G_{a11}$  基で任意に置換された4～7員ヘテロシクリル環  
 で任意に置換されており；または1つ以上の  $G_{a12}$  基で任意に置換されたフェニル基を  
 表し、

$q$  は、0、1、または2を表し、

$Q$  は、 $-N-$ 、 $-CH-$  を表し、

$X$  は、 $-C(R_4)R_5-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R_6)-$  を表し、

$m$  は、0または1を表し、

$L$  は、 $-C(R_7)R_8-$  を表し、

$p$  は、0～1を表し、

$R_3$  はハロ；ヒドロキシ；シアノ；または  $C_{1-4}$  アルキルもしくは  $C_{1-4}$  アルコキシ  
 を表し、各アルキル基もしくはアルコキシ基は、1つ以上のフルオロ基で任意に置換され  
 ており、

$R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$  および  $R_8$  は、それぞれ独立して、Hまたは  $C_{1-2}$  アルキルを  
 表し、

$R_{a1}$ 、 $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$ 、 $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$ 、 $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$ 、 $R_{a8}$ 、 $R_{a9}$ 、 $R_{a10}$   
 $R_{a11}$ 、および  $R_{a12}$  は、それぞれ独立して、Hもしくは  $C_{1-3}$  アルキルを表し  
 、または

$R_{a1}$  および  $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$  および  $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$  および  $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$  および  $R_{a8}$ 、  
 $R_{a9}$  および  $R_{a10}$ 、ならびに  $R_{a11}$  および  $R_{a12}$  は、独立して、それらが結して  
 いる原子と共に、一緒に結合して、4～7員のヘテロシクリル環を形成してもよく、  
 $G_{a1}$ 、 $G_{a2}$ 、 $G_{a4}$ 、 $G_{a6}$ 、 $G_{a7}$ 、 $G_{a10}$ 、および  $G_{a12}$  はそれぞれ独立し  
 て、 $C_{1-2}$  アルキルまたはハロを表し、

$G_{a3}$ 、 $G_{a5}$ 、 $G_{a8}$ 、 $G_{a9}$ 、および  $G_{a11}$  はそれぞれ独立して、 $C_{1-2}$  アルキ  
 ル、ハロまたは  $=O$  を表し、

$R_2$  基はまた、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$  または  $R_8$  のうちのいずれか1つと一緒に結合し  
 て、4～7員のヘテロシクリル環、または5～6員のヘテロアリール環を形成してもよく  
 、前記ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環は、 $G_3$  から選択される1つ以上の置換基  
 によって任意に置換されており、

$G_3$  は、ハロ、 $C_{1-2}$  アルキルまたは  $C_{1-2}$  アルコキシを表す]

またはその薬学的に許容される塩であって、

$R_1$  は、メチルを表し、

$n$  は、1を表し、かつ

$R_2$  は、プロモ；1つ以上のフルオロ基で任意に置換された直鎖もしくは分岐鎖  $C_{1-4}$   
 アルキル；または1つ以上のフルオロ基、4～7員ヘテロシクリル環、もしくは  $C_{1-2}$   
 アルコキシ基で任意に置換された  $C_{1-5}$  アルコキシを表す、

化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項17】

10

20

30

40

50

化合物が、

1 - (4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - (4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

3 - [2, 4, 6 - トリオキソ - 3 - (4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 1 - イル] ベンゾニトリル、

1 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [4 - (ベンジルオキシ)フェニル] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [4 - (4 - クロロフェノキシ)フェニル] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

4 - [4 - (2, 4, 6 - トリオキソ - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 1 - イル)フェノキシ] ベンゾニトリル、

1 - (2 - メトキシ - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [4 - (モルホリン - 4 - イル)フェニル] - 3 - (4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - メトキシ - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

2 - フェノキシ - 5 - (2, 4, 6 - トリオキソ - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 1 - イル) ベンゾニトリル、

