

【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10月15日 (2009.10.15)

【公表番号】特表2009-507851 (P2009-507851A)

【公表日】平成21年2月26日 (2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-530198 (P2008-530198)

【国際特許分類】

C 07 D 277/20 (2006.01)

C 07 D 277/52 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 31/426 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 29/02 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 5/00 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 13/02 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 277/52 C S P

C 07 D 417/12

A 61 K 31/4709

A 61 K 31/426

A 61 K 31/427

A 61 P 25/04

A 61 P 29/00

A 61 P 29/02

A 61 P 19/02

A 61 P 25/06

A 61 P 25/08

A 61 P 25/28

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 21/00

A 61 P 9/06

A 61 P 25/14

A 6 1 P 5/00  
 A 6 1 P 1/00  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 13/02  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年8月28日(2009.8.28)

## 【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

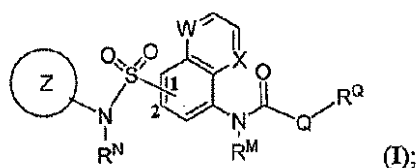
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、

式中、

XおよびWの1つはNもしくはCHであり、XおよびWのもう1つはCHであり；

環Zは、少なくとも1つのSを有する5員の不飽和もしくは芳香族環であるが、ここでZは、 $R^Z$ のzまでの存在で必要に応じて置換され；

zは、0～4であり；

各 $R^Z$ は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは $R^5$ から独立して選択され；

該 $SO_2$ 基は、第1もしくは第2のいずれかの炭素に結合され；

WおよびXを含む該環は、ハロ、CN、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OR^6$ 、 $SR^6$ 、 $NH_2$ 、 $N(R^2)_2$ 、 $COOR^2$ 、もしくはC1-C6直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖から選択される4つまでの置換基で必要に応じて置換され、ここで該アルキリジンの2つまでの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して $-CO-$ 、 $-CONR^2$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR^2CO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-OCONR^2$ 、 $-NR^2CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-SO_2NR^2-$ 、もしくは $NR^2SO_2-$ で置換され；

Qは結合であるか、またはC1-C6直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖であるが、ここでQの2つまでの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して $-CO-$ 、 $-CONR^2$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR^2CO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-OCONR^2$ 、 $-NR^2CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-SO_2NR^2-$ 、 $NR^2SO_2-$ 、またはスピロシクロアルキレン成分で置換され；

$R^Q$ は、O、S、N、もしくはNH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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和単環式環、またはO、S、N、もしくはNH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、部分不飽和、もしくは完全不飽和二環式環系であり；

ここで $R^Q$ は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは $R^5$ から選択された4つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$R^M$ および $R^N$ は、独立して $R^2$ であり；

$R^1$  は、オキソ、もしくは  $(CH_2)_n - Y$  であり；

$n$  は、0、1、もしくは2であり；

$Y$  は、ハロ、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OH$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^6$ 、 $N(R^6)_2$ 、 $NR^6R^8$ 、 $COOH$ 、 $COOR^6$ 、もしくは  $OR^6$  であるか；または

隣接環原子上の2つの  $R^1$  は、一緒に、1, 2 - メチレンジオキシもしくは1, 2 - エチレンジオキシを形成し；

$R^2$  は、水素もしくはC1 - C6 脂肪族であり；

$R^3$  は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$ 、もしくは  $R^5$  から独立して選択される3つまでの置換基で必要に応じて置換されるC3 - C8 脂環式、C6 - C10 アリール、C3 - C8 複素環式、もしくはC5 - C10 ヘテロアリール環であり；

$R^4$  は、 $OR^5$ 、 $OR^6$ 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)R^6$ 、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、または  $C(O)N(R^5R^6)$  であり；

$R^5$  は、3つまでの  $R^1$  置換基で必要に応じて置換されるC3 - C8 脂環式、C6 - C10 アリール、C3 - C8 複素環式、もしくはC5 - C10 ヘテロアリール環であり；

$R^6$  は、HもしくはC1 - C6 脂肪族であり；そして

$R^8$  は、アセチル、C6 - C10 アリールスルホニル、もしくはC1 - C6 アルキルスルホニルである；

ただし、 $W$  がCHであり、 $X$  がCHである場合は、一緒にになった  $Q - R^Q$  はメチルではないことを前提とする、化合物。

【請求項2】

Z は：

【化2】



a-i,



a-ii,



a-iii,

【化3】



a-xi,



a-xii,



a-xiii,



a-xix,



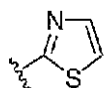
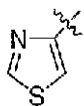
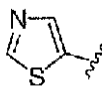
または a-xx,

から選択される必要に応じて置換された環である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Z は：

## 【化 4】

**a-i-a,****a-i-b,** または**a-i-c.**

から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

X は N であり、W は C H である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

X は C H であり、W は N である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

各 X および W は独立して C H である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

Q は、結合、または C 1 - C 6 直鎖状もしくは分枝状アルキリデン鎖から選択され、ここで該アルキリデンの 2 つまでのメチレン単位は、O、S、OCO、NH、N (C 1 - C 4 アルキル)、またはスピロシクロアルキレン基で独立して置換される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

Q は、 $-X_2-(X_1)_p-$  であり：

式中、

$X_2$  は、結合、または C 1 - C 6 脂肪族であり；

p は 0 もしくは 1 であり；そして

$X_1$  は、O、S、もしくは  $NR^2$  である、請求項 7 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$X_2$  は、結合、C 1 - C 6 アルキル、もしくは C 2 - C 6 アルキリデンであり、該アルキルおよびアルキリデンは  $R^1$  または  $R^4$  で独立してかつ必要に応じて置換される、請求項 8 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

$X_2$  は、結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-C(Me)_2-$ 、 $-CH(Me)-$ 、 $-C(Me)=CH-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH(Ph)-$ 、 $-CH_2-CH(Me)-$ 、 $-CH(Et)-$ 、もしくは  $-CH(i-Pr)-$  から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

