

【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6月18日 (2009.6.18)

【公表番号】特表2008-540665(P2008-540665A)

【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2008-512432(P2008-512432)

【国際特許分類】

C 07 D 295/18 (2006.01)

A 61 K 31/495 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 5/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 295/18 C S P A

A 61 K 31/495

A 61 P 25/04

A 61 P 25/06

A 61 P 25/08

A 61 P 25/00

A 61 P 25/24

A 61 P 25/22

A 61 P 9/06

A 61 P 5/00

A 61 P 19/02

A 61 P 3/10

A 61 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月17日 (2009.4.17)

【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

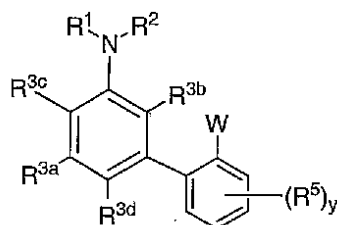
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



I

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩であって、
ここで：

Wは、ハロ、OR'、SR'、N(R')₂、CHF₂、またはCH₂Fである；

R¹およびR²は、それらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄、または酸素から独立して選択される0～3個のさらなるヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された3～8員の単環式の飽和または部分的に不飽和の環を形成し；ここで、一緒にあってR¹およびR²により形成される該環は、z個の独立した出現の-R⁴で、一個または一個より多い置換可能な炭素原子、窒素原子、または硫黄原子にて、それぞれ必要に応じて、そして独立して置換され、ここで、zは0～5である；

yは0～5である；

R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、R⁴、およびR⁵の各出現は、独立してQ-R^xであり；ここで、Qは、結合またはC₁～C₆アルキリデン鎖であり、ここでQの二個までの隣接していないメチレン単位は、-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)-、または-POR-で、必要に応じて、そして独立して、置換され；そして、R^xの各出現は、-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'、-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、または-OPO(R')₂から独立して選択される；

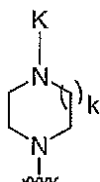
各Rの出現は、独立して、水素または必要に応じて置換されたC₁～₆脂肪族基である；

各R'の出現は、独立して、水素、または必要に応じて置換されたC₁～₆脂肪族基、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される0～5個のヘテロ原子を有する8～12員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であるか；あるいは、RおよびR'、Rの二つの出現、またはR'の二つの出現は、それらが結合している原子と一緒に、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される0～4個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された3～12員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式または二環式の環を形成する；

但し、

i) Wが-OMeである場合、一緒になったR¹およびR²は、

【化 2】



ではない、ここで、Kはメチルまたはエチルであり、そしてkは1または2である；

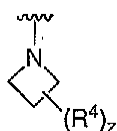
i i) Wが - OHまたは - OAc、 R^{3d} がMe、 R^5 が5 - メチル、そして R^{3a} 、 R^{3b} 、および R^{3c} が水素である場合、一緒になった R^1 および R^2 は、ピペリジルでもピロリジニルでもない；そしてWが CF_3 または CH_2F である場合、 R^{3d} はクロロではない、

化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】

R^1 および R^2 が一緒になって、アゼチジニル環：

【化 3】



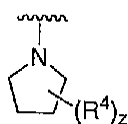
aa

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピロリジニル環：

【化 4】



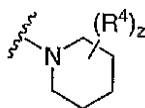
bb

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピペリジニル環：

【化 5】



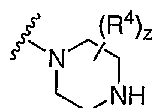
cc

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピペラジニル環：

【化 6】



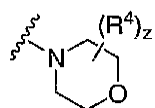
dd

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 および R^2 が一緒になって、モルホリニル環：

【化 7】



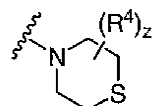
ee

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 および R^2 が一緒になって、チオモルホリニル環：

【化 8】



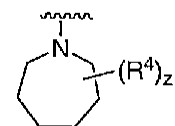
ff

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 および R^2 が一緒になって、アゼパニル環：

【化 9】



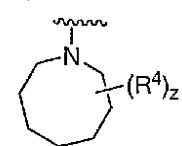
gg

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^1 および R^2 が一緒になって、アゾカニル環：

【化 10】



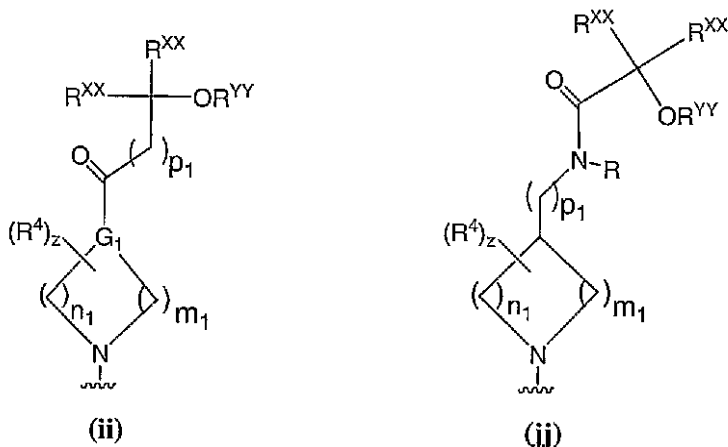
hh

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、 R^1 および R^2 が一緒になって、以下に示される環 (ii) または (jj)：

