

【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2年9月17日(2020.9.17)

【公表番号】特表2019-528259(P2019-528259A)

【公表日】令和1年10月10日(2019.10.10)

【年通号数】公開・登録公報2019-041

【出願番号】特願2019-505239(P2019-505239)

【国際特許分類】

C 07 D 205/12	(2006.01)
A 61 K 31/337	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)

【F I】

C 07 D 205/12	C S P
A 61 K 31/337	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/22	
A 61 P 25/18	

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月5日(2020.8.5)

【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

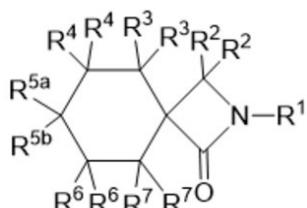
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化1】



(式中：

R¹は、H、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルキル-フェニル、-C(O)-R³¹、-C(O)-O-R³²、-O-C₁~C₄アルキル-フェニル、フェニルおよび-C_H(R⁸)-C(O)-R⁹からなる群から選択され；ここで、フェニルは、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルコキシ、ヒドロキシリルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；

R²は、各出現について、H、-C₁~C₄アルキルおよび-C₁~C₄ハロアルキルからなる群から独立して選択され；

R³、R⁴、R⁶およびR⁷は、各出現について、H、ヒドロキシリル、ハロゲン、シアノ、-C₁~C₄アルキルおよび-C₁~C₄ハロアルキルからなる群から各々独立して

選択され；または、R³およびR⁴は、これらが結合している隣接する炭素と一緒にになって、ハロゲン、ヒドロキシル、-C₁～C₃アルキル、-C₁～C₃アルコキシ、-C(O)NR^aR^bおよび-NR^aR^bからなる群から独立して選択される1もしくは2個の置換基により任意に置換されている3員炭素環を形成し；

R^{5a}は、H、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、-C₁～C₄アルコキシ、-O-C₁～C₄アルキル-フェニル、-C₁～C₄アルキル、-C(O)-C₁～C₄アルキル、-NR^a-C(O)-C₁～C₄アルキル、-NR^aR^bおよび-NR^aCH(R¹⁰)-C(O)-R¹¹からなる群から選択され；ここで、C₁～C₄アルキルは、-COOH、-C(O)NH₂、-NR^aR^b、-SH、-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C(O)-O-C₁～C₄アルキル、-O-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄アルコキシ、フェニル、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；ならびに、フェニルは、各出現について独立して、-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄ハロアルキル、-C₁～C₄アルコキシ、-NR^aR^b、ヒドロキシル、シアノおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；

R^{5b}は、H、ハロゲン、シアノ、-C₁～C₄アルキルおよび-C₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択され；または

R^{5a}およびR^{5b}は一緒にになってオキソ基を形成し；

R⁸およびR¹⁰はHおよび-C₁～C₄アルキルからなる群から独立して選択され、ここで、C₁～C₄アルキルは、-C(O)NR^aR^b、-NR^a-C(O)-C₁～C₄アルキル、-NR^aR^b、-SH、-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C(O)-O-C₁～C₄アルキル、-O-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄アルコキシ、-COOH、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；

R⁹およびR¹¹は、ヒドロキシル、-C₁～C₄アルコキシおよび-NR^aR^bからなる群から独立して選択され；

R³¹は、水素、-C₁～C₆アルキル、-C₁～C₆ハロアルキル、-C₃～C₆シクロアルキルおよびフェニルからなる群から選択され；

R³²は、水素、-C₁～C₆アルキル、-C₁～C₆ハロアルキル、-C₃～C₆シクロアルキル、ベンジルおよびフェニルからなる群から選択され；ならびに

R^aおよびR^bは、各出現について、H、-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄アルキル-フェニル、-C₁～C₄アルキル-C₃～C₇シクロアルキル、-C₁～C₄アルキル-ヘテロシクロアルキルおよび-C₁～C₄アルキル-ヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、ここで、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロアリールは、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個の環原子を含み、ならびに、フェニルは、ハロゲン、ヒドロキシル、-C(O)NH₂、-C(O)NH(C₁～C₄アルキル)、-C(O)N(C₁～C₄アルキル)₂、-C₁～C₃アルキルおよび-C₁～C₃アルコキシから選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；または

R^aおよびR^bは、これらが結合している窒素と一緒にになって、4～6員ヘテロシクロアルキルまたは5～8員ヘテロアリールを形成する)

を有する化合物、または、その薬学的に許容可能な塩および／もしくは立体異性体。

【請求項2】

R³、R⁴、R⁶およびR⁷の各出現がHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R²が、各出現について、Hおよびメチルからなる群から独立して選択される、請求項1または2に記載の化合物。

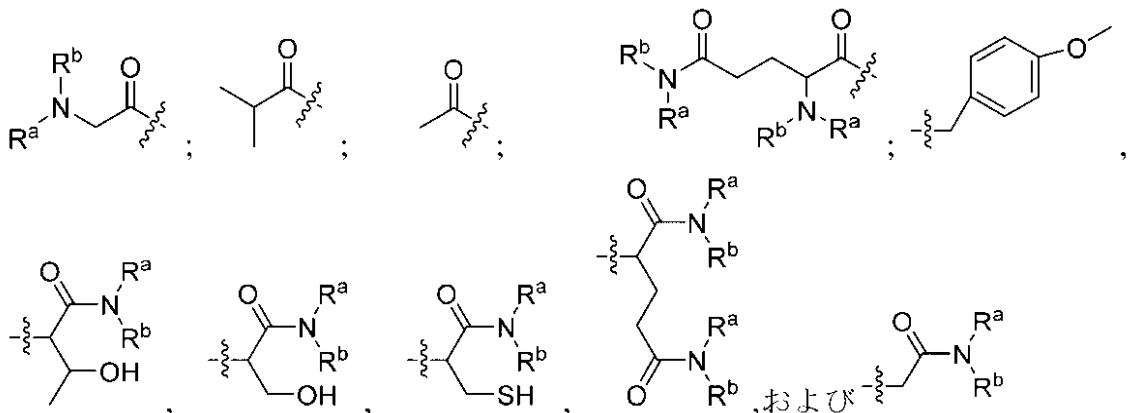
【請求項4】

R²の各出現がHである、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

 R^1 が：

【化 2】



からなる群から選択され、式中、 R^a および R^b は、各出現について、水素および $-C_1$ ~ C_4 アルキルからなる群から各々独立して選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 が、 H 、 4 -メトキシベンジルおよび $-CH(R^8)-C(O)-R^9$ からなる群から選択され；

R^8 が H および C_1 ~ C_4 アルキルからなる群から選択され、ならびに、前記 C_1 ~ C_4 アルキルは、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^a-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-NR^aR^b$ 、 $-SH$ 、 $-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-COOH$ 、 $-C(O)-O-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-O-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 C_1 ~ C_4 アルコキシ、ヒドロキシリルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって任意に置換されていてもよく；ならびに

R^9 が、ヒドロキシリル、 C_1 ~ C_4 アルコキシおよび $-NR^aR^b$ からなる群から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R^8 が、 H および $-C_1$ ~ C_4 アルキルからなる群から選択され、ここで、 C_1 ~ C_4 アルキルは、 $-C(O)NHR^a$ 、 $-NH-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-NR^aR^b$ 、 $-SH$ 、 $-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-COOH$ 、 $-C(O)-O-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-O-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-C_1$ ~ C_4 アルコキシ、ヒドロキシリルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^8 が、 H および $-C_1$ ~ C_4 アルキルからなる群から選択され、ここで、 C_1 ~ C_4 アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)-C_1$ ~ C_4 アルキル、 $-C_1$ ~ C_4 アルコキシおよびヒドロキシリルから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換される、請求項 6 に記載の化合物。

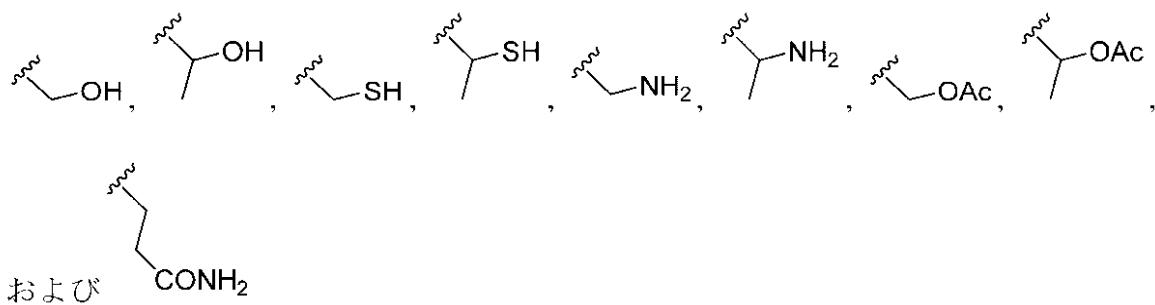
【請求項 9】

R^8 が C_1 ~ C_4 アルキルであり、前記 C_1 ~ C_4 アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)CH_3$ およびヒドロキシリルから選択される 1 個の置換基によって任意に置換され得る、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 10】

 R^8 が、 H 、メチル、

【化3】

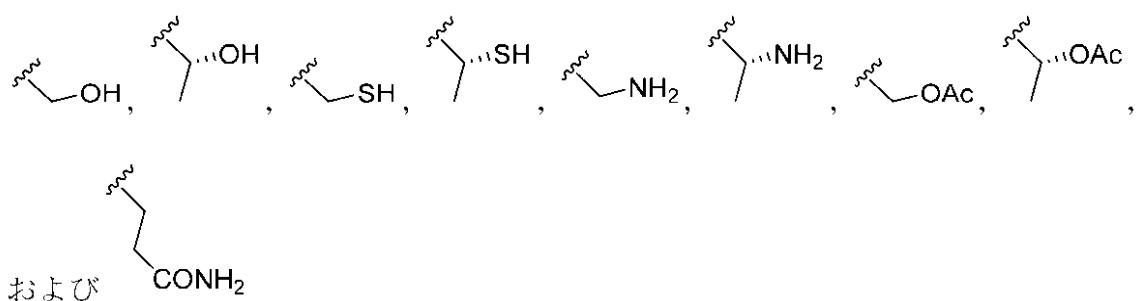


からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項11】

 R^8 が、H、メチル、

【化4】

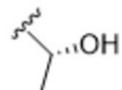


からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項12】

 R^8 が

【化5】



である、請求項6に記載の化合物。

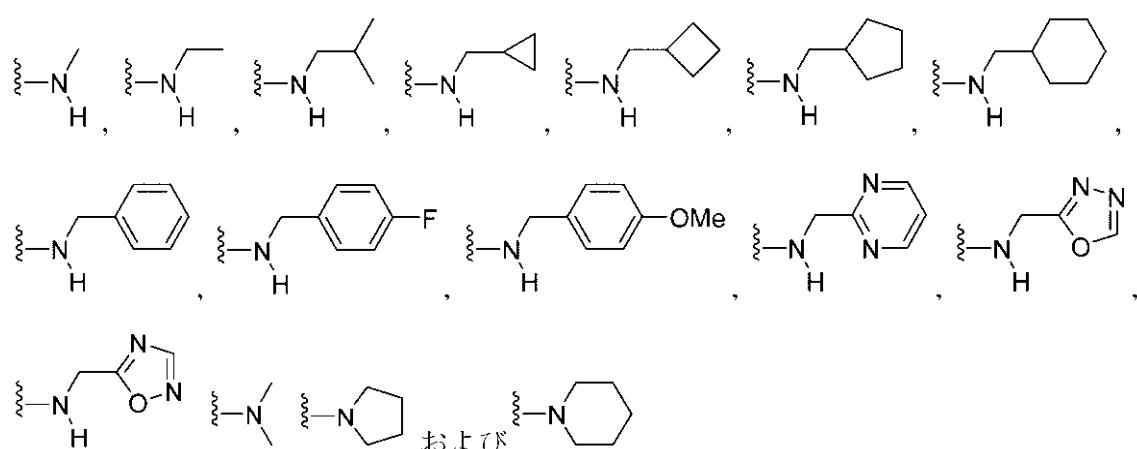
【請求項13】

 R^9 が $-NR^aR^b$ である、請求項6～12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