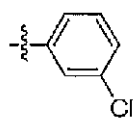
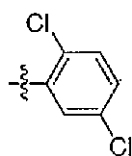
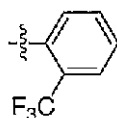
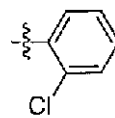
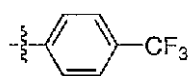
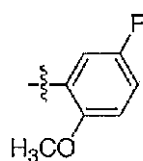
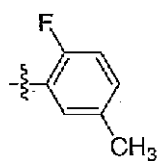
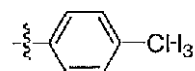
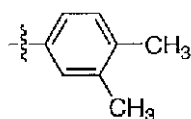
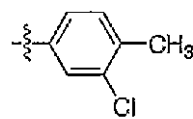
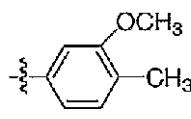
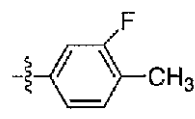
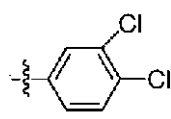
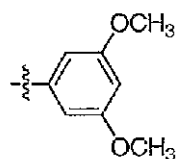
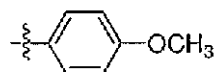
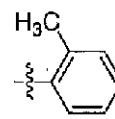
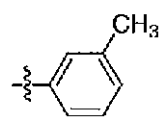
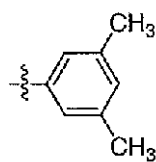
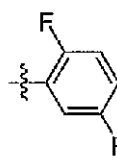
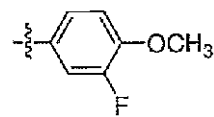
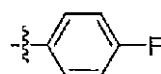
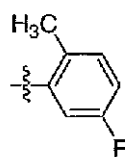
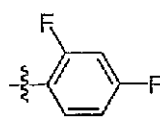
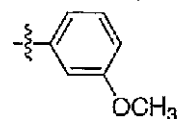
## 【請求項 11】

$R^Q$  は、必要に応じて置換されたフェニルもしくはナフチルである、請求項 1 に記載の化合物。

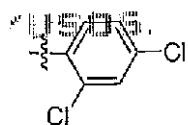
## 【請求項 12】

$R^Q$  は：

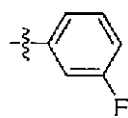
## 【化 5】

**xlix,****l,****li,****lii,****liii,****liv,****lv,****lvi,****lvii,****lviii,****lvix,****lx,****lxi,****lxii,****lxiii,****lxiv,****lxv,****lxvi,****lxvii,****lxviii,****lxix,****lxx,****lxxi,****lxxii,**

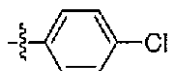
## 【化 6】



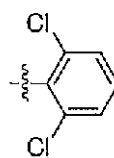
lxxiii



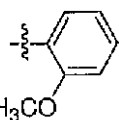
lxxiv,



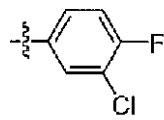
lxxv,



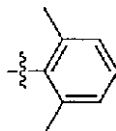
lxxvi,



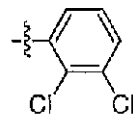
lxxvii,



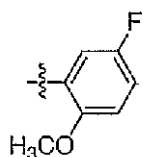
lxxviii,



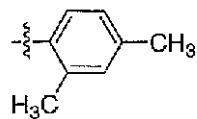
lxxix,



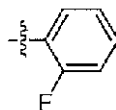
lxxx,



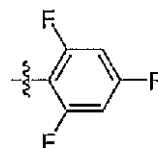
lxxxi,



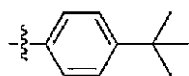
lxxxii,



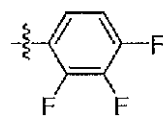
lxxxiii



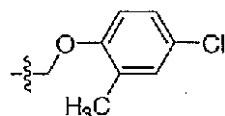
lxxxiv,



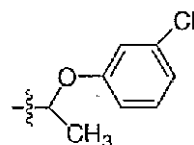
lxxxv



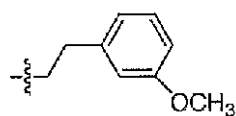
lxxxvi,



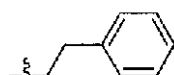
lxxxvii,



lxxxviii,



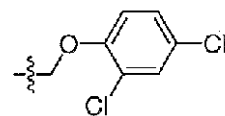
lxxxix,



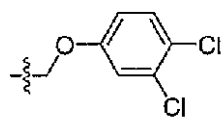
xc,



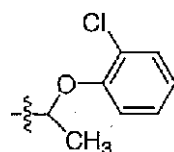
xci,



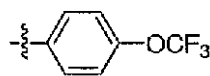
xcii,



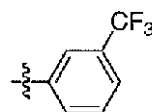
xciii,



xciv,



xcv,



または xcvi.

