

【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21年7月16日(2009.7.16)

【公表番号】特表2008-540443(P2008-540443A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-510216(P2008-510216)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/42	(2006.01)
C 0 7 D 401/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
C 0 7 D 405/14	(2006.01)
A 6 1 K 31/497	(2006.01)
C 0 7 D 403/04	(2006.01)
C 0 7 D 241/20	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 9/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 7/12	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/42	Z
C 0 7 D 401/04	C S P
A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 405/14	
A 6 1 K 31/497	
C 0 7 D 403/04	
C 0 7 D 241/20	
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 9/06	
A 6 1 P 25/14	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 7/12	

A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 29/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月22日(2009.4.22)

【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

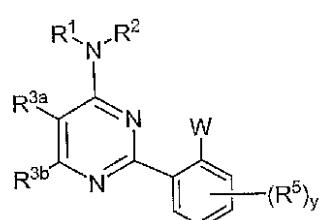
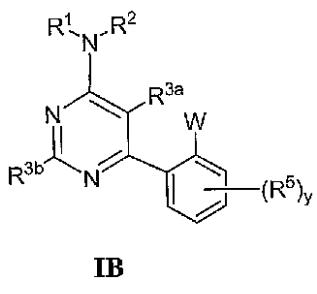
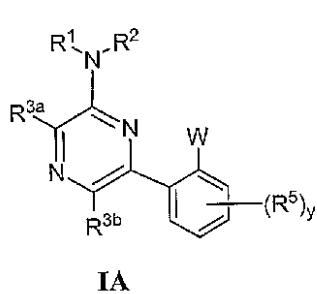
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

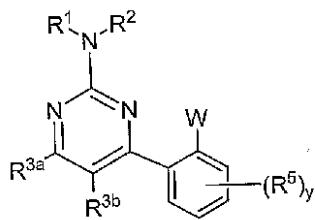
【請求項1】

以下の化学式IA、IB、IC又はIDの化合物であつて：

【化1】



または



式中：

Wがハロ、OR'、SR'、N(R')₂、CHF₂又はCH₂Fであり；

R¹及びR²が、それらが結合する窒素原子と一緒にになって、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択されるヘテロ原子を更に0～3個有する、場合により置換された3～8員の飽和又は部分不飽和单環であり；R¹及びR²が一緒にになって形成する環はそれぞれ、-R⁴が独立してz個存在する1つ以上の置換型炭素、窒素又は硫黄原子において場合により且つ独立して置換されており、zが0～5であり；

yが0～5であり；

R^{3a}及びR^{3b}が独立して水素又はX-R^Qであり、式中、XがC₁-C₆アルキリデン鎖であり、環Aに直接結合するそこに含まれる炭素原子を除いたXの2つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NRCO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-CONR-、-NRNR-、-NRSO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)-又は-POR-で置き換えられており；

R^Qが-R'、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-

$\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP(O)(OR')}_2$ 、 $-\text{P(O)(OR')}_2$ 、 $-\text{OP(O)}_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P(O)}_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO(R')}_2$ 又は $-\text{OPO(R')}_2$ から独立して選択され；

R^4 及び R^5 のそれぞれの存在が独立して $\text{Q}-\text{R}^\times$ であり；式中、 Q が結合であるか、又は C_1-C_6 アルキリデン鎖であり、 Q の2つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して $-\text{NR}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{COCO}-$ 、 $-\text{CONR}-$ 、 $-\text{NRCO}-$ 、 $-\text{NRCO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2-$ 、 $-\text{CONRNR}-$ 、 $-\text{NRCONR}-$ 、 $-\text{OCONR}-$ 、 $-\text{NRNR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{PO}-$ 、 $-\text{PO}_2-$ 、 $-\text{OP(O)(OR)-}$ 又は $-\text{POR-}$ で置き換えられており； R^\times のそれぞれの存在が、 $-\text{R}'$ 、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}'$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{COR}'$ 、 $-\text{NR}'\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{OCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP(O)(OR')}_2$ 、 $-\text{P(O)(OR')}_2$ 又は $-\text{OPO(R')}_2$ から独立して選択され；

R のそれぞれの存在が独立して水素、又は場合により置換される C_1-C_6 脂肪族基であり；

R' のそれぞれの存在が独立して水素、又は場合により置換される C_1-C_6 脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0～3個有する、3～8員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和单環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0～5個有する、8～12員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であるか；又は R 及び R' 、 R の2つの存在、若しくは R' の2つの存在が、それらが結合する原子と一緒にになって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0～4個有する、場合により置換される3～12員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和单環若しくは二環を形成するが；

但し：

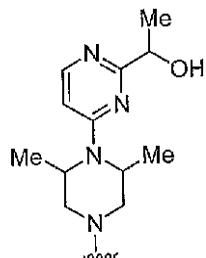
i) 化学式IBにおいて、 $\text{R}^{3\text{ a}}$ 及び $\text{R}^{3\text{ b}}$ が何れも水素であり、 y が0であり、 R^1 及び R^2 が一緒になってピペリジニル環を形成する場合、WがOHでもOMEでもなく；

ii) 化学式ICにおいて：

a . $\text{R}^{3\text{ a}}$ 及び $\text{R}^{3\text{ b}}$ が何れも水素であり、 y が0であり、WがOHである場合、一緒になる R^1 及び R^2 がピペリジン-1-イルではなく；

b . $\text{R}^{3\text{ a}}$ が水素であり、 $\text{R}^{3\text{ b}}$ がメチルであり、 y が0であり、WがOHである場合、一緒になる R^1 及び R^2 が、ピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、2-メチル-ピペリジン-1-イル、4-メチル-ピペリジン-1-イル、3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル、ヘキサヒドロ-1H-アゼピン-1-イル、4-モルホリン-1-イル、ピペラジン-1-イル、4-メチル-ピペラジン-1-イル、4-エチル-ピペラジン-1-イル、4-(ジフェニルメチル)-ピペラジン-1-イル、4-フェニル-ピペラジン-1-イル又は

