

【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

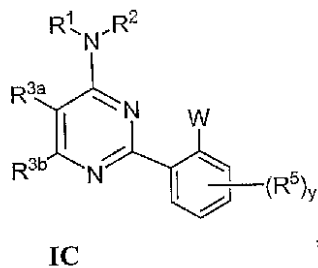
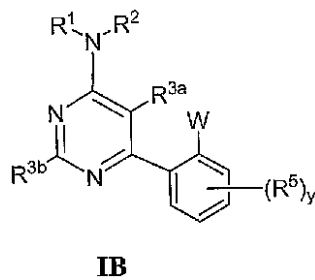
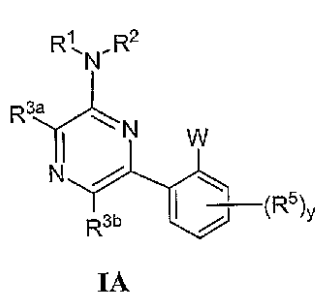
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

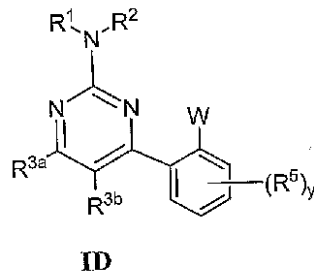
【請求項1】

以下の化学式 I A、I B、I C 又は I D の化合物であって：

【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、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単環であり；R¹及びR²と一緒に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-、-OCONR-、-NRRNR-、-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'、-

$\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO}(\text{R}')_2$ 又は $-\text{OPO}(\text{R}')_2$ 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 $\text{Q}-\text{R}^x$ 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 $-\text{NR}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{COCO}-$ 、 $-\text{CONR}-$ 、 $-\text{NRCO}-$ 、 $-\text{NRCO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2-$ 、 $-\text{CONRNR}-$ 、 $-\text{NRCONR}-$ 、 $-\text{OCONR}-$ 、 $-\text{NRNR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{PO}-$ 、 $-\text{PO}_2-$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR})-$ 又は $-\text{POR}-$ で置き換えられており； R^x のそれぞれの存在が、 $-\text{R}'$ 、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}'$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{COR}'$ 、 $-\text{NR}'\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{OCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO}(\text{R}')_2$ 又は $-\text{OPO}(\text{R}')_2$ 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あって、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が；

但し：

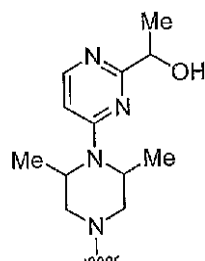
i) 化学式 I B において、 R^{3a} 及び R^{3b} が何れも水素であり、 y が 0 であり、 R^1 及び R^2 が一緒になってピペリジニル環を形成する場合、 W が OH でも OMe でもなく；

ii) 化学式 I C において：

a. R^{3a} 及び R^{3b} 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. R^{3a} が水素であり、 R^{3b} 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 - 1 H - 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^{3a} 及び R^{3b} 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. R^{3a} 及び R^{3b} が何れも水素であり、 W が、 R^5 、 y 及びそれに結合するフェニルと一緒にあって、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 R^1 及び R^2 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^{3a} 及び R^{3b} が何れも水素であり、 W が、 R^5 、 y 及びそれに結合するフェニルと一緒にあって、2, 4 - ジメトキシフェニルとなる場合、一緒になる R^1 及び R^2 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^{3a} 及び R^{3b} 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 R^1 及び R^2 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；

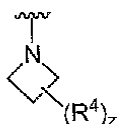
ではない、

化合物、或いはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R^1 及び R^2 が一緒にあってアゼチジニル環；