【化 1 1】



を形成し、ここで：

G_1 は、 $-N-$ 、 $-CH-NH-$ 、または $-CH-CH_2-NH-$ であり；

m_1 および n_1 はそれぞれ独立して 0 ~ 3 であり、但し、 $m_1 + n_1$ は 2 ~ 6 である；

p_1 は 0 ~ 2 である；

z は 0 ~ 4 である；

各 R^{XX} は、水素、 $C_1 \sim 6$ 脂肪族基、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり；ここで、 R^{XX} は、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である；

但し、双方の R^{XX} は同時に水素ではない；

R^{YY} は、水素、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、または $-PO(R')$ である；

R^{11} の各出現は、独立して $Q-R^X$ であり；ここで、 Q は、結合または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで Q の二個までの隣接していないメチレン単位は、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 、または $-POR-$ で、必要に応じて、そして独立して、置換され；そして、 R^X の各出現は、独立して、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ から独立して選択される；そして

各 R の出現は、独立して、水素または 3 個までの置換基を有する $C_1 \sim 6$ 脂肪族基であり；そして、各 R' の出現は、独立して、水素、または $C_1 \sim 6$ 脂肪族基、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり、ここで、 R' は 4 個までの置換基を有するか；あるいは、 R および R' 、 R の二つの出現、または R' の二つの出現は、それらが結合している原子と一緒にあって、窒素、酸素、また

は硫黄から独立して選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された 3 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式または二環式の環を形成する、化合物。

【請求項 11】

一つの R^{xx} が水素であり、そしてもう一つの R^{xx} が水素でない、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^{xx} が双方とも水素ではない、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

p_1 が 0 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 14】

p_1 が 1 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 15】

p_1 が 2 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 16】

m_1 および n_1 がそれぞれ 1 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 17】

m_1 および n_1 がそれぞれ 2 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 18】

m_1 および n_1 がそれぞれ 3 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^{xx} が、 $C_1 \sim 6$ 脂肪族基であり、ここで R^{xx} は、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である、請求項 10 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{xx} が、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル基であり、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である、請求項 10 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{xx} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基である、請求項 10 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 22】

請求項 10 に記載の化合物であって、 R^{xx} は、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 ~ 8 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり、ここで、 R^{xx} は、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 23】

請求項 10 に記載の化合物であって、 R^{xx} は、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または完全に不飽和の単環式の環であり、ここで、 R^{xx} は、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 24】

請求項 23 に記載の化合物であって、 R^{xx} は、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または完全に不飽和の二環式の環であり、ここで、 R^{xx} は、 w_1 個の独立した出現の $-R^{11}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_1 は 0 ~ 3 である、化合物。

【請求項 25】

R^{yy} が、水素、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO$

$_2 R'$ 、 $-SO_2 N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、または $-PO(R')$ である、請求項10～24のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

R^{YY} が、水素である、請求項25に記載の化合物。

【請求項27】

R^{YY} が、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、または $-PO(R')$ 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のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項29】

R がC1～C6アルキルである、請求項10～27のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項30】

R がメチル、エチル、プロピル、またはブチルである、請求項10～27のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項31】

R^{YY} が水素であり、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの 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、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの 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、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの R^{XX} がC1～C6アルキルである、請求項10に記載の化合物。

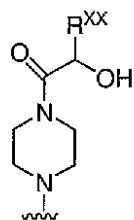
【請求項34】

p_1 が0であり、 R^{YY} が水素であり、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの 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 および R^2 が一緒になって、以下に示される環：

【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。

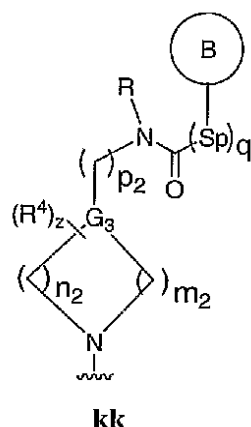
【請求項37】

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、または t -ブチルである、請求項36に記載の化合物。

【請求項38】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 R^1 および R^2 が一緒になって、以下に示される環(kk)：

