

【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22年7月15日(2010.7.15)

【公表番号】特表2009-539988(P2009-539988A)

【公表日】平成21年11月19日(2009.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-046

【出願番号】特願2009-515453(P2009-515453)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 41/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

C 0 7 D 495/14 C S P D

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/02 1 0 1

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 21/02  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 9/06  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 13/00  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 25/02 1 0 3  
 A 6 1 P 3/12  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 1/06  
 A 6 1 P 1/18  
 A 6 1 P 41/00  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 17/02  
 A 6 1 P 13/10

## 【手続補正書】

【提出日】平成22年5月27日(2010.5.27)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0026

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0026】

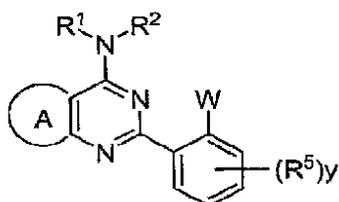
これらの化合物及び製薬学的に許容し得る組成物は、種々様々な疾患、障害又は状態、例えば、以下に限定されないが、急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全身神経痛、てんかん又はてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例えば不安及び鬱病、筋緊張症、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調症、多発性硬化症、過敏性腸症候群、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛、激痛又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛、あるいは癌性疼痛を治療又はそれらの重症度を軽減するのに有用である。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

式I:

【化124】



I

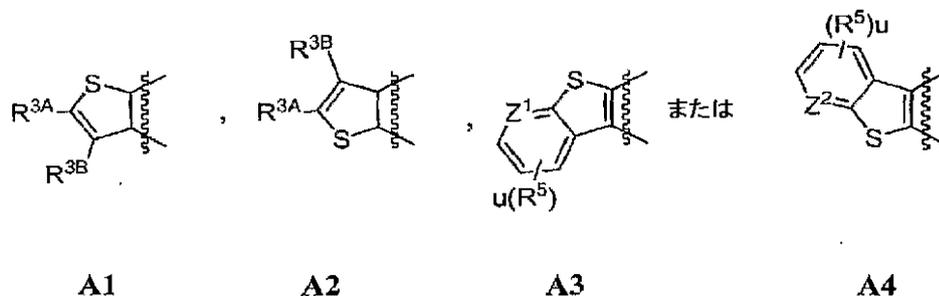
[式中:]

Wは、ハロゲン、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>Fであり、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される0~3個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい3~8員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>と一緒に形成する環は、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z個の独立して存在する-R<sup>4</sup>で場合により及び独立して置換されていてもよく、zは0~5であり；

環Aは、

【化125】



であり；

yは0~4であり；

uは0~3であり；

Z<sup>1</sup>及びZ<sup>2</sup>は、独立してN又はC-R<sup>5</sup>であり；

それぞれ存在するR<sup>3A</sup>、R<sup>3B</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、独立してQ-R<sup>x</sup>であり；ここで、Qは、結合であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であってQの最大2個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-C(=N-CN)、-NRCO-、-NRCO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR-、-NRSO<sub>2</sub>-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO<sub>2</sub>NR-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-PO-、-PO<sub>2</sub>-、-OP(O)(OR)-又は-POR-で置換されていてもよく；及びそれぞれ存在するR<sup>x</sup>は、独立して、-R'、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>又は-OPO(R')<sub>2</sub>から選択され；

それぞれ存在するRは、独立して、水素であるか又は0~5個の存在するR<sup>y</sup>で場合により置換されていてもよいC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>脂肪族基であり；及びそれぞれ存在するR<sup>y</sup>は、独立して、-R<sup>v</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>v</sup>、-SR<sup>v</sup>、-N(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>v</sup>COR<sup>v</sup>、-NR<sup>v</sup>CON(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>v</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-COR<sup>v</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-OCOR<sup>v</sup>、-CON(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>v</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>v</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>v</sup>、-NR<sup>v</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>v</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>v</sup>、-OP(O)(OR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>v</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>v</sup>、-PO(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>又は-OPO(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここでR<sup>v</sup>は、水素又は非置換C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>脂肪族基であり；

それぞれ存在するR'は、独立して、水素であるか又は0~5個の存在するR<sup>z</sup>で場合により置換されていてもよいC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>脂肪族基であり；及びそれぞれ存在するR<sup>z</sup>は、独立して、-R<sup>t</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>t</sup>、-SR<sup>t</sup>、-N(R<sup>t</sup>)<sub>2</sub>、

$-NR^T COR^T$ 、 $-NR^T CON(R^T)_2$ 、 $-NR^T CO_2 R^T$ 、 $-COR^T$ 、 $-CO_2 R^T$ 、 $-OCOR^T$ 、 $-CON(R^T)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^T)_2$ 、 $-SOR^T$ 、 $-SO_2 R^T$ 、 $-SO_2 N(R^T)_2$ 、 $-NR^T SO_2 R^T$ 、 $-NR^T SO_2 N(R^T)_2$ 、 $-COCOR^T$ 、 $-COCH_2 COR^T$ 、 $-OP(O)(OR^T)_2$ 、 $-P(O)(OR^T)_2$ 、 $-OP(O)_2 OR^T$ 、 $-P(O)_2 OR^T$ 、 $-PO(R^T)_2$  又は  $-OPO(R^T)_2$  から選択され、ここで  $R^T$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する  $R^U$  は、独立して、 $-R^Q$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^Q$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^Q$ 、 $-SR^Q$ 、 $-N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q COR^Q$ 、 $-NR^Q CON(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q CO_2 R^Q$ 、 $-COR^Q$ 、 $-CO_2 R^Q$ 、 $-OCOR^Q$ 、 $-CON(R^Q)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^Q)_2$ 、 $-SOR^Q$ 、 $-SO_2 R^Q$ 、 $-SO_2 N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q SO_2 R^Q$ 、 $-NR^Q SO_2 N(R^Q)_2$ 、 $-COCOR^Q$ 、 $-COCH_2 COR^Q$ 、 $-OP(O)(OR^Q)_2$ 、 $-P(O)(OR^Q)_2$ 、 $-OP(O)_2 OR^Q$ 、 $-P(O)_2 OR^Q$ 、 $-PO(R^Q)_2$  又は  $-OPO(R^Q)_2$  から選択され、ここで  $R^Q$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；あるいは  $R$  及び  $R'$ 、2 個の存在する  $R$ 、又は 2 個の存在する  $R'$  は、これらが結合している原子（1 個又は複数個）と一緒に、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される 0 ~ 4 個の異種原子を有する 3 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $R^{T1}$  で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在する  $R^{T1}$  は、独立して、 $-R^S$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^S$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^S$ 、 $-SR^S$ 、 $-N(R^S)_2$ 、 $-NR^S COR^S$ 、 $-NR^S CON(R^S)_2$ 、 $-NR^S CO_2 R^S$ 、 $-COR^S$ 、 $-CO_2 R^S$ 、 $-OCOR^S$ 、 $-CON(R^S)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^S)_2$ 、 $-SOR^S$ 、 $-SO_2 R^S$ 、 $-SO_2 N(R^S)_2$ 、 $-NR^S SO_2 R^S$ 、 $-NR^S SO_2 N(R^S)_2$ 、 $-COCOR^S$ 、 $-COCH_2 COR^S$ 、 $-OP(O)(OR^S)_2$ 、 $-P(O)(OR^S)_2$ 、 $-OP(O)_2 OR^S$ 、 $-P(O)_2 OR^S$ 、 $-PO(R^S)_2$  又は  $-OPO(R^S)_2$  から選択され、ここで  $R^S$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族である；

但し：

A.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、非置換ピペラジン環を形成し、環 A が環 A1 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ水素であり、W がハロゲンであり且つ y が 1 ~ 4 である場合には、 $R^5$  がニトロ、ハロゲン、 $C_{1-3}$  アルキル又は  $C_{1-3}$  アルコキシでないこと；

B. 環 A が環 A1 であり、 $R^{3A}$  が水素、 $CO_2 H$  又は  $CONH_2$  であり且つ  $R^{3B}$  が水素又はメチルであり、 $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒に形成する環が、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する  $-R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、z が 0 ~ 5 であり、W がフルオロであり、y が 1 ~ 2 であり、並びに Q が結合である）場合には、 $R^x$  がハロゲンでないこと；

C.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、非置換アゼパニル環を形成し、環 A が環 A1 であり且つ  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ水素である場合には、W が  $NMe_2$ 、 $OMe$  又は  $F$  でないこと；

D. 環 A が環 A1 であり、 $R^{3A}$  が水素であり且つ  $R^{3B}$  がメチルであり、 $R^1$  及び  $R^2$  がこれらが結合している窒素原子と一緒に、窒素から選択される 0 ~ 1 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 6 員単環式飽和又は部分不飽和環を

形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって形成する環が、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、 $z$  個の独立して存在する  $-R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、 $z$  が 0 ~ 5 であり、 $y$  が 2 であり、 $Q$  が結合であり、並びに  $R^x$  がハロゲンである）場合には、 $W$  が  $N(R')$  でないこと；

E.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって形成する環が、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、 $z$  個の独立して存在する  $-R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、 $z$  が 0 ~ 5 であり、 $W$  がハロ、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、 $y$  が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^x$  であり、環 A が環 A 2 であり並びに  $R^{3B}$  が  $Q-R^x$  である）場合には、 $R^{3A}$  がシアノでないこと；

F.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合により及び独立して、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、 $z$  個の独立して存在する  $-R^4$  で置換されていてもよいモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン、オキサゼパン又はチアゼパン環を形成し、 $z$  が 0 ~ 5 であり、 $W$  がハロ、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、 $y$  が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^x$  であり、環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  のいずれか一つ又はその両方が  $Q-R^x$  であり、並びに  $Q$  が  $C_1$  アルキリデン鎖である場合には、 $R^x$  が  $-N(R')$  でないこと；並びに

G. 環 A が環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ  $Q-R^x$  であり、 $W$  がハロ、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、 $y$  が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^x$  である場合には、 $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、4-置換ピペリジン環を形成せず、ここで  $z$  が 1 であり、 $-R^4$  が  $Q-R^x$  であり、 $Q$  が結合であり且つ  $R^x$  が  $-N(R')$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-NR'SO_2R'$  であるか、あるいは  $z$  が 1 であり且つ  $-R^4$  が 1-メトキシメチル、1-メトキシプロパン-2-オール又は 1-エトキシプロパン-2-オールであること；

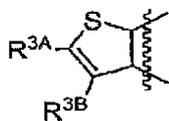
を条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩。

(項目 2)

環 A が環 A 1 :

【化 1 2 6】



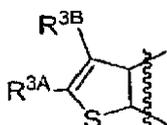
A1;

であり並びに  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が項目 1 で定義した通りである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

環 A が環 A 2 :

【化 1 2 7】



A2;

であり並びに  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が項目 1 で定義した通りである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4)

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり並びに  $R^X$  が  $-R'$  である、項目 2 又は 3 に記載の化合物。

(項目 5)

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が、水素、0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 5 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環から選択される、項目 4 に記載の化合物。

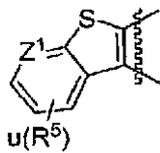
(項目 6)

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が水素、非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 3 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 5 ~ 6 員完全不飽和単環式環から選択される、項目 5 に記載の化合物。

(項目 7)

環 A が環 A 3 :

【化 1 2 8】



A3;

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が項目 1 で定義した通りである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8)

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が水素、又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、項目 7 に記載の化合物。

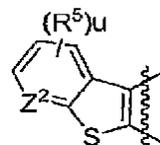
(項目 9)

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、項目 8 に記載の化合物。

(項目 10)

環 A が環 A 4 :

【化 1 2 9】



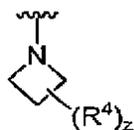
A4;

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が項目 1 で定義した通りである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 11)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってアゼチジニル環 :

【化 1 3 0】



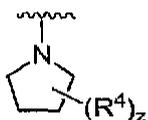
aa.

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 2)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピロリジニル環：

【化 1 3 1】



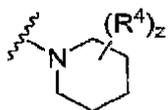
bb.

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 3)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペリジニル環：

【化 1 3 2】



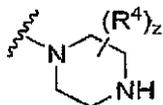
cc.

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 4)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペラジニル環：

【化 1 3 3】



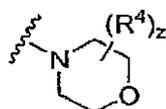
dd.

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 5)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってモルホリニル環：

【化 1 3 4】



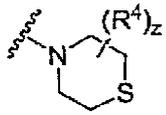
ee.

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目16)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってチオモルホリニル環：

【化135】



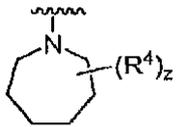
ff.

を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目17)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってアゼパニル環：

【化136】



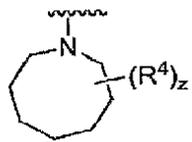
gg.

を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目18)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってアソカニル環：

【化137】



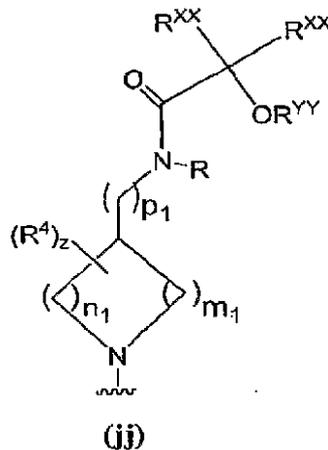
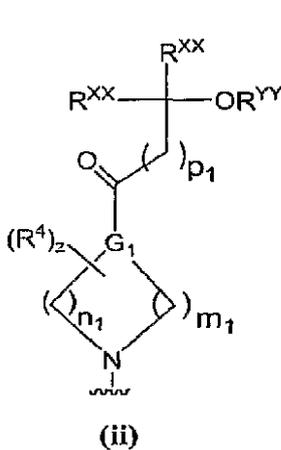
hh.