 R^9 が、 $-NH_2$ 、

【化6】



からなる群から選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

 R^9 が NH_2 である、請求項14に記載の化合物。

【請求項 16】

R^{5b} が H およびハロゲンから選択される、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

R^{5b} が H および F から選択される、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

R^{5b} が H である、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

R^{5a} が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、 $O-C_1 \sim C_4$ アルキル - フェニル、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NR^a-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NR^a-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NR^aR^b$ および $-NR^aCH(R^{10})-C(O)-R^{11}$ からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NR^aR^b$ 、 $-SH$ 、 $-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシル、フェニルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されており、ならびに、ここで、フェニルは、各出現について独立して、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $-C_1 \sim C_4$ アルコキシ、ヒドロキシル、シアノおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されている、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{5a} が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-CH_2-Ph$ 、 $-NH-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NHR^b$ および $-NR^aCH(R^{10})-C(O)-R^{11}$ からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NR^aR^b$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されている、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{5a} が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、 $-O-CH_2-Ph$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $-NR^aCH(R^{10})-C(O)-R^{11}$ からなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)CH_3$ 、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されており；

R^{10} が H および $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され、ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^a-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NR^aR^b$ 、 $-SH$ 、 $-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-COOH$ 、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されており；ならびに

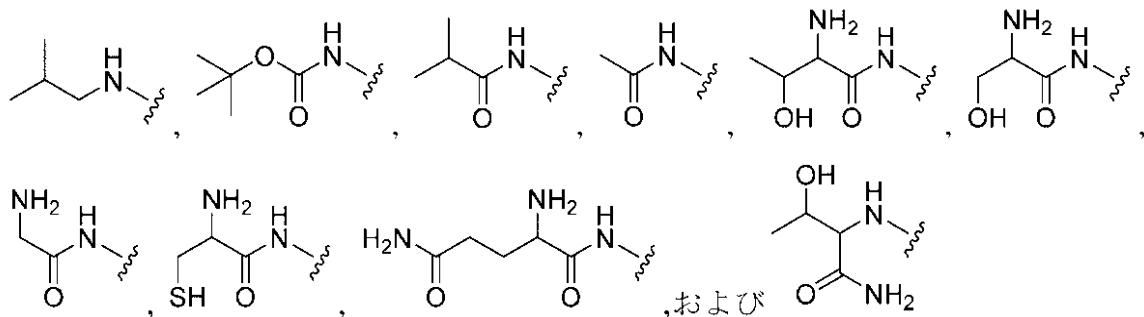
R^{11} が、ヒドロキシル、 $-C_1 \sim C_4$ アルコキシおよび $-NR^aR^b$ からなる群から選択される、請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 22】

R^{5b} が H であり；および

R^{5a} が、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、 $-O-CH_2-Ph$ 、 $-NH_2$ 、

【化7】



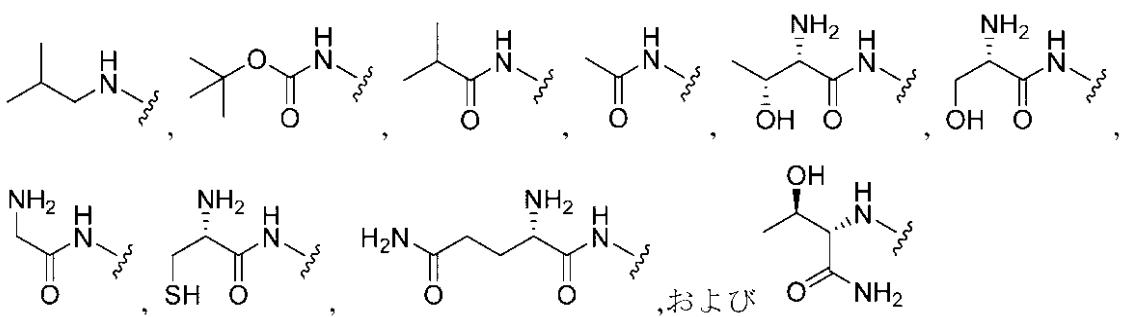
からなる群から選択される、請求項21に記載の化合物。

【請求項23】

R^5 ^bがHであり；および

R^5 ^aが、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、

【化8】



からなる群から選択される、請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

R^5 ^aが、H、ヒドロキシル、ハロゲン、C₁～C₄アルコキシ-フェニル、-C₁～C₄アルキル、-NR^a-C(O)-C₁～C₄アルキル、-NR^a-C(O)-O-C₁～C₄アルキル、-NR^aR^bおよび-NR^aCH(R¹0)-C(O)-R¹1からなる群から選択され、ここで、-NR^a-C(O)-C₁～C₄アルキルである各R⁵^aは、-C(O)NH₂、-NR^aR^b、-SH、-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C(O)-O-C₁～C₄アルキル、-O-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されていてもよく；

R¹0がHおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択され、ここで、C₁～C₄アルキルは、-C(O)NR^aR^b、-NR^a-C(O)-C₁～C₄アルキル、-NR^aR^b、-SH、-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C(O)-O-C₁～C₄アルキル、-O-C(O)-C₁～C₄アルキル、-C₁～C₄アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換され；

R¹1が、ヒドロキシル、-C₁～C₄アルコキシおよび-NR^aR^bからなる群から選択され；

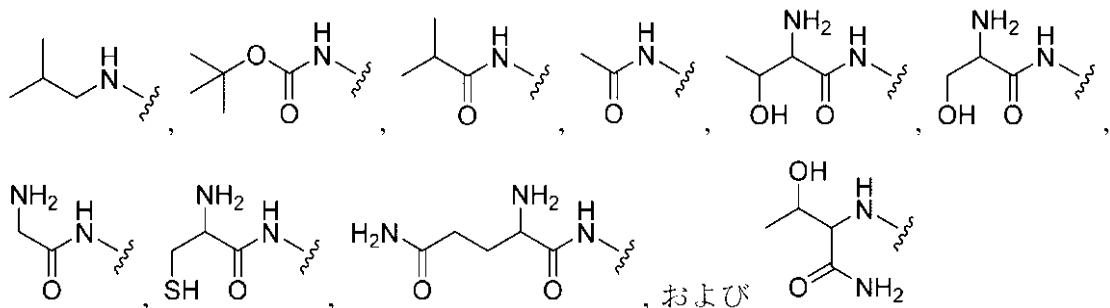
R^5 ^bがHであり；および

R¹がHである、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項25】

R^5 ^aが、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、

【化9】

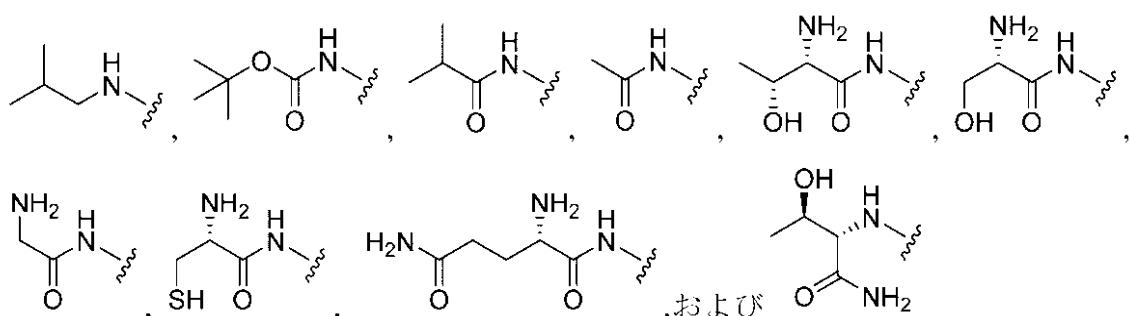


からなる群から選択される、請求項24に記載の化合物。

【請求項26】

$\text{R}^{5\text{a}}$ が、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、

【化10】

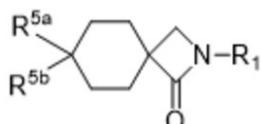


からなる群から選択される、請求項23に記載の化合物。

【請求項27】

式：

【化11】



R^1 は、H、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルキル-フェニルおよび-C₁(R^8)-C(O)-R⁹からなる群から選択され；ここで、フェニルは、-C₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；ならびに

$\text{R}^{5\text{a}}$ は、H、ヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、-C₁~C₄アルコキシ、-O-C₁~C₄アルキル-フェニル、-C₁~C₄アルキル、-C(O)-C₁~C₄アルキル、-NR^a-C(O)-C₁~C₄アルキル、-NR^a-C(O)-O-C₁~C₄アルキル、-NR^aR^bおよび-NR^aCH(R¹⁰)-C(O)-R¹¹からなる群から選択され；ここで、C₁~C₄アルキルは、-COOH、-C(O)NH₂、-NR^aR^b、-SH、-C(O)-C₁~C₄アルキル、-C(O)-O-C₁~C₄アルキル、-O-C(O)-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルコキシ、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；ならびに、フェニルは、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄ハロアルキル、-C₁~C₄アルコキシ、-NR^aR^b、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；

$\text{R}^{5\text{b}}$ は、H、ハロゲン、-C₁~C₄アルキルおよび-C₁~C₄ハロアルキルからなる群から選択され；または

$\text{R}^{5\text{a}}$ および $\text{R}^{5\text{b}}$ は一緒にオキソ基を形成し；

R^8 および R^{10} は、H および $-C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から独立して選択され、ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NR^aR^b$ 、 $-NR^a-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-SH$ 、 $-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-O-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-COOH$ 、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基によって任意に置換されており；

R^9 および R^{11} は、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシおよび $-NR^aR^b$ からなる群から独立して選択され；ならびに

R^a および R^b は、各出現について、H、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル-フェニル、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル- $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-C_1 \sim C_4$ アルキル-ヘテロシクロアルキルおよび $-C_1 \sim C_4$ アルキル-ヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、ここで、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロアリールは、N、O および S から独立して選択される 1、2 または 3 個の環原子を含み、ならびに、フェニルは、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $-C(O)N(C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、 $-C_1 \sim C_3$ アルキルおよび $-C_1 \sim C_3$ アルコキシから選択される 1、2 または 3 個の置換基によって任意に置換されており；または

R^a および R^b は、これらが結合している窒素と一緒にになって、4 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルまたは 5 ~ 8 員ヘテロアリールを形成する)

を有する化合物、または、その薬学的に許容可能な塩および／もしくは立体異性体。

【請求項 28】

R^1 が、H または $-CH(R^8)-C(O)-R^9$ であり；

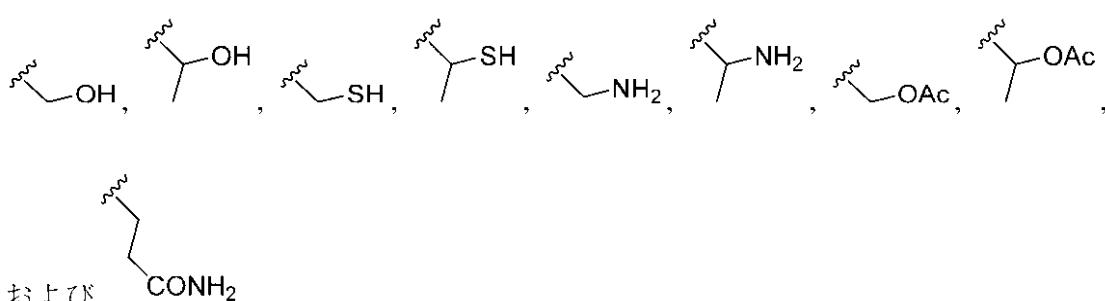
R^8 が、H および $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択され、ここで、 $-C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $-COOH$ およびヒドロキシルから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されており；ならびに