【化2】



ではなく；

i i i) 化学式 I Dにおいて：

a . R^{3 a} 及び R^{3 b} が何れも水素であり、y が 0 であり、W が OH である場合、一緒になる R¹ 及び R² がピペリジン - 1 - イルではなく；

b . R^{3 a} 及び R^{3 b} が何れも水素であり、W が、R⁵、y 及びそれに結合するフェニルと一緒にになって、2 - ヒドロキシ - 5 - (4' - ヒドロキシフェニル) となる場合、一緒になる R¹ 及び R² が、場合により置換される 4 - チオモルホリン - 1 - イルではなく；

c . R^{3 a} 及び R^{3 b} が何れも水素であり、W が、R⁵、y 及びそれに結合するフェニルと一緒にになって、2 , 4 - ジメトキシフェニルとなる場合、一緒になる R¹ 及び R² が 4 - ヒドロキシ - 4 - (4' - プロモフェニル) - ピペリジン - 1 - イルではなく；

d . R^{3 a} 及び R^{3 b} が何れも水素であり、y が 0 であり、W がメトキシである場合、一緒になる R¹ 及び R² が：

A . ピロリジン - 1 - イル、4 - モルホリン - 1 - イル、3 , 5 - ジメチル - 4 - モルホリン - 1 - イル、4 - チオモルホリン - 1 - イル又はヘキサヒドロ - 1 H - アゼピン - 1 - イル；

B . メチル、アミノカルボニル、エトキシカルボニル、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、1 - ヒドロキシ - 1 , 1 - ジフェニルメチル、ベンジル又は場合により置換されるフェニルで 4 位において場合により置換されるピペリジン - 1 - イル；

C . CHO、メチル又は場合により置換されるフェニル、ピリジル若しくはベンジルで 4 位において場合により置換されるピペラジン - 1 - イル；

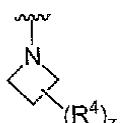
ではない、

化合物、或いはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R¹ 及び R² が一緒にになってアゼチジニル環：

【化 3】



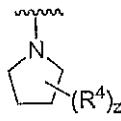
aa

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ 及び R² が一緒にになってピロリジニル環：

【化 4】



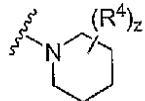
bb

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ 及び R² が一緒にになってピペリジニル環：

【化 5】



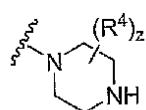
cc

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹及びR²が一緒になってピペラジニル環：

【化 6】

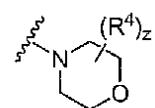
**dd**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R¹及びR²が一緒になってモルホリニル環：

【化 7】

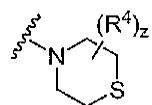
**ee**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R¹及びR²が一緒になってチオモルホリニル環：

【化 8】

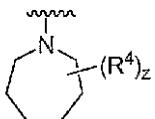
**ff**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R¹及びR²が一緒になってアゼパニル環：

【化 9】

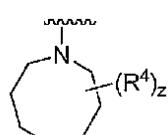
**gg**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R¹及びR²が一緒になってアゾカニル環：

【化 10】

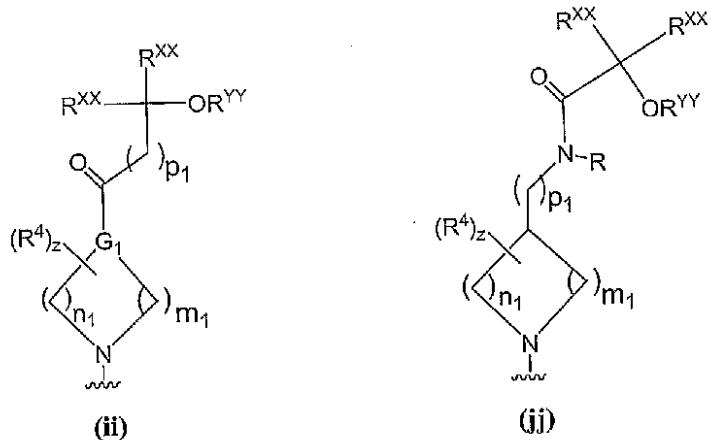
**hh**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R¹及びR²が一緒になって以下に示す環 (i i) 又は (j j) を形成し：

【化 1 1】



式中：

G^1 が $-N-$ 、 $-CH-NH-$ 又は $-CH-CH_2-NH-$ であり；
 m_1 及び n_1 がそれぞれ独立して $0 \sim 3$ であるが、但し、 $m_1 + n_1$ が $2 \sim 6$ であり；
 p_1 が $0 \sim 2$ であり；
 z が $0 \sim 4$ であり；

各 R^{X_X} が水素、C₁ ~ C₆ 脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり； R^{X_X} が場合により - R¹
の w₁ 個の独立した存在により置換されており、w₁ が 0 ~ 3 であるが；

但し、両方の $R^{x \times x}$ が同時に水素ではなく；

R^Y が水素、-COR'、-CO₂R'、-CON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-P(O)(OR')₂、-P(O)₂OR' 又は -PO(R')₂ であり；

R^{1-1} のそれぞれの存在が独立して $Q - R^X$ であり；式中、 Q が結合であるか、又が $C_1 - C_6$ アルキリデン鎖であり、 Q の 2 つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)$ 又は $-POR-$ で置き換えられており； R^X のそれぞれの存在が、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'CO$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 又は $-OPO(R')_2$ から独立して選択され：