を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目19)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環 (ii) 又は (jj)：

【化138】



〔式中：

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

$m_1$  及び  $n_1$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_1 + n_1$  が 2 ~ 6 であることを条件とする) ;

$p_1$  は 0 ~ 2 であり ;

$z$  は 0 ~ 4 であり ;

それぞれの  $R^{X X}$  は、水素であるか、 $C_{1-6}$  脂肪族基であるか、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり ; ここで  $R^{X X}$  は、 $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  は 0 ~ 3 であり (但し、両方の  $R^{X X}$  が同時に水素でないことを条件とする) ;

$R^{Y Y}$  は、水素、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$  又は  $-PO(R')$  であり ; 並びに

それぞれ存在する  $R^{1 1}$  は、独立して  $Q-R^X$  である ]  
を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 20)

一方の  $R^{X X}$  が水素であり且つ他方の  $R^{X X}$  が水素でない、項目 19 に記載の化合物。

(項目 21)

両方の  $R^{X X}$  が水素でない、項目 19 に記載の化合物。

(項目 22)

$p_1$  が 0 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 23)

$p_1$  が 1 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 24)

$p_1$  が 2 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 25)

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 1 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 26)

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 2 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 27)

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 3 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 28)

$R^{X X}$  が  $C_{1-6}$  脂肪族基であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、項目 19 ~ 27 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 29)

$R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルであり、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、項目 19 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 30)

$R^{X X}$  が  $C_{1-6}$  アルキルである、項目 19 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 31)

$R^{X X}$  が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 32)

$R^{X X}$  が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立し

て存在する - R<sup>1 1</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>1</sub> が 0 ~ 3 である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 33)

R<sup>x x</sup> が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、ここで R<sup>x x</sup> が w<sub>1</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 1</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>1</sub> が 0 ~ 3 である、項目 32 に記載の化合物。

(項目 34)

R<sup>y y</sup> が、水素、-COR', -CO<sub>2</sub>R', -CON(R')<sub>2</sub>, -SOR', -SO<sub>2</sub>R', -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>, -COCOR', -COCH<sub>2</sub>COR', -P(O)(OR')<sub>2</sub>, -P(O)<sub>2</sub>OR' 又は -PO(R') である、項目 19 ~ 33 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 35)

R<sup>y y</sup> が水素である、項目 34 に記載の化合物。

(項目 36)

R<sup>y y</sup> が、-COR', -CO<sub>2</sub>R', -CON(R')<sub>2</sub>, -SOR', -SO<sub>2</sub>R', -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>, -COCOR', -COCH<sub>2</sub>COR', -P(O)(OR')<sub>2</sub>, -P(O)<sub>2</sub>OR' 又は -PO(R') である、項目 34 に記載の化合物。

(項目 37)

R が水素である、項目 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 38)

R が C1 - C6 アルキルである、項目 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 39)

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、項目 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 40)

R<sup>y y</sup> が水素であり、一方の R<sup>x x</sup> が水素であり且つ他方の R<sup>x x</sup> が C1 - C6 アルキルである、項目 19 に記載の化合物。

(項目 41)

p<sub>1</sub> が 0 であり、R<sup>y y</sup> が水素であり、一方の R<sup>x x</sup> が水素であり且つ他方の R<sup>x x</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである、項目 19 に記載の化合物。

(項目 42)

R<sup>y y</sup> が水素であり、一方の R<sup>x x</sup> が水素であり且つ他方の R<sup>x x</sup> が C1 - C6 アルキルである、項目 19 に記載の化合物。

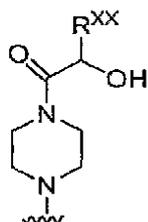
(項目 43)

p<sub>1</sub> が 0 であり、R<sup>y y</sup> が水素であり、一方の R<sup>x x</sup> が水素であり且つ他方の R<sup>x x</sup> が C1 - C6 アルキルである、項目 19 に記載の化合物。

(項目 44)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって以下に示す環：

【化 139】



を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 45)

R<sup>x x</sup> が C1 - C6 アルキルである、項目 44 に記載の化合物。

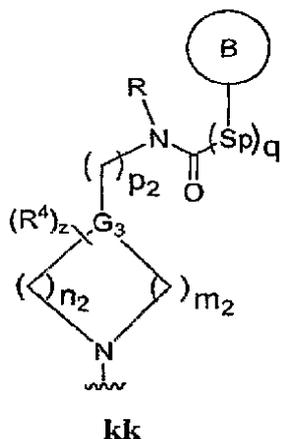
(項目46)

$R^x$  がメチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $n$ -ブチル、イソブチル又は  $t$ -ブチルである、項目45に記載の化合物。

(項目47)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環 (kk) :

【化140】



〔式中：〕

$G_3$  は、 $-N-$  又は  $CH$  であり；

$m_2$  及び  $n_2$  のそれぞれは、独立して  $0 \sim 3$  であり (但し、 $m_2 + n_2$  が  $2 \sim 6$  であることを条件とする)；

$p_2$  は  $0 \sim 2$  であり (但し、 $G_3$  が  $N$  である場合には、 $p_2$  が  $0$  でないことを条件とする)；

$q_2$  は  $0$  又は  $1$  であり；

$z$  は  $0 \sim 4$  であり；

$Sp$  は、結合であるか又は  $C1 - C6$  アルキリデンリンカーであり、ここで最大 2 個までのメチレン単位は、場合により及び独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR'-$ 、 $-CONR'NR'-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR'CO_2-$ 、 $-NR'CONR'-$ 、 $-OCONR'-$ 、 $-NR'NR'$ 、 $-NR'NR'CO-$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-SO$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR'-$ 、 $-SO_2NR'-$ 、 $NR'SO_2-$  又は  $-NR'SO_2NR'-$  で置換されていてもよく；

環  $B$  は、 $O$ 、 $S$  又は  $N$  から選択される  $1 \sim 4$  個の異種原子を有する  $4 \sim 8$  員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環  $B$  は、 $w_2$  個の独立して存在する  $-R^1$  で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  は  $0 \sim 4$  であり；それぞれ存在する  $R^1$  は独立して  $Q-R^x$  である]

を形成する、項目1に記載の化合物。

(項目48)

$G_3$  が  $N$  である、項目47に記載の化合物。

(項目49)

$G_3$  が  $CH$  である、項目47に記載の化合物。

(項目50)

$p_2$  が  $0$  である、項目47～49のいずれか1項に記載の化合物。

(項目51)

$p_2$  が  $1$  である、項目47～49のいずれか1項に記載の化合物。

(項目52)

$p_2$  が  $2$  である、項目47～49のいずれか1項に記載の化合物。

(項目53)

q<sub>2</sub> が 0 である、項目 47 ~ 52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 54)

q<sub>2</sub> が 1 である、項目 47 ~ 52 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 55)

p<sub>2</sub> が 1 であり、及び q<sub>2</sub> が 1 である、項目 47 に記載の化合物。

(項目 56)

G<sub>3</sub> が CH であり、p<sub>2</sub> が 0 であり、及び q<sub>2</sub> が 1 である、項目 47 に記載の化合物。

(項目 57)

m<sub>2</sub> 及び n<sub>2</sub> がそれぞれ 1 である、項目 47 ~ 56 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 58)

m<sub>2</sub> 及び n<sub>2</sub> がそれぞれ 2 である、項目 47 ~ 56 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 59)

S<sub>p</sub> が - O -、- S - 又は - NR' - から選択される、項目 47 ~ 58 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 60)

S<sub>p</sub> が - O - である、項目 47 ~ 59 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 61)

S<sub>p</sub> が - NR' - である、項目 47 ~ 59 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 62)

S<sub>p</sub> が - NH - である、項目 47 ~ 59 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 63)

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環 B が w<sub>2</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>2</sub> が 0 ~ 4 である、項目 47 ~ 62 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 64)

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B が w<sub>2</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>2</sub> が 0 ~ 4 である、項目 47 ~ 63 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 65)

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B が w<sub>2</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>2</sub> が 0 ~ 4 である、項目 47 ~ 64 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 66)

w<sub>2</sub> が 0 である、項目 47 ~ 65 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 67)

環 B がテトラヒドロフランである、項目 47 ~ 66 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 68)

S<sub>p</sub> が結合、O 又は - O - CH<sub>2</sub> - であり；p<sub>2</sub> が 1 であり；R が水素であり；且つ m<sub>2</sub> 及び n<sub>2</sub> が両方同時に 1 又は 2 である、項目 47 に記載の化合物。

(項目 69)

R が水素である、項目 47 ~ 68 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 70)

R が C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルである、項目 69 に記載の化合物。

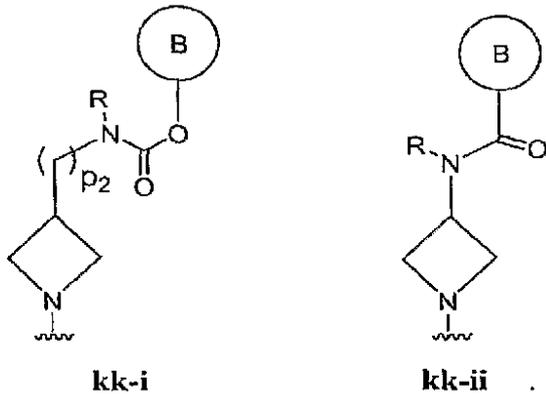
(項目 71)

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、項目 70 に記載の化合物。

(項目 72)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって式 (kk - i) 又は式 (kk - ii) :

## 【化 1 4 1】



の環を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 3)

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B が  $w_2$  個の独立して存在する  $-R^{1,2}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  が 0 ~ 4 である、項目 7 2 に記載の化合物。

(項目 7 4)

R が水素である、項目 7 2 ~ 7 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 5)

R が水素であり及び環 B がテトラヒドロフランルである、項目 7 4 に記載の化合物。

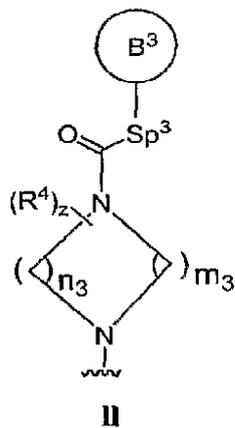
(項目 7 6)

$S_p$  が結合、 $-O-$  又は  $-O-CH_2-$  である、項目 7 2 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7 7)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (II) :

## 【化 1 4 2】



〔式中：

$m_3$  及び  $n_3$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_3 + n_3$  が 2 ~ 6 であることを条件とする) ;

$z$  は 0 ~ 4 であり ;

$S_{p^3}$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'-$ 、又は C1 - C6 アルキリデンリンカーであり、ここで最大 2 個までのメチレン単位は、場合により及び独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR'-$ 、 $-CONR'NR'-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR'CO_2-$ 、 $-NR'CONR'-$ 、 $-OCONR'-$ 、 $-NR'NR'$ 、 $-NR'NR'CO-$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR'-$ 、 $-$

S O<sub>2</sub> N R' -、N R' S O<sub>2</sub> - 又は - N R' S O<sub>2</sub> N R' - で置換されていてもよく (但し、S p<sup>3</sup> は、カルボニル基に、炭素原子以外の原子を介して結合されることを条件とする) ;

環 B<sup>3</sup> は、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環 B<sup>3</sup> は、w<sub>3</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 3</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>3</sub> は 0 ~ 4 であり ;

それぞれ存在する R<sup>1 3</sup> は独立して Q - R<sup>x</sup> である]

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 8)

S p<sup>3</sup> が - O -、- S - 又は - N R' - から選択される、項目 7 7 に記載の化合物。

(項目 7 9)

S p<sup>3</sup> が - O - である、項目 7 7 ~ 7 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 0)

S p<sup>3</sup> が - O - C H<sub>2</sub> - である、項目 7 7 に記載の化合物。

(項目 8 1)

S p<sup>3</sup> が - N R' - である、項目 7 8 に記載の化合物。

(項目 8 2)

S p<sup>3</sup> が - N H - である、項目 7 8 に記載の化合物。

(項目 8 3)

S p<sup>3</sup> が - N H - C H<sub>2</sub> - である、項目 7 8 に記載の化合物。

(項目 8 4)

m<sub>3</sub> 及び n<sub>3</sub> のそれぞれが 1 である、項目 7 7 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 5)

m<sub>3</sub> 及び n<sub>3</sub> が 2 である、項目 7 7 ~ 8 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 6)

環 B<sup>3</sup> が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環 B<sup>3</sup> が w<sub>3</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 3</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>3</sub> が 0 ~ 4 である、項目 7 7 ~ 8 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 7)

環 B<sup>3</sup> が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B<sup>3</sup> が w<sub>3</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 3</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>3</sub> が 0 ~ 4 である、項目 8 6 に記載の化合物。

(項目 8 8)

環 B<sup>3</sup> が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B<sup>3</sup> が w<sub>3</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 3</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>3</sub> が 0 ~ 4 である、項目 7 7 ~ 8 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8 9)

w<sub>3</sub> が 0 である、項目 7 7 ~ 8 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9 0)

環 B<sup>3</sup> がテトラヒドロフランである、項目 7 7 ~ 8 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9 1)

S p<sup>3</sup> が結合、O 又は - O - C H<sub>2</sub> - であり ; R が水素であり ; 且つ n<sub>3</sub> 及び m<sub>3</sub> が両方同時に 1 又は 2 である、項目 7 7 に記載の化合物。

(項目 9 2)

R が水素である、項目 7 7 ~ 9 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9 3)

R が C 1 - C 6 アルキルである、項目 7 7 ~ 9 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9 4)

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、項目 9 3 に記載の化合物。

(項目 9 5)

z が 0 である、項目 7 7 ~ 9 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

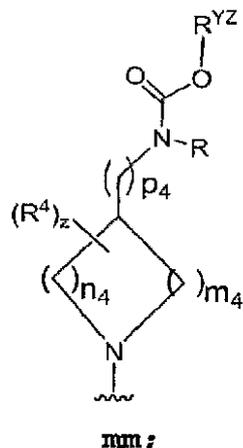
(項目 9 6)