【化 13】



を形成し、

G_3 は、 $-N-$ 、または CH である；

m_2 および n_2 はそれぞれ独立して $0 \sim 3$ であり、但し、 $m_2 + n_2$ は $2 \sim 6$ である；

p_2 は $0 \sim 2$ であり；但し、 G_3 が N である場合、 p_2 は 0 ではない；

q_2 は 0 または 1 である；

z は $0 \sim 4$ である；

Sp は、結合または $C_1 \sim C_6$ アルキリデンリンカーであり、ここで 2 個までのメチレン単位は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR'-$ 、 $-CONR'NR'-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR'CO_2-$ 、 $-NR'CONR'-$ 、 $-OCONR'-$ 、 $-NR'NR'$ 、 $-NR'NR'CO-$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-SO$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR'-$ 、 $-SO_2NR'-$ 、 $NR'SO_2-$ 、または $-NR'SO_2NR'-$ で、必要に応じて、そして独立して、置換される；

環 B は、 O 、 S 、または N から選択される $1 \sim 4$ 個のヘテロ原子を有する、 $4 \sim 8$ 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または芳香族の単環式の複素環であり、ここで環 B は、 w_2 個の独立した出現の $-R^{12}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_2 は $0 \sim 4$ である；

R^{12} の各出現は、独立して $Q-R^x$ であり；ここで、 Q は、結合または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで Q の二個までの隣接していないメチレン単位は、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 、または $-POR-$ で、必要に応じて、そして独立して、置換され；そして、 R^x の各出現は、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ から独立して選択される；そして

各 R の出現は、独立して、水素または 3 個までの置換基を有する $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり；そして、各 R' の出現は、独立して、水素、または $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される $0 \sim 3$ 個のヘテロ原子を有する、 $3 \sim 8$ 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される $0 \sim 5$ 個のヘテロ原子を有する、 $8 \sim 12$ 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり、ここで、 R' は 4 個までの置換基を有するか；あるいは、 R および R' 、 R の二つの出現

、または R' の二つの出現は、それらが結合している原子と一緒にあって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された 3 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式または二環式の環を形成する、化合物。

【請求項 39】

G₃ が N である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

G₃ が CH である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 41】

p₂ が 0 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 42】

p₂ が 1 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 43】

p₂ が 2 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 44】

q₂ が 0 である、請求項 38 ~ 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 45】

q₂ が 1 である、請求項 38 ~ 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 46】

p₂ が 1 であり、そして q₂ が 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 47】

G₃ が CH であり、p₂ が 0 であり、そして q₂ が 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 48】

m₂ および n₂ がそれぞれ 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 49】

m₂ および n₂ がそれぞれ 2 である、請求項 38 ~ 48 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 50】

S_p が、-O-、-S-、または -NR'- から選択される、請求項 38 ~ 49 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 51】

S_p が、-O- である、請求項 38 ~ 50 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 52】

S_p が、-NR'- である、請求項 38 ~ 50 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 53】

S_p が、-NH- である、請求項 38 ~ 50 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 54】

請求項 38 ~ 53 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B は、O、S、または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または芳香族の単環式の複素環であり、ここで環 B は、w₂ 個の独立した出現の -R^{1 2} で、必要に応じて置換され、ここで、w₂ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 55】

請求項 38 ~ 54 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B は、O、S、または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B は、w₂ 個の独立した出現の -R^{1 2} で、必要に応じて置換され、ここで、w₂ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 56】

請求項 38 ~ 55 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B は、O、S、または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B は、w₂ 個の独立した出現の -R^{1 2} で、必要に応じて置換され、ここで、w₂

は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 57】

w_2 が 0 である、請求項 38 ~ 56 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 58】

環 B がテトラヒドロフランである、請求項 38 ~ 57 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 59】

S p が結合、O、または - O - CH₂ - であり；p₂ は 1 であり；R は水素であり；そして n₂ および m₂ の双方が同時に 1 または 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 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 61】

R が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 60 に記載の化合物。

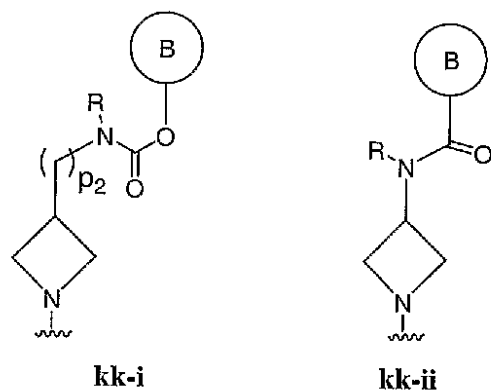
【請求項 62】

R がメチル、エチル、プロピル、またはブチルである、請求項 61 に記載の化合物。

【請求項 63】

R¹ および R² が、一緒になって式 (kk-i) または式 (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】

請求項 63 に記載の化合物であって、環 B が、O、S、または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B は、 w_2 個の独立した出現の - R^{1 2} で、必要に応じて置換され、ここで、 w_2 は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 65】