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

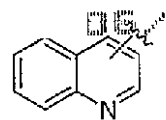
## 【請求項 1 3】

R<sup>Q</sup> は、必要に応じて置換された 8 ~ 10 員の二環式環、複素環式環もしくはヘテロ芳香族環である、請求項 1 に記載の化合物。

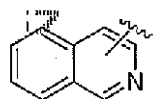
## 【請求項 1 4】

R<sup>Q</sup> は：

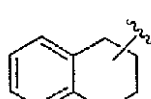
## 【化 8】



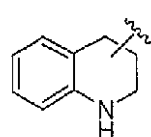
xxv,



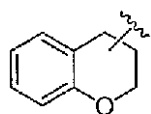
xxvi,



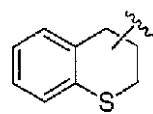
xxvii,



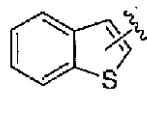
xxviii,



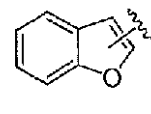
xxix,



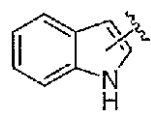
xxx,



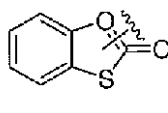
xxxi,



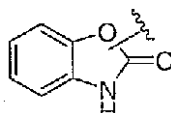
xxxii,



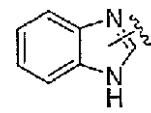
xxxiii,



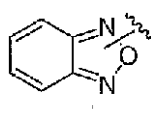
xxxiv,



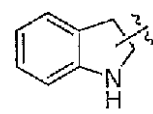
xxxv,



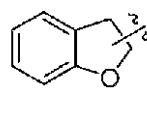
xxxvi,



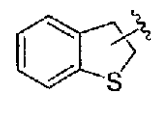
xxxvii,



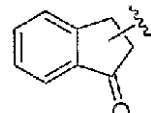
xxxviii,



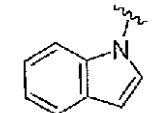
xxxix,



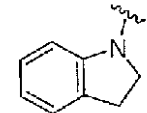
xl,



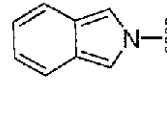
xli,



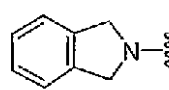
xlii,



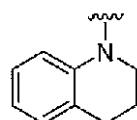
xliii,



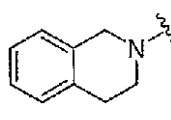
xliv,



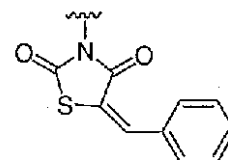
xlv,



xlvii,



xlviii,



または xlviii.

から選択される必要に応じて置換された環である、請求項 1 に記載の化合物。

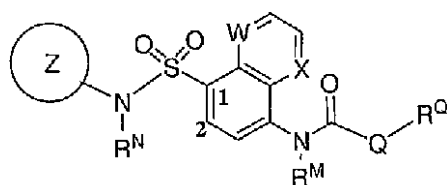
## 【請求項 15】

R<sup>Q</sup> は、2 - フルオロ - フェン - 1 - イル、フェニル、3 - クロロ - フェン - 1 - イル、4 - クロロ - フェン - 1 - イル、4 - tert - ブチル - フェン - 1 - イル、2, 5 - ジフルオロ - フェン - 1 - イル、3, 4 - ジクロロ - フェン - 1 - イル、3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェン - 1 - イル、もしくはインドール - 1 - イルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

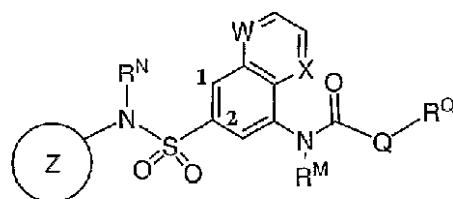
## 【請求項 16】

前記化合物は、式 I - A、または式 I - B :

## 【化 9】



I-A,



または I-B,

から選択され、

式中、Z、 $R^M$ 、 $R^N$ 、W、X、Q、および $R^Q$ は、上記に規定されたとおりである、請求項1に記載の化合物。

【請求項17】

XはNであり、WはCHである、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

XはCHであり、WはNである、請求項16に記載の化合物。

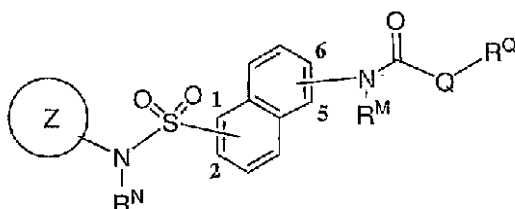
【請求項19】

各XおよびWは独立してCHである、請求項16に記載の化合物。

【請求項20】

式II：

【化10】



II;

の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、  
式中、

環Zは、少なくとも1つのSを有する5員の不飽和環もしくは芳香族環であるが、ここでZは、 $R^Z$ のzまでの存在で必要に応じて置換され；

zは、0～4であり；

各 $R^Z$ は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは $R^5$ から独立して選択され；

該 $SO_2$ 基は、第1もしくは第2のいずれかの炭素に結合され；

$NR^M C(O)$ 基は、第5もしくは第6のいずれかの炭素に結合され；

第5および第6の炭素を含む環は、八員、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、 $OR^6$ 、 $SR^6$ 、 $NH_2$ 、 $N(R^2)_2$ 、 $COOR^2$ 、もしくはC1-C6直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖から選択される4つまでの置換基で必要に応じて置換され、ここで該アルキリジンの2つまでの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して $-CO-$ 、 $-CONR^2-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR^2CO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-OCONR^2-$ 、 $-NR^2CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-SO_2NR^2-$ 、または $NR^2SO_2$ で置換され；

Qは結合であるか、またはC1-C6直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖であるが、ここでQの2つまでの非隣接メチレン単位は、任意かつ独立して $-CO-$ 、 $-CONR^2-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR^2CO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-OCONR^2-$ 、 $-NR^2CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-SO_2NR^2-$ 、 $NR^2SO_2-$ 、またはスピロシクロアルキレン成分で置換され；

$R^Q$ は、O、S、N、もしくはNH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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和単環式環、またはO、S、N、もしくはNH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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和二環式環系であり；

ここで $R^Q$ は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは $R^5$ から選択された4つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$R^M$ および $R^N$ は、独立して $R^2$ であり；

$R^1$ は、オキソ、もしくは $(CH_2)_n-Y$ であり；

nは、0、1、もしくは2であり；



Y は、ハロ、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、NH<sub>2</sub>、NHR<sup>6</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>、COOH、COOR<sup>6</sup>、もしくはOR<sup>6</sup>であるか；または