【化 3】



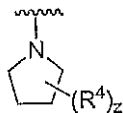
aa

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 及び R^2 が一緒にあってピロリジニル環；

【化 4】



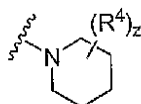
bb

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 及び R^2 が一緒にあってピペリジニル環；

【化 5】



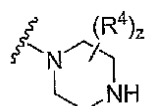
cc

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】



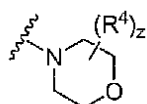
dd

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】



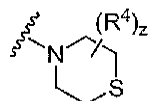
ee

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】



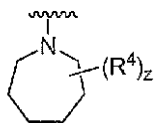
ff

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】



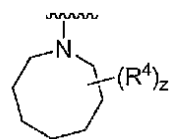
gg

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】



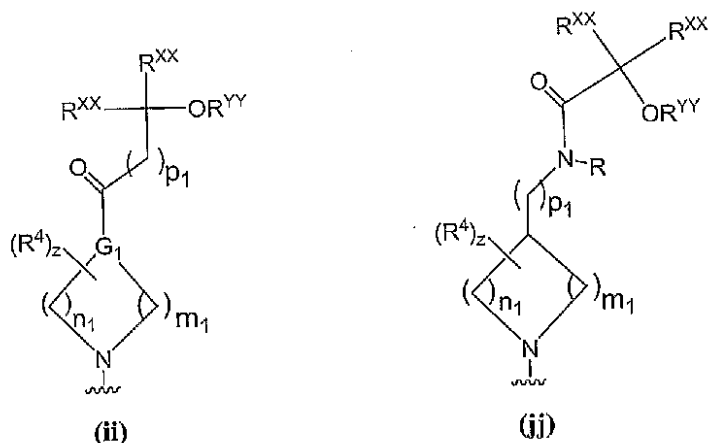
hh

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 $-\text{N}-$ 、 $-\text{CH}-\text{NH}-$ 又は $-\text{CH}-\text{CH}_2-\text{NH}-$ であり；

m_1 及び n_1 がそれぞれ独立して 0 ~ 3 であるが、但し、 $m_1 + n_1$ が 2 ~ 6 であり；

p_1 が 0 ~ 2 であり；

z が 0 ~ 4 であり；

各 R^{XX} が水素、 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^{XX} が場合により $-R^{11}$ 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 であるが；

但し、両方の R^{XX} が同時に水素ではなく；

R^{YY} が水素、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 又は $-\text{PO}(\text{R}')$ であり；

R^{11} 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 $-\text{NR}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{COCO}-$ 、 $-\text{CONR}-$ 、 $-\text{NRCO}-$ 、 $-\text{NRCO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2-$ 、 $-\text{CONRNR}-$ 、 $-\text{NRCONR}-$ 、 $-\text{OCONR}-$ 、 $-\text{NRNR}-$ 、 $-\text{NRSO}_2\text{NR}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{PO}-$ 、 $-\text{PO}_2-$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR})-$ 又は $-\text{POR}-$ で置き換えられており； R^X のそれぞれの存在が、 $-\text{R}'$ 、ハロゲン、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}'$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{COR}'$ 、 $-\text{NR}'\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{OCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCO}\text{R}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO}(\text{R}')$ 又は $-\text{OPO}(\text{R}')_2$ 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、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 1 1】

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

【請求項 1 2】

$R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ が C_{1-6} 脂肪族基であり、 $R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ 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、 $R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ 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、 $R^{x x}$ 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】

$R^{x x}$ 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、 $R^{x x}$ 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】

$R^{y y}$ が水素、- COR' 、- CO_2R' 、- $CON(R')_2$ 、- SOR' 、- SO_2R' 、- $SO_2N(R')_2$ 、- $COCOR'$ 、- $COCH_2COR'$ 、- $P(O)(OR')_2$ 、- $P(O)_2OR'$ 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】

$R^{y y}$ 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 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ 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。

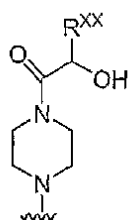
【請求項 34】

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。

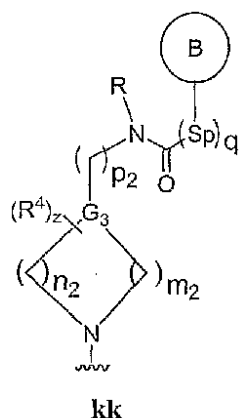
【請求項 37】

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 (kk)：

【化 1 3】



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；

Sp 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' -、- SO₂ NR' -、- NR' SO₂ - 又は - NR' SO₂ NR' - 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 C₁ - C₆ 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 -、- NR CO -、- NR CO₂ -、- SO₂ NR -、- NR SO₂ -、- CONR NR -、- NR CONR -、- OCONR -、- NR NR -、- NR SO₂ 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' CO₂ R'、- COR'、- CO₂ R'、- OCOR'、- CON(R')₂、- OCON(R')₂、- SOR'、- SO₂ R'、- SO₂ N(R')₂、- NR' SO₂ R'、- NR' SO₂ N(R')₂、- COCO R'、- COCH₂ COR'、- OP(O)(OR')₂、- P(O)(OR')₂、- OP(O)₂ OR'、- P(O)₂ OR'、- 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 - C₆ 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 - 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' 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あって、窒素、酸素若しくは硫黄が