R が水素である、請求項 63 ~ 64 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 66】

R が水素であり、そして環 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。

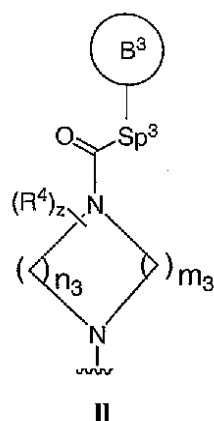
【請求項 67】

S p が結合、- O -、または - O - CH₂ - である、請求項 63 ~ 66 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 68】

請求項 1 に記載の化合物であって、R¹ および R² が、一緒になって環 (II)：

【化 15】



を形成し、ここで：

m_3 および n_3 はそれぞれ、独立して 0 ~ 3 であり、但し、 $m_3 + n_3$ は、2 ~ 6 である；

z は 0 ~ 4 である；

Sp^3 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'-$ 、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデンリンカーであり、ここで、2 個までのメチレン単位は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR'-$ 、 $-CONR'NR'-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR'CO_2-$ 、 $-NR'CONR'-$ 、 $-OCONR'-$ 、 $-NR'NR'$ 、 $-NR'NR'CO-$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR'-$ 、 $-SO_2NR'-$ 、 $NR'SO_2-$ 、または $-NR'SO_2NR'-$ で、必要に応じて、そして独立して置換され、但し、 Sp^3 は、炭素以外の原子を通して、カルボニル基と結合している；

環 B_3 は、O、S、または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または芳香族の単環式の複素環であり、ここで環 B_3 は、 w_3 個の独立した出現の $-R^{13}$ で、必要に応じて置換され、ここで、 w_3 は 0 ~ 4 である；

各 R^{13} の出現は、独立して $Q-R^x$ であり；ここで、 Q は、結合または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、ここで Q の 2 個までの隣接していないメチレン単位は、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 、または $-POR-$ で、必要に応じて、そして独立して置換され；そして、 R^x の各出現は、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、または $-OPO(R')_2$ から独立して選択される；そして、

各 R の出現は、独立して、水素または 3 個までの置換基を有する $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり；そして、各 R' の出現は、独立して、水素、または $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり、ここで、 R' は 4 個までの置換基を有する；あるいは、 R および R' 、 R の二つの出現、または R' の二つの出現は、それらが結合している原子と一緒にあって、窒素、酸素、もしくは

は硫黄から独立して選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された 3 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式または二環式の環を形成する、化合物。

【請求項 69】

Sp^3 が、-O-、-S-、または-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 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 および n_3 がそれぞれ 1 である、請求項 68 ~ 74 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 76】

m_3 および n_3 が 2 である、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 77】

請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B₃ は、O、S、または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和の、または部分的に不飽和の、または芳香族の単環式の複素環であり、ここで環 B₃ は、w₃ 個の独立した出現の -R^{1 3} で、必要に応じて置換され、ここで、w₃ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 78】

請求項 77 に記載の化合物であって、環 B₃ は、O、S、または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B₃ は、w₃ 個の独立した出現の -R^{1 3} で、必要に応じて置換され、ここで、w₃ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 79】

請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B₃ は、O、S、または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B₃ は、w₃ 個の独立した出現の -R^{1 3} で、必要に応じて置換され、ここで w₃ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 80】

w₃ が 0 である、請求項 68 ~ 79 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 81】

環 B₃ がテトラヒドロフラニルである、請求項 68 ~ 80 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 82】

Sp^3 が結合、O、または -O-CH₂-であり；R は、水素であり；そして、 n_3 および m_3 の双方は同時に 1 または 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 ~ 82 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 84】

R が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 68 ~ 82 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 85】

R が、メチル、エチル、プロピル、またはブチルを含む、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 のいずれか一項に記載の化合物。

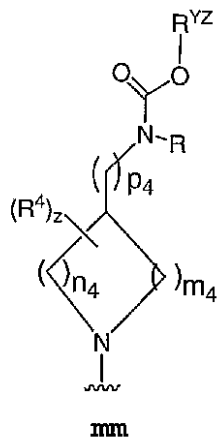
【請求項 87】

請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物であって、環 B₃ は、O、S、または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和の単環式複素環であり、ここで環 B₃ は、w₃ 個の独立した出現の - R^{1 3} で、必要に応じて置換され、ここで w₃ は 0 ~ 4 である、化合物。

【請求項 88】

請求項 1 に記載の化合物であって、R¹ および R² が、一緒になって環 (mm) :

【化 16】



を形成し、ここで：

m₄ および n₄ はそれぞれ、独立して 0 ~ 3 であり、但し、m₄ + n₄ は、2 ~ 6 である；

p₄ は 1 ~ 2 である；

R^{YZ} は、w₄ 個の独立した出現の - R^{1 4} で、必要に応じて置換された C₁ ~ C₆ 脂肪族基であり、ここで、w₄ は 0 ~ 3 である；