Rのそれぞれの存在が独立して水素、又は3個までの置換基を有するC₁~6脂肪族基であり；R'のそれぞれの存在が独立して水素、又はC₁~6脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0~3個有する、3~8員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0~5個有する、8~12員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、R'が4個までの置換基を有するか；又はR及びR'、Rの2つの存在、若しくはR'の2つの存在が、それらが結合する原子と一緒にになって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を0~4個有する、場合により置換される3~12員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環若しくが二環を形成する、請求項1に記載の

化合物。

【請求項 1 1】

一方の $R^{X \times}$ が水素であり、もう一方の $R^{X \times}$ が水素ではない、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

$R^{X \times}$ が何れも水素ではない、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

p_1 が 0 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

p_1 が 1 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

p_1 が 2 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

m_1 及び n_1 がそれぞれ 1 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

m_1 及び n_1 がそれぞれ 2 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

m_1 及び n_1 がそれぞれ 3 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

$R^{X \times}$ が $C_{1 - 6}$ 脂肪族基であり、 $R^{X \times}$ が場合により - $R^{1 - 1}$ の w_1 個の独立した存在により置換されており、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 1 0 ~ 1 8 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

$R^{X \times}$ が場合により - $R^{1 - 1}$ の w_1 個の独立した存在により置換されている $C_{1 - C_6}$ アルキル基であり、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 1 0 ~ 1 9 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

$R^{X \times}$ が $C_{1 - C_6}$ アルキル基である、請求項 1 0 ~ 2 0 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 2】

$R^{X \times}$ が窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、 $R^{X \times}$ が場合により - $R^{1 - 1}$ の w_1 個の独立した存在により置換されており、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

$R^{X \times}$ が窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環であり、 $R^{X \times}$ が場合により - $R^{1 - 1}$ の w_1 個の独立した存在により置換されており、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

$R^{X \times}$ が窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、 $R^{X \times}$ が場合により - $R^{1 - 1}$ の w_1 個の独立した存在により置換されており、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

$R^{Y \times}$ が水素、-COR'、-CO₂R'、-CON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-P(O)(O R')₂、-P(O)₂OR' 又は -PO(R') である、請求項 1 0 ~ 2 4 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 6】

$R^{Y \times}$ が水素である、請求項 2 5 に記載の化合物。

【請求項 27】

R^{YY} が -COR'、-CO₂R'、-CON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-P(O)(OR')₂、-P(O)₂OR' 又は -PO(R') である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 28】

R が水素である、請求項 10 ~ 27 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 29】

R が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 ~ 27 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 10 ~ 27 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 31】

R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 32】

p_1 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 33】

R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

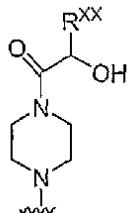
【請求項 34】

p_1 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 35】

R^1 及び R^2 が一緒になって以下に示す環：

【化 12】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 36】

R^{XX} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 35 に記載の化合物。

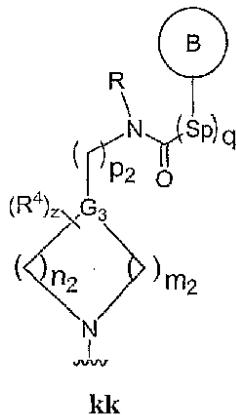
【請求項 37】

R^{XX} がメチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル又は t-ブチルである、請求項 35 に記載の化合物。

【請求項 38】

R^1 及び R^2 が一緒になって以下に示す環 (k k) :

【化13】



を形成し；

式中：

 G_3 が -N- 又は CH であり； m_2 及び n_2 がそれぞれ独立して 0 ~ 3 であるが、但し、 $m_2 + n_2$ が 2 ~ 6 であり； p_2 が 0 ~ 2 であるが；但し、 G_3 が N である場合、 p_2 が 0 ではなく； q_2 が 0 又は 1 であり； z が 0 ~ 4 であり；

S_p が結合又は $C_1 - C_6$ アルキリデンリンカーであり、2つまでのメチレン単位が、場合により且つ独立して -O-、-S-、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR'-、-CONR'NR'-、-CO₂-、-OCO-、-NR'CO₂-、-NR'CONR'-、-OCONR'-、-NR'NR'-、-NR'NR'CO-、-NR'CO-、-SO-、-SO₂-、-NR'-、-SO₂NR'-、-NR'SO₂- 又は -NR'SO₂NR' - で置き換えられており；

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和又は芳香族の単環複素環であり、環 B が場合により $-R^{1-2}$ の w_2 個の独立した存在により置換されており、 w_2 が 0 ~ 4 であり；

R^{1-2} のそれぞれの存在が独立して $Q - R^X$ であり；式中、Q が結合であるか、又は $C_1 - C_6$ アルキリデン鎖であり、Q の 2 つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して -NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NR₂CO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NR₂SO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)- 又は -POR- で置き換えられており； R^X のそれぞれの存在が、-R'、ハロゲン、=O、=NR'、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'CO'R'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCO'R'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂ 又は -OPO(R')₂ から独立して選択され；

R のそれぞれの存在が独立して水素、又は 3 個までの置換基を有する C_{1-6} 脂肪族基であり； R' のそれぞれの存在が独立して水素又は C_{1-6} 脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和单環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、 R' が 4 個までの置換基を有するか；又は R 及び R' 、 R の 2 つの存在、若しくは R' の 2 つの存在が、それらが結合する原子と一緒にになって、窒素、酸素若しくは硫黄か

ら独立して選択されるヘテロ原子を0～4個有する、場合により置換される3～12員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和単環若しくは二環を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項39】