環 B<sup>3</sup> が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B<sup>3</sup> が w<sub>3</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 3</sup> で場合により置換されていてもよく、w<sub>3</sub> が 0 ~ 4 である、項目 7 7 ~ 8 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9 7)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって環 (mm) :

【化 1 4 3】



[ 式中 :

m<sub>4</sub> 及び n<sub>4</sub> のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、m<sub>4</sub> + n<sub>4</sub> が 2 ~ 6 であることを条件とする) ;

p<sub>4</sub> は 1 ~ 2 であり ;

R<sup>YZ</sup> は、場合により w<sub>4</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 4</sup> で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 脂肪族基であり、ここで w<sub>4</sub> は 0 ~ 3 であり ;

それぞれ存在する - R<sup>1 4</sup> は独立して Q - R<sup>X</sup> である ]

を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 9 8)

p<sub>4</sub> が 1 である、項目 9 7 に記載の化合物。

(項目 9 9)

p<sub>4</sub> が 2 である、項目 9 8 に記載の化合物。

(項目 1 0 0)

m<sub>4</sub> 及び n<sub>4</sub> がそれぞれ 1 である、項目 9 6 ~ 9 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 1)

m<sub>4</sub> 及び n<sub>4</sub> がそれぞれ 2 である、項目 9 6 ~ 9 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 2)

m<sub>4</sub> 及び n<sub>4</sub> がそれぞれ 3 である、項目 9 6 ~ 9 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 3)

R<sup>YZ</sup> が、w<sub>4</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 4</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり、ここで w<sub>4</sub> が 0 ~ 3 である、項目 9 7 ~ 1 0 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 4)

R<sup>YZ</sup> が、w<sub>4</sub> 個の独立して存在する - R<sup>1 4</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルであり、ここで w<sub>4</sub> が 0 ~ 3 である、項目 1 0 3 に記載の化合物。

(項目 1 0 5)

R<sup>Y Z</sup> が C 1 - C 6 アルキルである、項目 1 0 3 に記載の化合物。

(項目 1 0 6)

R が水素である、項目 9 6 ~ 1 0 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 0 7)

R が C 1 - C 6 アルキルである、項目 9 6 ~ 1 0 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

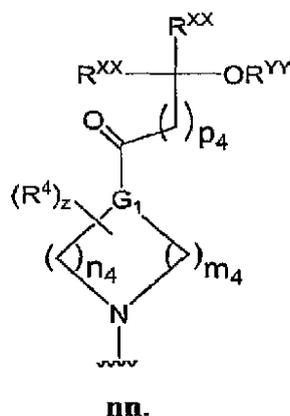
(項目 1 0 8)

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、項目 1 0 7 に記載の化合物。

(項目 1 0 9)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって環 ( n n ) :

【化 1 4 4】



を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 1 0)

G<sub>1</sub> が - N - である、項目 1 0 9 に記載の化合物。

(項目 1 1 1)

G<sub>1</sub> が - CH - NH - である、項目 1 0 9 に記載の化合物。

(項目 1 1 2)

G<sub>1</sub> が - CH - CH<sub>2</sub> - NH - である、項目 1 0 9 に記載の化合物。

(項目 1 1 3)

R<sup>Y Y</sup> が水素であり、一方の R<sup>X X</sup> が水素であり、且つ他方の R<sup>X X</sup> が C 1 - C 6 アルキルである、項目 1 0 9 ~ 1 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

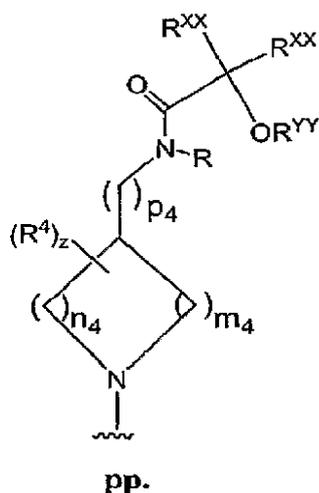
(項目 1 1 4)

p<sub>4</sub> が 0 であり、R<sup>Y Y</sup> が水素であり、一方の R<sup>X X</sup> が水素であり、且つ他方の R<sup>X X</sup> が C 1 - C 6 アルキルである、項目 1 0 9 ~ 1 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 5)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって環 ( p p ) :

【化 1 4 5】



を形成する、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 1 6)

$R^{YY}$  が水素であり、一方の  $R^{XX}$  が水素であり、且つ他方の  $R^{XX}$  が C 1 - C 6 アルキルである、項目 1 1 5 に記載の化合物。

(項目 1 1 7)

$p_4$  が 0 であり、 $R^{YY}$  が水素であり、一方の  $R^{XX}$  が水素であり、且つ他方の  $R^{XX}$  が C 1 - C 6 アルキルである、項目 1 0 9 ~ 1 1 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 8)

W が OR' である、項目 1 ~ 1 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 9)

W が OH である、項目 1 1 8 に記載の化合物。

(項目 1 2 0)

W が SR' である、項目 1 ~ 1 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 1)

W が SH である、項目 1 2 0 に記載の化合物。

(項目 1 2 2)

W が  $N(R')$  である、項目 1 ~ 1 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 3)

W が  $NHR'$  である、項目 1 2 2 に記載の化合物。

(項目 1 2 4)

W が  $NH_2$  である、項目 1 2 3 に記載の化合物。

(項目 1 2 5)

W が  $CHF_2$  又は  $CH_2F$  である、項目 1 ~ 1 1 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 6)

W が  $CHF_2$  である、項目 1 2 5 に記載の化合物。

(項目 1 2 7)

W が  $CH_2F$  である、項目 1 2 5 に記載の化合物。

(項目 1 2 8)

z が 0 ~ 5 である、項目 1 ~ 1 2 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 9)

z が 1 ~ 3 である、項目 1 2 8 に記載の化合物。

(項目 1 3 0)

z が 1 ~ 2 である、項目 1 2 9 に記載の化合物。

(項目 1 3 1)

z が 1 である、項目 130 に記載の化合物。

(項目 132)

R<sup>4</sup> が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、-N(R')<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OR'、-CH<sub>2</sub>OR'、-SR'、-CH<sub>2</sub>SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、COR'、-NHCOOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub> であるか、あるいは C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリール C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、ヘテロアリール C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル、脂環式 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル又はヘテロ脂環式 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、項目 1 ~ 131 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 133)

R<sup>4</sup> が、独立して、Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CN、-COOH、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(Et)<sub>2</sub>、-N(iPr)<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-COOCH<sub>3</sub>、-OH、-CH<sub>2</sub>OH、-NHCOCH<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(O)OCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(O)NHCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NHCOOCH<sub>3</sub>、-C(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-COO(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(O)NHCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> であるか、あるいは -ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH<sub>2</sub>シクロヘキシル、ピリジル、-CH<sub>2</sub>ピリジル又は -CH<sub>2</sub>チアゾリルから選択される場合により置換されていてもよい基である、項目 132 に記載の化合物。

(項目 134)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R'、-NRCOOR' 又は -NRCOR' である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 135)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R' である、項目 134 に記載の化合物。

(項目 136)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOOR' である、項目 134 に記載の化合物。

(項目 137)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOR' である、項目 134 に記載の化合物。

(項目 138)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピロリジン - 1 - イル (bb) であり、z が 1 又は 2 であり並びに R<sup>4</sup> が Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OR' 又は -CH<sub>2</sub>OR' である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 139)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OR' 又は -CH<sub>2</sub>OR'、-NRSO<sub>2</sub>R'、-NRCOOR' あるいは -OCON(R')<sub>2</sub> である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 140)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-

OR'、又は -CH<sub>2</sub>OR' である、項目 139 に記載の化合物。

(項目 141)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R' である、項目 139 に記載の化合物。

(項目 142)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOOR' である、項目 139 に記載の化合物。

(項目 143)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -SOR', -CON(R')<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>, -COR' 又は -COOR' である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 144)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SOR' である、項目 143 に記載の化合物。

(項目 145)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COOR' である、項目 143 に記載の化合物。

(項目 146)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -CON(R')<sub>2</sub> である、項目 143 に記載の化合物。

(項目 147)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub> である、項目 143 に記載の化合物。

(項目 148)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COR' である、項目 143 に記載の化合物。

(項目 149)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -SOR', -CON(R')<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>, -COR' 又は -COOR' である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 150)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SOR' である、項目 149 に記載の化合物。

(項目 151)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COOR' である、項目 149 に記載の化合物。

(項目 152)

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -

CON(R')<sub>2</sub>である、項目149に記載の化合物。

(項目153)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン-1-イル(ee)又はチオモルホリン-1-イル(ff)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>である、項目149に記載の化合物。

(項目154)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン-1-イル(ee)又はチオモルホリン-1-イル(ff)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COR'である、項目149に記載の化合物。

(項目155)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1又は2であり並びに少なくとも1個の存在するR<sup>4</sup>が-SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR'又は-COOR'である、項目1に記載の化合物。

(項目156)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SOR'である、項目155に記載の化合物。

(項目157)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COOR'である、項目155に記載の化合物。

(項目158)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-CON(R')<sub>2</sub>である、項目155に記載の化合物。

(項目159)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>である、項目155に記載の化合物。

(項目160)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COR'である、項目155に記載の化合物。

(項目161)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1又は2であり並びに少なくとも1個の存在するR<sup>4</sup>が-SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR'又は-COOR'である、項目1に記載の化合物。

(項目162)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SOR'である、項目161に記載の化合物。

(項目163)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COOR'である、項目161に記載の化合物。

(項目164)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-CON(R')<sub>2</sub>である、項目161に記載の化合物。

載の化合物。

(項目165)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>である、項目161に記載の化合物。

(項目166)

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COR'である、項目161に記載の化合物。

(項目167)

yが0~4である、項目133~166のいずれか1項に記載の化合物。

(項目168)

yが0である、項目167に記載の化合物。

(項目169)

yが1~3である、項目167に記載の化合物。

(項目170)

yが1~2である、項目169に記載の化合物。

(項目171)

yが1である、項目170に記載の化合物。

(項目172)

それぞれのR<sup>5</sup>が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、-N(R')<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OR'、-CH<sub>2</sub>OR'、-SR'、-CH<sub>2</sub>SR'、-NRCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OCOR'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCON(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>、-OPO(R')<sub>2</sub>であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル又はヘテロ脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、項目133~171のいずれか1項に記載の化合物。

(項目173)

それぞれのR<sup>5</sup>が、独立して、Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、Me、Et、CN、-COOH、-NH<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(Et)<sub>2</sub>、-N(iPr)<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-COOCH<sub>3</sub>、-OH、-OCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-NHCOCH<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NHC(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-OCCO(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-OCOCH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、4-CH<sub>3</sub>-ピペラジン-1-イル、-OCOCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-OCO(シクロペンチル)、-COCH<sub>3</sub>、場合により置換されていてもよいフェノキシ又は場合により置換されていてもよいベンジルオキシである、項目172に記載の化合物。

(項目174)

R<sup>5</sup>がFである、項目173に記載の化合物。

(項目175)

R<sup>5</sup>がOR'である、項目172に記載の化合物。

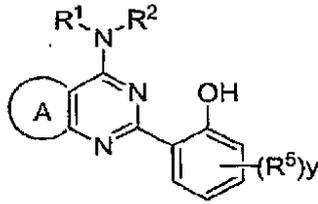
(項目176)

R<sup>5</sup>がOHである、項目175に記載の化合物。

(項目177)

前記化合物が式I-A:

【化 1 4 6】



I-A

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $y$  及び環 A は、項目 1 で定義した通りである)  
を有する、項目 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩。

(項目 1 7 8)

環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  の一つが水素であるか又は  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  の両方が水素である、項目 1 7 7 に記載の化合物。

(項目 1 7 9)

環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  又は  $R^{3B}$  のそれぞれが独立して  $Q - R^X$  である、項目 1 7 8 に記載の化合物。

(項目 1 8 0)

Q が C 1 - C 6 アルキリデンである、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 1)

Q が C 1 - C 4 アルキリデンである、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 2)

Q が  $-CH_2-$  である、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 3)

Q が結合であり及びそれぞれの  $R^X$  が、独立して、 $-R'$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')$ <sub>2</sub>、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ <sub>2</sub>、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')$ <sub>2</sub>、 $-OCON(R')$ <sub>2</sub>、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')$ <sub>2</sub>、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ <sub>2</sub>、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')$ <sub>2</sub>、 $-P(O)(OR')$ <sub>2</sub>、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')$ <sub>2</sub> 又は  $-OPO(R')$ <sub>2</sub> から選択される、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 4)

Q が結合であり及びそれぞれの  $R^X$  が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、 $-N(R')$ <sub>2</sub>、 $-CH_2N(R')$ <sub>2</sub>、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-COOR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')$ <sub>2</sub>、 $-OCON(R')$ <sub>2</sub>、COR'、 $-NHCOOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')$ <sub>2</sub> であるか、あるいは C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリール C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、ヘテロアリール C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、脂環式 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル又はヘテロ脂環式 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、項目 1 7 9 に記載の化合物。

(項目 1 8 5)

それぞれの  $R^X$  が独立して  $R'$  である、項目 1 8 3 に記載の化合物。

(項目 1 8 6)

環 A が環 A 3 又は A 4 であり及びそれぞれの  $R^5$  が水素である、項目 1 7 7 に記載の化合物。

(項目 1 8 7)

環 A が環 A 3 又は A 4 であり、u が 1 ~ 3 であり及びそれぞれの  $R^5$  が独立して  $Q - R^X$  である、項目 1 7 7 に記載の化合物。

(項目 1 8 8)

Q が C 1 - C 6 アルキリデンである、項目 1 8 7 に記載の化合物。

(項目189)

QがC1-C4アルキリデンである、項目187に記載の化合物。

(項目190)

Qが-CH<sub>2</sub>-である、項目187に記載の化合物。

(項目191)