各 R^{1 4} の出現は、独立して Q - R^X であり；ここで、Q は、結合または C₁ ~ C₆ アルキリデン鎖であり、ここで Q の二個までの隣接していないメチレン単位は - 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) - 、または - POR - で、必要に応じて、そして独立して置換され；そして、R^X の各出現は、- 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、または - OPO(R')₂ から独立して選択される；そして、

各 R の出現は、独立して、水素または 3 個までの置換基を有する C₁ ~ C₆ 脂肪族基であり；そして、各 R' の出現は、独立して、水素、または C₁ ~ C₆ 脂肪族基、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式の環、または、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の二環式の環系であり、ここで、R' は 4 個までの置換基を有する；あるいは、R および R'、R の二つの出現、または R' の二つの出現は、それらが結合している原子と一緒に、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、必要に応じて置換された

3 ~ 12 員の飽和の、もしくは部分的に不飽和の、もしくは完全に不飽和の単環式または二環式の環を形成する、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 89 に記載の化合物。

【請求項 91】

m_4 および n_4 がそれぞれ 1 である、請求項 87 ~ 90 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 92】

m_4 および n_4 がそれぞれ 2 である、請求項 87 ~ 90 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 93】

m_4 および n_4 がそれぞれ 3 である、請求項 87 ~ 90 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 94】

R^{Y^Z} が、 w_4 個の独立した出現の $-R^{1^4}$ で、必要に応じて置換された C 1 ~ C 6 アルキルであり、ここで、 w_4 は 0 ~ 3 である、請求項 88 ~ 93 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 95】

R^{Y^Z} が、 w_4 個の独立した出現の $-R^{1^4}$ で、必要に応じて置換された C 1 ~ C 4 アルキル基であり、ここで、 w_4 は 0 ~ 3 である、請求項 94 に記載の化合物。

【請求項 96】

R^Y が C 1 ~ C 6 アルキル基である、請求項 94 に記載の化合物。

【請求項 97】

R が水素である、請求項 87 ~ 96 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 98】

R が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 87 ~ 96 のいずれか一項に記載の化合物。

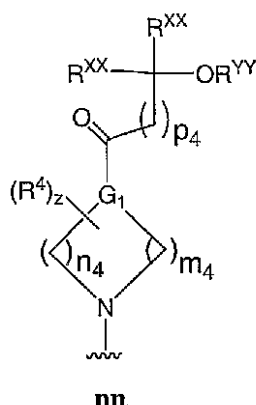
【請求項 99】

R が、メチル、エチル、プロピル、またはブチルである、請求項 98 に記載の化合物。

【請求項 100】

R^1 および R^2 が、一緒になって環 (nn) :

【化 17】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 101】

G_1 が $-N-$ である、請求項 100 に記載の化合物。

【請求項 102】

G_1 が $-CH-NH-$ である、請求項 100 に記載の化合物。

【請求項 103】

G_1 が $-CH-CH_2-NH-$ である、請求項 100 に記載の化合物。

【請求項 104】

R^{Y^Y} が水素であり、一つの R^{X^X} が水素であり、そしてもう一つの R^{X^X} が C 1 ~ C 6

アルキルである、請求項 100 ~ 103 のいずれか一項に記載の化合物。

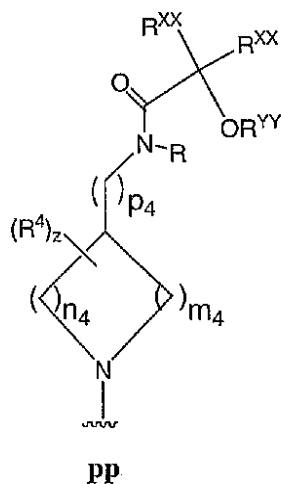
【請求項 105】

p_4 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの R^{XX} が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 100 ~ 104 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 106】

R^1 および R^2 が、ともに環 (pp) :

【化 18 - 1】



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、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの 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、一つの R^{XX} が水素であり、そしてもう一つの R^{XX} が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 100 ~ 107 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 109】

W が OR' である、請求項 1 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 または CH₂F である、請求項 1 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 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 のいずれか一項に記載の化合物。

【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 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{CH}_2\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ 、 $-\text{CH}_2\text{SR}'$ 、 $-\text{COOR}'$ 、 $-\text{NRCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 COR' 、 $-\text{NHCOOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、脂環族、ヘテロ脂環族 (heterocycloaliphatic)、アリール $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ヘテロアリール $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、脂環族 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、もしくはヘテロ脂環族 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 1 ~ 122 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 124】