G_3 がNである、請求項38に記載の化合物。

【請求項40】

G_3 がCHである、請求項38に記載の化合物。

【請求項41】

p_2 が0である、請求項38～40の何れか1項に記載の化合物。

【請求項42】

p_2 が1である、請求項38～40の何れか1項に記載の化合物。

【請求項43】

p_2 が2である、請求項38～40の何れか1項に記載の化合物。

【請求項44】

q_2 が0である、請求項38～43の何れか1項に記載の化合物。

【請求項45】

q_2 が1である、請求項38～43の何れか1項に記載の化合物。

【請求項46】

p_2 が1であり、 q_2 が1である、請求項38に記載の化合物。

【請求項47】

G_3 がCHであり、 p_2 が0であり、 q_2 が1である、請求項38に記載の化合物。

【請求項48】

m_2 及び n_2 がそれぞれ1である、請求項38に記載の化合物。

【請求項49】

m_2 及び n_2 がそれぞれ2である、請求項38～48の何れか1項に記載の化合物。

【請求項50】

S pが-O-、-S-又は-NR'-から選択される、請求項38～49の何れか1項に記載の化合物。

【請求項51】

S pが-O-である、請求項38～50の何れか1項に記載の化合物。

【請求項52】

S pが-NR'-である、請求項38～50の何れか1項に記載の化合物。

【請求項53】

S pが-NH-である、請求項38～50の何れか1項に記載の化合物。

【請求項54】

環Bが、O、S又はNから選択される1～4個のヘテロ原子を有する、4～8員の飽和、部分不飽和又は芳香族の単環複素環であり、環Bが場合により-R^{1～2}のw₂個の独立した存在により置換されており、w₂が0～4である、請求項38～53の何れか1項に記載の化合物。

【請求項55】

環Bが、O、S又はNから選択される1～4個のヘテロ原子を有する、4～8員の飽和单環複素環であり、環Bが場合により-R^{1～2}のw₂個の独立した存在により置換されており、w₂が0～4である、請求項38～54の何れか1項に記載の化合物。

【請求項56】

環Bが、O、S又はNから選択される1～2個のヘテロ原子を有する、5～6員飽和单環複素環であり、環Bが場合により-R^{1～2}のw₂個の独立した存在により置換されており、w₂が0～4である、請求項38～55の何れか1項に記載の化合物。

【請求項57】

w₂が0である、請求項38～56の何れか1項に記載の化合物。

【請求項58】

環 B がテトラヒドロフラニルである、請求項 38 ~ 57 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 59】

S p が結合、O 又は - O - C H₂ - であり；p₂ が 1 であり；R が水素であり；n₂ 及び m₂ が何れも同時に 1 又は 2 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 60】

R が水素である、請求項 38 ~ 59 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 61】

R がC1-C6 アルキルである、請求項 60 に記載の化合物。

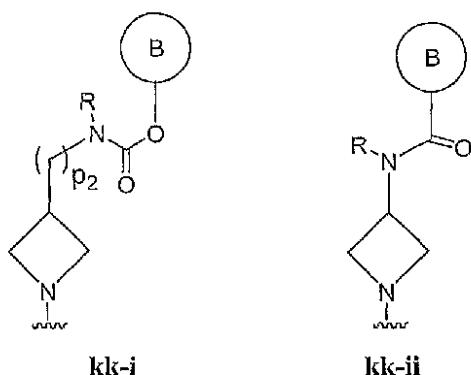
【請求項 62】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 60 に記載の化合物。

【請求項 63】

R¹ 及び R² が一緒になって以下の化学式 (kk-i) 又は化学式 (kk-ii) :

【化 14】



の環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 64】

環 B が、O、S 又はN から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員飽和单環複素環であり、環 B が場合により - R¹² の w₂ 個の独立した存在により置換されており、w₂ が 0 ~ 4 である、請求項 63 に記載の化合物。

【請求項 65】

R が水素である、請求項 63 ~ 64 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 66】

R が水素であり、環 B がテトラヒドロフラニルである、請求項 65 に記載の化合物。

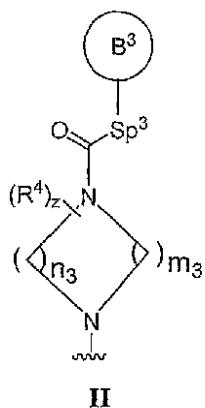
【請求項 67】

S p が結合、- O - 又は - O - C H₂ - である、請求項 63 ~ 66 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 68】

R¹ 及び R² が一緒になって以下の環 (II) を形成し：

【化15】



式中：

m_3 及び n_3 がそれぞれ独立して 0 ~ 3 であるが、但し、 $m_3 + n_3$ は 2 ~ 6 であり；
 z が 0 ~ 4 であり；

Sp^3 が -O-、-S-、-NR' - 又は C1-C6 アルキリデンリンカーであり、2つまでのメチレン単位が、場合により且つ独立して -O-、-S-、-CO-、-CS-、
- COCO-、-CONR' -、-CONR' NR' -、-CO2-、-OCO-、-NR' CO2-、-NR' CONR' -、-OCONR' -、-NR' NR' -、-NR'
NR' CO-、-NR' CO-、-SO-、-SO2-、-NR' -、-SO2NR' -、-NR' SO2- 又は -NR' SO2NR' - で置き換えられているが、但し、 Sp^3 は炭素原子を除いた原子を介してカルボニル基に結合してあり；

環 B_3 が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和又は芳香族の単環複素環であり、環 B_3 が場合により $-R^{1\sim 3}$ の w_3 個の独立した存在により置換されており、 w_3 が 0 ~ 4 であり；

