

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【公表番号】特表2008-514707(P2008-514707A)

【公表日】平成20年5月8日(2008.5.8)

【年通号数】公開・登録公報2008-018

【出願番号】特願2007-534694(P2007-534694)

【国際特許分類】

C 0 7 D 235/10 (2006.01)

C 0 7 D 235/12 (2006.01)

C 0 7 D 235/14 (2006.01)

C 0 7 D 235/16 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 5/26 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 235/10 C S P

C 0 7 D 235/12

C 0 7 D 235/14

C 0 7 D 235/16

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 405/06

C 0 7 D 409/06

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 417/10

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/433
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 5/26
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 15/08
 A 6 1 P 15/16
 A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 17/10
 A 6 1 P 17/14
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月26日(2008.9.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

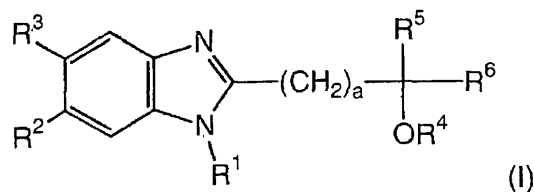
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



[式中、

R^1 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル-OH、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル- NO_2 、 $-C_{1-4}$ アルキル- $N(R^A R^B)$ 、 $-C_{1-4}$ アルキル- CO_2H 、 $-(C_{1-4}アルキル)-X-R^7$ 、 $-CH_2-$ アリールおよび $-CH_2-$ ヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記 $-CH_2-$ アリールおよび $-CH_2-$ ヘテロアリール基の前記アリールまたはヘテロアリール基は場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン置換 C_{1-4} アルコキシ、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル-OH、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ、 $-S-C_{1-4}$ アルキル、 $-S-(ハロゲン置換C_{1-4}アルキル)$ 、 $-SO-C_{1-4}$ アルキル、 $-SO_2-C_{1-4}$ アルキル、 $-O-$ アラールキル、 $-C(O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-CO_2H$ 、 $-C(O)H$ 、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

ここで R^A および R^B は、独立して、水素または C_{1-4} アルキルから選択されるか、または、 R^A と R^B は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合によりO、SまたはNから選択される追加的ヘテロ原子を1から2個含有していてもよくかつ場合により C_{1-4} アルキルで置換されていてもよい5員から7員の芳香、部分不飽和もしくは飽和環構造を形成しており、

ここでXは、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-SO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-C(OH)-$ 、 $-C(=N(OH))-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-NR^C-$ 、 $-NR^C-C(O)-$ 、 $-C(O)-NR^C-$ 、 $-NR^C-SO_2-$ および $-SO_2-NR^C-$ （ここで、 R^C

は水素または C_{1-4} アルキルから選択される) から成る群から選択され、

ここで R^7 は、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、アリール、アラルキル、ビフェニル、シクロアルキル、シクロアルキル - (C_{1-4} アルキル) - 、ヘテロアリール、ヘテロアリール - (C_{1-4} アルキル) - 、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル - (C_{1-4} アルキル) - から成る群から選択され、ここで、前記シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン置換 C_{1-4} アルコキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ、 $-S(O)_{0-2}-(C_{1-4}$ アルキル)、 $-SO_2-N(R^D)_2$ (ここで、 R^D は各々独立して水素または C_{1-4} アルキルから選択される)、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよいが、但し

X が O または NR^C の時には R^6 が C_{2-4} アルケニル以外であることを条件とし、

R^2 は、水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-S-C_{1-4}$ アルキル、 $-SO-C_{1-4}$ アルキル、 $-SO_2-C_{1-4}$ アルキルおよび $-NR^E-C(O)-C_{1-4}$ アルキル (ここで、 R^E は水素または C_{1-4} アルキルから選択される) から成る群から選択され、

R^3 は、水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-S-C_{1-4}$ アルキル、 $-SO-C_{1-4}$ アルキル、 $-SO_2-C_{1-4}$ アルキルおよび $-NR^F-C(O)-C_{1-4}$ アルキル (ここで、 R^F は水素または C_{1-4} アルキルから選択される) から成る群から選択されるが、但し

R^2 または R^3 の中の少なくとも一方が水素以外であることを条件とし、

a は、0 から 1 の整数であり、

R^4 は、水素、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキルおよび $-C(O)-R^8$ から成る群から選択され、