1 - (2 - メトキシ - 5 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - メトキシ - 5 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [3 - (シクロペンチルオキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - エトキシ - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [3 - (オキサラン - 3 - イルオキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - (ピリジン - 2 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - フェニル - 3 - (1 - フェニル - 1H - インダゾール - 5 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - フェニル - 3 - [4 - (フェニルアミノ)フェニル] - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - (3 - エトキシ - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - メチル - 3 - [3 - (オキサラン - 3 - イルオキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [3 - (シクロペンチルオキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - メチル - 3 - [3 - (オキサタン - 3 - イルメトキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

1 - [3 - (オキサタン - 3 - イルメトキシ) - 4 - フェノキシフェニル] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

10

20

30

40

50

- ル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - メチル - 3 - [ 4 - フェノキシ - 3 - (プロパン - 2 - イルオキシ) フェニル ] - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - [ 4 - フェノキシ - 3 - (プロパン - 2 - イルオキシ) フェニル ] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - [ 3 - (2 - メトキシエトキシ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - [ 3 - (2 - メトキシエトキシ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - [ 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - メチル - 3 - (1 - フェニル - 1 H - インダゾール - 5 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メトキシ - 5 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (2 - メトキシ - 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - [ 3 - メチル - 4 - (フェニルスルファニル) フェニル ] - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メチル - 1 - フェニル - 1 H - インドール - 5 - イル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (1 - ベンジル - 3 - メチル - 1 H - インドール - 5 - イル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - メチル - 3 - (3 - メチル - 1 - フェニル - 1 H - インドール - 5 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (1 - ベンジル - 3 - メチル - 1 H - インドール - 5 - イル) - 3 - メチル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - クロロ - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - (5 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - (4 - メチルフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (4 - ベンジル - 3 - メチルフェニル) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - クロロフェニル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 3 - [ 3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル ] - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (1 - ベンゾフラン - 5 - イル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (1 H - インドール - 5 - イル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (2 H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (1 H - インドール - 4 - イル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、  
 1 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - (3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル) - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、

- 、 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 2 - メトキシフェニル ) - 3 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 1 , 3  
、 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - メトキシ - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - ( 3 - メトキシフェニル ) - 1 ,  
3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - メトキシ - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - ( 4 - メトキシフェニル ) - 1 ,  
3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン  
1 - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - フェニル - 1 , 3 , 5 - トリ  
アジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - メチル - 3 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン 10  
- 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - ( 4 - メチルフ  
ェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - ( 3 - メチルフ  
ェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - クロロフェニル ) - 3 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフ  
ェニル ] - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフ  
ェニル ] - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - ( 4 - メトキシ 20  
フェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - ( 3 - メトキシ  
フェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - メチル - 4 - ( 2 - メチルフエノキシ ) フェニル ] - 3 - フェニル - 1 , 3 ,  
5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - ( 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル )  
- 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - ( 5 - メチルチ  
オフエン - 2 - イル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 , 3 - ビス ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 30  
、 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - ( 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール  
- 4 - イル ) - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 3 - プロモ - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - フェニル - 1 , 3 , 5 - トリアジナ  
ン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 2 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - フェニル - 1 , 3 , 5 - トリアジナ  
ン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 2 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - ( 4 - メチルフエニル ) - 1 , 3 ,  
5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 1 - ベンゾフラン - 4 - イル ) - 3 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 40  
1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - ( 1 - ベンゾフラン - 7 - イル ) - 3 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) -  
1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
2 - フェノキシ - 5 - ( 2 , 4 , 6 - トリオキソ - 3 - フェニル - 1 , 3 , 5 - トリアジ  
ナン - 1 - イル ) 安息香酸メチル、  
1 - [ 3 - ( ヒドロキシメチル ) - 4 - フェノキシフェニル ] - 3 - フェニル - 1 , 3 ,  
5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - { 3 - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) - 2 - オキソエチル ] - 4 - フェノキシフェニル }  
- 3 - フェニル - 1 , 3 , 5 - トリアジナン - 2 , 4 , 6 - トリオン、  
1 - { 3 - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) - 2 - オキソエトキシ ] - 4 - フェノキシフェニル 50