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 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である、請求項38～55の何れか1項に記載の化合物。

【請求項57】

w_2 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ンである、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 - CH₂ - 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。

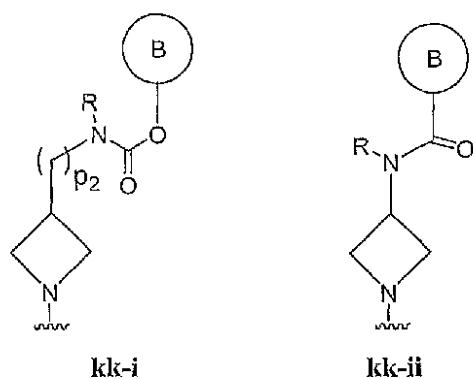
【請求項 62】

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 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ンである、請求項 65 に記載の化合物。

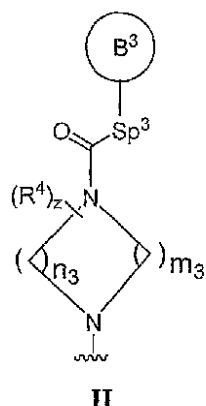
【請求項 67】

S_p が結合、- O - 又は - O - CH₂ - 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おり；

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 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 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 C₁ - C₆ 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 -、- NRCO₂ -、- SO₂NR -、- NRSO₂ -、- CONRNR -、- NRCONR -、- OCONR -、- NRNR -、- NRSO₂NR -、- 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'COR'、- 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、- COCOR'、- 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 C₁ - C₆ 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 - 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' 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、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 69】

Sp^3 が - O - 、 - S - 又は - NR' - から選択される、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 70】

Sp^3 が - O - である、請求項 68 ~ 69 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 71】

Sp^3 が - O - CH₂ - である、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 72】

Sp^3 が - NR' - である、請求項 69 に記載の化合物。

【請求項 73】

Sp^3 が - NH - である、請求項 69 に記載の化合物。

【請求項 74】

Sp^3 が - NH - CH₂ - である、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 75】

m_3 及び n_3 がそれぞれ 1 である、請求項 68 ~ 74 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 76】

m_3 及び n_3 がそれぞれ 2 である、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 77】

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 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 68 ~ 76 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 78】

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 員の飽和単環複素環であり、環 B_3 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 77 に記載の化合物。

【請求項 79】

環 B_3 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 B_3 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 68 ~ 76 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 80】

w_3 が 0 である、請求項 68 ~ 79 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 81】

環 B_3 がテトラヒドロフランである、請求項 68 ~ 80 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 82】

Sp^3 が結合、O 又は - O - CH₂ - であり；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 68 に記載の化合物。

【請求項 83】

R が水素である、請求項 68 ~ 83 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 84】

R が C₁ - C₆ アルキルである、請求項 68 ~ 83 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 85】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 84 に記載の化合物。

【請求項 86】

z が 0 である、請求項 68 ~ 85 の何れか 1 項に記載の化合物。

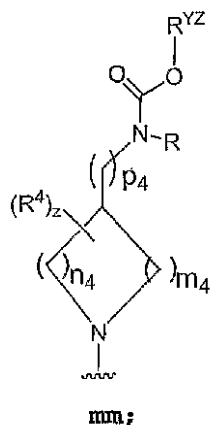
【請求項 87】

環 B_3 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 B_3 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 68 ~ 76 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 88】

R¹ 及び R² が一緒になって環 (mm) 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^{YZ} が場合により $-R^{14}$ 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^{14} 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、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 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あって、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 89】

p_4 が 1 である、請求項 88 に記載の化合物。

【請求項 90】

p_4 が 2 である、請求項 88 に記載の化合物。

【請求項 91】

m_4 及び n_4 がそれぞれ 1 である、請求項 87 ~ 90 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 92】

m_4 及び n_4 がそれぞれ 2 である、請求項 87 ~ 90 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。