R^9 が、ヒドロキシル、 $-C_1 \sim C_4$ アルコキシおよび $-NR^aR^b$ からなる群から独立して選択されている、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

R^8 が、H、メチル、

【化 12】



からなる群から選択される、請求項 27 または 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R^1 が H である、請求項 27 ~ 29 のいずれか一項に記載の化合物。

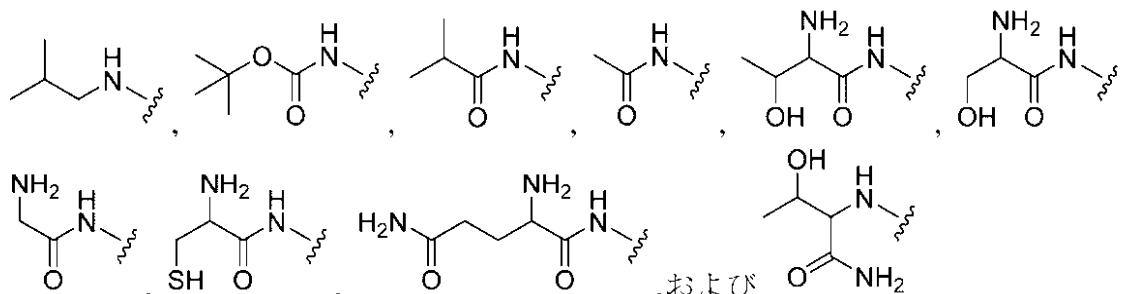
【請求項 31】

R^{5a} が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、 $-O-CH_2-Ph$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH-C(O)-C_1 \sim C_4$ アルキル、 $-NH-C(O)-O-C_1 \sim C_4$ アルキルおよび $-NR^aCH(R^{10})-C(O)-R^{11}$ からなる群から選択され；ここで、 $C_1 \sim C_4$ アルキルは、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SH$ 、 $-O-C(O)CH_3$ 、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される 1 もしくは 2 個の置換基によって任意に置換されており；ならびに

R^{5b} が H またはハロゲンである、請求項 27 ~ 30 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 2】

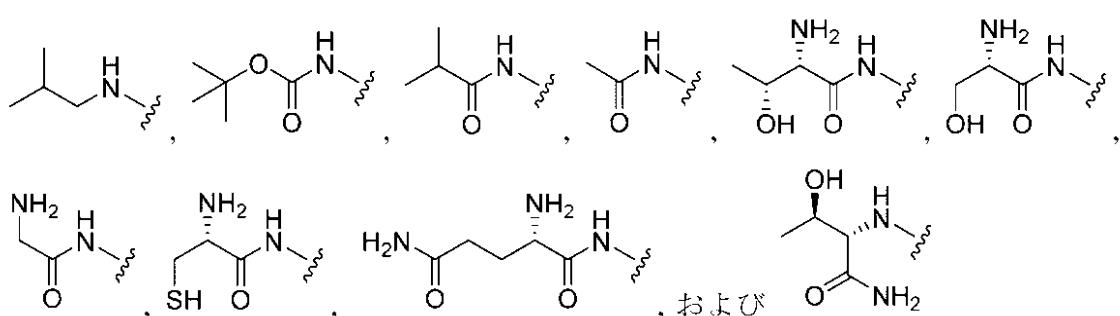
R^{5b} が H またはハロゲンであり；ならびに
 R^{5a} が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、
【化 1 3】



からなる群から選択される、請求項 27～31 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 3】

R^{5b} が H またはハロゲンであり；ならびに
 R^{5a} が、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、
【化 1 4】

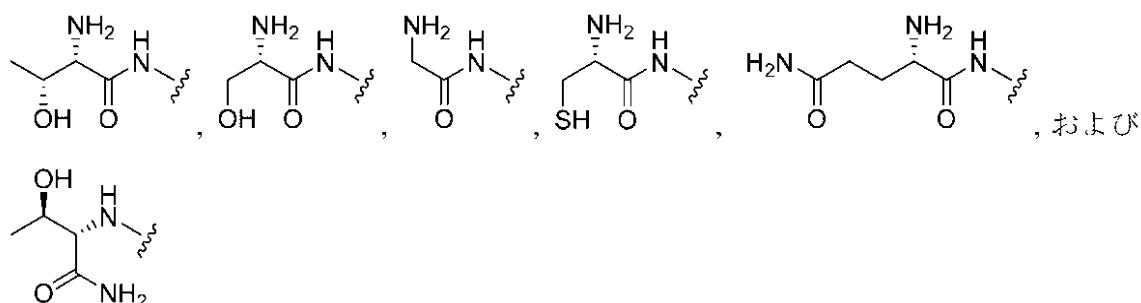


からなる群から選択される、請求項 27～31 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 4】

R^1 が H であり；
 R^{5b} が H であり；ならびに
 R^{5a} が

【化 1 5】

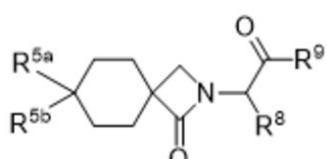


からなる群から選択される、請求項 33 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

式：

【化 1 6】



(式中：

R^5 ^a は、H、ヒドロキシル、ハロゲン、-CH₃、-C(=O)-C₁~C₄アルキル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、-NH-C₁~C₄アルキル、-NH-C(=O)-C₁~C₄アルキルおよび-NR^aCH(R¹⁰)-C(=O)-R¹¹からなる群から選択され；ここで、C₁~C₄アルキルは、-C(=O)NH₂、-NH₂、-SH、-OC(=O)CH₃、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されており；

R^5 ^b はHまたはハロゲンであり；

R^8 および R^{10} は、HおよびC₁~C₄アルキルからなる群から独立して選択され、ここで、C₁~C₄アルキルは、-C(=O)NR^aR^b、-NR^a-C(=O)-C₁~C₄アルキル、-NR^aR^b、-SH、-C(=O)-C₁~C₄アルキル、-C(=O)-O-C₁~C₄アルキル、-O-C(=O)-C₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルコキシ、-COOH、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されていてもよく；ならびに

R^9 および R^{11} は、ヒドロキシル、C₁~C₄アルコキシおよび-NR^aR^bからなる群から独立して選択され；ならびに

R^a および R^b は、各出現について、H、-C₁~C₄アルキル、-C₁~C₄アルキル-フェニル、-C₁~C₄アルキル-C₃~C₇シクロアルキル、-C₁~C₄アルキル-ヘテロシクロアルキルおよび-C₁~C₄アルキル-ヘテロアリールからなる群から各々独立して選択され、ここで、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロアリールは、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個の環原子を含み、ならびに、フェニルは、ハロゲン、ヒドロキシル、-C(=O)NH₂、-C(=O)NH(C₁~C₄アルキル)、-C(=O)N(C₁~C₄アルキル)₂、-C₁~C₃アルキルおよび-C₁~C₃アルコキシから選択される1、2または3個の置換基によって任意に置換されており；または

R^a および R^b は、これらが結合している窒素と一緒にになって、4~6員ヘテロシクロアルキルまたは5~8員ヘテロアリールを形成する)

を有する化合物、または、その薬学的に許容可能な塩および/もしくは立体異性体。

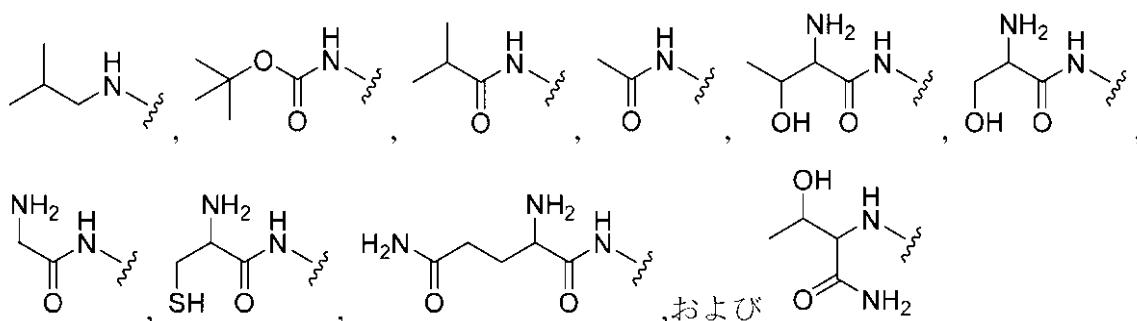
【請求項36】

R^5 ^a が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、-NH-C₁~C₄アルキル、-NH-C(=O)-C₁~C₄アルキルおよび-NH-C(=O)-O-C₁~C₄アルキルからなる群から選択され、ここで、C₁~C₄アルキルは、-C(=O)NH₂、-NH₂、-SH、-OC(=O)CH₃、ヒドロキシルおよびハロゲンから各々独立して選択される1もしくは2個の置換基によって任意に置換されている、請求項35に記載の化合物。