3 - フェニル - 1, 3, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン、及び  
1 - ( 5 - メチル - 6 - フェノキシピリジン - 3 - イル ) - 3 - ( p - トリル ) - 1, 3  
, 5 - トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオン  
 からなる群から選択される、請求項 15 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩

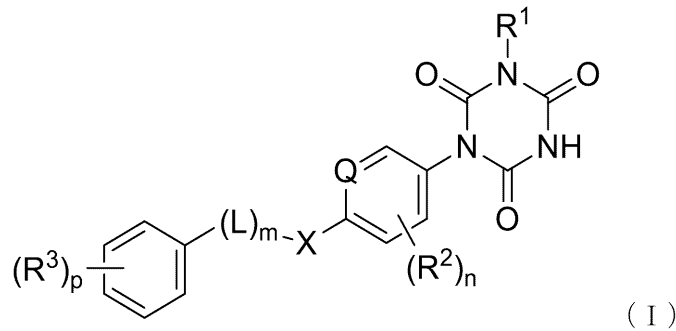
【請求項 18】  
 化合物が、1 - ( 3 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - 3 - フェニル - 1, 3, 5 -  
トリアジナン - 2, 4, 6 - トリオンである、請求項 17 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】  
 ヒト医学における使用のための医薬であって、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む医薬。

【請求項 20】  
 請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、および薬学的に許容される賦形剤を含む、薬学的組成物。

【請求項 21】  
 ニューロトロフィンおよび/または他の栄養因子のシグナル伝達障害を特徴とする疾患の治療および/または予防のための医薬であって、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または請求項 20 に記載の薬学的組成物を含む、医薬。

【請求項 22】  
 ニューロトロフィンおよび/または他の栄養因子のシグナル伝達障害を特徴とする疾患の治療および/または予防のための医薬であって、式 I の化合物



[ 式中、  
R<sub>1</sub> は、メチル；1つ以上の G<sub>1</sub> 基で任意に置換されたフェニル；または1つ以上の G<sub>2</sub> 基で任意に置換された 5 ~ 9 員のヘテロアリール基を表し、  
G<sub>1</sub> は、ハロ；1つ以上の G<sub>a1</sub> 基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の G<sub>a2</sub> 基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ；- N ( R<sub>a1</sub> ) R<sub>a2</sub>；- C ( O ) N ( R<sub>a3</sub> ) R<sub>a4</sub>、  
1つ以上の G<sub>a3</sub> 基で任意に置換された 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環；1つ以上の G<sub>a4</sub> 基で任意に置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリール基；C<sub>1</sub> - 4 アルキル基または C<sub>1</sub> - 4 アルコキシ基を表し、後者の 2 つの基は 1 つ以上のフルオロ原子で任意に置換されており、  
または任意の 2 つの G<sub>1</sub> 基が一緒に結合して、5 ~ 6 員のヘテロシクリル環を形成してもよく、これは、1つ以上の G<sub>a5</sub> 基で任意に置換されてもよく、  
G<sub>2</sub> は、ハロ；1つ以上の G<sub>a6</sub> 基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の G<sub>a7</sub> 基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ；- N ( R<sub>a5</sub> ) R<sub>a6</sub>；- C ( O ) N ( R<sub>a7</sub> ) R<sub>a8</sub>、  
1つ以上の G<sub>a8</sub> 基で任意に置換された 4 ~ 7 員のヘテロシクリル環；C<sub>1</sub> - 4 アルキル基または C<sub>1</sub> - 4 アルコキシ基を表し、後者の 2 つの基は 1 つ以上のフルオロ基で任意に置換され、  
n は、0、1、または 2 を表し、