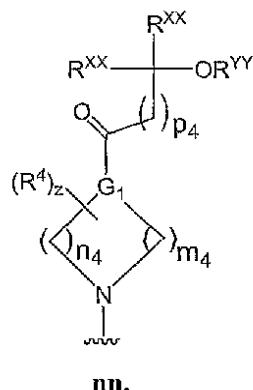
【請求項 9 9】

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 - CH - NH - 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 - CH - CH₂ - NH - 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。

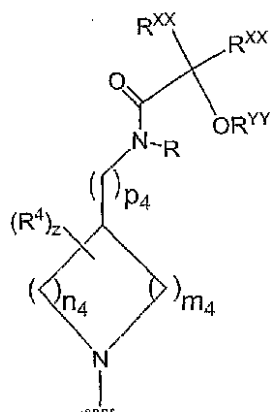
【請求項 1 0 5】

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 C 1 - C 6 アルキルである、請求項 106 に記載の化合物。

【請求項 108】

p_4 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 C 1 - C 6 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 NH_2 である、請求項 114 に記載の化合物。

【請求項 116】

W が CHF_2 又は CH_2F 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 CHF_2 である、請求項 116 に記載の化合物。

【請求項 118】

W が CH_2F 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 、 NO_2 、 $-N(R')_2$ 、 $-CH_2N(R')_2$ 、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-COOR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 COR' 、 $-NHCOOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、又は $C_1 - C_6$ 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 $C_1 - C_6$ アルキル、ヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルキル、環式脂環族 $C_1 - C_6$ アルキル若しくはヘテロ環式脂環族 $C_1 - C_6$ 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 、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 CN 、 $-COOH$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(iPr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2(CH_2)_3CH_3$ 、 $-SO_2CH(CH_3)_2$ 、 $-SO_2N(CH_3)_2$ 、 $-SO_2CH_2CH_3$ 、 $-C(O)OCH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)NHCH_2CH(CH_3)_2$ 、 $-NHCOOCH_3$ 、 $-C(O)C(CH_3)_3$ 、 $-COO(CH_2)_2CH_3$ 、 $-C(O)NHCH(CH_3)_2$ 、 $-C(O)CH_2CH_3$ 、又はピペリジル (piperidiny l)、ピペリジニル (piperiziny l)、モルホリノ、 $C_1 - 4$ 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、 CH_2 シクロヘキシル、ピリジル、 $-CH_2$ ピリジル又は $-CH_2$ 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 R^1 及び R^2 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、 R^4 の少なくとも 1 つの存在が $-NRSO_2R'$ 、 $-NRCOOR'$ 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 R^1 及び R^2 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、 R^4 が $-NRSO_2R'$ である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 127】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が $-NRCOOR'$ である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 128】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が $-NRCOR'$ である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 129】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が Cl 、 Br 、 F 、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 又は $-CH_2OR'$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 130】

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 (cc) 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、 Cl 、 Br 、 F 、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 又は $-CH_2OR'$ 、 $-NRSO_2R'$ 、 $-NRCOOR'$ 又は $-OCON(R')_2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 131】

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 (cc) であり、 z が 1 であり、 R^4 が F 、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 又は $-CH_2OR'$ である、請求項 130 に記載の化合物。

【請求項 132】

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 (cc) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-NRSO_2R'$ 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 $-NRCOOR'$ 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 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 又は $-COOR'$ 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 $-SOR'$ 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 $-COOR'$ 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 $-CON(R')_2$ 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 $-SO_2N(R')_2$ 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 $-COR'$ 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 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 又は $-COOR'$ 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 $-SOR'$ 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 $-COOR'$ 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 $-CON(R')_2$ 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 $-SO_2N(R')_2$ 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 $-COR'$ 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 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、

- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、-COR' 又は -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 147】

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 (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 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 R^1 及び R^2 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、 R^4 が -COOR' である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 149】

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 (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が -CON(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 R^1 及び R^2 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、 R^4 が - $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 151】