【請求項37】

R^5 ^a が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、

【化17】

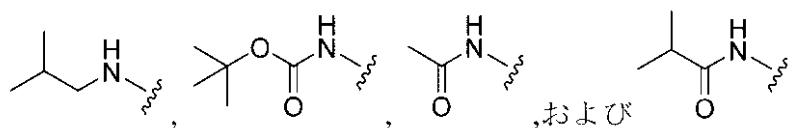


からなる群から選択される、請求項35に記載の化合物。

【請求項38】

R^5 ^b がHまたはハロゲンであり；ならびに

R^5 ^a が、H、ヒドロキシル、ハロゲン、メチル、-O-CH₂-Ph、-NH₂、
【化18】

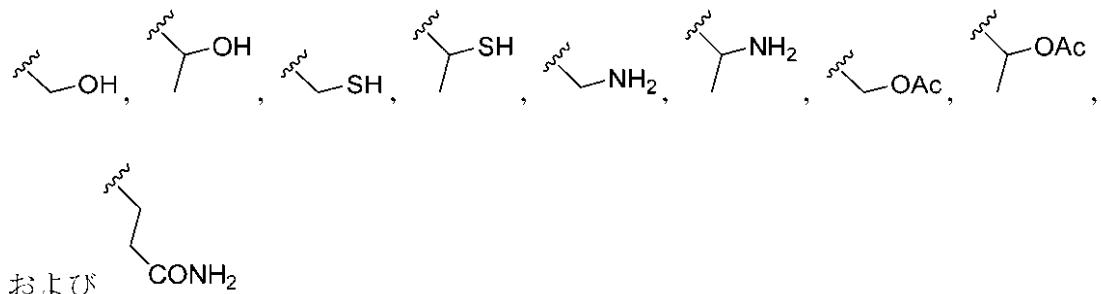


からなる群から選択される、請求項35に記載の化合物。

【請求項39】

R^8 が、H、メチル、

【化19】



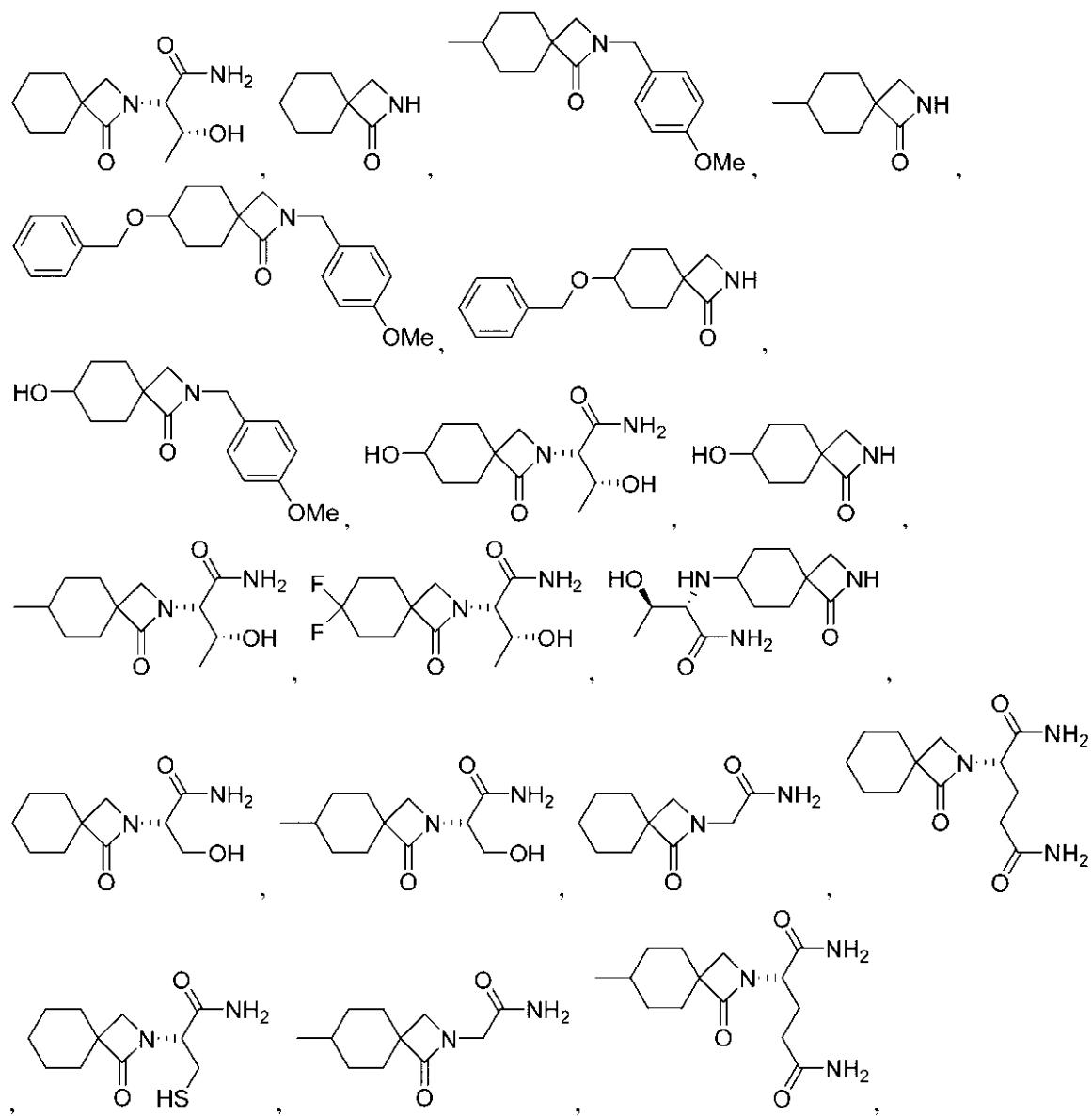
からなる群から選択される、請求項35～38のいずれか一項に記載の化合物。

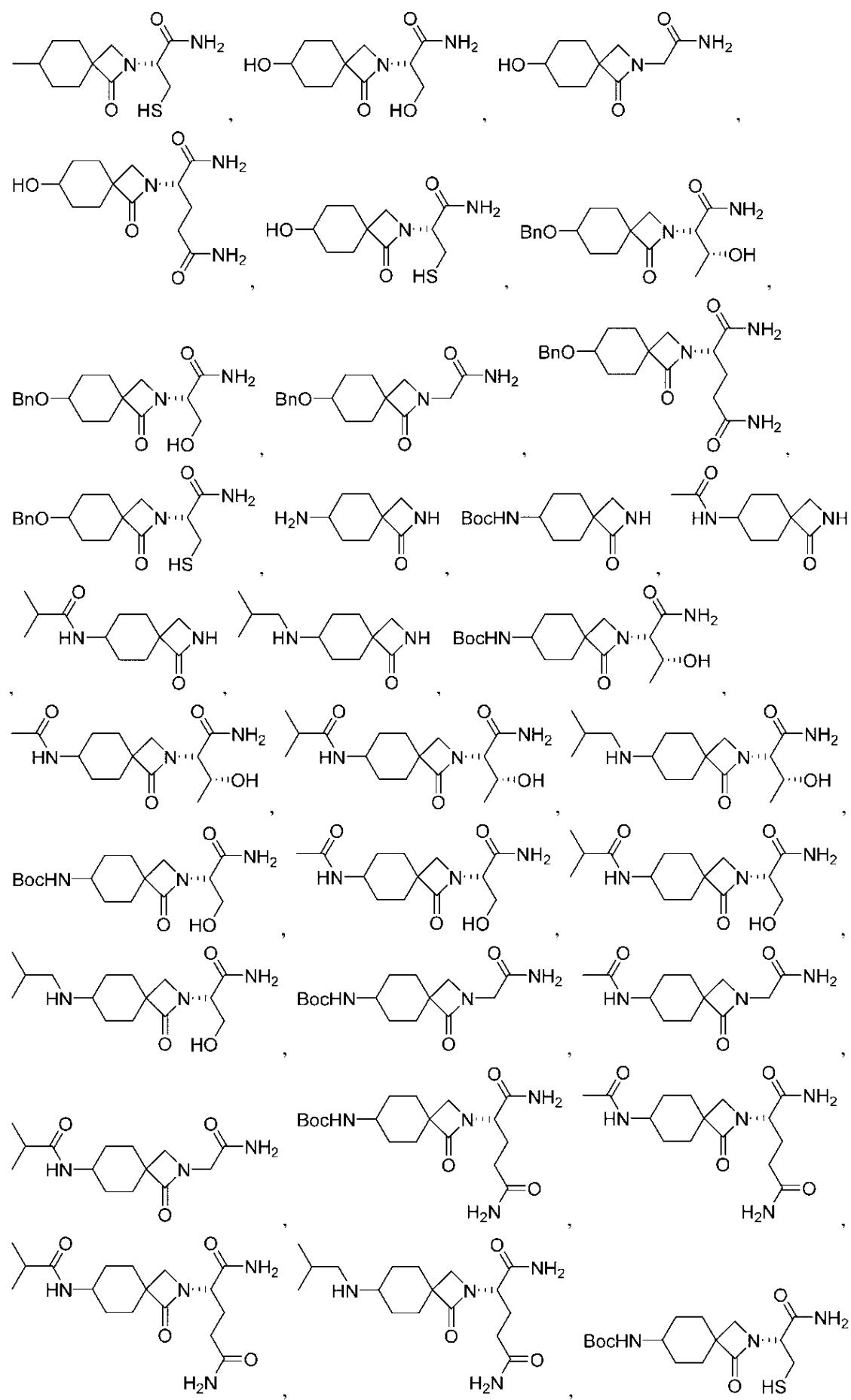
【請求項40】

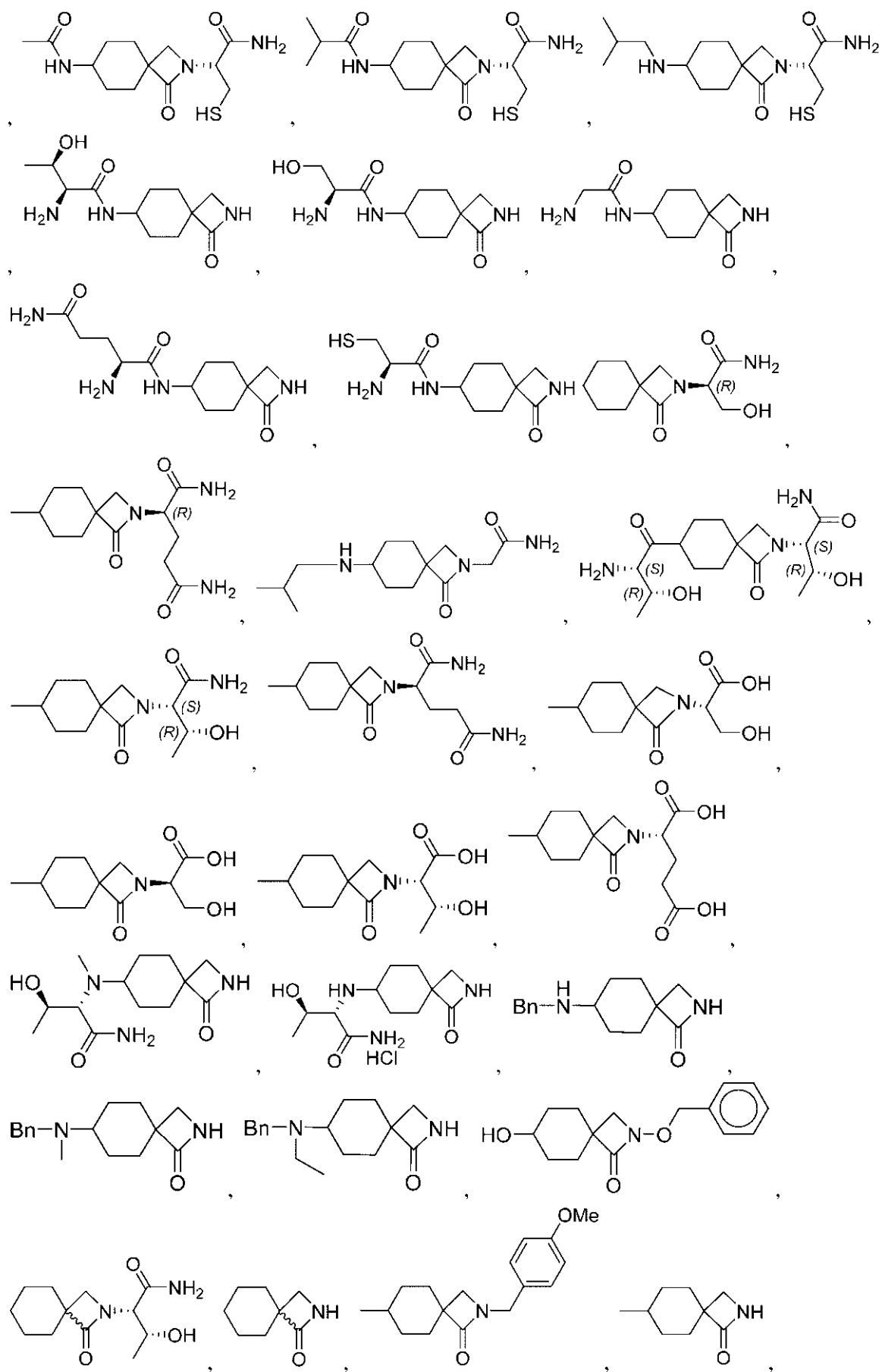
R^9 が-NH₂である、請求項35～39のいずれか一項に記載の化合物。

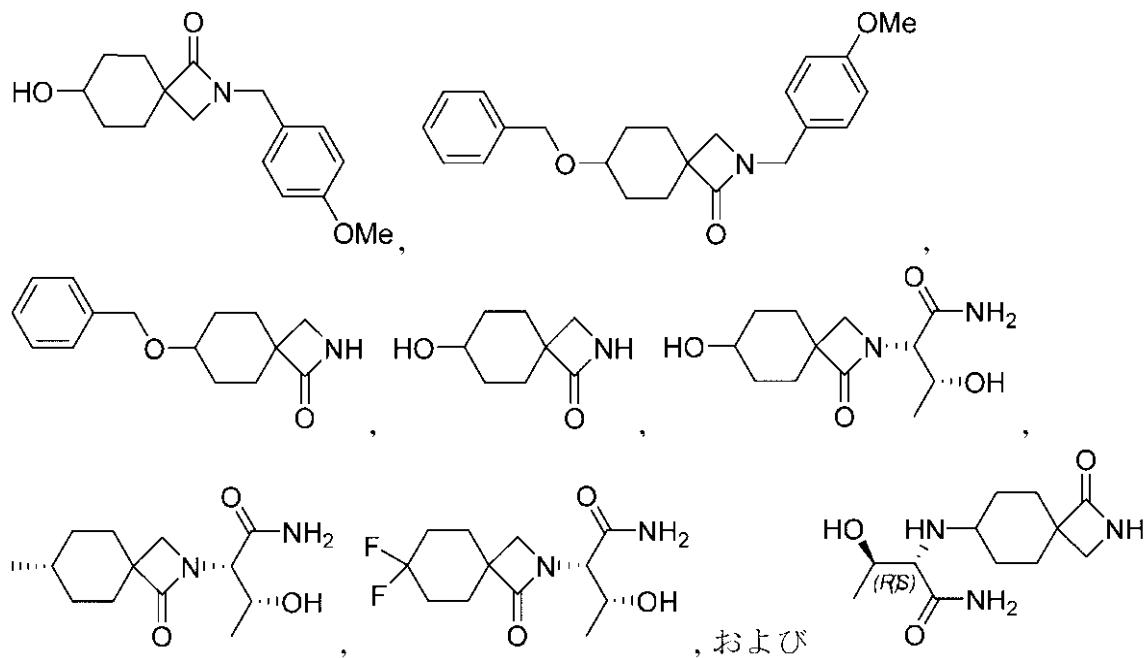
【請求項41】

【化 2 0】





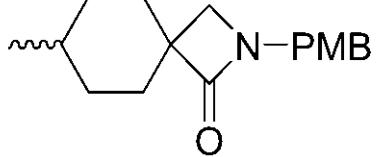
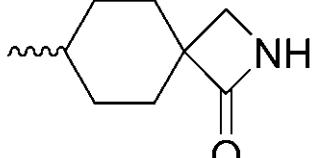
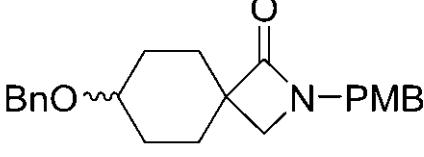
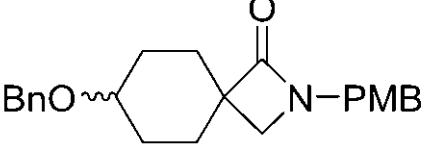
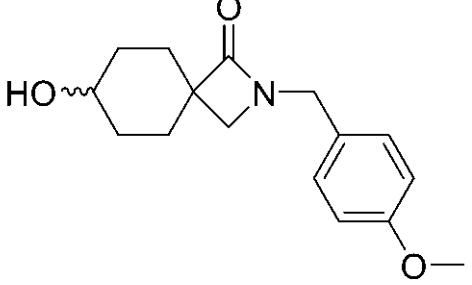
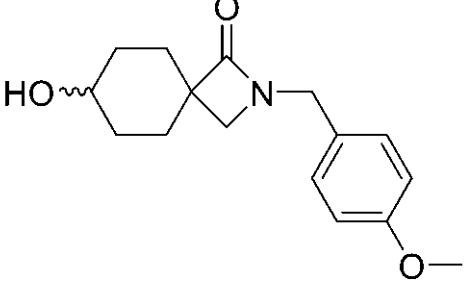