$R_2$ は、ハロ；シアノ； $-N(R_{a9})R_{a10}$ ；1つ以上の $G_{a9}$ 基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；もしくは1つ以上の $G_{a10}$ 基で任意に置換されたフェニル基を表し、後者の2つの基は、式Iの化合物中の関連するフェニル基にO原子を介して任意に結合されており；または $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、もしくは $-S(O)_qC_{1-6}$ アルキル基を表し、後者の3つの基は、1つ以上のフルオロ、 $=O$ 、ヒドロキシ、 $C_{1-2}$ アルコキシもしくは $-N(R_{a11})R_{a12}$ 基で任意に置換され、かつ/もしくは1つ以上の $G_{a11}$ 基で任意に置換された4～7員ヘテロシクリル環で任意に置換されており；または1つ以上の $G_{a12}$ 基で任意に置換されたフェニル基を表し、

10

$q$ は、0、1、または2を表し、

$Q$ は、 $-N-$ 、 $-CH-$ を表し、

$X$ は、 $-C(R_4)R_5-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-N(R_6)-$ を表し、

$m$ は、0または1を表し、

$L$ は、 $-C(R_7)R_8-$ を表し、

$p$ は、0～1を表し、

$R_3$ はハロ；ヒドロキシ；シアノ；または $C_{1-4}$ アルキルもしくは $C_{1-4}$ アルコキシを表し、各アルキル基もしくはアルコキシ基は、1つ以上のフルオロ基で任意に置換されており、

$R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ および $R_8$ は、それぞれ独立して、Hまたは $C_{1-2}$ アルキルを表し、

20

$R_{a1}$ 、 $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$ 、 $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$ 、 $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$ 、 $R_{a8}$ 、 $R_{a9}$ 、 $R_{a10}$ 、 $R_{a11}$ 、および $R_{a12}$ は、それぞれ独立して、Hもしくは $C_{1-3}$ アルキルを表し、または

$R_{a1}$ および $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$ および $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$ および $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$ および $R_{a8}$ 、 $R_{a9}$ および $R_{a10}$ 、ならびに $R_{a11}$ および $R_{a12}$ は、独立して、それらが結している原子と共に、一緒に結合して、4～7員のヘテロシクリル環を形成してもよく、

$G_{a1}$ 、 $G_{a2}$ 、 $G_{a4}$ 、 $G_{a6}$ 、 $G_{a7}$ 、 $G_{a10}$ 、および $G_{a12}$ はそれぞれ独立して、 $C_{1-2}$ アルキルまたはハロを表し、

$G_{a3}$ 、 $G_{a5}$ 、 $G_{a8}$ 、 $G_{a9}$ 、および $G_{a11}$ はそれぞれ独立して、 $C_{1-2}$ アルキル、ハロまたは $=O$ を表し、

30

$R_2$ 基はまた、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ または $R_8$ のうちのいずれか1つと一緒に結合して、4～7員のヘテロシクリル環、または5～6員のヘテロアリール環を形成してもよく、前記ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環は、 $G_3$ から選択される1つ以上の置換基によって任意に置換されており、

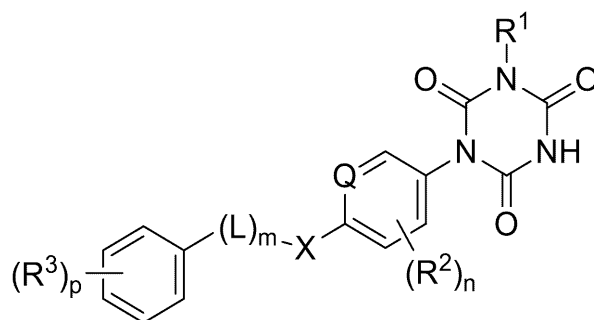
$G_3$ は、ハロ、 $C_{1-2}$ アルキルまたは $C_{1-2}$ アルコキシを表す]

またはその薬学的に許容される塩を含む医薬。

【請求項23】

ニューロトロフィンおよび/または他の栄養因子のシグナル伝達障害を特徴とする疾患の治療および/または予防のための医薬の製造における、式Iの化合物

40



(I)

50

[ 式中、

$R_1$  は、メチル；1つ以上の  $G_1$  基で任意に置換されたフェニル；または1つ以上の  $G_2$  基で任意に置換された5～9員のヘテロアリール基を表し、