隣接環原子上の2つのR<sup>1</sup>は、一緒に、1,2-メチレンジオキシもしくは1,2-エチレンジオキシを形成し；

R<sup>2</sup>は、水素もしくはC1-C6脂肪族であり；

R<sup>3</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、もしくはR<sup>5</sup>から独立して選択される3つまでの置換基で必要に応じて置換されるC3-C8脂環式環、C6-C10アリール環、C3-C8複素環式環、もしくはC5-C10ヘテロアリール環であり；

R<sup>4</sup>は、OR<sup>5</sup>、OR<sup>6</sup>、C(O)R<sup>5</sup>、C(O)OR<sup>5</sup>、C(O)R<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、またはC(O)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)であり；

R<sup>5</sup>は、3つまでのR<sup>1</sup>置換基で必要に応じて置換されるC3-C8脂環式環、C6-C10アリール環、C3-C8複素環式環、もしくはC5-C10ヘテロアリール環であり；

R<sup>6</sup>は、HもしくはC1-C6脂肪族であり；そして

R<sup>8</sup>は、アセチル、C6-C10アリールスルホニル、もしくはC1-C6アルキルスルホニルである；

ただし、一緒になったQ-R<sup>Q</sup>は、メチルもしくはイソプロピルではないことを前提とする、化合物。

【請求項21】

Zは：

【化11-1】



a-i,



a-ii,



a-iii,



a-xi,



a-xii,



a-xiii,

【化11-2】



a-xix,



a-xx,

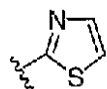
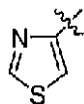
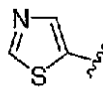
または

から選択される必要に応じて置換された環である、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

Zは：

## 【化 1 2】

**a-i-a,****a-i-b,** または**a-i-c.**

から選択される、請求項 2 0 に記載の化合物。

## 【請求項 2 3】

Q は、結合、または C 1 - C 6 直鎖状もしくは分枝状アルキリデン鎖から選択され、ここで該アルキリデンの 2 つまでのメチレン単位は、O、S、OCO、NH、N (C 1 - C 4 アルキル)、またはスピロシクロアルキレン基で独立して置換される、請求項 2 0 に記載の化合物。

## 【請求項 2 4】

Q は - X<sub>2</sub> - (X<sub>1</sub>)<sub>p</sub> - であって、式中、

X<sub>2</sub> は、結合、または C 1 - C 6 脂肪族であり；

p は 0 もしくは 1 であり；そして

X<sub>1</sub> は、O、S、もしくは NR<sup>2</sup> である、請求項 2 0 に記載の化合物。

## 【請求項 2 5】

X<sub>2</sub> は、結合、C 1 - C 6 アルキル、もしくは C 2 - C 6 アルキリデンであり、該アルキルおよびアルキリデンは R<sup>1</sup> または R<sup>4</sup> で独立してかつ必要に応じて置換される、請求項 2 4 に記載の化合物。

## 【請求項 2 6】

X<sub>2</sub> は、結合、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-C(Me)<sub>2</sub>-、-CH(Me)-、-C(Me)=CH-、-CH=CH-、-CH(Ph)-、-CH<sub>2</sub>-CH(Me)-、-CH(Et)-、もしくは -CH(i-Pr)- から選択される、請求項 2 5 に記載の化合物。

## 【請求項 2 7】

R<sup>Q</sup> は、必要に応じて置換されたフェニルもしくはナフチルである、請求項 2 0 に記載の化合物。

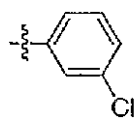
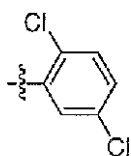
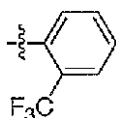
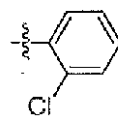
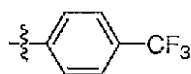
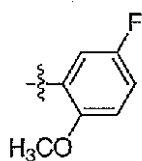
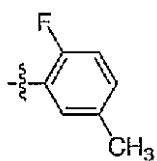
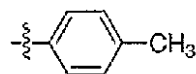
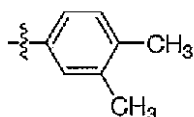
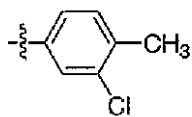
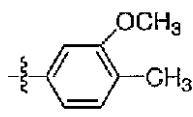
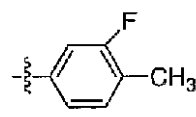
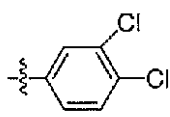
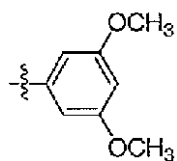
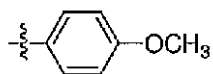
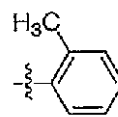
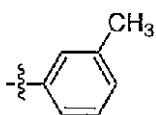
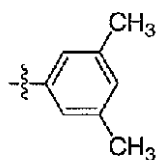
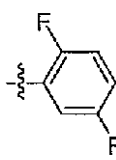
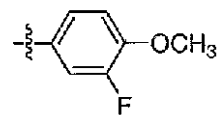
## 【請求項 2 8】

R<sup>Q</sup> は、ハロ、シアノ、トリフルオロメチル、OH、C 1 - C 4 アルキル、C 2 - C 4 アルケニル、C 1 - C 4 アルコキシ、トリフルオロメトキシ、C(O)NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル)、N(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル)<sub>2</sub>、NHC(O)C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル、もしくは C(O)C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキルから独立して選択される 3 つまでの置換基で必要に応じて置換される、請求項 2 6 に記載の化合物。