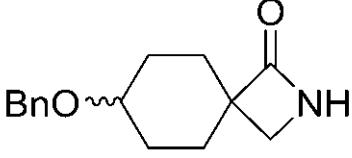
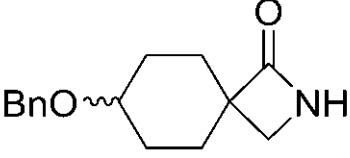


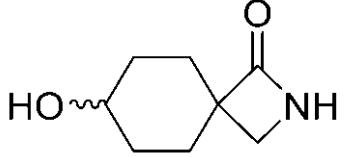
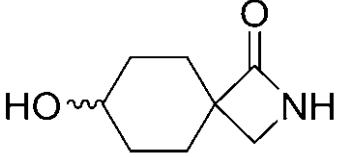
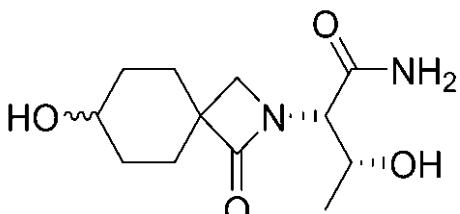
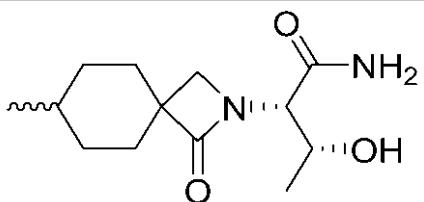
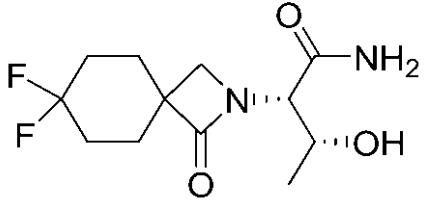
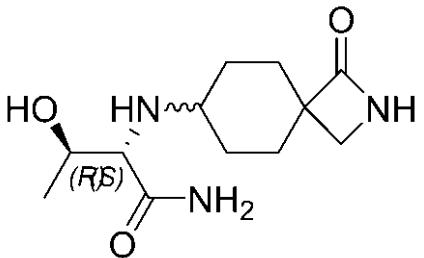
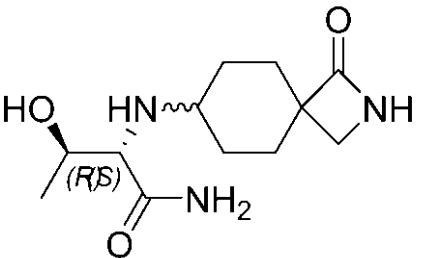


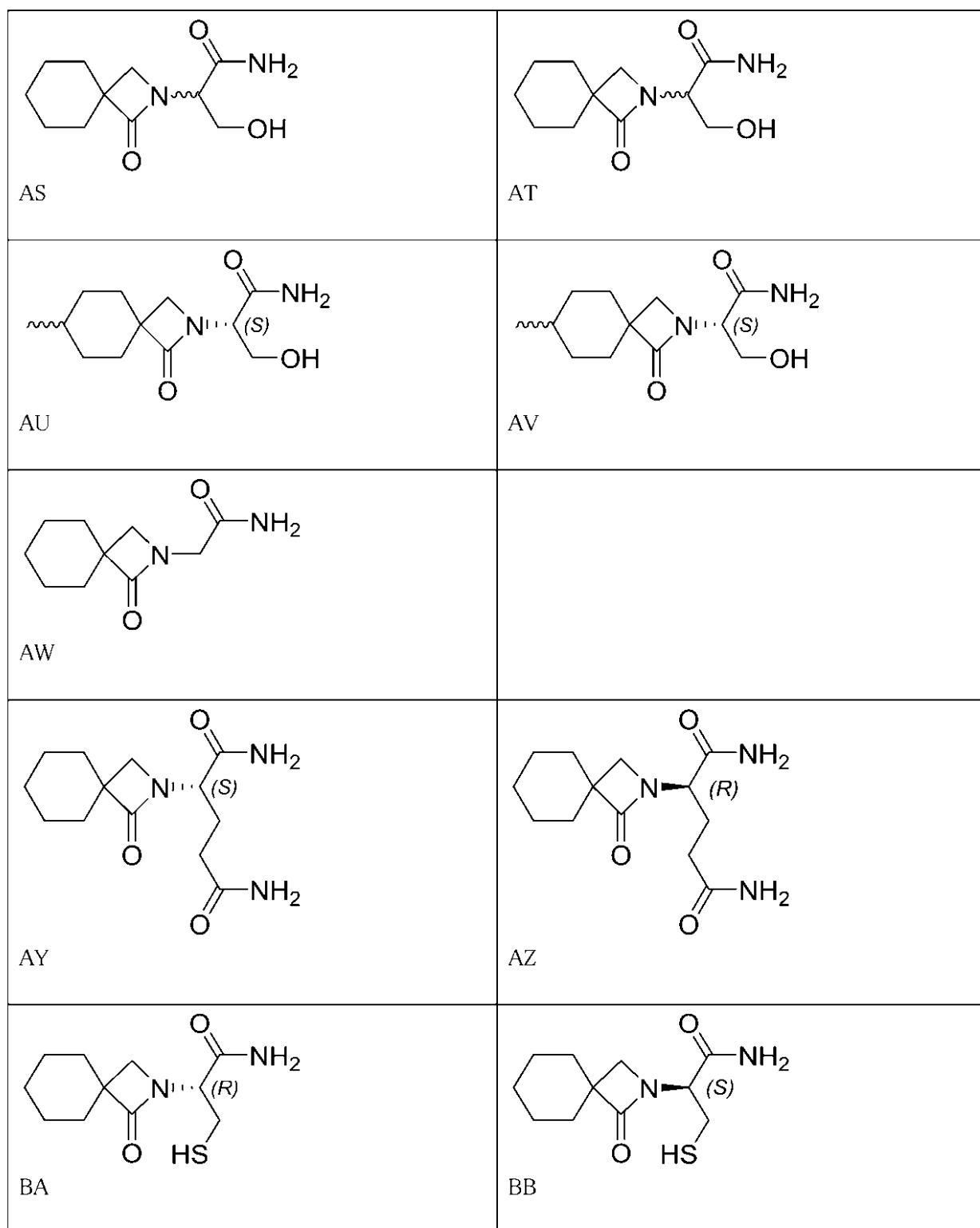
からなる群から選択される化合物、または、その薬学的に許容可能な塩および／もしくは立体異性体。

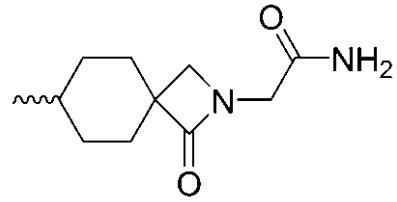
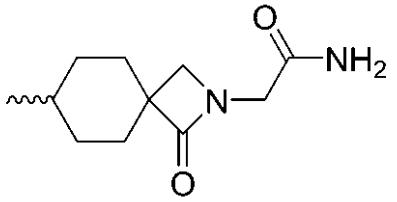
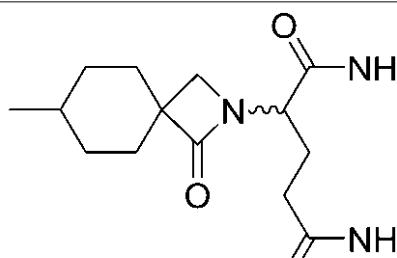
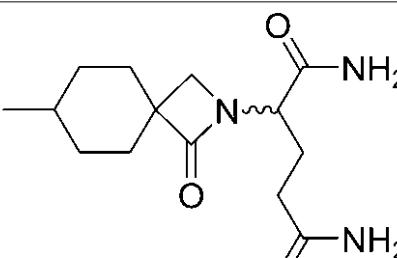
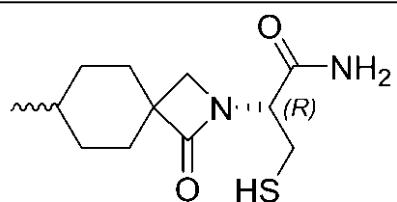
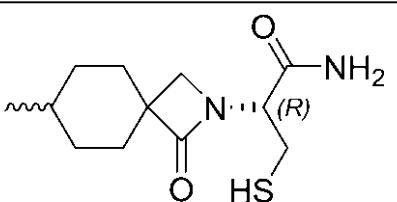
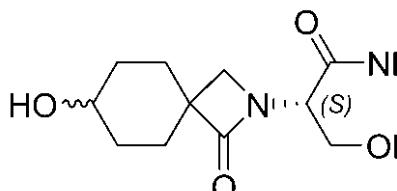
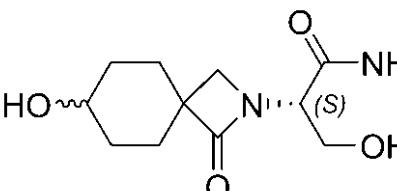
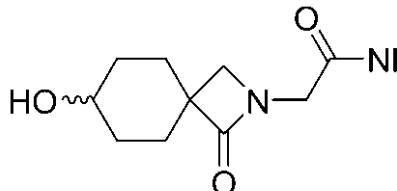
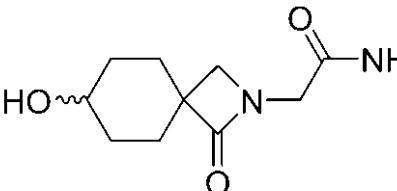
【請求項 4 2】