$G_1$  は、ハロ；1つ以上の  $G_{a1}$  基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の  $G_{a2}$  基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ； $-N(R_{a1})R_{a2}$ ； $-C(O)N(R_{a3})$

$R_{a4}$ 、1つ以上の  $G_{a3}$  基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；1つ以上の  $G_{a4}$  基で任意に置換された5～6員のヘテロアリール基； $C_{1-4}$  アルキル基または  $C_{1-4}$  アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ原子で任意に置換されており、または任意の2つの  $G_1$  基と一緒に結合して、5～6員のヘテロシクリル環を形成してもよく、これは、1つ以上の  $G_{a5}$  基で任意に置換されてもよく、

$G_2$  は、ハロ；1つ以上の  $G_{a6}$  基で任意に置換されたフェニル；1つ以上の  $G_{a7}$  基で任意に置換されたフェノキシ；シアノ； $-N(R_{a5})R_{a6}$ ； $-C(O)N(R_{a7})$

$R_{a8}$ 、1つ以上の  $G_{a8}$  基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環； $C_{1-4}$  アルキル基または  $C_{1-4}$  アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ基で任意に置換され、

$n$  は、0、1、または2を表し、

$R_2$  は、ハロ；シアノ； $-N(R_{a9})R_{a10}$ ；1つ以上の  $G_{a9}$  基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；もしくは1つ以上の  $G_{a10}$  基で任意に置換されたフェニル基を表し、後者の2つの基は、式Iの化合物中の関連するフェニル基にO原子を介して任意に結合されており；または  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、もしくは

$-S(O)_q C_{1-6}$  アルキル基を表し、後者の3つの基は、1つ以上のフルオロ、 $=O$ 、ヒドロキシ、 $C_{1-2}$  アルコキシもしくは  $-N(R_{a11})R_{a12}$  基で任意に置換され、かつ/もしくは1つ以上の  $G_{a11}$  基で任意に置換された4～7員ヘテロシクリル環で任意に置換されており；または1つ以上の  $G_{a12}$  基で任意に置換されたフェニル基を表し、

$q$  は、0、1、または2を表し、

$Q$  は、 $-N-$ 、 $-CH-$  を表し、

$X$  は、 $-C(R_4)R_5-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、または  $-N(R_6)-$  を表し、

$m$  は、0または1を表し、

$L$  は、 $-C(R_7)R_8-$  を表し、

$p$  は、0～1を表し、

$R_3$  はハロ；ヒドロキシ；シアノ；または  $C_{1-4}$  アルキルもしくは  $C_{1-4}$  アルコキシを表し、各アルキル基もしくはアルコキシ基は、1つ以上のフルオロ基で任意に置換されており、

$R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$  および  $R_8$  は、それぞれ独立して、 $H$  または  $C_{1-2}$  アルキルを表し、

$R_{a1}$ 、 $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$ 、 $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$ 、 $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$ 、 $R_{a8}$ 、 $R_{a9}$ 、 $R_{a10}$ 、 $R_{a11}$ 、および  $R_{a12}$  は、それぞれ独立して、 $H$  もしくは  $C_{1-3}$  アルキルを表し、または

$R_{a1}$  および  $R_{a2}$ 、 $R_{a3}$  および  $R_{a4}$ 、 $R_{a5}$  および  $R_{a6}$ 、 $R_{a7}$  および  $R_{a8}$ 、 $R_{a9}$  および  $R_{a10}$ 、ならびに  $R_{a11}$  および  $R_{a12}$  は、独立して、それらが結している原子と共に、一緒に結合して、4～7員のヘテロシクリル環を形成してもよく、

$G_{a1}$ 、 $G_{a2}$ 、 $G_{a4}$ 、 $G_{a6}$ 、 $G_{a7}$ 、 $G_{a10}$ 、および  $G_{a12}$  はそれぞれ独立して、 $C_{1-2}$  アルキルまたはハロを表し、