ここで R^8 は、 C_{1-4} アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル - (C_{1-4} アルキル) - 、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール - (C_{1-4} アルキル) - 、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル - (C_{1-4} アルキル) - から成る群から選択され、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン置換 C_{1-4} アルコキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノまたはジ(C_{1-4} アルキル)アミノから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、

R^5 は、水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキルおよびハロゲン置換 C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^6 は、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル - OH 、 $-C_{1-4}$ アルキル - CN 、 $-C_{1-4}$ アルキル - NO_2 、 $-C_{1-4}$ アルキル - $N(R^G R^H)$ 、 C_{1-4} アルキル - CO_2H 、 $-(C_{1-4}$ アルキル) - $Y-R^9$ 、 $-CH_2$ - アリールおよび $-CH_2$ - ヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記 $-CH_2$ - アリールおよび $-CH_2$ - ヘテロアリール基の前記アリールまたはヘテロアリールは場合によりハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン置換 C_{1-4} アルコキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ(C_{1-4} アルキル)アミノ、 $-S(O)_{0-2}-C_{1-4}$ アルキルまたは $-SO_2-N(R^J)_2$ (ここで、 R^J は各々独立して水素または C_{1-4} アルキルから選択される) から独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよく、

ここで R^G および R^H は、独立して、水素または C_{1-4} アルキルから選択されるか、または

R^G と R^H は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合によりO、SまたはNから選択される追加的ヘテロ原子を1から2個含有していてもよくかつ場合により C_{1-4} アルキルで置換されていてもよい5員から7員の芳香、部分不飽和もしくは飽和環構造を形成しており、

ここでYは、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-SO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-C(OH)-$ 、 $-C(=N(OH))-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-O-$ 、 $-NR^K-$ 、 $-NR^K-C(O)-$ 、 $-C(O)-NR^K-$ 、 $-NR^K-SO_2-$ および $-SO_2-NR^K-$ （ここで、 R^K は水素または C_{1-4} アルキルから選択される）から成る群から選択され、

ここで R^9 は、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、アリール、アラルキル、ビフェニル、シクロアルキル、シクロアルキル- $(C_{1-4}$ アルキル)-、ヘテロアリール、ヘテロアリール- $(C_{1-4}$ アルキル)-、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル- $(C_{1-4}$ アルキル)-から成る群から選択され、ここで、前記シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキル基は、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲン置換 C_{1-4} アルコキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ $(C_{1-4}$ アルキル)アミノ、 $-S(O)_{0-2}-(C_{1-4}$ アルキル)、 $-SO_2-N(R^L)_2$ または $-NR^M-C(O)-C_{1-4}$ アルキル（ここで、 R^L は各々独立して水素または C_{1-4} アルキルから選択され、そして R^M は水素または C_{1-4} アルキルから選択される）から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよいが、但し

YがOまたは NR^K の時には R^9 が C_{2-4} アルケニル以外であることを条件とし、

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、aが0であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が C_{1-4} アルキルの時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることも条件とし、

更に、 R^1 が水素であり、aが0であり、 R^2 が $-O-C_{1-4}$ アルキルであり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素の時には R^6 が $-CH_2-$ フェニル（このフェニルは $-O-C_{1-4}$ アルキルで置換されている）以外であることも条件とし、

更に、 R^1 が水素であり、aが0であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が水素の時には R^6 が $-CH_2-($ ベンゾイミダゾリル $)$ （ここで、このベンゾイミダゾリルはハロゲン、 C_{1-4} アルキルまたは $-O-C_{1-4}$ アルキルから選択される1から2個の置換基で置換されている）以外であることも条件とする]

で表される化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項2】

R^1 が水素、 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル-OH、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル-X- R^7 、 $-CH_2-$ フェニルおよび $-CH_2-$ ヘテロアリールから成る群から選択され、ここで、前記 $-CH_2-$ フェニルまたは $-CH_2-$ ヘテロアリール基の前記フェニルまたはヘテロアリールが場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-($ ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル $)$ 、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、ニトロ、シアノ、 $-S-($ ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル $)$ 、 $-SO_2-C_{1-4}$ アルキル、 $-O-CH_2-$ フェニル、 $-C(O)O-C_{1-4}$ アルキル、 $-C(O)H$ 、ヘテロアリールまたはヘテロシクロアルキルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

ここでXが $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-O-$ および $-C(=N(OH))-$ から成る群から選択され、

ここで R^7 が C_{1-4} アルキル、フェニル、 $-CH_2-$ フェニル、ヘテロアリールおよびヘテロシクロアルキルから成る群から選択され、ここで、前記フェニルまたはヘテロアリールが、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、フェニルまたはヘテロアリールから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、