## 【請求項 2 9】

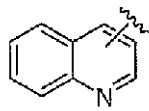
R<sup>Q</sup> は：

## 【化 1 3】

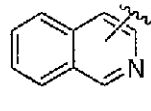
**xlix,****l,****li,****lii,****liii,****liv,****lv,****lvi,****lvii,****lviii,****lvix,****lx,****lxi,****lxii,****lxiii,****lxiv,****lxv,****lxvi,****lxvii,****lxviii,**



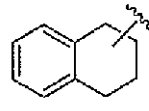
## 【化 1 6】



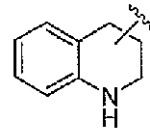
xxv,



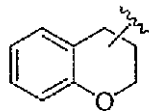
xxvi,



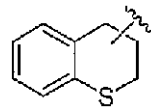
xxvii,



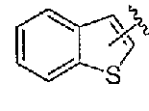
xxviii,



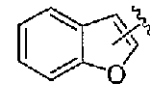
xxix,



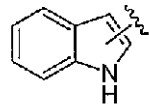
xxx,



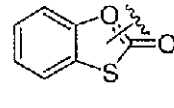
xxxi,



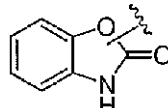
xxxii,



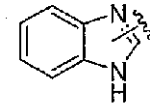
xxxiii,



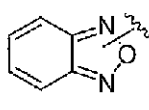
xxxiv,



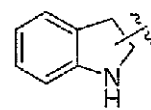
xxxv,



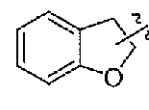
xxxvi,



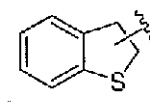
xxxvii,



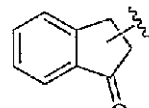
xxxviii,



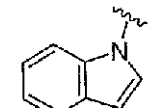
xxxix,



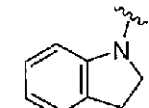
xl,



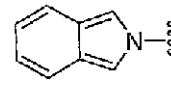
xli,



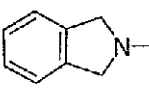
xlii,



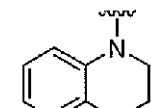
xliii,



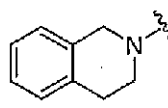
xliv,



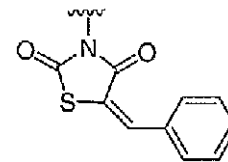
xlv,



xlvii,



xlviii,



または xlviii.

から選択される必要に応じて置換された環である、請求項 30 に記載の化合物。

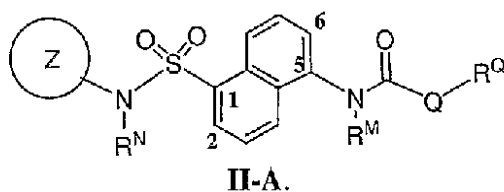
## 【請求項 3 2】

R<sup>Q</sup> は、2 - フルオロ - フェン - 1 - イル、フェニル、3 - クロロ - フェン - 1 - イル、4 - クロロ - フェン - 1 - イル、4 - tert - ブチル - フェン - 1 - イル、2, 5 - ジフルオロ - フェン - 1 - イル、3, 4 - ジクロロ - フェン - 1 - イル、3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェン - 1 - イル、もしくはインドール - 1 - イルから選択される、請求項 20 に記載の化合物。

## 【請求項 3 3】

前記化合物は、式 II - A :

## 【化 1 7】



を有し、

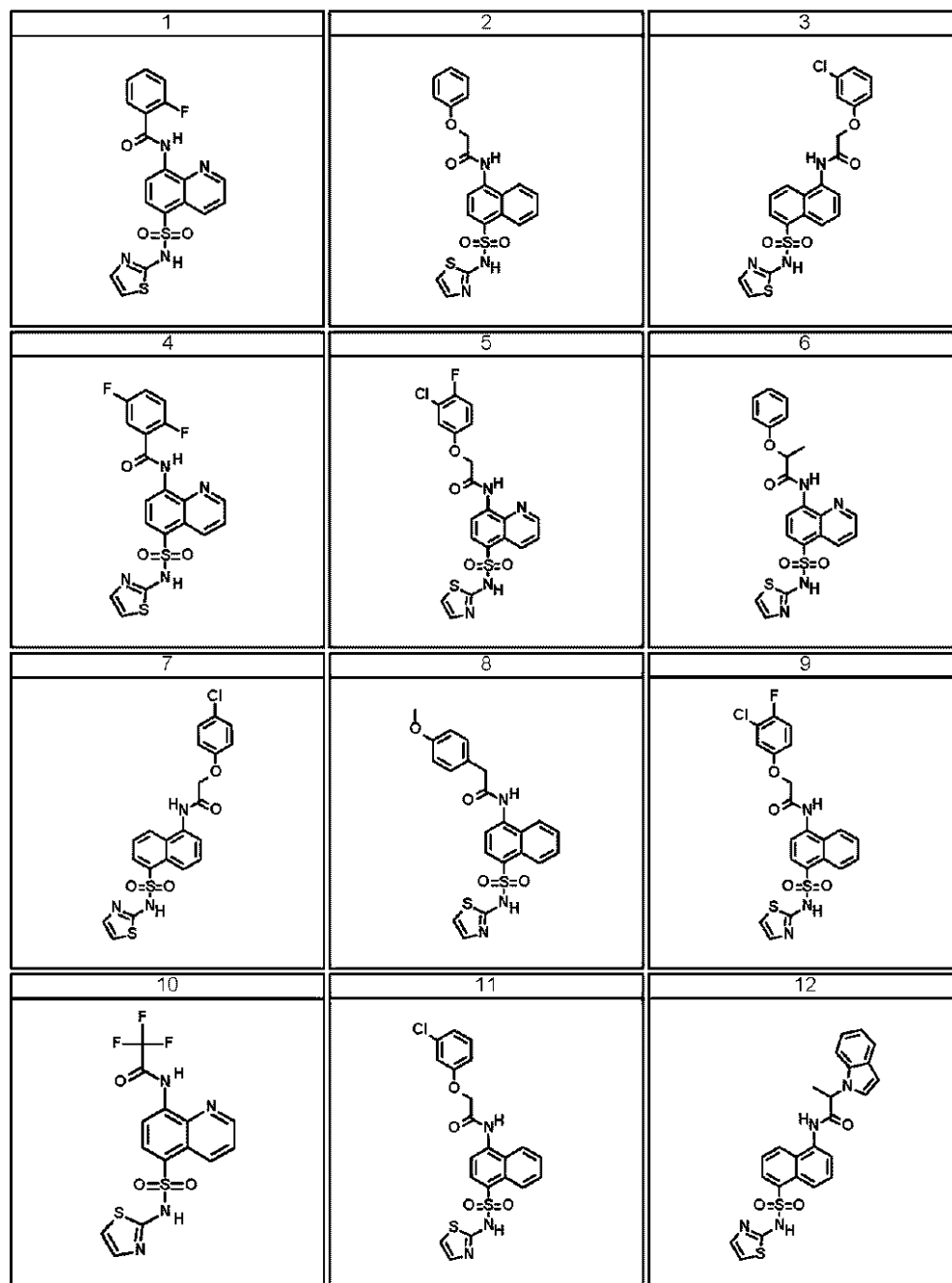
式中、Z、R<sup>M</sup>、R<sup>N</sup>、Q、および R<sup>Q</sup> は、上記に規定されたとおりである、請求項 20