Qが結合であり及びR<sup>x</sup>が、独立して、-R'、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>又は-OP(O)(R')<sub>2</sub>から選択される、項目187に記載の化合物。

(項目192)

R<sup>x</sup>がR'である、項目191に記載の化合物。

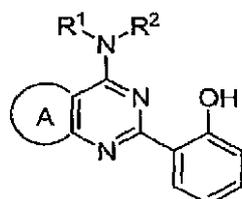
(項目193)

Qが結合であり及びそれぞれのR<sup>x</sup>が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、-N(R')<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OR'、-CH<sub>2</sub>OR'、-SR'、-CH<sub>2</sub>SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、COR'、-NHCOOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル又はヘテロ脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、項目187に記載の化合物。

(項目194)

前記化合物が、式I-A-i:

【化147】



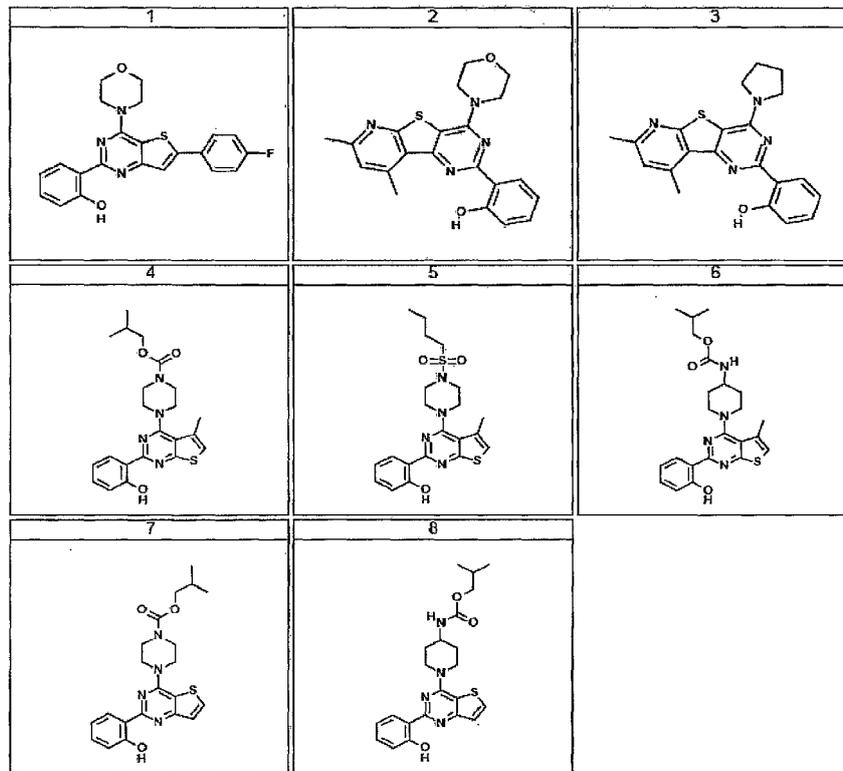
I-A-i;

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及び環Aは、項目1で定義した通りである)を有する、項目1に記載の化合物。

(項目195)

前記化合物が、

## 【化 1 4 8】



から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 1 9 6)

項目 1 ~ 1 9 5 のいずれか 1 項に記載の化合物と製薬学的に許容し得る補助剤又は担体とを含有する医薬組成物。

(項目 1 9 7)

急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全身神経痛、てんかん又はてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例えば不安及び鬱病、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、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛、激痛又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛あるいは癌性疼痛から選択される疾患、障害又は状態を治療又はそれらの重症度を軽減する方法であって、前記患者に有効量の項目 1 9 6 に記載の組成物を投与する工程を含む方法。

(項目 1 9 8)

前記疾患、状態又は障害が電位依存性ナトリウムチャネルの活性化又は過活動に関連している、項目 1 9 7 に記載の方法。

(項目 1 9 9)

前記疾患、状態又は障害が急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛である、項目 1 9 7 に記載の方法。

(項目 2 0 0)

前記疾患、状態又は障害が神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛である、項目 1 9 7 に記載の方法。

(項目 2 0 1)

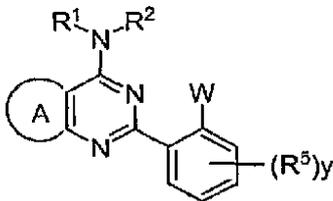
前記疾患、状態又は障害が激痛又は難治性疼痛、急性痛、術後疼痛、背痛あるいは癌性疼痛である、項目 1 9 7 に記載の方法。

(項目 2 0 2)

急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛

、疱疹性神経痛、全身神経痛、てんかん又はてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例えば不安及び鬱病、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、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛、激痛又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛あるいは癌性疼痛から選択される疾患、障害又は状態を治療又はそれらの重症度を軽減する方法であって、患者に、有効量の式 I :

【化 1 4 9】



I

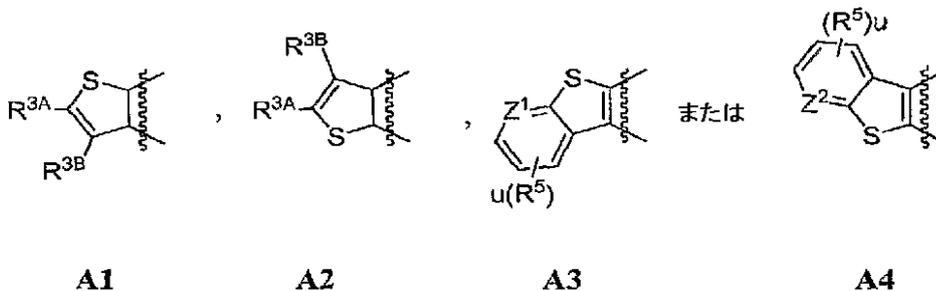
〔式中：

Wは、ハロ、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>Fであり、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される0～3個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい3～8員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が一緒に形成する環は、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z個の独立して存在する-R<sup>4</sup>で場合により及び独立して置換されていてもよく、zは0～5であり；

環 A は、

【化 1 5 0】



A1

A2

A3

A4

であり；

yは0～4であり；

uは0～3であり；

Z<sup>1</sup>及びZ<sup>2</sup>は、独立してN又はC-R<sup>5</sup>であり；

それぞれ存在するR<sup>3A</sup>、R<sup>3B</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、独立してQ-R<sup>x</sup>であり；ここで、Qは、結合であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であってQの最大2個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-C(=N-CN)、-NRCO-、-NRCO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR-、-NRSO<sub>2</sub>-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO<sub>2</sub>NR-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-PO-、-PO<sub>2</sub>-、-OP(O)(OR)-又は-POR-で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であり；及びそれぞれ存在するR<sup>x</sup>は、独立して、-R'、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')

$_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$  又は  $-OP(O)(R')_2$  から選択され；

それぞれ存在する R は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する R<sup>V</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する R<sup>V</sup> は、独立して、 $-R^V$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^V$ 、 $-SR^V$ 、 $-N(R^V)_2$ 、 $-NR^V COR^V$ 、 $-NR^V CON(R^V)_2$ 、 $-NR^V CO_2R^V$ 、 $-COR^V$ 、 $-CO_2R^V$ 、 $-OCOR^V$ 、 $-CON(R^V)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^V)_2$ 、 $-SOR^V$ 、 $-SO_2R^V$ 、 $-SO_2N(R^V)_2$ 、 $-NR^V SO_2R^V$ 、 $-NR^V SO_2N(R^V)_2$ 、 $-COCOR^V$ 、 $-COCH_2COR^V$ 、 $-OP(O)(OR^V)_2$ 、 $-P(O)(OR^V)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^V$ 、 $-P(O)_2OR^V$ 、 $-PO(R^V)_2$  又は  $-OPO(R^V)_2$  から選択され、ここで R<sup>V</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；

それぞれ存在する R' は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する R<sup>Z</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する R<sup>Z</sup> は、独立して、 $-R^T$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^T$ 、 $-SR^T$ 、 $-N(R^T)_2$ 、 $-NR^T COR^T$ 、 $-NR^T CON(R^T)_2$ 、 $-NR^T CO_2R^T$ 、 $-COR^T$ 、 $-CO_2R^T$ 、 $-OCOR^T$ 、 $-CON(R^T)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^T)_2$ 、 $-SOR^T$ 、 $-SO_2R^T$ 、 $-SO_2N(R^T)_2$ 、 $-NR^T SO_2R^T$ 、 $-NR^T SO_2N(R^T)_2$ 、 $-COCOR^T$ 、 $-COCH_2COR^T$ 、 $-OP(O)(OR^T)_2$ 、 $-P(O)(OR^T)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^T$ 、 $-P(O)_2OR^T$ 、 $-PO(R^T)_2$  又は  $-OPO(R^T)_2$  から選択され、ここで R<sup>T</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する R<sup>U</sup> で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する R<sup>U</sup> は、独立して、 $-R^Q$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^Q$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^Q$ 、 $-SR^Q$ 、 $-N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q COR^Q$ 、 $-NR^Q CON(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q CO_2R^Q$ 、 $-COR^Q$ 、 $-CO_2R^Q$ 、 $-OCOR^Q$ 、 $-CON(R^Q)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^Q)_2$ 、 $-SOR^Q$ 、 $-SO_2R^Q$ 、 $-SO_2N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q SO_2R^Q$ 、 $-NR^Q SO_2N(R^Q)_2$ 、 $-COCOR^Q$ 、 $-COCH_2COR^Q$ 、 $-OP(O)(OR^Q)_2$ 、 $-P(O)(OR^Q)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^Q$ 、 $-P(O)_2OR^Q$ 、 $-PO(R^Q)_2$  又は  $-OPO(R^Q)_2$  から選択され、ここで R<sup>Q</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；あるいは R 及び R'、2 個の存在する R、又は 2 個の存在する R' は、これらが結合している原子（1 個又は複数個）と一緒にあって、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される 0 ~ 4 個の異種原子を有する 3 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する R<sup>T1</sup> で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在する R<sup>T1</sup> は、独立して、 $-R^S$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^S$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^S$ 、 $-SR^S$ 、 $-N(R^S)_2$ 、 $-NR^S COR^S$ 、 $-NR^S CON(R^S)_2$ 、 $-NR^S CO_2R^S$ 、 $-COR^S$ 、 $-CO_2R^S$ 、 $-OCOR^S$ 、 $-CON(R^S)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^S)_2$ 、 $-SOR^S$ 、 $-SO_2R^S$ 、 $-SO_2N(R^S)_2$ 、 $-NR^S SO_2R^S$ 、 $-NR^S SO_2N(R^S)_2$ 、 $-COCOR^S$ 、 $-COCH_2COR^S$ 、 $-OP(O)(OR^S)_2$ 、 $-P(O)(OR^S)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^S$ 、 $-P(O)_2OR^S$ 、 $-PO(R^S)_2$  又は  $-OPO(R^S)_2$  から選択され、ここで R<sup>S</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基である；

但し；

G 環 A が環 A 2 であり、R<sup>3A</sup> 及び R<sup>3B</sup> がそれぞれ Q-R<sup>X</sup> であり、W がハロ、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub> 又は CH<sub>2</sub>F であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞ

れの  $R^5$  が独立して  $Q - R^X$  である場合には、 $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、4-置換ピペリジン環を形成せず、ここで  $z$  が 1 であり、 $-R^4$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり且つ  $R^X$  が  $-N(R')$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-NR'SO_2R'$  であるか、あるいは  $z$  が 1 であり且つ  $-R^4$  が 1-メトキシメチル、1-メトキシプロパン-2-オール又は 1-エトキシプロパン-2-オールであることを条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩を投与する工程を含む方法。

(項目 203)

前記疾患、状態又は障害が電位依存性ナトリウムチャネルの活性化又は過活動に関係している、項目 202 に記載の方法。

(項目 204)

前記疾患、状態又は障害が急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛である、項目 202 に記載の方法。

(項目 205)

前記疾患、状態又は障害が神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛である、項目 202 に記載の方法。

(項目 206)

前記疾患、状態又は障害が激痛又は難治性疼痛、急性痛、術後疼痛、背痛又は癌性疼痛である、項目 202 に記載の方法。

(項目 207)

前記疾患が、大腿骨癌性疼痛；非悪性慢性骨痛；関節リウマチ；変形性関節症；脊柱管狭窄症；神経障害性腰痛；神経障害性腰痛；筋筋膜痛症候群；線維筋痛症；顎関節痛；慢性内臓痛、例えば腹痛；膵臓痛；IBS痛；慢性頭痛；片頭痛；緊張性頭痛、例えば群発性頭痛；慢性神経障害性疼痛、例えば帯状疱疹後神経痛；糖尿病性神経障害；HIV関連神経障害；三叉神経痛；シャルコー・マリー・トゥース神経障害；遺伝性感覚性ニューロパシー；末梢神経損傷；有痛性神経腫；異所性近位及び遠位発射；神経根障害；化学療法誘発性神経障害性疼痛；放射線治療誘発性神経障害性疼痛；乳房切除術後疼痛；中枢痛；脊髄損傷疼痛；脳卒中後疼痛；視床痛；複合性局所疼痛症候群；幻痛；難治性疼痛；急性痛、急性術後疼痛；急性筋骨格痛；関節痛；機械的腰痛；頸痛；腱炎；外傷/運動痛；急性内臓痛、例えば腹痛；腎盂腎炎；虫垂炎；胆嚢炎；腸閉塞；ヘルニア、など；胸痛、例えば心臓痛；骨盤痛、腎仙痛、急性分娩痛、例えば陣痛；帝王切開痛；急性炎症性、熱傷及び外傷痛；急性間欠痛、例えば子宮内膜症；急性帯状疱疹疼痛；鎌状赤血球貧血；急性膵炎；突出痛；口腔顔面痛、例えば副鼻腔炎疼痛、歯痛；多発性硬化症(MS)痛；鬱病での疼痛；ハンセン病痛；ベーチェット病痛；有痛脂肪症；静脈炎痛；ギラン・バレー疼痛；痛む脚と動く足趾症候群；ハグランド症候群；先端紅痛症痛；ファブリー病痛；膀胱及び泌尿器疾患、例えば尿失禁；機能亢進膀胱；疼痛性膀胱症候群；間質性膀胱炎(IC)；又は前立腺炎から選択される、項目 202 に記載の方法。