R_4 が、独立して、

【化 18 - 2】

Cl , Br , F ,

CF_3 , CH_3 , $-\text{CH}_2\text{CH}_3$, CN , $-\text{COOH}$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{Et})_2$, $-\text{N}(\text{iPr})_2$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{COOCH}_3$, $-\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{OH}$, $-\text{NHCOCH}_3$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOOCH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{COO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_3$,

または、 $-\text{ピペリジニル}$ 、 ピペリジニル 、 モルホリノ 、 $\text{C}_1 \sim 4$ 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、 $-\text{CH}_2$ シクロヘキシル、ピリジル、 $-\text{CH}_2$ ピリジル、または $-\text{CH}_2$ チアゾリルから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 123 に記載の化合物。

【請求項 125】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、ここで、z は 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、 $-\text{NRSO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NRCOOR}'$ 、または $-\text{NRCOR}'$ である、化合物。

【請求項 126】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、ここで、z は 1 であり、そして R^4 は、 $-\text{NRSO}_2\text{R}'$ である、化合物。

【請求項 127】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、ここで、z は 1 であり、そして R^4 は、 $-\text{NRCOOR}'$ である、化合物。

【請求項 128】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、ここで、z は 1 であり、そして R^4 は、 $-\text{NRCOR}'$ である、化合物。

【請求項 129】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたピロリジン - 1 - イル (bb) であり、ここで、 z は 1 または 2 であり、そして R^4 は、Cl、Br、F、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 、または $-CH_2OR'$ である、化合物。

【請求項 130】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (cc) であり、ここで、 z は 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、Cl、Br、F、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 、または $-CH_2OR'$ 、 $-NRSO_2R'$ 、 $-NRCOOR'$ 、もしくは $OC(OR')_2$ である、化合物。

【請求項 131】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (cc) であり、ここで、 z は 1 であり、そして R^4 は、F、 CF_3 、 CH_3 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-OR'$ 、または $-CH_2OR'$ である、化合物。

【請求項 132】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (cc) であり、ここで、 z は 1 であり、そして R^4 は、 $-NRSO_2R'$ である、化合物。

【請求項 133】

請求項 125 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が、一緒になって必要に応じて置換されたピペリジン - 1 - イル (cc) であり、ここで、 z は 1 であり、そして R^4 は、 $-NRCOOR'$ である、化合物。

【請求項 134】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z は 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 、または $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 135】

請求項 134 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 が $-SOR'$ である、化合物。

【請求項 136】

請求項 134 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 が $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 137】

請求項 134 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 が $-CON(R')_2$ である、化合物。

【請求項 138】

請求項 134 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 が $-SO_2N(R')_2$ である、化合物。

【請求項 139】

請求項 134 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたピペラジン - 1 - イル (dd) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 が $-COR'$ である、化合物。

【請求項 140】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 、または $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 1】

請求項 1 4 0 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 2】

請求項 1 4 0 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 3】

請求項 1 4 0 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-CON(R')_2$ である、化合物。

【請求項 1 4 4】

請求項 1 4 0 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SO_2N(R')_2$ である、化合物。

【請求項 1 4 5】

請求項 1 4 0 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたモルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 6】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 、または $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 7】

請求項 1 4 6 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 8】

請求項 1 4 6 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 1 4 9】

請求項 1 4 6 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-CON(R')_2$ である、化合物。

【請求項 1 5 0】

請求項 1 4 6 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SO_2N(R')_2$ である、化合物。

【請求項 1 5 1】

請求項 1 4 6 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゼパン - 1 - イル (g g) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COR'$ である、化合物。

【請求項 152】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 または 2 であり、そして R^4 の少なくとも一つの出現は、 $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ 、または $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 153】

請求項 152 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SOR'$ である、化合物。

【請求項 154】

請求項 152 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COOR'$ である、化合物。

【請求項 155】

請求項 152 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-CON(R')_2$ である、化合物。

【請求項 156】

請求項 152 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-SO_2N(R')_2$ である、化合物。

【請求項 157】

請求項 152 に記載の化合物であって、 R^1 および R^2 が一緒になって、必要に応じて置換されたアゾカン - 1 - イル (hh) であり、ここで、 z が 1 であり、そして R^4 は、 $-COR'$ である、化合物。

【請求項 158】

y が 0 ~ 5 である、請求項 124 ~ 157 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 159】

一つの実施形態において、 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。

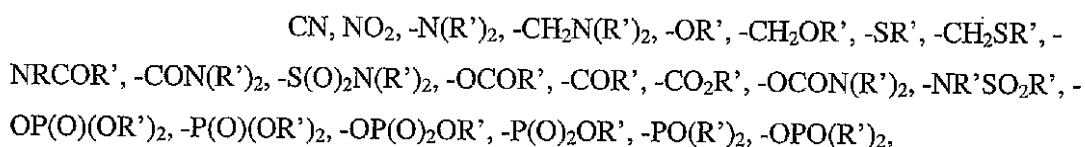
【請求項 162】

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、

【化 18 - 3】



または、 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、脂環族、ヘテロ脂環族、アリール $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキル、脂環族 $C_1 \sim C_6$ アルキル、もしくはヘテロ脂環族 $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 124 ~ 162 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 164】