R^2 が水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル

ル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

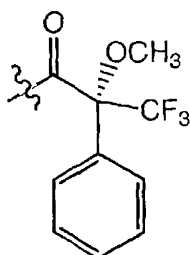
R^3 が水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択されるが、但し

R^2 または R^3 の中の少なくとも一方が水素以外であることを条件とし、

a が0から1の整数であり、

R^4 が水素、 C_{1-4} アルキルおよび

【化2】



から成る群から選択され、

R^5 が水素、ハロゲンおよび C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^6 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル-OH、 $-C_{1-4}$ アルキル-Y- R^9 および $-CH_2$ -フェニルから成る群から選択され、ここで、前記フェニルが場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-O$ -(ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル)、ニトロまたはシアノから独立して選択される1から2個の置換基で置換されていてもよく、

ここでYが $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ および $-O-SO_2-$ から成る群から選択され、

ここで R^9 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、フェニルおよび $-CH_2$ -フェニルから選択され、ここで、前記フェニルが、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-O$ -(ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル)、シアノ、ニトロまたは $-NR^M-C(O)-C_{1-4}$ アルキル(ここで、 R^M は水素または C_{1-4} アルキルから選択される)から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよいが、但し

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、 a が0であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が C_{1-4} アルキルの時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることも条件とし、

更に、 R^1 が水素であり、 a が0であり、 R^2 が $-O-C_{1-4}$ アルキルであり、 R^3 が水素であり、 R^4 が水素であり、 R^5 が水素の時には R^6 が $-CH_2$ -フェニル(このフェニルは $-O-C_{1-4}$ アルキルで置換されている)以外であることも条件とする、

請求項2記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項3】

R^1 が水素、 $-C_{1-4}$ アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル-O- C_{1-4} アルキルおよび $-C_{1-4}$ アルキル-S(O)₀₋₂- C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

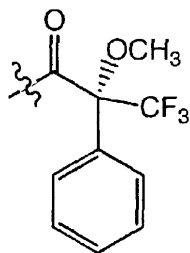
R^2 が水素、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキルおよびニトロから成る群から選択され、

R^3 がハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

a が0から1の整数であり、

R^4 が水素、 C_{1-4} アルキルおよび

【化 3】



から成る群から選択され、

R^5 が水素および C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^6 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル-CN、 $-C_{1-4}$ アルキル-OH、 $-C_{1-4}$ アルキル-Y- R^9 および $-CH_2$ -フェニルから成る群から選択され、ここで、前記フェニルが場合によりハロゲンで置換されていてもよく、

Yが-O-、-S-、-SO-、-SO₂-および-O-SO₂-から選択され、

R^9 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、フェニルおよび $-CH_2$ フェニルから選択され、ここで、前記フェニルが、単独または置換基の一部であるかに拘わらず、場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキルまたは $-NR^M-C(O)-C_{1-4}$ アルキル(ここで、 R^M は水素または C_{1-2} アルキルから選択される)から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよいが、但し

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、aが0であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が C_{1-4} アルキルの時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることも条件とする、

請求項2記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項4】

R^1 が水素、メチル、エチル、n-プロピル、n-ブチル、シアノ-メチル、メトキシ-メチルおよびメチル-チオ-メチルから成る群から選択され、

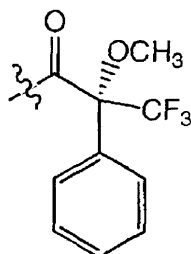
R^2 が水素、クロロ、フルオロ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシおよびニトロから成る群から選択され、

R^3 がクロロ、フルオロ、メチル、メトキシ、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

aが0から1の整数であり、

R^4 が水素、メチル、エチルおよび

【化 4】



から成る群から選択され、

R^5 が水素およびメチルから成る群から選択され、

R^6 がメチル、クロロ-メチル-、トリフルオロメチル、シアノ-メチル-、ヒドロキシ-メチル、3-フルオロ-ベンジル-、メトキシ-メチル-、エトキシ-メチル-、メチル-チオ-メチル-、エチル-チオ-メチル-、n-プロピル-チオ-メチル-、イソプロピル-チオ-メチル-、トリフルオロエチル-チオ-メチル-、ベンジル-チオ-メチル-、4-フルオロフェニル-チオ-メチル-、4-メトキシベンジル-チオ-メチル-、4-クロロベンジル-チオ-メチル-、4-フルオロベンジル-チオ-メチル-、メチ