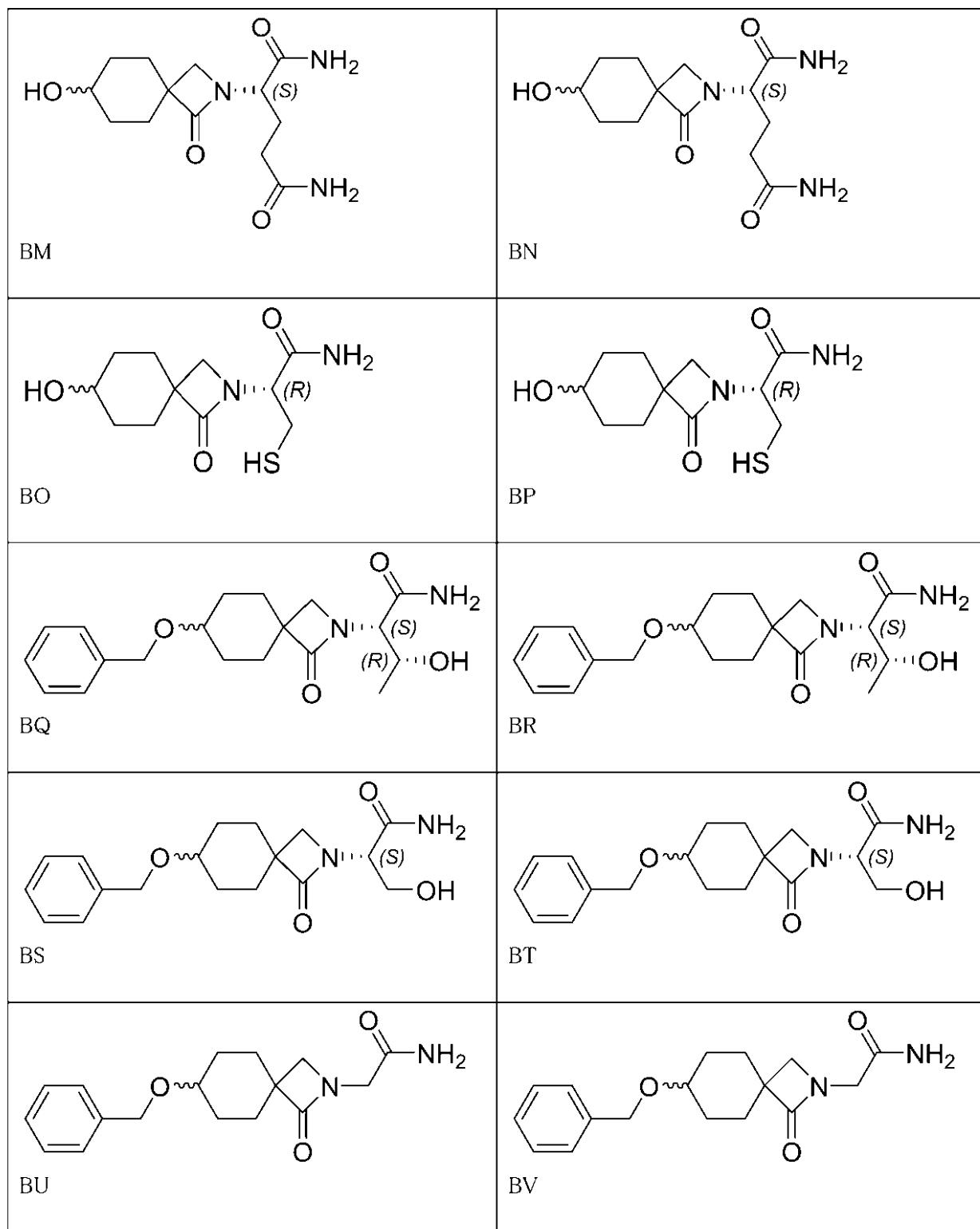
前記化合物が、以下の表に記載されている化合物、または、その薬学的に許容可能な塩および／もしくは立体異性体から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