に記載の化合物。

【請求項 3 4】

以下

【化 1 7 - 1】



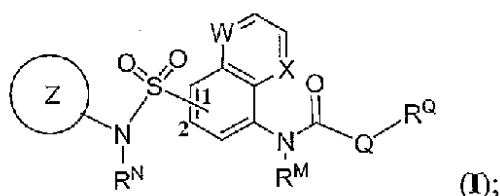
<p>13</p>	<p>14</p>	<p>15</p>
<p>16</p>	<p>17</p>	<p>18</p>

【請求項 35】

【請求項 36】

( b ) 生物学的サンプル ;

【化 1 8】



X および W の 1 つは N もしくは C H であり、X および W のもう 1 つは C H であり；

z は、0 ~ 4 であり；

各  $R^Z$  は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは  $R^5$  から独立して選択され；

該SO<sub>2</sub>基は、第1もしくは第2のいずれかの炭素に結合され；

W および X を含む環は、ハロ、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OR<sup>6</sup>、SR<sup>6</sup>、S(O)R<sup>2</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>、NH<sub>2</sub>、N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>、COOR<sup>2</sup>、もしくはC1 - C6直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖から選択される4つまでの置換基で必要に応じて置換され、ここで該アルキリジンの2つまでの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立し

て -CO-、-CS-、-COCO-、-CONR<sup>2</sup>-、-CONR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-NR<sup>2</sup>CO<sub>2</sub>-、-O-、-NR<sup>2</sup>CONR<sup>2</sup>-、-OCONR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>CO-、-NR<sup>2</sup>CO-、-S-、-SO、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>2</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>-、NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>-、もしくは -NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>- で置換され；

Qは結合であるか、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖であるが、ここでQの2つまでの非隣接メチレン単位は、必要に応じてかつ独立して-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR<sup>2</sup>-、-CONR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-NR<sup>2</sup>CO<sub>2</sub>-、-O-、-NR<sup>2</sup>CONR<sup>2</sup>-、-OCONR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>CO-、-NR<sup>2</sup>CO-、-S-、-SO、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>2</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>-、NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>-、またはスピロシクロアルキレン成分で置換され；

R<sup>Q</sup>は、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>脂肪族基、O、S、N、もしくはNH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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和単環式環、またはO、S、N、もしくはNH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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和二環式環系であり；

ここでR<sup>Q</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、もしくはR<sup>5</sup>から選択された4つまでの置換基で必要に応じて置換され；

R<sup>M</sup>およびR<sup>N</sup>は、独立してR<sup>2</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、オキソ、=NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、=NN(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、=NN(R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)、R<sup>6</sup>、もしくは(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Yであり；

nは、0、1、もしくは2であり；

Yは、ハロ、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、SR<sup>6</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NH<sub>2</sub>、NHR<sup>6</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>、COOH、COOR<sup>6</sup>、もしくはOR<sup>6</sup>であるか；または

隣接環原子上の2つのR<sup>1</sup>は、一緒になって、1,2-メチレンジオキシもしくは1,2-エチレンジオキシを形成し；

R<sup>2</sup>は、水素もしくはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>脂肪族であるが、ここで各R<sup>2</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、もしくはR<sup>5</sup>から独立して選択される2つまでの置換基で必要に応じて置換され；

R<sup>3</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、もしくはR<sup>5</sup>から独立して選択される3つまでの置換基で必要に応じて置換されるC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>脂環式環、C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>アリール環、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>複素環式環、もしくはC<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>ヘテロアリール環であり；

R<sup>4</sup>は、OR<sup>5</sup>、OR<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>5</sup>、OC(O)OR<sup>6</sup>、OC(O)OR<sup>5</sup>、OC(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>6</sup>R<sup>5</sup>)、OP(O)(OR<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>6</sup>)(OR<sup>5</sup>)、SR<sup>6</sup>、SR<sup>5</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、S(O)R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>5</sup>、C(O)R<sup>5</sup>、C(O)OR<sup>5</sup>、C(O)R<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R



$^5R^6$ )、 $P(O)(OR^5)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)_2$ 、もしくは $P(O)(OR^6)(OR^5)$ である；

$R^5$ は、3つまでの $R^1$ 置換基で必要に応じて置換されたC3 - C8脂環式環、C6 - C10アリール環、C3 - C8複素環式環、もしくはC5 - C10ヘテロアリール環であり；