$G_{a3}$ 、 $G_{a5}$ 、 $G_{a8}$ 、 $G_{a9}$ 、および  $G_{a11}$  はそれぞれ独立して、 $C_{1-2}$  アルキル、ハロまたは  $=O$  を表し、

$R_2$  基はまた、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$  または  $R_8$  のうちのいずれか1つと一緒に結合して、4～7員のヘテロシクリル環、または5～6員のヘテロアリール環を形成してもよく、前記ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環は、 $G_3$  から選択される1つ以上の置換基によって任意に置換されており、

10

20

30

40

50

G<sub>3</sub>は、ハロ、C<sub>1</sub>-2アルキルまたはC<sub>1</sub>-2アルコキシを表す]  
 またはその薬学的に許容される塩  
 の使用。

【請求項24】

前記疾患が、アルツハイマー病、うつ病、パーキンソン病、他のパーキンソン病様障害お  
よび/または他のタウオパチー、レビー小体型認知症、多発性硬化症、ハンチントン病、  
軽度認知障害、脳損傷、外傷性脳損傷、脳卒中、他の認知症障害、運動神経疾患、ピック  
病、脊髄損傷、低酸素性虚血損傷、認知機能障害、冠動脈疾患、肥満、メタボリックシン  
ドローム、糖尿病、シャルコーマリートゥース病、糖尿病性ニューロパシー、組織再生、  
糖尿病誘発性骨粗しょう症、運動機能、神経損傷、難聴、失明、後眼部疾患、前眼部疾患  
、ドライアイ疾患、神経栄養角膜炎、緑内障、高眼圧（IOP）、網膜色素変性症、心的  
外傷後ストレス障害、WAGR症候群、プラダーウィリー症候群、嗅索疾患、嗅覚低下、  
嗅覚機能障害、不安、脆弱X症候群、先天性中枢性低換気症候群、強迫性障害、全身性不  
安障害、摂食障害、双極性障害、慢性疲労症候群、視神経脊髄炎、レット症候群、フリー  
ドリッヒ運動失調、および閉塞性睡眠時無呼吸-呼吸低下症候群からなる群から選択され  
る、請求項19、21、および22のいずれか一項に記載の医薬。

10

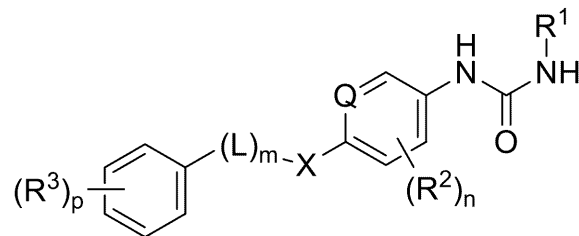
【請求項25】

前記疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、別のパーキンソン病様疾患、別のタウ  
オパチー、レビー小体型認知症、運動神経疾患、ピック病、肥満、メタボリックシン  
ドローム、糖尿病、およびレット症候群、後眼部疾患、および認知機能障害からなる群から選  
択される、請求項24に記載の医薬。

20

【請求項26】

式II、



(II)

30

[式中、

R<sub>1</sub>は、メチル；1つ以上のG<sub>1</sub>基で任意に置換されたフェニル；または1つ以上のG<sub>2</sub>  
基で任意に置換された5～9員のヘテロアリール基を表し、

G<sub>1</sub>は、ハロ；1つ以上のG<sub>a1</sub>基で任意に置換されたフェニル；1つ以上のG<sub>a2</sub>基で  
任意に置換されたフェノキシ；シアノ；-N(R<sub>a1</sub>)R<sub>a2</sub>；-C(O)N(R<sub>a3</sub>)  
R<sub>a4</sub>、1つ以上のG<sub>a3</sub>基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；1つ以上  
のG<sub>a4</sub>基で任意に置換された5～6員のヘテロアリール基；C<sub>1</sub>-4アルキル基または  
C<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ原子で任意に置換さ  
れており、または任意の2つのG<sub>1</sub>基が一緒に結合して、5～6員のヘテロシクリル環を  
形成してもよく、これは、1つ以上のG<sub>a5</sub>基で任意に置換されてもよく、