$R^{1\sim 3}$ のそれぞれの存在が独立して $Q - R^X$ であり；式中、 Q が結合であるか、又は $C_1 - C_6$ アルキリデン鎖であり、 Q の2つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して -NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO2-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NR CO_2 -、-SO2NR-、-NRSO2-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NR SO_2 NR-、-SO-、-SO2-、-PO-、-PO2-、-OP(O)(OR)- 又は -POR- で置き換えられており； R^X のそれぞれの存在が、-R'、ハロゲン、=O、=NR'、-NO2、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')2、-NR'CO R' 、-NR'CON(R')2、-NR'CO2R'、-COR'、-CO2R'、-OCOR'、-CON(R')2、-OCON(R')2、-SOR'、-SO2R'、-SO2N(R')2、-NR'SO2R'、-NR'SO2N(R')2、-COCO R' 、-COCH2COR'、-OP(O)(OR')2、-P(O)(OR')2、-OP(O)2OR'、-P(O)2OR'、-PO(R')2 又は -OPO(R')2 から独立して選択され；

R のそれぞれの存在が独立して水素、又は3個までの置換基を有する $C_{1\sim 6}$ 脂肪族基であり； R' のそれぞれの存在が独立して水素又は $C_{1\sim 6}$ 脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和单環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、 R' が 4 個までの置換基を有するか；又は R 及び R' 、 R の2つの存在、若しくは R' の2つの存在が、それらが結合する原子と一緒にになって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 4 個有する、場合により置換される 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和单環若しくは二環を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項 6 9】

$S p^3$ が - O - 、 - S - 又は - N R ' - から選択される、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 0】

$S p^3$ が - O - である、請求項 6 8 ~ 6 9 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 1】

$S p^3$ が - O - C H₂ - である、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

$S p^3$ が - N R ' - である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

$S p^3$ が - N H - である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 4】

$S p^3$ が - N H - C H₂ - である、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 5】

m_3 及び n_3 がそれぞれ 1 である、請求項 6 8 ~ 7 4 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 6】

m_3 及び n_3 がそれぞれ 2 である、請求項 7 5 に記載の化合物。

【請求項 7 7】

環 B₃ が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和又は芳香族の単環複素環であり、環 B₃ が場合により - R^{1~3} の w_3 個の独立した存在により置換されており、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 8】

環 B₃ が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和単環複素環であり、環 B₃ が場合により - R^{1~3} の w_3 個の独立した存在により置換されており、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 7 7 に記載の化合物。

【請求項 7 9】

環 B₃ が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員飽和単環複素環であり、環 B₃ が場合により - R^{1~3} の w_3 個の独立した存在により置換されており、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 0】

w_3 が 0 である、請求項 6 8 ~ 7 9 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 1】

環 B₃ がテトラヒドロフラニルである、請求項 6 8 ~ 8 0 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 2】

$S p^3$ が結合、O 又は - O - C H₂ - あり；R が水素であり； n_3 及び m_3 が何れも同時に 1 又は 2 である、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 8 3】

R が水素である、請求項 6 8 ~ 8 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 4】

R が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 6 8 ~ 8 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 5】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 8 4 に記載の化合物。

【請求項 8 6】

z が 0 である、請求項 6 8 ~ 8 5 の何れか 1 項に記載の化合物。

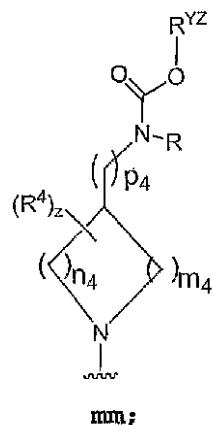
【請求項 8 7】

環 B₃ が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員飽和単環複素環であり、環 B₃ が場合により - R^{1~3} の w_3 個の独立した存在により置換されており、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8 8】

R¹ 及び R² が一緒に環 (m m) を形成し：

【化16】



式中：

m_4 及び n_4 がそれぞれ独立して 0 ~ 3 であるが、但し、 $m_4 + n_4$ が 2 ~ 6 であり；
 p_4 が 1 ~ 2 であり；
 $R^{Y\ Z}$ が場合により - $R^{1\ 4}$ の w_4 個の独立した存在により置換される $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり、 w_4 が 0 ~ 3 であり；

$R^{1\ 4}$ のそれぞれの存在が独立して $Q - R^X$ であり；式中、 Q が結合であるか、又は $C_1 - C_6$ アルキリデン鎖であり、 Q の 2 つまでの非隣接メチレン単位が、場合により且つ独立して - $NR-$ 、- $S-$ 、- $O-$ 、- $CS-$ 、- CO_2- 、- $OCO-$ 、- $CO-$ 、- $COCO-$ 、- $CONR-$ 、- $NRCO-$ 、- $NRCO_2-$ 、- SO_2NR- 、- $NRSO_2-$ 、- $CONRNR-$ 、- $NRCONR-$ 、- $OCONR-$ 、- $NRNR-$ 、- $NRSO_2NR-$ 、- $SO-$ 、- SO_2- 、- $PO-$ 、- PO_2- 、- $OP(O)(OR)-$ 又は - $POR-$ で置き換えられており； R^X のそれぞれの存在が、- R' 、ハロゲン、= O 、= NR' 、- NO_2 、- CN 、- OR' 、- SR' 、- $N(R')_2$ 、- $NR'CO$ R' 、- $NR'CON(R')_2$ 、- $NR'CO_2R'$ 、- COR' 、- CO_2R' 、- $OCOR'$ 、- $CON(R')_2$ 、- $OCON(R')_2$ 、- SOR' 、- SO_2R' 、- $SO_2N(R')_2$ 、- $NR'SO_2R'$ 、- $NR'SO_2N(R')_2$ 、- $COCOR'$ 、- $COCH_2COR'$ 、- $OP(O)(OR')_2$ 、- $P(O)(OR')_2$ 、- $OP(O)_2OR'$ 、- $P(O)_2OR'$ 、- $PO(R')_2$ 又は - $OPO(R')_2$ から独立して選択され；