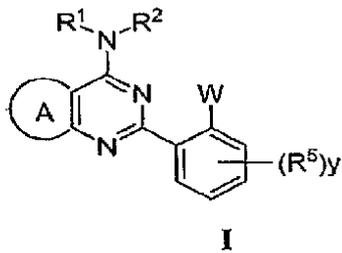
(項目 208)

(a) 患者；又は

(b) 生物学的試料

における  $NaV1.1$ 、 $NaV1.2$ 、 $NaV1.3$ 、 $NaV1.4$ 、 $NaV1.5$ 、 $NaV1.6$ 、 $NaV1.7$ 、 $NaV1.8$ 、 $NaV1.9$  又は  $CaV2.2$  活性の一つ又はそれ以上を阻害する方法であって、式 I：

【化151】



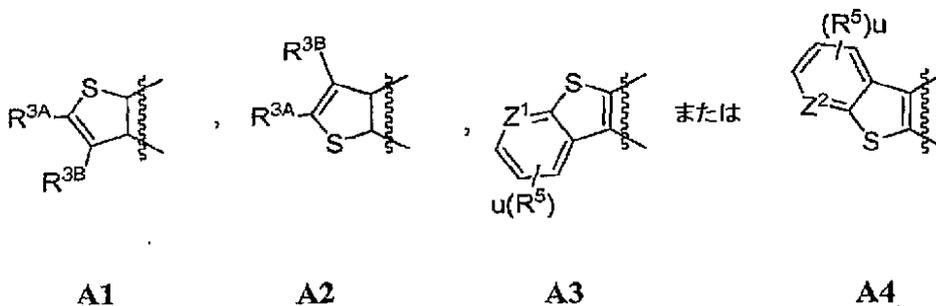
〔式中：〕

Wは、ハロゲン、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>Fであり、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される0～3個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい3～8員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が一緒に形成する環は、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z個の独立して存在する-R<sup>4</sup>で場合により及び独立して置換されていてもよく、zは0～5であり；

環Aは、

【化152】



であり；

yは0～4であり；

uは0～3であり；

Z<sup>1</sup>及びZ<sup>2</sup>は、独立してN又はC-R<sup>5</sup>であり；

それぞれ存在するR<sup>3A</sup>、R<sup>3B</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、独立してQ-R<sup>x</sup>であり；ここで、Qは、結合であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であってQの最大2個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-C(=N-CN)、-NRCO-、-NRCO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR-、-NRSO<sub>2</sub>-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO<sub>2</sub>NR-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-PO-、-PO<sub>2</sub>-、-OP(O)(OR)-又は-POR-で置換されていてもよく；及びそれぞれ存在するR<sup>x</sup>は、独立して、-R'、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>又は-OPO(R')<sub>2</sub>から選択され；

それぞれ存在するRは、独立して、水素であるか又は0～5個の存在するR<sup>y</sup>で場合により置換されていてもよいC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>脂肪族基であり；及びそれぞれ存在するR<sup>y</sup>は、独立して、-R<sup>v</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>v</sup>、-SR<sup>v</sup>、-N(R<sup>v</sup>)<sub>2</sub>、-

$\text{NR}^V\text{COR}^V$ 、 $-\text{NR}^V\text{CON}(\text{R}^V)_2$ 、 $-\text{NR}^V\text{CO}_2\text{R}^V$ 、 $-\text{COR}^V$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^V$ 、 $-\text{OCOR}^V$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^V)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{CN})$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^V)_2$ 、 $-\text{SOR}^V$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^V$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^V)_2$ 、 $-\text{NR}^V\text{SO}_2\text{R}^V$ 、 $-\text{NR}^V\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^V)_2$ 、 $-\text{COCOR}^V$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^V$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^V)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^V)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^V$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^V$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^V)_2$  又は  $-\text{OPO}(\text{R}^V)_2$  から選択され、ここで  $\text{R}^V$  は、水素又は非置換  $\text{C}_{1-6}$  脂肪族基であり；

それぞれ存在する  $\text{R}^V$  は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する  $\text{R}^Z$  で場合により置換されていてもよい  $\text{C}_{1-6}$  脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する  $\text{R}^Z$  は、独立して、 $-\text{R}^T$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^T$ 、 $-\text{SR}^T$ 、 $-\text{N}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{NR}^T\text{COR}^T$ 、 $-\text{NR}^T\text{CON}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{NR}^T\text{CO}_2\text{R}^T$ 、 $-\text{COR}^T$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^T$ 、 $-\text{OCOR}^T$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{CN})$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{SOR}^T$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^T$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{NR}^T\text{SO}_2\text{R}^T$ 、 $-\text{NR}^T\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^T)_2$ 、 $-\text{COCOR}^T$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^T$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^T)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^T)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^T$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^T$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^T)_2$  又は  $-\text{OPO}(\text{R}^T)_2$  から選択され、ここで  $\text{R}^T$  は、水素又は非置換  $\text{C}_{1-6}$  脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $\text{R}^U$  で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する  $\text{R}^U$  は、独立して、 $-\text{R}^Q$ 、ハロゲン、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}^Q$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^Q$ 、 $-\text{SR}^Q$ 、 $-\text{N}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{NR}^Q\text{COR}^Q$ 、 $-\text{NR}^Q\text{CON}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{NR}^Q\text{CO}_2\text{R}^Q$ 、 $-\text{COR}^Q$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^Q$ 、 $-\text{OCOR}^Q$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{CN})$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{SOR}^Q$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^Q$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{NR}^Q\text{SO}_2\text{R}^Q$ 、 $-\text{NR}^Q\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^Q)_2$ 、 $-\text{COCOR}^Q$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^Q$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^Q)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^Q)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^Q$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^Q$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^Q)_2$  又は  $-\text{OPO}(\text{R}^Q)_2$  から選択され、ここで  $\text{R}^Q$  は、水素又は非置換  $\text{C}_{1-6}$  脂肪族基であり；あるいは  $\text{R}$  及び  $\text{R}'$ 、2 個の存在する  $\text{R}$ 、又は 2 個の存在する  $\text{R}'$  は、これらが結合している原子 (1 個又は複数個) と一緒になって、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される 0 ~ 4 個の異種原子を有する 3 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $\text{R}^T$  で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在する  $\text{R}^T$  は、独立して、 $-\text{R}^S$ 、ハロゲン、 $=\text{O}$ 、 $=\text{NR}^S$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{OR}^S$ 、 $-\text{SR}^S$ 、 $-\text{N}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{NR}^S\text{COR}^S$ 、 $-\text{NR}^S\text{CON}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{NR}^S\text{CO}_2\text{R}^S$ 、 $-\text{COR}^S$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^S$ 、 $-\text{OCOR}^S$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{CN})$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{SOR}^S$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^S$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{NR}^S\text{SO}_2\text{R}^S$ 、 $-\text{NR}^S\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^S)_2$ 、 $-\text{COCOR}^S$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^S$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^S)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^S)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^S$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^S$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^S)_2$  又は  $-\text{OPO}(\text{R}^S)_2$  から選択され、ここで  $\text{R}^S$  は、水素又は非置換  $\text{C}_{1-6}$  脂肪族基である；

但し；

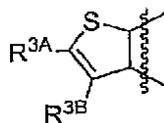
G. 環 A が環 A' であり、 $\text{R}^3\text{A}$  及び  $\text{R}^3\text{B}$  がそれぞれ  $\text{Q}-\text{R}^X$  であり、W がハロ、 $\text{OR}^Y$ 、 $\text{SR}^Y$ 、 $\text{N}(\text{R}^Y)_2$ 、 $\text{CHF}_2$  又は  $\text{CH}_2\text{F}$  であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $\text{R}^5$  が独立して  $\text{Q}-\text{R}^X$  である場合には、 $\text{R}^1$  及び  $\text{R}^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、4 - 置換ピペリジン環を形成せず、ここで z が 1 であり、 $-\text{R}^4$  が  $\text{Q}-\text{R}^X$  であり、Q が結合であり且つ  $\text{R}^X$  が  $-\text{N}(\text{R}^Y)_2$ 、 $-\text{NR}^Y\text{COR}^Y$ 、 $-\text{NR}^Y\text{CON}(\text{R}^Y)_2$ 、 $-\text{NR}^Y\text{CO}_2\text{R}^Y$ 、 $-\text{NR}^Y\text{SO}_2\text{R}^Y$  であるか、あるいは z が 1 であり且つ  $-\text{R}^4$  が 1 - メトキシメチル、1 - メトキシプロパン - 2 - オール又は 1 - エトキシプロパン - 2 - オールであることを条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩を前記患者に投与するか又は前記生物学的試料と接触させることを含む、方法。

(項目209)

環Aが環A1:

【化153】



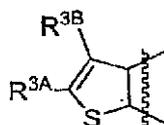
A1;

であり;並びに $R^{3A}$ 及び $R^{3B}$ が項目202又は208で定義した通りである、項目202又は208に記載の方法。

(項目210)

環Aが環A2:

【化154】



A2;

であり;並びに $R^{3A}$ 及び $R^{3B}$ が項目202又は208で定義した通りである、項目202又は208に記載の方法。

(項目211)

$R^{3A}$ 及び $R^{3B}$ が $Q-R^X$ であり、Qが結合であり、並びに $R^X$ が $-R'$ である、項目209又は210に記載の方法。

(項目212)

$R^{3A}$ 及び $R^{3B}$ が $Q-R^X$ であり、Qが結合であり、 $R^X$ が $-R'$ であり並びに $-R'$ が、水素、0~5個の存在する $R^Z$ で場合により置換されていてもよい $C_{1-6}$ 脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される0~3個の異種原子を有し、0~5個の存在する $R^U$ で場合により置換されていてもよい3~8員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環から選択される、項目211に記載の方法。

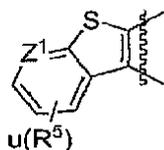
(項目213)

$R^{3A}$ 及び $R^{3B}$ が $Q-R^X$ であり、Qが結合であり、 $R^X$ が $-R'$ であり並びに $-R'$ が水素、非置換 $C_{1-6}$ 脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される0~3個の異種原子を有し、0~3個の存在する $R^U$ で場合により置換されていてもよい5~6員完全不飽和単環式環から選択される、項目212に記載の方法。

(項目214)

環Aが環A3:

【化155】



A3;

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が項目 202 又は 208 で定義した通りである、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 215)

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^x$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^x$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が水素、又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、項目 214 に記載の方法。

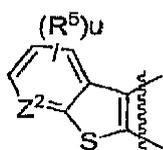
(項目 216)

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^x$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^x$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、項目 215 に記載の方法。

(項目 217)

環 A が環 A4 :

【化 156】



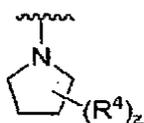
A4;

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が項目 1 で定義した通りである、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 218)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピロリジニル環 :

【化 157】



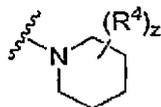
bb.

を形成する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 219)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペリジニル環 :

【化 158】



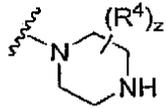
cc.

を形成する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 220)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペラジニル環 :

【化 1 5 9】



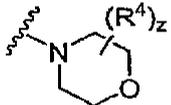
dd.

を形成する、項目 2 0 2 又は 2 0 8 に記載の方法。

(項目 2 2 1)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってモルホリニル環：

【化 1 6 0】



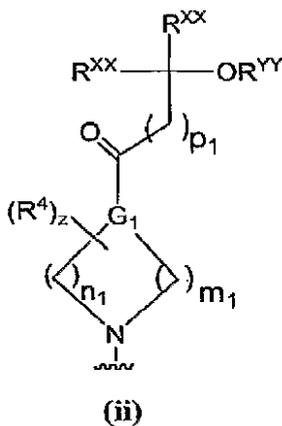
ee.