40

G<sub>2</sub>は、ハロ；1つ以上のG<sub>a6</sub>基で任意に置換されたフェニル；1つ以上のG<sub>a7</sub>基で  
任意に置換されたフェノキシ；シアノ；-N(R<sub>a5</sub>)R<sub>a6</sub>；-C(O)N(R<sub>a7</sub>)  
R<sub>a8</sub>、1つ以上のG<sub>a8</sub>基で任意に置換された4～7員のヘテロシクリル環；C<sub>1</sub>-4  
アルキル基またはC<sub>1</sub>-4アルコキシ基を表し、後者の2つの基は1つ以上のフルオロ基  
で任意に置換され、

nは、0、1、または2を表し、

R<sub>2</sub>は、ハロ；シアノ；-N(R<sub>a9</sub>)R<sub>a10</sub>；1つ以上のG<sub>a9</sub>基で任意に置換され  
た4～7員のヘテロシクリル環；もしくは1つ以上のG<sub>a10</sub>基で任意に置換されたフェ

50

ニル基を表し、後者の2つの基は、式Iの化合物中の関連するフェニル基にO原子を介して任意に結合されており；またはC<sub>1</sub>-6アルキル基、C<sub>1</sub>-6アルコキシ基、もしくは-S(O)<sub>q</sub>C<sub>1</sub>-6アルキル基を表し、後者の3つの基は、1つ以上のフルオロ、=O、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-2アルコキシもしくは-N(R<sub>a11</sub>)R<sub>a12</sub>基で任意に置換され、かつ/もしくは1つ以上のG<sub>a11</sub>基で任意に置換された4~7員ヘテロシクリル環で任意に置換されており；または1つ以上のG<sub>a12</sub>基で任意に置換されたフェニル基を表し、

qは、0、1、または2を表し、

Qは、-N-、-CH-を表し、

Xは、-C(R<sub>4</sub>)R<sub>5</sub>-、-O-、-S-、または-N(R<sub>6</sub>)-を表し、

mは、0または1を表し、

Lは、-C(R<sub>7</sub>)R<sub>8</sub>-を表し、

pは、0~1を表し、

R<sub>3</sub>はハロ；ヒドロキシ；シアノ；またはC<sub>1</sub>-4アルキルもしくはC<sub>1</sub>-4アルコキシを表し、各アルキル基もしくはアルコキシ基は、1つ以上のフルオロ基で任意に置換されており、

R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、それぞれ独立して、HまたはC<sub>1</sub>-2アルキルを表し、

R<sub>a1</sub>、R<sub>a2</sub>、R<sub>a3</sub>、R<sub>a4</sub>、R<sub>a5</sub>、R<sub>a6</sub>、R<sub>a7</sub>、R<sub>a8</sub>、R<sub>a9</sub>、R<sub>a10</sub>、R<sub>a11</sub>、およびR<sub>a12</sub>は、それぞれ独立して、HもしくはC<sub>1</sub>-3アルキルを表し、または

R<sub>a1</sub>およびR<sub>a2</sub>、R<sub>a3</sub>およびR<sub>a4</sub>、R<sub>a5</sub>およびR<sub>a6</sub>、R<sub>a7</sub>およびR<sub>a8</sub>、R<sub>a9</sub>およびR<sub>a10</sub>、ならびにR<sub>a11</sub>およびR<sub>a12</sub>は、独立して、それらが結している原子と共に、一緒に結合して、4~7員のヘテロシクリル環を形成してもよく、G<sub>a1</sub>、G<sub>a2</sub>、G<sub>a4</sub>、G<sub>a6</sub>、G<sub>a7</sub>、G<sub>a10</sub>、およびG<sub>a12</sub>はそれぞれ独立して、C<sub>1</sub>-2アルキルまたはハロを表し、

G<sub>a3</sub>、G<sub>a5</sub>、G<sub>a8</sub>、G<sub>a9</sub>、およびG<sub>a11</sub>はそれぞれ独立して、C<sub>1</sub>-2アルキル、ハロまたは=Oを表し、