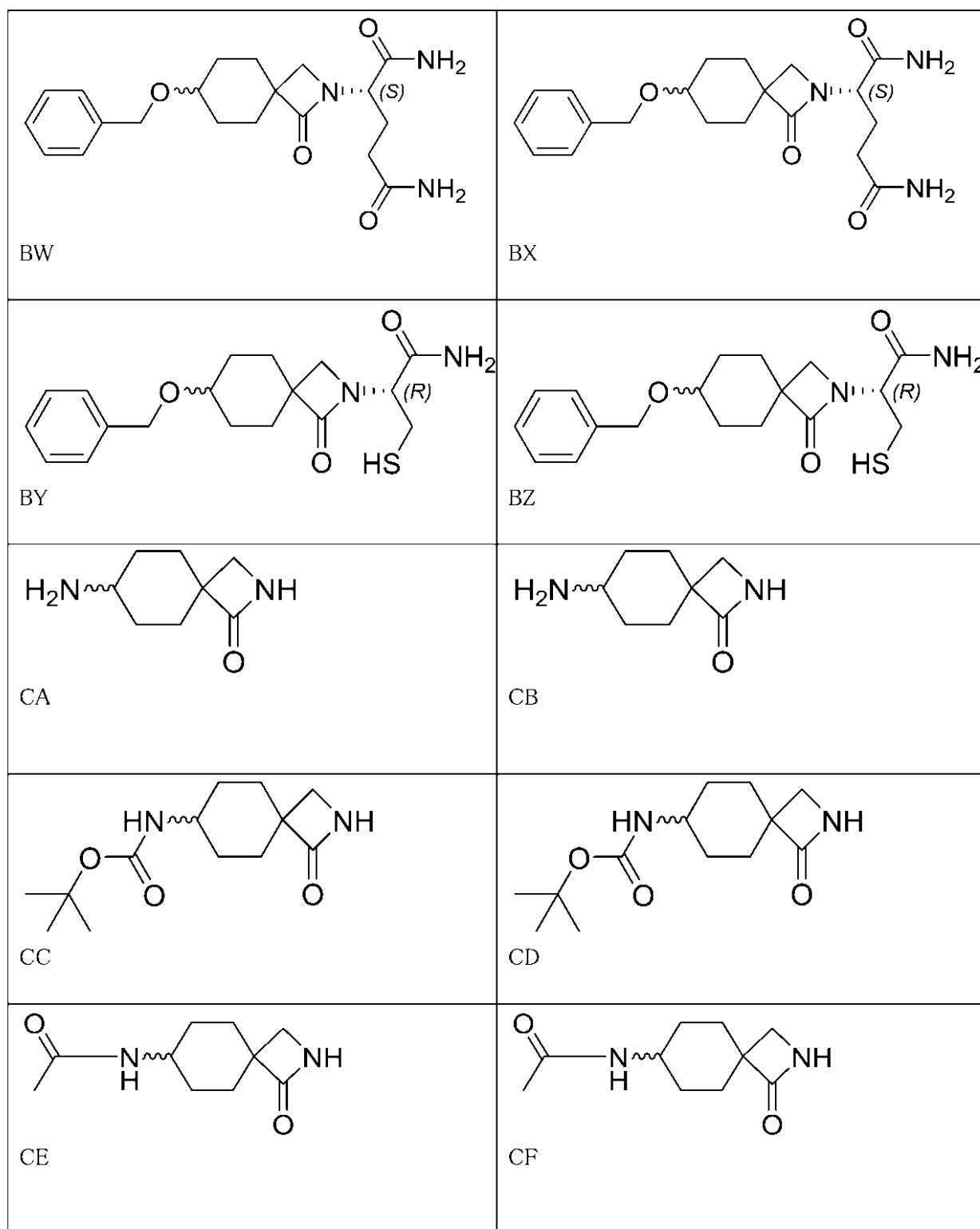
 AC	
 AD	
 AE	 AF
 AG	 AH
 AI	 AJ

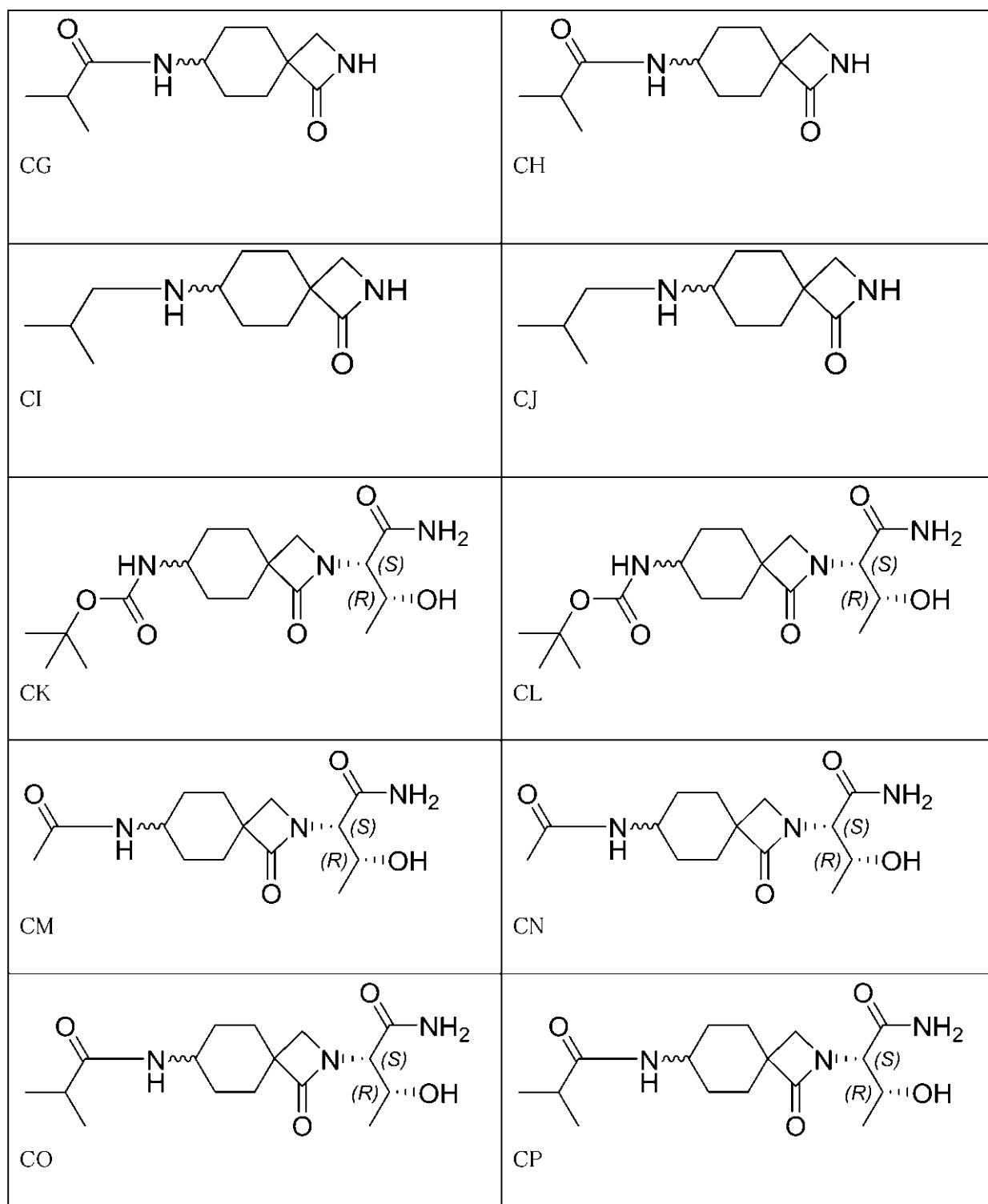
 AK	 AL
 AM	
 AN	
 AO	
 AP	 AQ

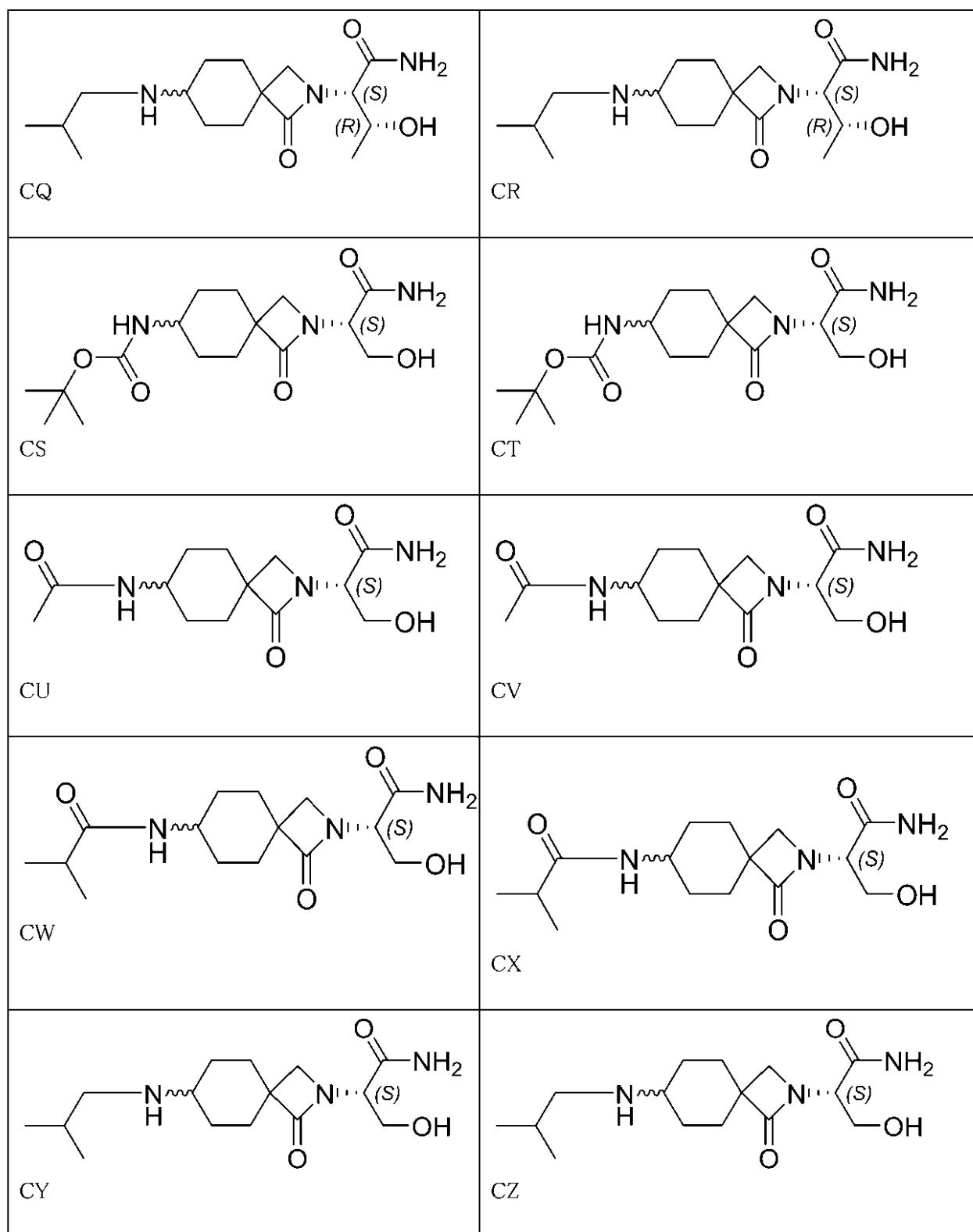


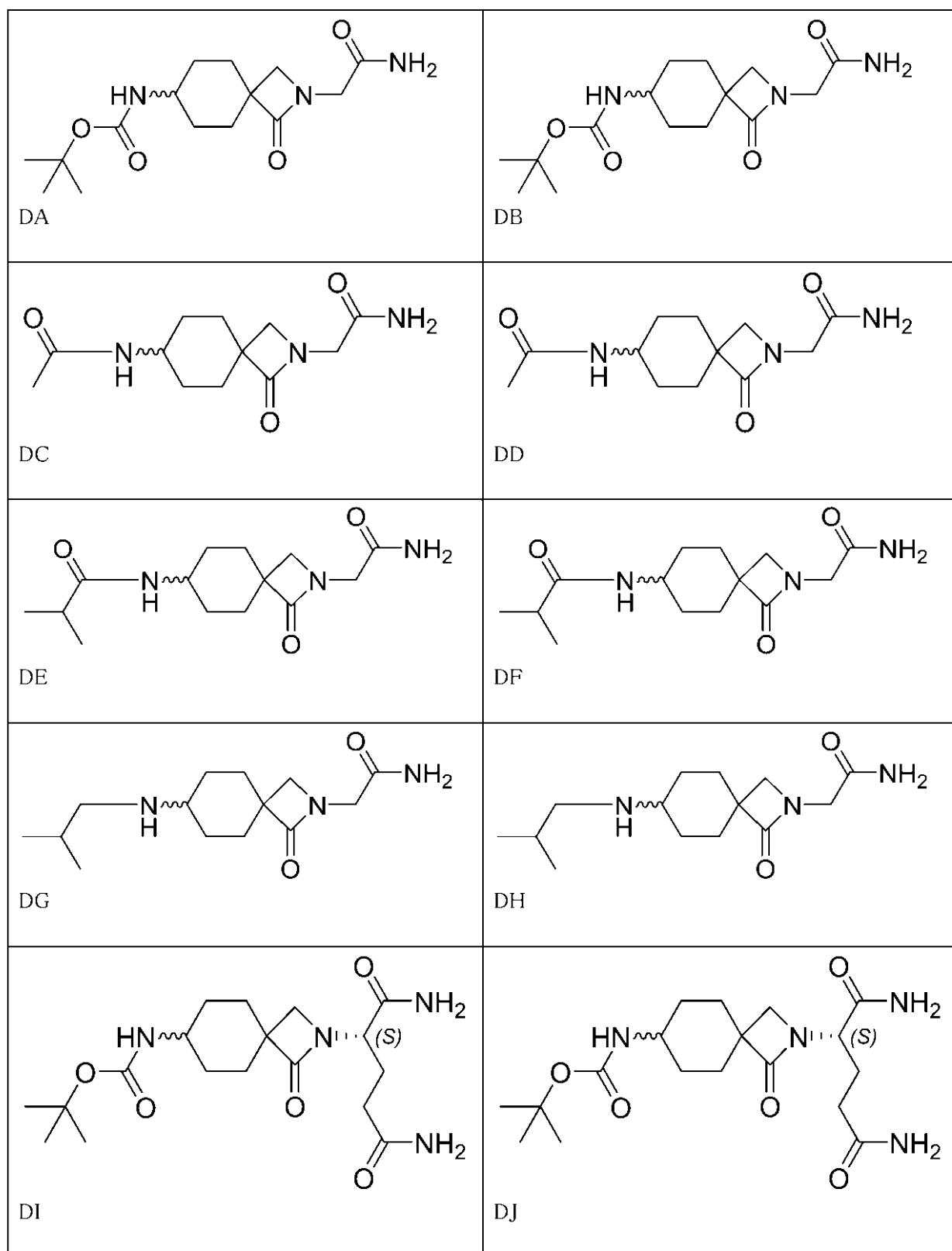
 BC	 BD
 BE	 BF
 BG	 BH
 BI	 BJ
 BK	 BL

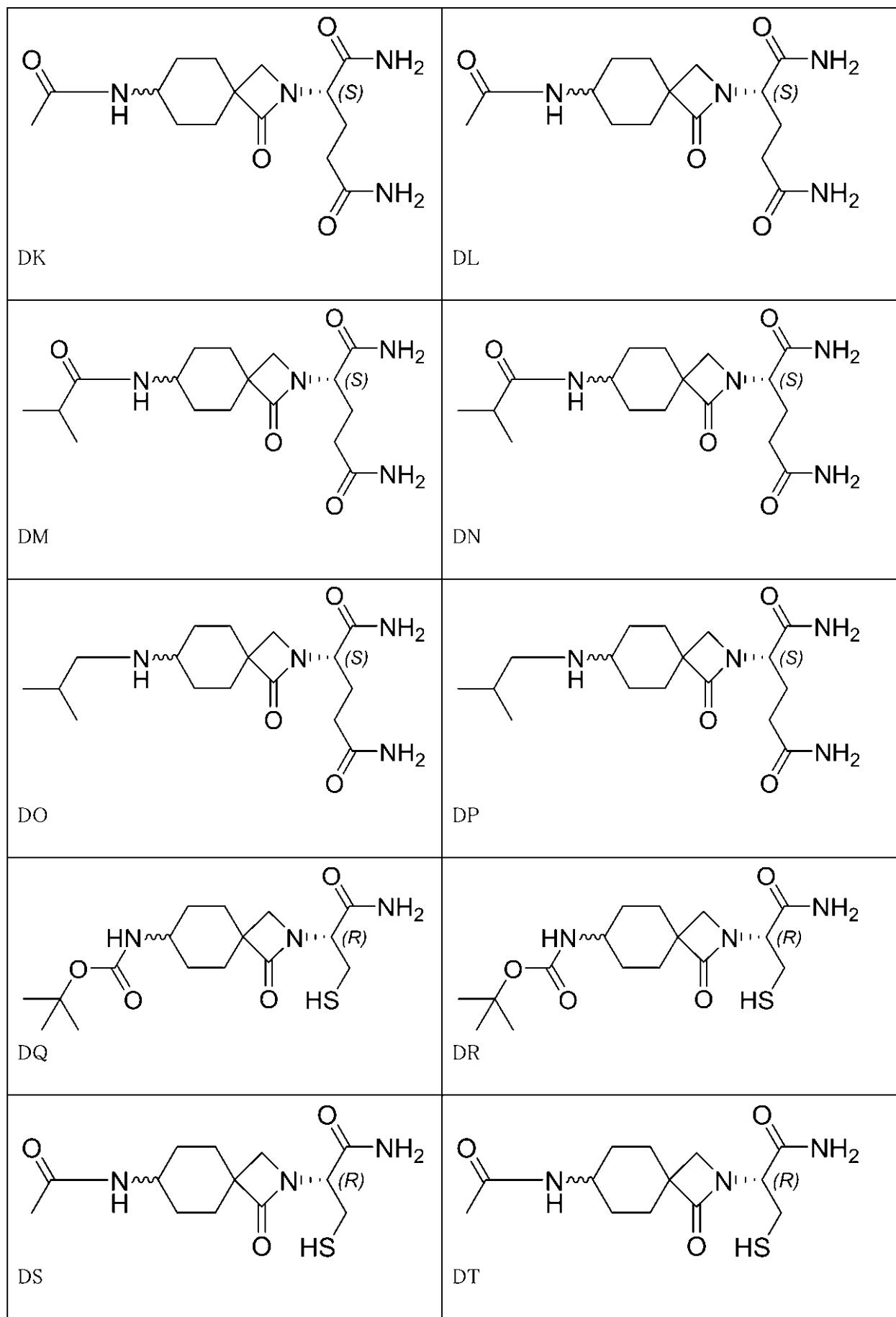


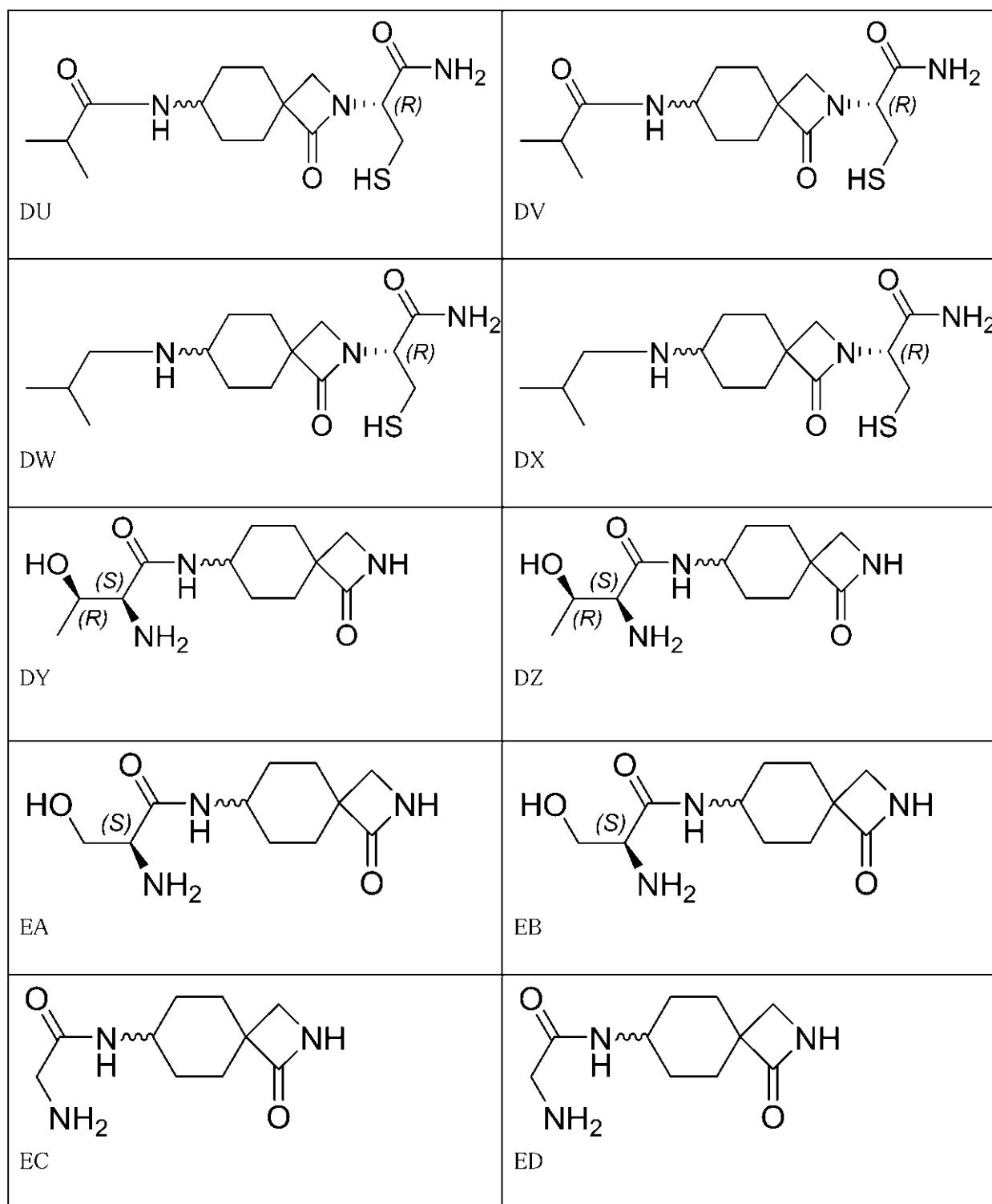


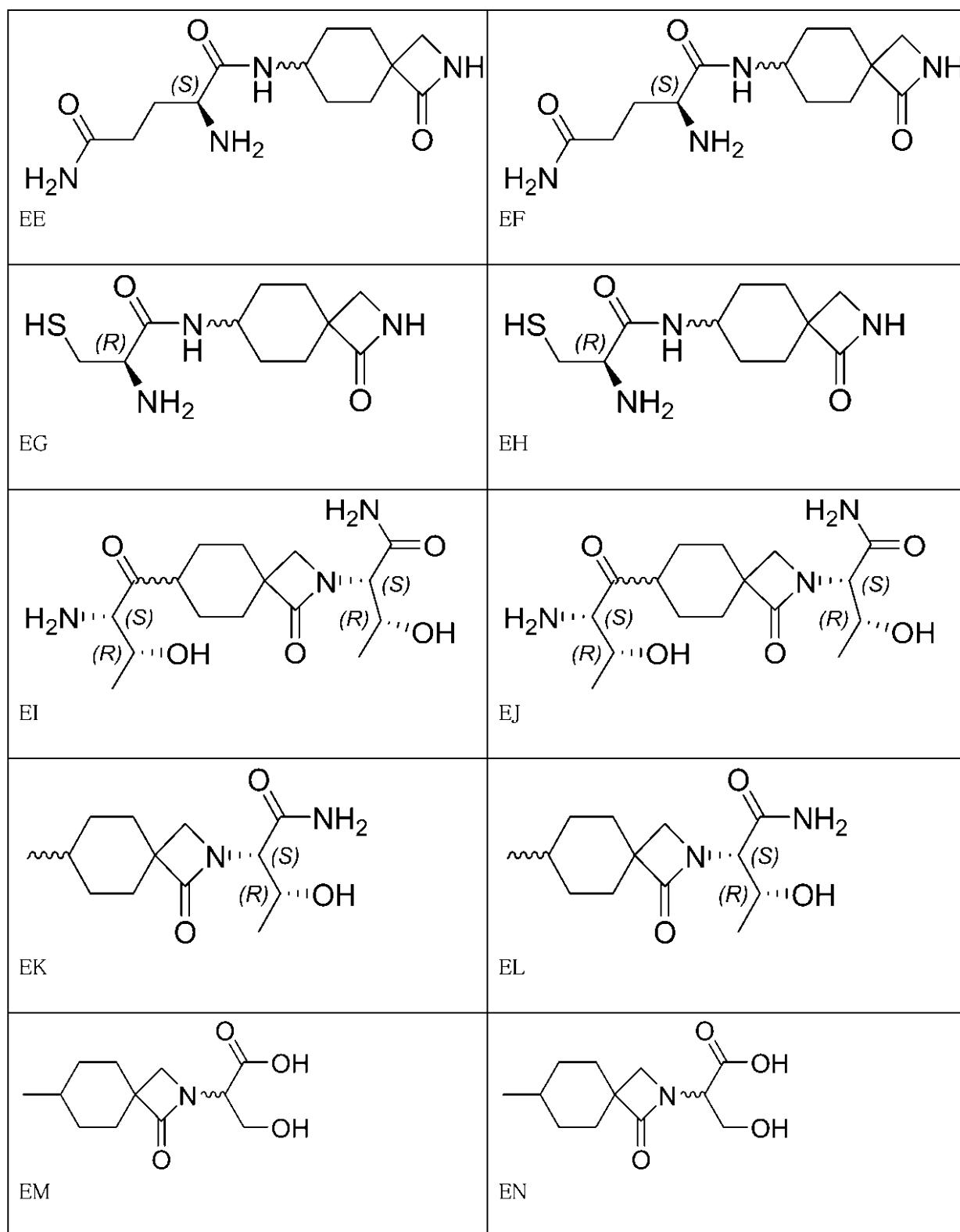


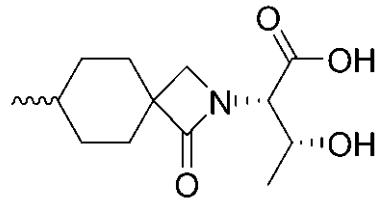
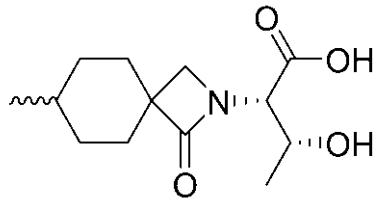
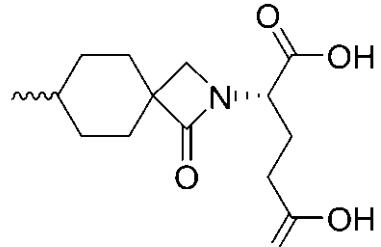
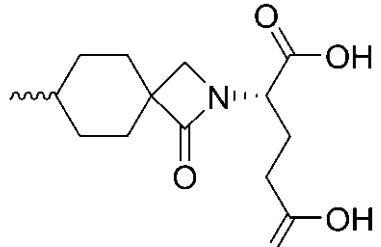
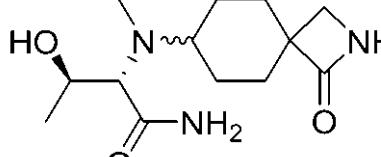
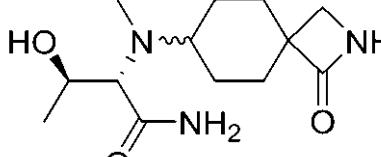
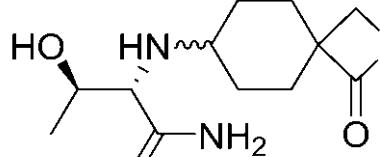
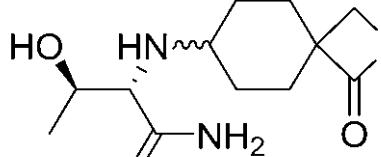