$R^6$ は、HもしくはC1 - C6脂肪族であるが、ここで $R^6$ は $R^7$ 置換基で必要に応じて置換され；

$R^7$ は、C3 - C8脂環式環、C6 - C10アリール環、C3 - C8複素環式環、C5 - C10ヘテロアリール環であり、各 $R^7$ は、H、C1 - C6脂肪族、もしくは $(CH_2)_m - Z'$ （式中、 $m$ は0～2である）から独立して選択される2つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$Z'$ は、ハロ、CN、 $NO_2$ 、 $C(ハロ)_3$ 、 $CH(ハロ)_2$ 、 $CH_2(ハロ)$ 、 $-OC(ハロ)_3$ 、 $-OCH(ハロ)_2$ 、 $-OCH_2(ハロ)$ 、OH、S - (C1 - C6)脂肪族、 $S(O) - (C1 - C6)$ 脂肪族、 $SO_2 - (C1 - C6)$ 脂肪族、 $NH_2$ 、 $NH - (C1 - C6)$ 脂肪族、 $N((C1 - C6)脂肪族)_2$ 、 $N((C1 - C6)脂肪族)R^8$ 、 $COOH$ 、 $C(O)O - (C1 - C6)脂肪族$ 、もしくは $O - (C1 - C6)脂肪族$ から選択され；そして

$R^8$ は、アセチル、C6 - C10アリールスルホニル、もしくはC1 - C6アルキルスルホニルであり、

該組成物は、該患者に投与されるか、または該生物学的サンプルと接触されることを特徴とする、組成物。

#### 【請求項37】

前記化合物は、請求項16に記載の式I - A、または請求項16に記載の式I - Bを有する、請求項36に記載の組成物。

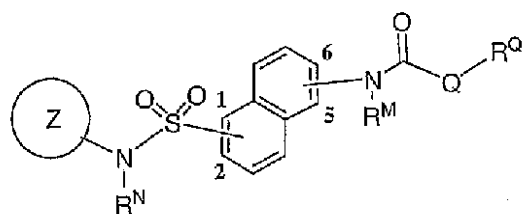
#### 【請求項38】

(a) 患者；または

(b) 生物学的サンプル；

において1つ以上のNaV1.1、NaV1.2、NaV1.3、NaV1.4、NaV1.5、NaV1.6、NaV1.7、NaV1.8、NaV1.9、もしくはCaV2.2活性を阻害するための組成物であって、式II：

#### 【化19】



### II;

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩を含み、  
式中、

環Zは、O、S、N、もしくはNHから選択された少なくとも1つの環状ヘテロ原子を有する5～7員の不飽和環もしくは芳香族環であるが、ここでZは、 $R^Z$ のzまでの存在で必要に応じて置換され；

zは、0～4であり；

各 $R^Z$ は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、もしくは $R^5$ から独立して選択され；

該 $SO_2$ 基は、第1もしくは第2のいずれかの炭素に結合され；

$NR^2C(O)$ 基は、第5もしくは第6のいずれかの炭素に結合され；

第5および第6の炭素を含有する環は、八口、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OR}^6$ 、 $\text{SR}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^2$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{N}(\text{R}^2)_2$ 、 $\text{COOR}^2$ 、もしくは $\text{C}1 - \text{C}6$ 直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖から選択された4つまでの置換基で必要に応じて置換され、ここで該アルキリジンの2つまでの非隣接メチレン単位は、任意かつ独立して $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{COCO}-$ 、 $-\text{CONR}^2-$ 、 $-\text{CONR}^2\text{NR}^2-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CO}_2-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CONR}^2-$ 、 $-\text{OCONR}^2-$ 、 $-\text{NR}^2\text{NR}^2-$ 、 $-\text{NR}^2\text{NR}^2\text{CO}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^2-$ 、 $\text{NR}^2\text{SO}_2-$ 、もしくは $-\text{NR}^2\text{SO}_2\text{NR}^2-$ で置換され；

Qは結合であるか、または $\text{C}1 - \text{C}6$ 直鎖状もしくは分枝状アルキリジン鎖であるが、ここでQの2つまでの非隣接メチレン単位は、任意かつ独立して $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{COCO}-$ 、 $-\text{CONR}^2-$ 、 $-\text{CONR}^2\text{NR}^2-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OCO}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CO}_2-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CONR}^2-$ 、 $-\text{OCONR}^2-$ 、 $-\text{NR}^2\text{NR}^2-$ 、 $-\text{NR}^2\text{NR}^2\text{CO}-$ 、 $-\text{NR}^2\text{CO}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^2-$ 、 $\text{NR}^2\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^2\text{SO}_2\text{NR}^2-$ 、またはスピロシクロアルキレン成分で置換され；

$\text{R}^Q$ は、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ 脂肪族基、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{N}$ 、もしくは $\text{NH}$ 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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和単環式環、または $\text{O}$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{N}$ 、もしくは $\text{NH}$ 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員の飽和環、部分不飽和環、もしくは完全不飽和二環式環系である；

ここで $\text{R}^Q$ は、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、もしくは $\text{R}^5$ から選択される4つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$\text{R}^M$ および $\text{R}^N$ は、独立して $\text{R}^2$ であり；

$\text{R}^1$ は、オキソ、 $=\text{NN}(\text{R}^6)_2$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^7)_2$ 、 $=\text{NN}(\text{R}^6\text{R}^7)$ 、 $\text{R}^6$ 、もしくは $(\text{CH}_2)_n - \text{Y}$ であり；

$n$ は、0、1、もしくは2であり；

$\text{Y}$ は、八口、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OH}$ 、 $\text{SR}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NHR}^6$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{R}^8$ 、 $\text{COOH}$ 、 $\text{COOR}^6$ 、もしくは $\text{OR}^6$ であるか；または