R のそれぞれの存在が独立して水素、又は 3 個までの置換基を有する $C_1 - C_6$ 脂肪族基であり； R' のそれぞれの存在が独立して水素、又は $C_1 - C_6$ 脂肪族基、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 3 個有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和單環、又は窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 5 個有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和二環系であり、 R' が 4 個までの置換基を有するか；又は R 及び R' 、 R の 2 つの存在、若しくは R' の 2 つの存在が、それらが結合する原子と一緒にになって、窒素、酸素若しくは硫黄から独立して選択されるヘテロ原子を 0 ~ 4 個有する、場合により置換される 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和若しくは完全不飽和單環若しくは二環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8 9】

p_4 が 1 である、請求項 8 8 に記載の化合物。

【請求項 9 0】

p_4 が 2 である、請求項 8 8 に記載の化合物。

【請求項 9 1】

m_4 及び n_4 がそれぞれ 1 である、請求項 8 7 ~ 9 0 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 2】

m_4 及び n_4 がそれぞれ 2 である、請求項 8 7 ~ 9 0 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 3】

m_4 及び n_4 がそれぞれ 3 である、請求項 8 7 ~ 9 0 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 4】

R^{Y^Z} が場合により - R^{1^4} の w_4 個の独立した存在により置換される C 1 - C 6 アルキルであり、 w_4 が 0 ~ 3 である、請求項 8 8 ~ 9 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 5】

R^{Y^Z} が場合により - R^{1^4} の w_4 個の独立した存在により置換される C 1 - C 4 アルキル基であり、 w_4 が 0 ~ 3 である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 6】

R^Y が C 1 - C 6 アルキル基である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 7】

R が水素である、請求項 8 7 ~ 9 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 8】

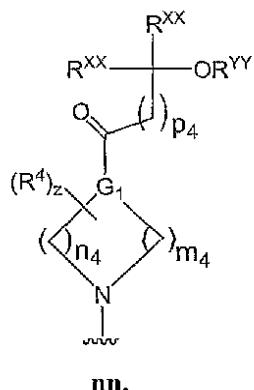
R が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 8 7 ~ 9 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9 9】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 9 8 に記載の化合物。

【請求項 1 0 0】

R^1 及び R^2 が一緒になって環 ($n n$) :

【化 1 7】

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 0 1】

G_1 が - N - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 2】

G_1 が - C H - N H - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 3】

G_1 が - C H - C H₂ - N H - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 4】

R^{Y^Y} が水素であり、一方の R^{X^X} が水素であり、もう一方の R^{X^X} が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 1 0 0 ~ 1 0 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

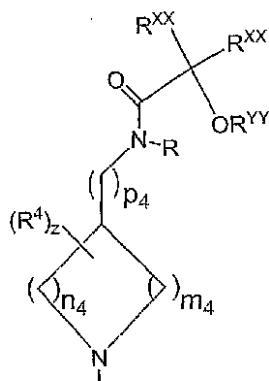
【請求項 1 0 5】

p_4 が 0 であり、 R^{Y^Y} が水素であり、一方の R^{X^X} が水素であり、もう一方の R^{X^X} が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 1 0 0 ~ 1 0 4 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 0 6】

R^1 及び R^2 が一緒になって環 ($p p$) :

【化18】



pp.

を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項107】

R^{YY}が水素であり、一方のR^{XX}が水素であり、もう一方のR^{XX}がC1-C6アルキルである、請求項106に記載の化合物。

【請求項108】

p₄が0であり、R^{YY}が水素であり、一方のR^{XX}が水素であり、もう一方のR^{XX}がC1-C6アルキルである、請求項100~107の何れか1項に記載の化合物。

【請求項109】

WがOR'である、請求項1~108の何れか1項に記載の化合物。

【請求項110】

WがOHである、請求項109に記載の化合物。

【請求項111】

WがSR'である、請求項1~110の何れか1項に記載の化合物。

【請求項112】

WがSHである、請求項111に記載の化合物。

【請求項113】

WがN(R')₂である、請求項1~110の何れか1項に記載の化合物。

【請求項114】

WがNHR'である、請求項113に記載の化合物。

【請求項115】

WがNH₂である、請求項114に記載の化合物。

【請求項116】

WがCHF₂又はCH₂Fである、請求項1~110の何れか1項に記載の化合物。

【請求項117】

WがCHF₂である、請求項116に記載の化合物。

【請求項118】

WがCH₂Fである、請求項116に記載の化合物。

【請求項119】

zが0~5である、請求項1~118の何れか1項に記載の化合物。

【請求項120】

zが1~3である、請求項119に記載の化合物。

【請求項121】

zが1~2である、請求項120に記載の化合物。

【請求項122】

zが1である、請求項121に記載の化合物。

【請求項123】

R^4 が独立してハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OC(=O)NR'、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、又はC₁-C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、環式脂肪族、ヘテロ環式脂肪族、アリールC₁-C₆アルキル、ヘテロアリールC₁-C₆アルキル、環式脂環族C₁-C₆アルキル若しくはヘテロ環式脂環族C₁-C₆アルキルから選択される場合により置換される基である、請求項1～122の何れか1項に記載の化合物。

【請求項124】

R^4 が独立してCl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHC(H₂CH(CH₃)₂)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHC(H₂CH(CH₃)₂)₂、-C(O)CH₂CH₃、又はピペリジニル(piperidinyl)、ピペリジニル(piperizinyl)、モルホリノ、C₁-₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジル又は-CH₂チアゾリルから選択される場合により置換される基である、請求項123に記載の化合物。

【請求項125】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼチジン-1-イル(aa)であり、zが1又は2であり、R⁴の少なくとも1つの存在が-NRSO₂R'、-NRCOO₂R'又は-NRCOR'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項126】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼチジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、R⁴が-NRSO₂R'である、請求項125に記載の化合物。