R^5 が、独立して、

【化 18 - 4】

Cl, 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、必要に応じて置換されたフェノキシ、もしくは必要に応じて置換された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。

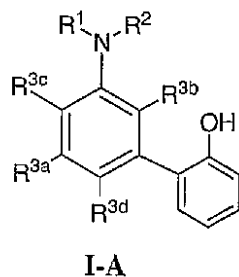
【請求項 167】

R⁵ が OH である、請求項 166 に記載の化合物。

【請求項 168】

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩であって、ここで該化合物は、式 I - A :

【化 19】



を有し、ここで、R¹、R²、R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、および R^{3d} は、請求項 1 で定義される通りである化合物、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 169】

R^{3a} が水素である、請求項 168 に記載の化合物。

【請求項 170】

R^{3a} が X - R^Q である、請求項 168 に記載の化合物。

【請求項 171】

X が C1 ~ C6 アルキリデンである、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 172】

X が C1 ~ C4 アルキリデンである、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 173】

X が -CH₂- である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 174】

R^Q が、独立して

【化 19 - 2】

-R', -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, または -OPO(R')₂.

から選択される、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 175】

R^Q が R' である、請求項 174 に記載の化合物。

【請求項 176】

R^{3b} が水素である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 177】

R^{3c} が水素である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 178】

R^{3b} および R^{3c} の双方が、同時に水素である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 179】

R^{3b} および R^{3c} が、それぞれ独立して、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、または C₁~C₆ 脂肪族、アリアル、ヘテロアリアル、脂環族、ヘテロ脂環族、アリアル C₁~C₆ アルキル、ヘテロアリアル C₁~C₆ アルキル、脂環族 C₁~C₆ アルキル、もしくはヘテロ脂環族 C₁~C₆ アルキルから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 180】

R^{3b} および R^{3c} の各出現が、独立して、

【化 19-3】

Cl, Br, F, CF₃, -OCF₃, Me, Et, CN, -COOH, -NH₂, -N(CH₃)₂, -N(Et)₂, -

N(iPr)₂, -O(CH₂)₂OCH₃, -CONH₂, -COOCH₃, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -CH₂OH, -

NHCOCH₃, -NHCOCH(CH₃)₂, -SO₂NH₂, -CONH(シクロプロピル), -CONHCH₃, -

CONHCH₂CH₃,

または、-ピペリジニル、ピペリジニル、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、またはベンジルオキシから選択される必要に応じて置換された基である、請求項 179 に記載の化合物。

【請求項 181】

R^{3b} および R^{3c} の各出現が、独立して、ハロゲン、CN、必要に応じて置換された C₁~C₆ アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂、または NRCOR' である、請求項 179 に記載の化合物。

【請求項 182】

R^{3b} および R^{3c} の各出現が、独立して、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または -CN である、請求項 181 に記載の化合物。

【請求項 183】

R^{3b} および R^{3c} が、独立して、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃、または -CN である、請求項 182 に記載の化合物。

【請求項 184】

R^{3b} および R^{3c} が、独立して、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、または -OCH₂CH₃ である、請求項 183 に記載の化合物。

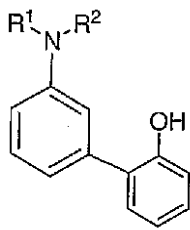
【請求項 185】

R^{3b} および R^{3c} がそれぞれ、-CON(R')₂ または -NRCOR' である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 186】

請求項 1 に記載の化合物であって、該化合物は式 I A - i :

【化 20】



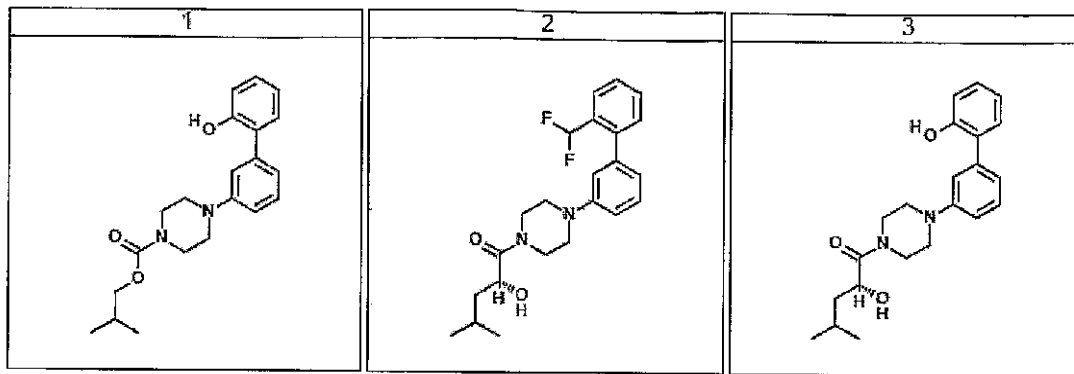
IA-i;