R<sub>2</sub>基はまた、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>またはR<sub>8</sub>のうちのいずれか1つと一緒に結合して、4~7員のヘテロシクリル環、または5~6員のヘテロアリール環を形成してもよく、前記ヘテロシクリルまたはヘテロアリール環は、G<sub>3</sub>から選択される1つ以上の置換基によって任意に置換されており、

G<sub>3</sub>は、ハロ、C<sub>1</sub>-2アルキルまたはC<sub>1</sub>-2アルコキシを表す]

の化合物であって、

R<sub>1</sub>がメチルを表し、mが0であり、かつ、

(i) XがOまたはSを表す場合、nおよびpは、両方が0を表すものではなく、

(ii) XがOを表し、かつ

R<sub>2</sub>が、トリアジン環に対して3位にある単一のフルオロ基を表す場合、R<sub>3</sub>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一の-CF<sub>3</sub>基を表すものではなく、

R<sub>2</sub>が、トリアジン環に対して3位および5位にある2つのクロロ基を表す場合、R<sub>3</sub>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一の-OCF<sub>3</sub>もしくはシアノ基を表すものではなく、

R<sub>2</sub>が、トリアジン環に対して3位にある単一のクロロ基を表す場合、

(a) pは、0を表すものではない、もしくは

(b) pが1を表す場合、R<sub>3</sub>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にあるクロロ基を表すものではない、のいずれかであり、

nが0を表す場合、R<sub>3</sub>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のフルオロ、クロロ、-CF<sub>3</sub>、シアノもしくはメチル基、または3位にあるクロロ基を表すものではなく、

(iii) XがSを表し、かつ

10

20

30

40

50

R<sup>2</sup>がトリアジン環に対して3位および5位にある2つのクロロ原子を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して2位にある単一のエチル基、3位もしくは4位にある単一のエトキシ基、または4位にある単一のクロロ、ブromo、シアノ、-CF<sub>3</sub>もしくはtert-ブチル基を表すものではなく、

R<sup>2</sup>が、トリアジン環に対して3位および5位にある2つのメチル基を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のクロロもしくはブromo基を表すものではなく、

R<sup>2</sup>が、トリアジン環に対して2位および5位にある2つのメチル基を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のメチルもしくはtert-ブチル基を表すものではなく、

nが0を表す場合、R<sup>3</sup>は、ベンゼン環の結合点に対して4位にある単一のクロロ、メチル、シアノ、もしくはtert-ブチル基を表すものではない、という条件での、式IIの化合物とエトキシカルボニルイソシアネートとの反応の工程を含む、請求項1~18のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を調製するための方法。

10

**【請求項27】**

(I)請求項1~18のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、請求項19、21、22、24、及び25のいずれか一項に記載の医薬、または請求項20に記載の薬学的組成物；および

(II)ニューロトロフィンおよび/または他の栄養因子のシグナル伝達障害を特徴とする疾患の治療または予防に有用な1つ以上の他の治療薬

20

を含み、  
成分(I)および(II)のそれぞれが、任意で、薬学的に許容されるアジュバント希釈剤または担体などの薬学的に許容される賦形剤と混合して製剤化される、組み合わせ製品。

**【請求項28】**

(a)薬学的に許容されるアジュバント希釈剤または担体などの薬学的に許容される賦形剤と任意に混合されて製剤化された、請求項1~18のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、請求項19、21、22、24、及び25のいずれか一項に記載の医薬、または請求項20に記載の薬学的組成物；および

30

(b)薬学的に許容されるアジュバント希釈剤または担体などの薬学的に許容される賦形剤と任意に混合されて製剤化された、ニューロトロフィンおよび/または他の栄養因子のシグナル伝達障害を特徴とする疾患の治療または予防において有用である1つ以上の他の治療薬を含む薬学的組成物

を含み、

成分(a)および(b)が各々、他方と併せて投与するのに好適な形態で提供される、パーツキット。

40

50