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 (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が -COR' である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 152】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 の少なくとも 1 つの存在が -SOR'、-CON(R')₂、- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、-COR' 又は -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 153】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が -SOR' である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 154】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が -COOR' である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 155】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が -CON(R')₂ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 156】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 が - $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 157】

一緒になる R^1 及び R^2 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、 R^4 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】

R^5 が独立してハロゲン、CN、 NO_2 、-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

、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、 $-OPO(R')_2$ 、又は $C_1 - C_6$ 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 $C_1 - C_6$ アルキル、ヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルキル、環式脂環族 $C_1 - C_6$ アルキル又はヘテロ環式脂環族 $C_1 - C_6$ 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】

R^5 が独立して Cl 、 Br 、 F 、 CF_3 、 Me 、 Et 、 CN 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(iPr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC(CH_3)_2$ 、 $-OCOC(CH_3)_3$ 、 $-OCOCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ 、4- CH_3 -ピペラジン-1-イル、 $OCOCH(CH_3)_2$ 、 OCO (シクロペンチル)、 $-COCH_3$ 、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】

R^5 が F である、請求項164に記載の化合物。

【請求項166】

R^5 が OR' である、請求項163に記載の化合物。

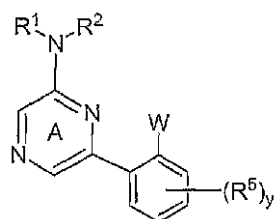
【請求項167】

R^5 が OH である、請求項166に記載の化合物。

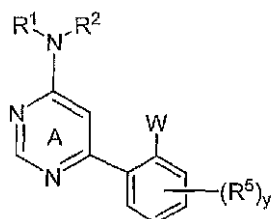
【請求項168】

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：

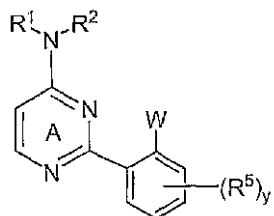
【化19】



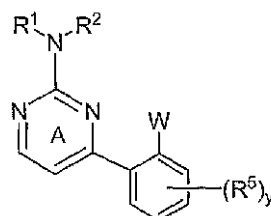
IA-i



IB-i



IC-i



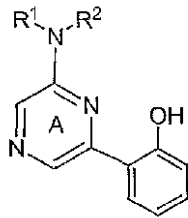
ID-i

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。

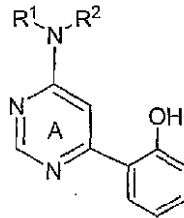
【請求項169】

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

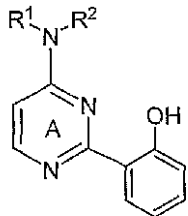
【化 2 0】



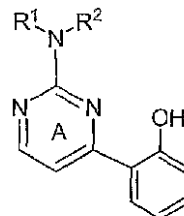
IA-ii



IB-ii



IC-ii



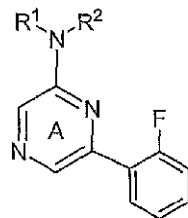
ID-ii

を有する、請求項 1 ~ 1 0 8 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。

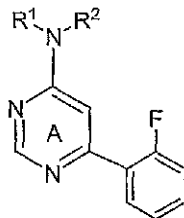
【請求項 1 7 0】

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

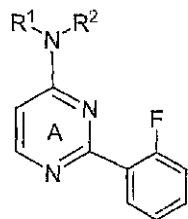
【化 2 1】



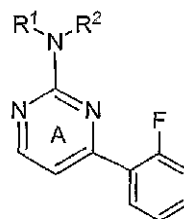
IA-iii



IB-iii



IC-iii



ID-iii

を有する、請求項 1 ~ 1 0 8 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 1 7 1】

前記化合物が表 2 A から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7 2】

請求項 1 ~ 1 7 1 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 1 7 3】

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；慢性関節リウマチ；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；側頭下顎関節疼痛；慢性内臓痛、例えば腹部；脾臓；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-マリエ歯部神経障害；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；腎盂腎炎；虫垂炎；胆嚢炎；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；急性带状疱疹疼痛；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；ベーチェット病疼痛；有痛脂肪症；静脈炎疼痛；ギラン-バレー疼痛；脚部痛及び運動時踵部痛；ハグルンド症候群；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（IC）；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。