を形成する、項目 2 0 2 又は 2 0 8 に記載の方法。

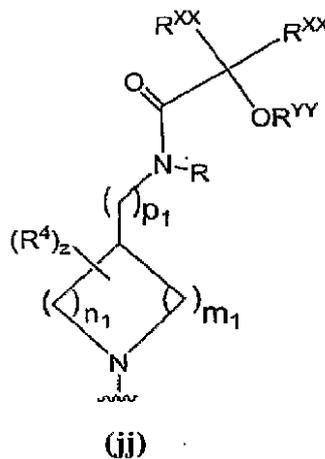
(項目 2 2 2)

 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環 (ii) 又は (jj)：

【化 1 6 1】



(ii)



(jj)

〔式中：

 $G_1$  は、 $-N-$ 、 $-CH-NH-$  又は  $-CH-CH_2-NH-$  であり； $m_1$  及び  $n_1$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_1 + n_1$  が 2 ~ 6 であることを条件とする)； $p_1$  は 0 ~ 2 であり； $z$  は 0 ~ 4 であり；それぞれの  $R^{XX}$  は、水素であるか、 $C_{1-6}$  脂肪族基であるか、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり；ここで  $R^{XX}$  は、 $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{11}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  は 0 ~ 3 であり (但し、両方の  $R^{XX}$  が同時に水素でないことを条件とする)； $R^{YY}$  は、水素、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$  又は  $-PO(R')$  であり；並びに

それぞれ存在する  $R^{11}$  は、独立して  $Q - R^X$  である]  
を形成する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 223)

$R^{XX}$  が C1 - C6 アルキルである、項目 222 に記載の方法。

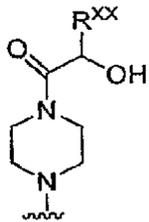
(項目 224)

$R^{YY}$  が水素である、項目 222 に記載の方法。

(項目 225)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環：

**【化 162】**



を形成する、項目 222 に記載の方法。

(項目 226)

$R^{XX}$  が C1 - C6 アルキルである、項目 225 に記載の方法。

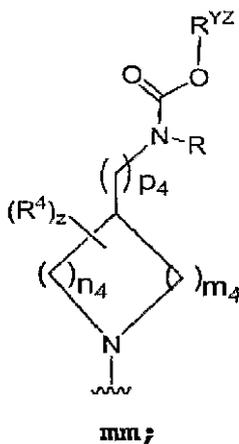
(項目 227)

$R^{XX}$  がメチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル又は t - ブチルである、項目 226 に記載の方法。

(項目 228)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (mm)：

**【化 163】**



[式中：

$m_4$  及び  $n_4$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_4 + n_4$  が 2 ~ 6 であることを条件とする)；

$p_4$  は 1 ~ 2 であり；

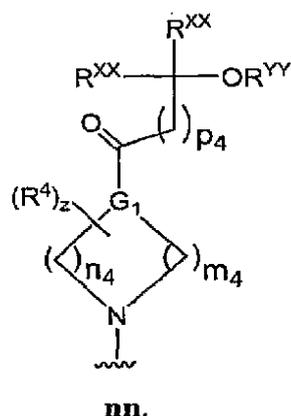
$R^{YZ}$  は、 $w_4$  個の独立して存在する -  $R^{14}$  で場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 脂肪族基であり、 $w_4$  は 0 ~ 3 であり；

それぞれ存在する -  $R^{14}$  は独立して  $Q - R^X$  である]  
を形成する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 229)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (nn)：

## 【化 1 6 4】

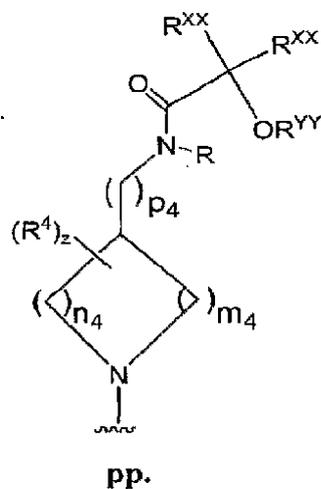


を形成する、項目 2 0 2 又は 2 0 8 に記載の方法。

(項目 2 3 0)

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 ( p p ) :

## 【化 1 6 5】



を形成する、項目 2 0 2 又は 2 0 8 に記載の方法。

(項目 2 3 1)

W が OR' である、項目 2 0 2 ~ 2 3 0 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 3 2)

W が OH である、項目 2 3 1 に記載の方法。

(項目 2 3 3)

y が 0 である、項目 2 0 2 ~ 2 3 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 3 4)

y が 1 である、項目 2 0 2 ~ 2 3 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

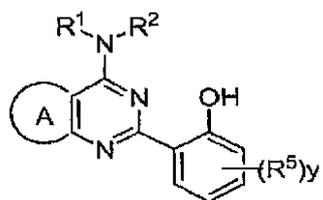
(項目 2 3 5)

$R^5$  が F である、項目 2 3 4 に記載の方法。

(項目 2 3 6)

前記化合物が式 I - A :

【化 1 6 6】



I-A

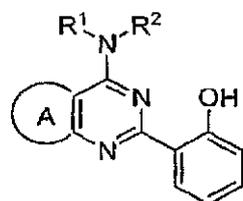
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $y$  及び環 A は、項目 202 又は 208 で定義した通りである)

を有する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 237)

前記化合物が、式 I - A - i :

【化 1 6 7】



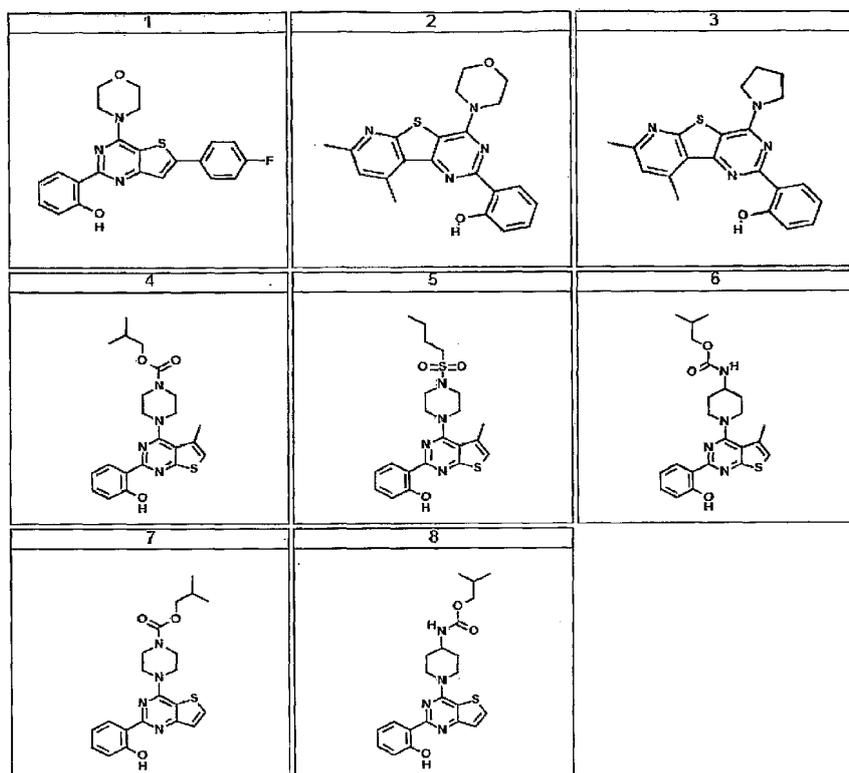
I-A-i;

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び環 A は、項目 202 又は 208 で定義した通りである) を有する、項目 202 又は 208 に記載の方法。

(項目 238)

前記化合物が、

【化 1 6 8】



から選択される、項目 202 又は 208 に記載の方法。

【手続補正 2】

【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

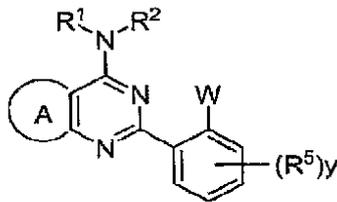
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1 2 4】



I

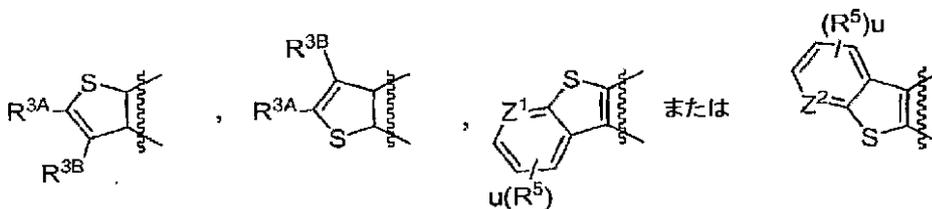
〔式中：

W は、ハロ、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub> 又は CH<sub>2</sub>F であり、

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒に形成する環は、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する - R<sup>4</sup> で場合により及び独立して置換されていてもよく、z は 0 ~ 5 であり；

環 A は、

【化 1 2 5】



A1

A2

A3

A4

であり；

y は 0 ~ 4 であり；

u は 0 ~ 3 であり；

Z<sup>1</sup> 及び Z<sup>2</sup> は、独立して N 又は C - R<sup>5</sup> であり；

それぞれ存在する R<sup>3A</sup>、R<sup>3B</sup>、R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> は、独立して Q - R<sup>x</sup> であり；ここで、Q は、結合であるか、あるいは C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキリデン鎖であって Q の最大 2 個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、- NR -、- S -、- O -、- CS -、- CO<sub>2</sub> -、- OCO -、- CO -、- COCO -、- CONR -、- C(=N - CN)、- NRCO -、- NRCO<sub>2</sub> -、- SO<sub>2</sub>NR -、- NRSO<sub>2</sub> -、- CONRNR -、- NRCONR -、- OCONR -、- NRNR -、- NRSO<sub>2</sub>NR -、- SO -、- SO<sub>2</sub> -、- PO -、- PO<sub>2</sub> -、- OP(O)(OR) - 又は - POR - で

置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する  $R^X$  は、独立して、 $-R'$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$  又は  $-OPO(R')_2$  から選択され；

それぞれ存在する  $R$  は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Y$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する  $R^Y$  は、独立して、 $-R^V$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^V$ 、 $-SR^V$ 、 $-N(R^V)_2$ 、 $-NR^V COR^V$ 、 $-NR^V CON(R^V)_2$ 、 $-NR^V CO_2R^V$ 、 $-COR^V$ 、 $-CO_2R^V$ 、 $-OCOR^V$ 、 $-CON(R^V)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^V)_2$ 、 $-SOR^V$ 、 $-SO_2R^V$ 、 $-SO_2N(R^V)_2$ 、 $-NR^V SO_2R^V$ 、 $-NR^V SO_2N(R^V)_2$ 、 $-COCOR^V$ 、 $-COCH_2COR^V$ 、 $-OP(O)(OR^V)_2$ 、 $-P(O)(OR^V)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^V$ 、 $-P(O)_2OR^V$ 、 $-PO(R^V)_2$  又は  $-OPO(R^V)_2$  から選択され、ここで  $R^V$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；

それぞれ存在する  $R'$  は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する  $R^Z$  は、独立して、 $-R^T$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^T$ 、 $-SR^T$ 、 $-N(R^T)_2$ 、 $-NR^T COR^T$ 、 $-NR^T CON(R^T)_2$ 、 $-NR^T CO_2R^T$ 、 $-COR^T$ 、 $-CO_2R^T$ 、 $-OCOR^T$ 、 $-CON(R^T)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^T)_2$ 、 $-SOR^T$ 、 $-SO_2R^T$ 、 $-SO_2N(R^T)_2$ 、 $-NR^T SO_2R^T$ 、 $-NR^T SO_2N(R^T)_2$ 、 $-COCOR^T$ 、 $-COCH_2COR^T$ 、 $-OP(O)(OR^T)_2$ 、 $-P(O)(OR^T)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^T$ 、 $-P(O)_2OR^T$ 、 $-PO(R^T)_2$  又は  $-OPO(R^T)_2$  から選択され、ここで  $R^T$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する  $R^U$  は、独立して、 $-R^Q$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^Q$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^Q$ 、 $-SR^Q$ 、 $-N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q COR^Q$ 、 $-NR^Q CON(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q CO_2R^Q$ 、 $-COR^Q$ 、 $-CO_2R^Q$ 、 $-OCOR^Q$ 、 $-CON(R^Q)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^Q)_2$ 、 $-SOR^Q$ 、 $-SO_2R^Q$ 、 $-SO_2N(R^Q)_2$ 、 $-NR^Q SO_2R^Q$ 、 $-NR^Q SO_2N(R^Q)_2$ 、 $-COCOR^Q$ 、 $-COCH_2COR^Q$ 、 $-OP(O)(OR^Q)_2$ 、 $-P(O)(OR^Q)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^Q$ 、 $-P(O)_2OR^Q$ 、 $-PO(R^Q)_2$  又は  $-OPO(R^Q)_2$  から選択され、ここで  $R^Q$  は、水素又は非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基であり；あるいは  $R$  及び  $R'$ 、2 個の存在する  $R$ 、又は 2 個の存在する  $R'$  は、これらが結合している原子（1 個又は複数個）と一緒に、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される 0 ~ 4 個の異種原子を有する 3 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する  $R^{T1}$  で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在する  $R^{T1}$  は、独立して、 $-R^S$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR^S$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^S$ 、 $-SR^S$ 、 $-N(R^S)_2$ 、 $-NR^S COR^S$ 、 $-NR^S CON(R^S)_2$ 、 $-NR^S CO_2R^S$ 、 $-COR^S$ 、 $-CO_2R^S$ 、 $-OCOR^S$ 、 $-CON(R^S)_2$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^S)_2$ 、 $-SOR^S$ 、 $-SO_2R^S$ 、 $-SO_2N(R^S)_2$ 、 $-NR^S SO_2R^S$ 、 $-NR^S SO_2N(R^S)_2$ 、 $-COCOR^S$ 、 $-COCH_2COR^S$ 、 $-OP(O)(OR^S)_2$ 、 $-P(O)(OR^S)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^S$ 、 $-P(O)_2OR^S$ 、 $-PO(R^S)_2$  又は  $-OPO(R^S)_2$  から選択され、ここで  $R^S$  は、水素又は

非置換  $C_{1-6}$  脂肪族である；

但し：

A.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、非置換ピペラジン環を形成し、環 A が環 A 1 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ水素であり、W がハロゲンであり且つ y が 1 ~ 4 である場合には、 $R^5$  がニトロ、ハロゲン、 $C_{1-3}$  アルキル又は  $C_{1-3}$  アルコキシでないこと；

B. 環 A が環 A 1 であり、 $R^{3A}$  が水素、 $CO_2H$  又は  $CONH_2$  であり且つ  $R^{3B}$  が水素又はメチルであり、 $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって形成する環が、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する -  $R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、z が 0 ~ 5 であり、W がフルオロであり、y が 1 ~ 2 であり、並びに Q が結合である）場合には、 $R^X$  がハロゲンでないこと；

C.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、非置換アゼパニル環を形成し、環 A が環 A 1 であり且つ  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ水素である場合には、W が  $NMe_2$ 、OMe 又は F でないこと；

D. 環 A が環 A 1 であり、 $R^{3A}$  が水素であり且つ  $R^{3B}$  がメチルであり、 $R^1$  及び  $R^2$  がこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素から選択される 0 ~ 1 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 6 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって形成する環が、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する -  $R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、z が 0 ~ 5 であり、y が 2 であり、Q が結合であり、並びに  $R^X$  がハロゲンである）場合には、W が  $N(R')$  でないこと；