【請求項127】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼチジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、R⁴が-NRCOO₂R'である、請求項125に記載の化合物。

【請求項128】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼチジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、R⁴が-NRCOR'である、請求項125に記載の化合物。

【請求項129】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるピロリジン-1-イル(bb)であり、zが1又は2であり、R⁴がCl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'又は-CH₂OR'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項130】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるピペリジン-1-イル(cc)であり、zが1又は2であり、R⁴の少なくとも1つの存在が、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'又は-CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOO₂R'又は-OC(=O)NR'₂である、請求項1に記載の化合物。

【請求項131】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるピペリジン-1-イル(cc)であり、zが1であり、R⁴がF、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'又は-CH₂OR'である、請求項130に記載の化合物。

【請求項132】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるピペリジン-1-イル(cc)であり、zが1であり、R⁴が-NRSO₂R'である、請求項130に記載の化合物。

【請求項133】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペリジン - 1 - イル (c c) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - N R C O O R ' である、請求項 130 に記載の化合物。

【請求項 134】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 又は 2 であり、 R^4 の少なくとも 1 つの存在が - S O R ' 、 - C O N (R ')₂ 、 - S O₂ N (R ')₂ 、 - C O R ' 又は - C O O R ' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 135】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - S O R ' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 136】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O O R ' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 137】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O N (R ')₂ である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 138】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - S O₂ N (R ')₂ である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 139】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるピペラジン - 1 - イル (d d) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O R ' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 140】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 又は 2 であり、 R^4 の少なくとも 1 つの存在が - S O R ' 、 - C O N (R ')₂ 、 - S O₂ N (R ')₂ 、 - C O R ' 又は - C O O R ' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 141】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - S O R ' である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 142】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O O R ' である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 143】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O N (R ')₂ である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 144】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - S O₂ N (R ')₂ である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 145】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるモルホリン - 1 - イル (e e) 又はチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - C O R ' である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 146】

一緒になる R^1 及び R^2 が、場合により置換されるアゼパン - 1 - イル (g g) であり、 z が 1 又は 2 であり、 R^4 の少なくとも 1 つの存在が - S O R ' 、 - C O N (R ')₂ 、

- SO₂N(R')₂、-COR'又は-COO'R'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項147】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり、R⁴が-SOR'である、請求項146に記載の化合物。

【請求項148】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり、R⁴が-COO'R'である、請求項146に記載の化合物。

【請求項149】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり、R⁴が-CO(N(R')₂)である、請求項146に記載の化合物。

【請求項150】

一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり、R⁴が-SO₂N(R')₂である、請求項146に記載の化合物。

【請求項151】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり、R⁴が-COR'である、請求項146に記載の化合物。

【請求項152】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1又は2であり、R⁴の少なくとも1つの存在が-SOR'、-CO(N(R')₂)、-SO₂N(R')₂、-COR'又は-COO'R'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項153】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり、R⁴が-SOR'である、請求項152に記載の化合物。

【請求項154】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり、R⁴が-COO'R'である、請求項152に記載の化合物。

【請求項155】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり、R⁴が-CO(N(R')₂)である、請求項152に記載の化合物。

【請求項156】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり、R⁴が-SO₂N(R')₂である、請求項152に記載の化合物。

【請求項157】

と一緒になるR¹及びR²が、場合により置換されるアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり、R⁴が-COR'である、請求項152に記載の化合物。

【請求項158】

yが0～5である、請求項124～157の何れか1項に記載の化合物。

【請求項159】

yが0である、請求項158に記載の化合物。

【請求項160】

yが1～3である、請求項158に記載の化合物。

【請求項161】

yが1～2である、請求項160に記載の化合物。

【請求項162】

yが1である、請求項161に記載の化合物。

【請求項163】

R⁵が独立してハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂

、 - O P (O)₂ O R' 、 - P (O)₂ O R' 、 - P O (R')₂ 、 - O P O (R')₂ 、 又は C₁ - C₆ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、環式脂肪族、ヘテロ環式脂肪族、アリール C₁ - C₆ アルキル、ヘテロアリール C₁ - C₆ アルキル、環式脂環族 C₁ - C₆ アルキル又はヘテロ環式脂環族 C₁ - C₆ アルキルから選択される場合により置換される基である、請求項 124 ~ 162 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 164】

R⁵ が独立して C₁、Br、F、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン-1-イル、OCOCH(CH₃)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、場合により置換されるフェノキシ、又は場合により置換されるベンジルオキシである、請求項 163 に記載の化合物。

【請求項 165】

R⁵ が F である、請求項 164 に記載の化合物。

【請求項 166】

R⁵ が OR' である、請求項 163 に記載の化合物。

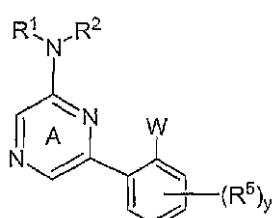
【請求項 167】

R⁵ が OH である、請求項 166 に記載の化合物。

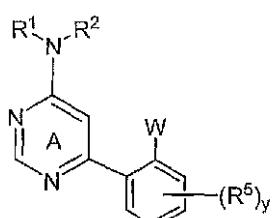
【請求項 168】

前記化合物が以下の化学式 I-A-i、化学式 I-B-i、化学式 I-C-i 又は化学式 I-D-i :