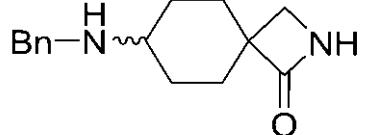
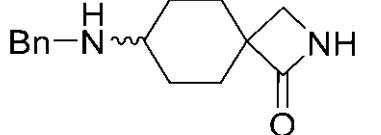










 <p>EO</p>	 <p>EP</p>
 <p>EQ</p>	 <p>ER</p>
 <p>ES</p>	 <p>ET</p>
 <p>EU</p>	 <p>EV</p>
 <p>EW</p>	 <p>EX</p>

【請求項 4 3】

請求項 1 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物；および、薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 4 4】

経口投与、非経口投与、局所投与、腔内投与、直腸内投与、舌下投与、点眼投与、経皮

投与または鼻噴投与に好適である、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項45】

有効量の請求項1～42のいずれか一項に記載の化合物を含む、うつ病、アルツハイマー病、注意欠陥障害、統合失調症または不安の治療用の医薬組成物。

【請求項46】

有効量の請求項1～42のいずれか一項に記載の化合物を含む、偏頭痛の治療用の医薬組成物。

【請求項47】

有効量の請求項1～42のいずれか一項に記載の化合物を含む、神経障害性疼痛の治療用の医薬組成物。

【請求項48】

有効量の請求項1～42のいずれか一項に記載の化合物を含む、シナプス機能不全に関する神経発達障害の治療用の医薬組成物。