E.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成する（ここで  $R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって形成する環が、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する -  $R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、z が 0 ~ 5 であり、W がハロゲン、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')_2$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^X$  であり、環 A が環 A 2 であり並びに  $R^{3B}$  が  $Q-R^X$  である）場合には、 $R^{3A}$  がシアノでないこと；

F.  $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、場合により及び独立して、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z 個の独立して存在する -  $R^4$  で置換されていてもよいモルホリン、チオモルホリン、ピペリジン、ピペラジン、オキサゼパン又はチアゼパン環を形成し、z が 0 ~ 5 であり、W がハロゲン、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')_2$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^X$  であり、環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  のいずれか一つ又はその両方が  $Q-R^X$  であり、並びに Q が  $C_{1-3}$  アルキリデン鎖である場合には、 $R^X$  が  $-N(R')_2$  でないこと；並びに

G. 環 A が環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  がそれぞれ  $Q-R^X$  であり、W がハロゲン、 $OR'$ 、 $SR'$ 、 $N(R')_2$ 、 $CHF_2$  又は  $CH_2F$  であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞれの  $R^5$  が独立して  $Q-R^X$  である場合には、 $R^1$  及び  $R^2$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、4 - 置換ピペリジン環を形成せず、ここで z が 1 であり、-  $R^4$  が  $Q-R^X$  であり、Q が結合であり且つ  $R^X$  が  $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-NR'SO_2R'$  であるか、あるいは z が 1 であり且つ -  $R^4$  が 1 - メトキシメチル、1 - メトキシプロパン - 2 - オール又は 1 - エトキシプロパン - 2 - オールであること；

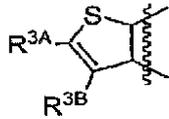
を条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩。

## 【請求項 2】

環 A が環 A 1 :

## 【化 1 2 6】



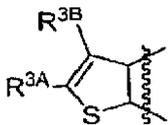
A1;

であり並びに  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が請求項 1 で定義した通りである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

環 A が環 A 2 :

## 【化 1 2 7】



A2;

であり並びに  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が請求項 1 で定義した通りである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり並びに  $R^X$  が  $-R'$  である、請求項 2 又は 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が、水素、0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 5 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

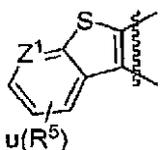
## 【請求項 6】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が水素、非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 3 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 5 ~ 6 員完全不飽和単環式環から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

環 A が環 A 3 :

## 【化 1 2 8】



A3;

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が請求項 1 で定義した通りである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が

- R' であり及び - R' が水素、又は 0 ~ 5 個の存在する R<sup>Z</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1</sub> - 6 脂肪族基から選択される、請求項 7 に記載の化合物。

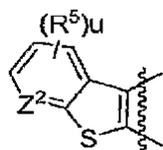
【請求項 9】

Z<sup>1</sup> が N であり、u が 1 ~ 3 であり、R<sup>5</sup> が Q - R<sup>X</sup> であり、Q が結合であり、R<sup>X</sup> が - R' であり及び - R' が非置換 C<sub>1</sub> - 6 脂肪族基から選択される、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

環 A が環 A 4 :

【化 1 2 9】



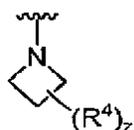
**A4;**

であり並びに Z<sup>1</sup>、R<sup>5</sup> 及び u が請求項 1 で定義した通りである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってアゼチジニル環 :

【化 1 3 0】



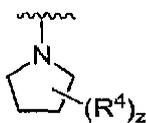
**aa.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってピロリジニル環 :

【化 1 3 1】



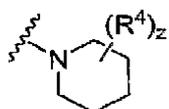
**bb.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってピペリジニル環 :

【化 1 3 2】



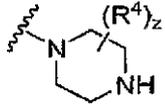
**cc.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってピペラジニル環 :

【化 1 3 3】

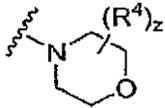
**dd.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってモルホリニル環：

【化 1 3 4】

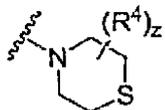
**ee.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってチオモルホリニル環：

【化 1 3 5】

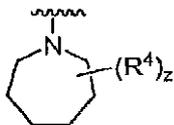
**ff.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってアゼパニル環：

【化 1 3 6】

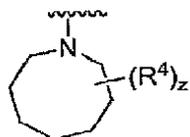
**gg.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になってアゾカニル環：

【化 1 3 7】

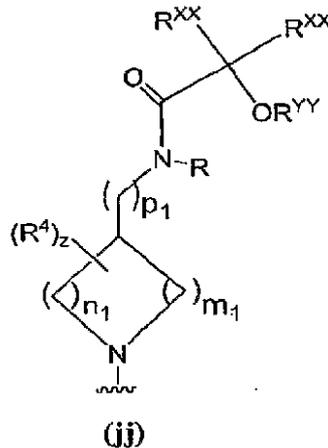
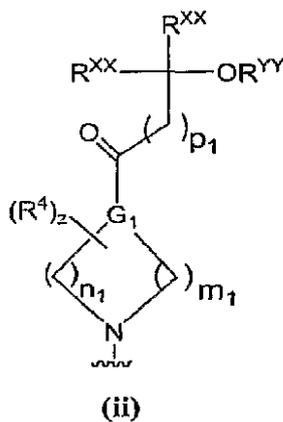
**hh.**

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が一緒になって以下に示す環 ( i i ) 又は ( j j ) :

## 【化 1 3 8】



〔式中：

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

$m_1$  及び  $n_1$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり（但し、 $m_1 + n_1$  が 2 ~ 6 であることを条件とする）；

$p_1$  は 0 ~ 2 であり；

$z$  は 0 ~ 4 であり；

それぞれの  $R^{XX}$  は、水素であるか、 $C_{1-6}$  脂肪族基であるか、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり；ここで  $R^{XX}$  は、 $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{11}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  は 0 ~ 3 であり（但し、両方の  $R^{XX}$  が同時に水素でないことを条件とする）；

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

それぞれ存在する  $R^{11}$  は、独立して  $Q-R^X$  である〕

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 20】

一方の  $R^{XX}$  が水素であり且つ他方の  $R^{XX}$  が水素でない、請求項 19 に記載の化合物

## 【請求項 21】

両方の  $R^{XX}$  が水素でない、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 22】

$p_1$  が 0 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 23】

$p_1$  が 1 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 24】

$p_1$  が 2 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 25】

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 1 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 26】

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 2 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 27】

$m_1$  及び  $n_1$  がそれぞれ 3 である、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 28】

$R^{XX}$  が  $C_{1-6}$  脂肪族基であり、ここで  $R^{XX}$  が  $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{11}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、請求項 19 ~ 27 のいずれか

1 項に記載の化合物。

【請求項 29】

$R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する -  $R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよい C 1 - C 6 アルキルであり、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、請求項 19 ~ 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

$R^{X X}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 19 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 31】

$R^{X X}$  が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する -  $R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 32】

$R^{X X}$  が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する -  $R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 33】

$R^{X X}$  が、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、ここで  $R^{X X}$  が  $w_1$  個の独立して存在する -  $R^{1 1}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  が 0 ~ 3 である、請求項 32 に記載の化合物。

【請求項 34】

$R^{Y Y}$  が、水素、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)<sub>2</sub>OR' 又は -PO(R') である、請求項 19 ~ 33 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 35】

$R^{Y Y}$  が水素である、請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 36】

$R^{Y Y}$  が、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)<sub>2</sub>OR' 又は -PO(R') である、請求項 34 に記載の化合物。

【請求項 37】

R が水素である、請求項 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 38】

R が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 39】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 19 ~ 36 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 40】

$R^{Y Y}$  が水素であり、一方の  $R^{X X}$  が水素であり且つ他方の  $R^{X X}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 19 に記載の化合物。

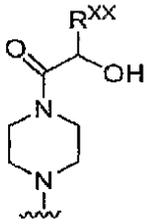
【請求項 41】

$p_1$  が 0 であり、 $R^{Y Y}$  が水素であり、一方の  $R^{X X}$  が水素であり且つ他方の  $R^{X X}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 42】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環：

## 【化 1 3 9】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4 3】

$R^{XX}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

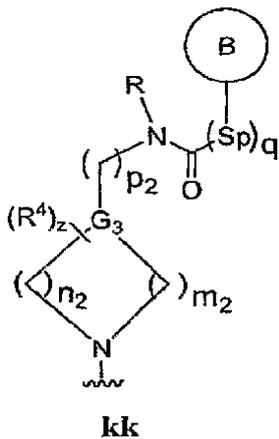
## 【請求項 4 4】

$R^{XX}$  がメチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル又は t - ブチルである、請求項 4 3 に記載の化合物。

## 【請求項 4 5】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環 (kk) :

## 【化 1 4 0】



〔式中：

$G_3$  は、- N - 又は CH であり；

$m_2$  及び  $n_2$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり（但し、 $m_2 + n_2$  が 2 ~ 6 であることを条件とする）；

$p_2$  は 0 ~ 2 であり（但し、 $G_3$  が N である場合には、 $p_2$  が 0 でないことを条件とする）；

$q_2$  は 0 又は 1 であり；

$z$  は 0 ~ 4 であり；

$Sp$  は、結合であるか又は C 1 - C 6 アルキリデンリンカーであり、ここで最大 2 個までのメチレン単位は、場合により及び独立して、- O -、- S -、- CO -、- CS -、- COCO -、- CONR' -、- CONR'NR' -、- CO<sub>2</sub> -、- C(=N-CN)、- OCO -、- NR'CO<sub>2</sub> -、- NR'CONR' -、- OCONR' -、- NR'NR'、- NR'NR'CO -、- NR'CO -、- SO、- SO<sub>2</sub> -、- NR' -、- SO<sub>2</sub>NR' -、NR'SO<sub>2</sub> - 又は - NR'SO<sub>2</sub>NR' - で置換されていてもよく；

環 B は、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環 B は、 $w_2$  個の独立して存在する -  $R^1$   $R^2$  で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  は 0 ~ 4 であり；それぞれ存在する  $R^1$   $R^2$  は独立して Q -  $R^X$  である]

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4 6】

$G_3$  が N である、請求項 4\_5 に記載の化合物。

【請求項 4\_7】

$G_3$  が CH である、請求項 4\_5 に記載の化合物。

【請求項 4\_8】

$p_2$  が 0 である、請求項 4\_5 ~ 4\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 4\_9】

$p_2$  が 1 である、請求項 4\_5 ~ 4\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_0】

$p_2$  が 2 である、請求項 4\_5 ~ 4\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_1】

$q_2$  が 0 である、請求項 4\_5 ~ 5\_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_2】

$q_2$  が 1 である、請求項 4\_5 ~ 5\_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_3】

$p_2$  が 1 であり、及び  $q_2$  が 1 である、請求項 4\_5 に記載の化合物。

【請求項 5\_4】

$G_3$  が CH であり、 $p_2$  が 0 であり、及び  $q_2$  が 1 である、請求項 4\_5 に記載の化合物

。

【請求項 5\_5】

$m_2$  及び  $n_2$  がそれぞれ 1 である、請求項 4\_5 ~ 5\_4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_6】

$m_2$  及び  $n_2$  がそれぞれ 2 である、請求項 4\_5 ~ 5\_4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_7】

$S_p$  が -O-、-S- 又は -NR'- から選択される、請求項 4\_5 ~ 5\_6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_8】

$S_p$  が -O- である、請求項 4\_5 ~ 5\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5\_9】

$S_p$  が -NR'- である、請求項 4\_5 ~ 5\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_0】

$S_p$  が -NH- である、請求項 4\_5 ~ 5\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_1】

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環 B が  $w_2$  個の独立して存在する -R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  が 0 ~ 4 である、請求項 4\_5 ~ 6\_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_2】

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B が  $w_2$  個の独立して存在する -R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  が 0 ~ 4 である、請求項 4\_5 ~ 6\_1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_3】

環 B が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環 B が  $w_2$  個の独立して存在する -R<sup>1 2</sup> で場合により置換されていてもよく、 $w_2$  が 0 ~ 4 である、請求項 4\_5 ~ 6\_2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_4】

$w_2$  が 0 である、請求項 4\_5 ~ 6\_3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6\_5】

環 B がテトラヒドロフラニルである、請求項 4\_5 ~ 6\_4 のいずれか 1 項に記載の化合物

。

【請求項 6\_6】

$S p$  が結合、 $O$  又は  $-O-CH_2-$  であり； $p_2$  が 1 であり； $R$  が水素であり；且つ  $m_2$  及び  $n_2$  が両方同時に 1 又は 2 である、請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 6 7】

$R$  が水素である、請求項 4 5 ~ 6 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6 8】

$R$  が  $C_1 - C_6$  アルキルである、請求項 6 7 に記載の化合物。

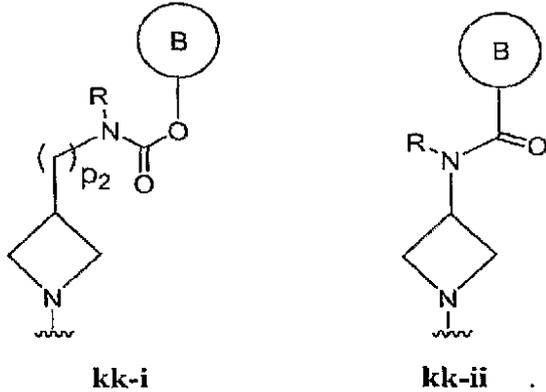
【請求項 6 9】

$R$  がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 0】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって式 (kk-i) 又は式 (kk-ii) :

【化 1 4 1】



の環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7 1】

環  $B$  が、 $O$ 、 $S$  又は  $N$  から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環  $B$  が  $w_2$  個の独立して存在する  $-R^1$   $^2$  で場合により置換されているとしてもよく、 $w_2$  が 0 ~ 4 である、請求項 7 0 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