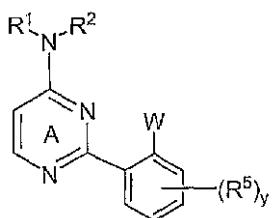
【化 19】



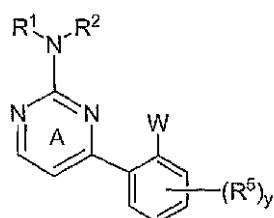
IA-i



IB-i



IC-i



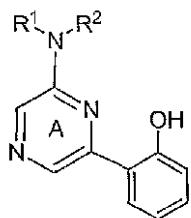
ID-i

を有する、請求項 1 ~ 108 の何れか 1 項に記載の化合物 ;
或いはその薬学的に許容される塩。

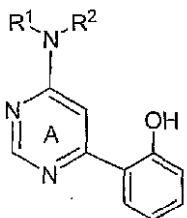
【請求項 169】

前記化合物が以下の化学式 I A - i i、化学式 I B - i i、化学式 I C - i i 又は化学式 I D - i i :

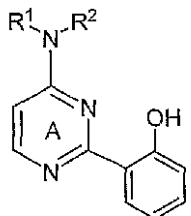
【化20】



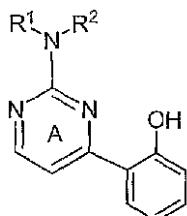
IA-ii



IB-ii



IC-ii



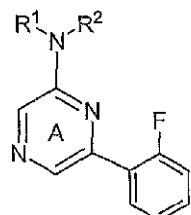
ID-ii ;

を有する、請求項1～108の何れか1項に記載の化合物；
或いはその薬学的に許容される塩。

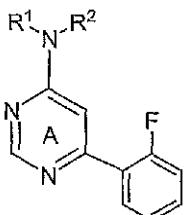
【請求項170】

前記化合物が以下の化学式IA-iii i i i、化学式IB-iii i i i、化学式IC-iii i i i又は
化学式ID-iii i i i :

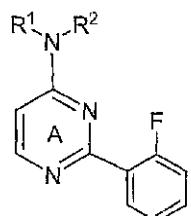
【化21】



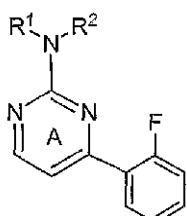
IA-iii



IB-iii



IC-iii



ID-iii ;

を有する、請求項1～108の何れか1項に記載の化合物；
或いはその薬学的に許容される塩。

【請求項171】

前記化合物が表2Aから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項172】

請求項1～171の何れか1項に記載の化合物及び薬学的に許容されるアジュバント又は
担体を含む薬学的組成物。

【請求項173】

急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、偏頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、
ヘルペス性神経痛、全身性神経痛、癲癇又は癲癇状態、神経変性障害、精神障害、例えば
不安及びうつ病、ミオトニー、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調、多発性硬

化症、過敏性腸症候群、失禁、内臓痛、骨関節痛、ヘルペス後神経痛、糖尿病性神経障害、脊髄根痛、坐骨神経痛、背部痛、頭頸部痛、重度又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突破性疼痛、術後疼痛又は癌性疼痛から選択される疾患、障害又は状態を処置するか、又はその重症度を低下させるための、請求項172に記載の薬学的組成物。

【請求項174】

前記疾患、状態又は障害が電圧ゲート性ナトリウムチャネルの活性化又は過剰活性に関与している、請求項173に記載の薬学的組成物。

【請求項175】

前記疾患、状態又は障害が急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛である、請求項174に記載の薬学的組成物。

【請求項176】

前記疾患、状態又は障害が脊髄根痛、坐骨神経痛、背部痛、頭部痛又は頸部痛である、請求項174に記載の薬学的組成物。

【請求項177】

前記疾患、状態又は障害が重度又は難治性疼痛、急性疼痛、術後疼痛、背部痛又は癌性疼痛である、請求項174に記載の薬学的組成物。

【請求項178】

前記疾患が大腿癌性疼痛；非悪性慢性骨疼痛；慢性関節リューマチ；骨関節炎；脊髄狭窄；神経障害性下部背部痛；顔面筋疼痛症候群；線維筋肉痛；側頭下頸関節疼痛；慢性内臓痛、例えば腹部；臍臓；IBS疼痛；慢性頭痛；偏頭痛；緊張性頭痛、例えば群発性頭痛；慢性神経障害性疼痛、例えばヘルペス後神経痛；糖尿病性神経障害；HIV関連神経障害；三叉神経痛；シャルコー・マリ工歯部神経障害；遺伝性感覚神経障害；末梢神経損傷；疼痛性神経腫；異所性近位遠位放電；神経根障害；化学療法誘導神経障害性疼痛；放射線療法誘導神経障害性疼痛；乳房切除後疼痛；中枢痛；脊髄損傷疼痛；卒中後疼痛；視床性疼痛；複合的の局所疼痛症候群；幻想痛；難治性疼痛；急性疼痛、急性術後疼痛；急性筋骨格疼痛；関節痛；機械的下部背部痛；頸部痛；腱炎；損傷／運動痛；急性内臓痛、例えば腹痛；腎孟腎炎；虫垂炎；胆囊炎；腸閉塞；ヘルニア等；胸部痛、例えば心臓痛；骨盤痛；腎仙痛；急性産科痛、例えば陣痛；帝王切開痛；急性炎症、熱傷及び外傷性疼痛；急性間欠性疼痛、例えば子宮内膜症；急性帶状疱疹疼痛；鎌状赤血球貧血；急性脾臓炎；突破性疼痛；口腔顔面疼痛、例えば複鼻腔疼痛、歯痛；多発性硬化症(MS)疼痛；うつ病における疼痛；らい病疼痛；ペーチェット病疼痛；有痛脂肪症；静脈炎疼痛；ギヤン・パレー疼痛；脚部痛及び運動時踵部痛；ハグランド症候群；皮膚紅痛症；ファブリー病性疼痛；膀胱及び泌尿器疾患、例えば尿失禁；過剰活性膀胱；疼痛性膀胱症候群；間質性膀胱炎(ICC)；又は前立腺炎から選択される、請求項174に記載の薬学的組成物。