隣接環原子上の2つの $\text{R}^1$ は、一緒に、1,2-メチレンジオキシもしくは1,2-エチレンジオキシを形成し；

$\text{R}^2$ は、水素もしくは $\text{C}1 - \text{C}6$ 脂肪族であるが、ここで各 $\text{R}^2$ は、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^4$ 、もしくは $\text{R}^5$ から独立して選択される2つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$\text{R}^3$ は、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^4$ 、もしくは $\text{R}^5$ から独立して選択される3つまでの置換基で必要に応じて置換される $\text{C}3 - \text{C}8$ 脂環式環、 $\text{C}6 - \text{C}10$ アリール環、 $\text{C}3 - \text{C}8$ 複素環式環、もしくは $\text{C}5 - \text{C}10$ ヘテロアリール環である；

$\text{R}^4$ は、 $\text{OR}^5$ 、 $\text{OR}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6\text{R}^5)$ 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^6)_2$ 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^5)_2$ 、 $\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^6)(\text{OR}^5)$ 、 $\text{SR}^6$ 、 $\text{SR}^5$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{SO}_3\text{R}^6$ 、 $\text{SO}_3\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{NOR}^6)\text{R}^5$ 、 $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{NOR}^5)\text{R}^5$ 、 $\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{R}^5$ 、

$\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^6$ 、 $\text{N}(\text{OR}^6)\text{R}^5$ 、 $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^5$ 、 $\text{N}(\text{OR}^5)\text{R}^6$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^6)\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^6)\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^6)\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)\text{N}(\text{R}^6)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)\text{N}(\text{R}^5)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^6)_2$ 、 $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^5)_2$ 、もしくは $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^6)(\text{OR}^5)$ であり；

$\text{R}^5$  は、3つまでの $\text{R}^1$ 置換基で必要に応じて置換されたC3 - C8脂環式環、C6 - C10アリール環、C3 - C8複素環式環、もしくはC5 - C10ヘテロアリール環であり；

$\text{R}^6$  は、HもしくはC1 - C6脂肪族であるが、ここで $\text{R}^6$ は $\text{R}^7$ 置換基で必要に応じて置換され；

$\text{R}^7$  は、C3 - C8脂環式環、C6 - C10アリール環、C3 - C8複素環式環、C5 - C10ヘテロアリール環であり、各 $\text{R}^7$ は、H、C1 - C6脂肪族、もしくは $(\text{CH}_2)_m - \text{Z}'$ （式中、 $m$ は0～2である）から独立して選択される2つまでの置換基で必要に応じて置換され；

$\text{Z}'$  は、ハロ、CN、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{C}(\text{ハロ})_3$ 、 $\text{CH}(\text{ハロ})_2$ 、 $\text{CH}_2(\text{ハロ})$ 、 $-\text{OC}(\text{ハロ})_3$ 、 $-\text{OCH}(\text{ハロ})_2$ 、 $-\text{OCH}_2(\text{ハロ})$ 、OH、S - (C1 - C6)脂肪族、 $\text{S}(\text{O}) - (\text{C1} - \text{C6})$ 脂肪族、 $\text{SO}_2 - (\text{C1} - \text{C6})$ 脂肪族、 $\text{NH}_2$ 、NH - (C1 - C6)脂肪族、 $\text{N}((\text{C1} - \text{C6})\text{脂肪族})_2$ 、 $\text{N}((\text{C1} - \text{C6})\text{脂肪族})\text{R}^8$ 、 $\text{COOH}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O} - (\text{C1} - \text{C6})\text{脂肪族}$ 、もしくはO - (C1 - C6)脂肪族から選択され；そして

$\text{R}^8$  は、アセチル、C6 - C10アリールスルホニル、もしくはC1 - C6アルキルスルホニルであり、

該組成物は、該患者に投与されるか、または該生物学的サンプルと接触されることを特徴とする、組成物。

#### 【請求項39】

前記化合物は、請求項33に記載の式II - Aを有する、請求項38に記載の組成物。

#### 【請求項40】

急性、慢性、神経因性、もしくは炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、ヘルペス性神経痛、全身性神経痛、てんかんもしくはてんかん状態、神経変性障害、例えば不安および抑うつなどの精神疾患、筋緊張症、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調症、多発性硬化症、過敏性腸症候群、尿失禁、内臓痛、骨関節症性疼痛、ヘルペス後神経痛、糖尿病性ニューロパシー、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛もしくは頸痛、重度もしくは難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突発痛、術後疼痛、脳卒中、双極性障害または癌性疼痛から選択される疾患、障害、もしくは状態を処置するための組成物、またはそれらの重症度を緩和するための組成物であって、請求項1に記載の式I、請求項16に記載の式I - A、請求項16に記載の式I - B、請求項20に記載の式II、請求項33に記載の式II - Aの化合物、または請求項35に記載の組成物を含む、組成物。

#### 【請求項41】

前記化合物は、請求項1、20および34のいずれか一項に記載されているものである、請求項40に記載の組成物。

#### 【請求項42】

前記疾患、状態、もしくは障害は、電位型ナトリウムチャネルの活性化または活動亢進に関係する、請求項40に記載の組成物。

#### 【請求項43】

前記疾患、状態、もしくは障害は、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛、頸痛、またはニューロパシーである、請求項42に記載の組成物。

#### 【請求項44】

前記疾患、状態、もしくは障害は、重度もしくは難治性の痛み、急性疼痛、術後疼痛、背

痛、または癌性疼痛である、請求項 4 2 に記載の組成物。

【請求項 4 5】

前記疾患、状態、もしくは障害は、電位型カルシウムチャネルの活性化または活動亢進に係する、請求項 4 0 に記載の組成物。

【請求項 4 6】

前記疾患、状態、もしくは障害は、急性、慢性、神経因性、炎症性疼痛、または炎症性突発痛である、請求項 4 5 に記載の組成物。