を有し、ここで、 R^1 および R^2 が、請求項 1 に定義される通りである、化合物。

【請求項 187】

請求項 1 に記載の化合物であって、該化合物は以下：

【化 21】



から選択される、化合物。

【請求項 188】

請求項 1 ~ 187 のいずれか一項に記載の化合物、およびその薬学的に受容可能なアジュバントまたはキャリアを含む、薬学的組成物。

【請求項 189】

急性痛、慢性痛、神経因性疼痛、もしくは炎症性疼痛、関節炎、偏頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全身神経痛、癲癇または癲癇の状態、神経変性障害、精神障害（例えば、不安またはうつ病）、筋硬直症、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、臓痛、変形性関節症、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性ニューロパチー、根性痛、坐骨神経痛、背部痛、頭部もしくは頸部痛、激痛もしくは難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突発疼痛（breakthrough pain）、術後痛、または癌性疼痛から選択される疾患、障害、または状態の重症度を処置あるいは緩和するための、請求項 188 に記載の薬学的組成物。

【請求項 190】

請求項 189 に記載の薬学的組成物であって、前記疾患、障害、または状態が、電位型ナトリウムチャネルの活性化または機能亢進に関連する、薬学的組成物。

【請求項 191】

請求項 190 に記載の薬学的組成物であって、前記疾患、障害、または状態が、急性痛、慢性痛、神経因性疼痛、もしくは炎症性疼痛である、薬学的組成物。

【請求項 192】

請求項 190 に記載の薬学的組成物であって、前記疾患、障害、または状態が、根性痛、坐骨神経痛、背部痛、頭部もしくは頸部痛である、薬学的組成物。

【請求項 193】

請求項 190 に記載の薬学的組成物であって、前記疾患、障害、または状態が、激痛もし

くは難治性疼痛、急性痛、術後痛、背部痛、または癌性疼痛である、薬学的組成物。

【請求項 194】

請求項 190 に記載の薬学的組成物であって、前記疾患が、大腿癌性疼痛、非悪性慢性骨痛；慢性関節リウマチ；変形性関節症；脊柱管狭窄；神経障害性腰痛；神経障害性腰痛；筋膜疼痛症候群；繊維筋痛症；側頭下顎関節疼痛；慢性内臓痛（腹部を含む）；脾臓；IBS 疼痛；慢性頭痛；偏頭痛；緊張性頭痛（群発性頭痛を含む）；慢性神経因性疼痛（帯状疱疹後神経痛を含む）；糖尿病性ニューロパチー；HIV 関連ニューロパチー；三叉神経痛；シャルコー・マリー・トゥスニューロパチー；遺伝性感覚ニューロパチー；末梢神経損傷；有痛神経腫；異所性近位および異所性遠位放電（discharge）；神経根障害；化学治療誘発神経因性疼痛；放射線治療誘発神経因性疼痛；乳房切除後疼痛；中枢痛；脊髄損傷痛；卒中後疼痛（post-stroke pain）；視床痛；複合性局所疼痛症候群；幻視痛；難治性疼痛；急性痛、急性術後痛；急性筋骨格系疼痛；関節痛；機械的（mechanical）腰痛；頸部痛；テノン嚢炎；損傷疼痛／運動疼痛；急性内臓痛（腹痛を含む）；腎盂腎炎；虫垂炎；胆嚢炎；腸閉塞；ヘルニアなど；胸部痛（心臓痛を含む）；骨盤痛；腎仙痛、急性分娩痛（分娩陣痛を含む）；帝王切開痛；急性炎症、熱傷痛、および外傷性疼痛、急性間欠痛（子宮内膜症を含む）；急性水泡带状疱疹性疼痛；鎌状赤血球貧血；急性脾炎；突発疼痛；口顔疼痛（orofacial pain）（静脈洞炎疼痛を含む）；歯痛；多発性硬化症（MS）疼痛；うつ病における疼痛；ハンセン病疼痛；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；痛む脚と動く足趾；ハグルンド症候群；肢端紅痛症疼痛；ファブリー病疼痛；膀胱疾患および尿性器疾患（尿失禁を含む）；活動亢進膀胱；有痛膀胱症候群；間質性膀胱炎（IC）；または前立腺炎から選択される、薬学的組成物。