ル - スルホニル - メチル - 、 エチル - スルホニル - メチル - 、 n - プロピル - スルホニル - メチル - 、 イソプロピル - スルホニル - メチル - 、 トリフルオロエチル - スルホニル - メチル - 、 4 - フルオロフェニル - スルホニル - メチル - 、 4 - メチルフェニル - スルホニル - メチル - 、 4 - メチルフェニル - スルホニルオキシ - メチル - 、 ベンジル - スルホニル - メチル - 、 4 - フルオロベンジル - スルホニル - メチル - 、 4 - メトキシベンジル - スルホニル - メチル - および 4 - メチルカルボニルアミノフェニル - スルホニル - メチル - から成る群から選択されるが、但し

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 がメチル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、 a が 0 であり、 R^4 が水素でありそして R^5 がメチルの時には R^6 がメチル以外であることも条件とする、

請求項 3 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 5】

R^1 が水素、 C_{1-2} アルキル、 $-C_{1-2}$ アルキル - OH、 $-C_{1-2}$ アルキル - CN、 $-C_{1-2}$ アルキル - O - C_{1-2} アルキルおよび $-C_{1-2}$ アルキル - S(O)₀₋₂ - C_{1-2} アルキルから成る群から選択され、

R^2 がハロゲン、 $-C_{1-4}$ アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

R^3 がハロゲン、 $^{\wedge}C_{1-4}$ アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

a が 0 であり、

R^4 が水素、 C_{1-4} アルキルおよびハロゲン置換 C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^5 が水素、 C_{1-4} アルキルおよびハロゲン置換 C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^6 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-C_{1-4}$ アルキル - CN、 $-C_{1-4}$ アルキル - OH および $-C_{1-4}$ アルキル - Y - R^9 から成る群から選択され、

Y が $-O-$ 、 $-S-$ および $-SO_2-$ から成る群から選択され、

R^9 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキルおよび $-CH_2-$ フェニルから選択され、ここで、前記フェニルが場合によりハロゲン、 C_{1-4} アルキルまたは $-O-C_{1-4}$ アルキルから独立して選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよいが、但し

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、 a が 0 であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が C_{1-4} アルキルの時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることも条件とする、

請求項 2 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 6】

R^1 が水素であり、

R^2 がハロゲン、 $-C_{1-4}$ アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

R^3 がハロゲン、 $-C_{1-4}$ アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、シアノおよびニトロから成る群から選択され、

a が 0 であり、

R^4 が水素および C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^5 が水素および C_{1-4} アルキルから成る群から選択され、

R^6 が C_{1-4} アルキル、ハロゲン置換 C_{1-4} アルキルおよび $-C_{1-4}$ アルキル - CN から成る群から選択されるが、但し

R^4 が水素でありかつ R^5 が水素の時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることを条件とし、更に、 R^1 が水素であり、 a が 0 であり、 R^4 が水素でありそして R^5 が C_{1-4} アルキルの時には R^6 が C_{1-4} アルキル以外であることも条件とする、

請求項 5 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 7】

1 - (5, 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - エタノール；

3 - (5 , 6 - ジクロロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 3 - ヒドロキシ - ブチロニトリル ;

から選択される請求項 6 記載の化合物またはこれの製薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 8】

製薬学的に受け入れられる担体と請求項 1 記載の化合物を含んで成る製薬学的組成物。

【請求項 9】

請求項 1 記載の化合物と製薬学的に受け入れられる担体を混合することで作られた製薬学的組成物。

【請求項 10】

請求項 1 記載の化合物と製薬学的に受け入れられる担体を混合することを含んで成る製薬学的組成物製造方法。

【請求項 11】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなるアンドロゲン受容体が媒介する障害の治療用製薬学的製剤。

【請求項 12】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる前立腺癌、良性前立腺過形成 (B P H)、多毛症、脱毛症、拒食症、乳癌、にきび、エイズ、悪液質、男性避妊および男性機能から成る群から選択される状態の治療用製薬学的製剤。

【請求項 13】

(a) 前立腺癌、(b) 良性前立腺過形成、(c) 多毛症、(d) 脱毛症、(e) 拒食症、(f) 乳癌、(g) にきび、(h) エイズ、(i) 悪液質の治療、(j) 男性避妊または (k) 男性機能強化を必要としている被験体におけるそれを治療するための薬剤を製造するための請求項 1 記載化合物の使用。