$R$  が水素である、請求項 7 0 ~ 7 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 3】

$R$  が水素であり及び環  $B$  がテトラヒドロフランルである、請求項 7 2 に記載の化合物。

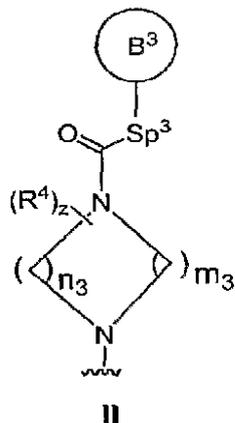
【請求項 7 4】

$S p$  が結合、 $-O-$  又は  $-O-CH_2-$  である、請求項 7 0 ~ 7 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7 5】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (II) :

【化 1 4 2】



〔式中：

$m_3$  及び  $n_3$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_3 + n_3$  が 2 ~ 6 であることを条件とする) ;

$z$  は 0 ~ 4 であり ;

$Sp^3$  は、-O-、-S-、-NR'-、又は C1 - C6 アルキリデンリンカーであり、ここで最大 2 個までのメチレン単位は、場合により及び独立して、-O-、-S-、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR'-、-CONR'NR'-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-NR'CO<sub>2</sub>-、-NR'CONR'-、-OCONR'-、-NR'NR'、-NR'NR'CO-、-NR'CO-、-SO、-SO<sub>2</sub>-、-NR'-、-SO<sub>2</sub>NR'-、NR'SO<sub>2</sub>- 又は -NR'SO<sub>2</sub>NR'- で置換されていてもよく (但し、 $Sp^3$  は、カルボニル基に、炭素原子以外の原子を介して結合されることを条件とする) ;

環  $B^3$  は、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環  $B^3$  は、 $w_3$  個の独立して存在する -R<sup>1</sup><sub>3</sub> で場合により置換されていてもよく、 $w_3$  は 0 ~ 4 であり ;

それぞれ存在する R<sup>1</sup><sub>3</sub> は独立して Q - R<sup>x</sup> である ]

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 76】

$Sp^3$  が -O-、-S- 又は -NR'- から選択される、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 77】

$Sp^3$  が -O- である、請求項 75 ~ 76 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 78】

$Sp^3$  が -O-CH<sub>2</sub>- である、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 79】

$Sp^3$  が -NR'- である、請求項 76 に記載の化合物。

【請求項 80】

$Sp^3$  が -NH- である、請求項 76 に記載の化合物。

【請求項 81】

$Sp^3$  が -NH-CH<sub>2</sub>- である、請求項 76 に記載の化合物。

【請求項 82】

$m_3$  及び  $n_3$  のそれぞれが 1 である、請求項 75 ~ 81 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 83】

$m_3$  及び  $n_3$  が 2 である、請求項 75 ~ 81 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 84】

環  $B^3$  が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は芳香族単環式複素環であり、ここで環  $B^3$  が  $w_3$  個の独立して存在する -R<sup>1</sup><sub>3</sub> で場合により置換されていてもよく、 $w_3$  が 0 ~ 4 である、請求項 75 ~ 83 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 85】

環  $B^3$  が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 4 個の異種原子を有する 4 ~ 8 員飽和単環式複素環であり、ここで環  $B^3$  が  $w_3$  個の独立して存在する -R<sup>1</sup><sub>3</sub> で場合により置換されていてもよく、 $w_3$  が 0 ~ 4 である、請求項 84 に記載の化合物。

【請求項 86】

環  $B^3$  が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環  $B^3$  が  $w_3$  個の独立して存在する -R<sup>1</sup><sub>3</sub> で場合により置換されていてもよく、 $w_3$  が 0 ~ 4 である、請求項 75 ~ 83 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 87】

$w_3$  が 0 である、請求項 75 ~ 86 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 88】

環  $B^3$  がテトラヒドロフランである、請求項 7\_5 ~ 8\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8\_9】

$S p^3$  が結合、O 又は  $-O-CH_2-$  であり；R が水素であり；且つ  $n_3$  及び  $m_3$  が両方同時に 1 又は 2 である、請求項 7\_5 に記載の化合物。

【請求項 9\_0】

R が水素である、請求項 7\_5 ~ 8\_9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9\_1】

R が  $C_1 - C_6$  アルキルである、請求項 7\_5 ~ 9\_0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9\_2】

R がメチル、エチル、プロピル又はブチルである、請求項 9\_1 に記載の化合物。

【請求項 9\_3】

z が 0 である、請求項 7\_5 ~ 9\_2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

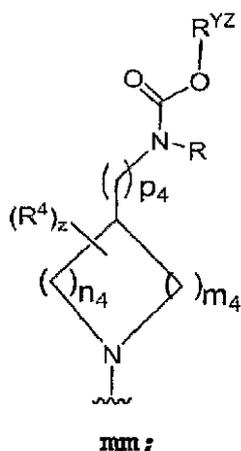
【請求項 9\_4】

環  $B^3$  が、O、S 又は N から選択される 1 ~ 2 個の異種原子を有する 5 ~ 6 員飽和単環式複素環であり、ここで環  $B^3$  が  $w_3$  個の独立して存在する  $-R^{1_3}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_3$  が 0 ~ 4 である、請求項 7\_5 ~ 8\_3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9\_5】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (mm)：

【化 1 4 3】



〔式中：

$m_4$  及び  $n_4$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり（但し、 $m_4 + n_4$  が 2 ~ 6 であることを条件とする）；

$p_4$  は 1 ~ 2 であり；

$R^{YZ}$  は、場合により  $w_4$  個の独立して存在する  $-R^{1_4}$  で置換されていてもよい  $C_1 - C_6$  脂肪族基であり、ここで  $w_4$  は 0 ~ 3 であり；

それぞれ存在する  $-R^{1_4}$  は独立して  $Q - R^X$  である〕

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9\_6】

$p_4$  が 1 である、請求項 9\_5 に記載の化合物。

【請求項 9\_7】

$p_4$  が 2 である、請求項 9\_6 に記載の化合物。

【請求項 9\_8】

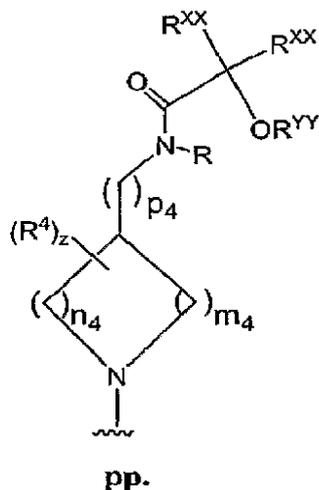
$m_4$  及び  $n_4$  がそれぞれ 1 である、請求項 9\_4 ~ 9\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9\_9】

$m_4$  及び  $n_4$  がそれぞれ 2 である、請求項 9\_4 ~ 9\_7 のいずれか 1 項に記載の化合物。



【化 1 4 5】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 1 4】

$R^{YY}$  が水素であり、一方の  $R^{XX}$  が水素であり、且つ他方の  $R^{XX}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 1 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 1 5】

$p_4$  が 0 であり、 $R^{YY}$  が水素であり、一方の  $R^{XX}$  が水素であり、且つ他方の  $R^{XX}$  が C 1 - C 6 アルキルである、請求項 1 0 7 ~ 1 1 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 1 6】

W が OR' である、請求項 1 ~ 1 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 1 7】

W が OH である、請求項 1 1 6 に記載の化合物。

【請求項 1 1 8】

W が SR' である、請求項 1 ~ 1 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 1 9】

W が SH である、請求項 1 1 8 に記載の化合物。

【請求項 1 2 0】

W が  $N(R')_2$  である、請求項 1 ~ 1 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 2 1】

W が  $NHR'$  である、請求項 1 2 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2 2】

W が  $NH_2$  である、請求項 1 2 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2 3】

W が  $CHF_2$  又は  $CH_2F$  である、請求項 1 ~ 1 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 2 4】

W が  $CHF_2$  である、請求項 1 2 3 に記載の化合物。

【請求項 1 2 5】

W が  $CH_2F$  である、請求項 1 2 3 に記載の化合物。

【請求項 1 2 6】

z が 0 ~ 5 である、請求項 1 ~ 1 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 2 7】

z が 1 ~ 3 である、請求項 1 2 6 に記載の化合物。

【請求項 1 2 8】

z が 1 ~ 2 である、請求項 1 2 7 に記載の化合物。

【請求項 1 2 9】

z が 1 である、請求項 1 2 8 に記載の化合物。

## 【請求項 130】

R<sup>4</sup> が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、-N(R')<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OR'、-CH<sub>2</sub>OR'、-SR'、-CH<sub>2</sub>SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、COR'、-NHCOOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub> であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>脂肪族基、アリアル、ヘテロアリアル、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリアルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、ヘテロアリアルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル又はヘテロ脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、請求項 1 ~ 129 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 131】

R<sup>4</sup> が、独立して、Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CN、-COOH、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-N(Et)<sub>2</sub>、-N(iPr)<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-COOCH<sub>3</sub>、-OH、-CH<sub>2</sub>OH、-NHCOCH<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、-SO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(O)OCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(O)NHCH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NHCOOCH<sub>3</sub>、-C(O)C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-COO(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(O)NHCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(O)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> であるか、あるいは -ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub>アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH<sub>2</sub>シクロヘキシル、ピリジル、-CH<sub>2</sub>ピリジル又は -CH<sub>2</sub>チアゾリルから選択される場合により置換されていてもよい基である、請求項 130 に記載の化合物。

## 【請求項 132】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R'、-NRCOOR' 又は -NRCOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 133】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R' である、請求項 132 に記載の化合物。

## 【請求項 134】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOOR' である、請求項 132 に記載の化合物。

## 【請求項 135】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 1 - イル (aa) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOR' である、請求項 132 に記載の化合物。

## 【請求項 136】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピロリジン - 1 - イル (bb) であり、z が 1 又は 2 であり並びに R<sup>4</sup> が Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OR' 又は -CH<sub>2</sub>OR' である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 137】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が Cl、Br、F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OR' 又は -CH<sub>2</sub>OR'、-NRSO<sub>2</sub>R'、-NRCOOR' あるいは -OCON(R')<sub>2</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 138】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が F、CF<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-

OR'、又は -CH<sub>2</sub>OR' である、請求項 137 に記載の化合物。

【請求項 139】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRSO<sub>2</sub>R' である、請求項 137 に記載の化合物。

【請求項 140】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペリジン - 1 - イル (cc) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -NRCOOR' である、請求項 137 に記載の化合物。

【請求項 141】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR' 又は -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 142】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SOR' である、請求項 141 に記載の化合物。

【請求項 143】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COOR' である、請求項 141 に記載の化合物。

【請求項 144】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -CON(R')<sub>2</sub> である、請求項 141 に記載の化合物。

【請求項 145】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub> である、請求項 141 に記載の化合物。

【請求項 146】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいピペラジン - 1 - イル (dd) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COR' である、請求項 141 に記載の化合物。

【請求項 147】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 又は 2 であり並びに少なくとも 1 個の存在する R<sup>4</sup> が -SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR' 又は -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 148】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -SOR' である、請求項 147 に記載の化合物。

【請求項 149】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -COOR' である、請求項 147 に記載の化合物。

【請求項 150】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) 又はチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり並びに R<sup>4</sup> が -

CON(R')<sub>2</sub>である、請求項147に記載の化合物。

【請求項151】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン-1-イル(ee)又はチオモルホリン-1-イル(ff)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>である、請求項147に記載の化合物。

【請求項152】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン-1-イル(ee)又はチオモルホリン-1-イル(ff)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COR'である、請求項147に記載の化合物。

【請求項153】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1又は2であり並びに少なくとも1個の存在するR<sup>4</sup>が-SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR'又は-COOR'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項154】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SOR'である、請求項153に記載の化合物。

【請求項155】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COOR'である、請求項153に記載の化合物。

【請求項156】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-CON(R')<sub>2</sub>である、請求項153に記載の化合物。

【請求項157】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>である、請求項153に記載の化合物。

【請求項158】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼパン-1-イル(gg)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COR'である、請求項153に記載の化合物。

【請求項159】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1又は2であり並びに少なくとも1個の存在するR<sup>4</sup>が-SOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COR'又は-COOR'である、請求項1に記載の化合物。

【請求項160】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-SOR'である、請求項159に記載の化合物。

【請求項161】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-COOR'である、請求項159に記載の化合物。

【請求項162】

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン-1-イル(hh)であり、zが1であり並びにR<sup>4</sup>が-CON(R')<sub>2</sub>である、請求項159に

記載の化合物。

【請求項 163】

$R^1$  及び  $R^2$  が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン - 1 - イル ( $hh$ ) であり、 $z$  が 1 であり並びに  $R^4$  が  $-SO_2N(R')$ <sub>2</sub> である、請求項 159 に記載の化合物。

【請求項 164】

$R^1$  及び  $R^2$  が、一緒になって、場合により置換されていてもよいアゾカン - 1 - イル ( $hh$ ) であり、 $z$  が 1 であり並びに  $R^4$  が  $-COR'$  である、請求項 159 に記載の化合物。

【請求項 165】

$y$  が 0 ~ 4 である、請求項 131 ~ 164 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 166】

$y$  が 0 である、請求項 165 に記載の化合物。

【請求項 167】

$y$  が 1 ~ 3 である、請求項 165 に記載の化合物。

【請求項 168】

$y$  が 1 ~ 2 である、請求項 167 に記載の化合物。

【請求項 169】

$y$  が 1 である、請求項 167 に記載の化合物。

【請求項 170】

それぞれの  $R^5$  が、独立して、ハロゲン、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-N(R')$ <sub>2</sub>、 $-CH_2N(R')$ <sub>2</sub>、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')$ <sub>2</sub>、 $-S(O)_2N(R')$ <sub>2</sub>、 $-OCOR'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCON(R')$ <sub>2</sub>、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-OP(O)(OR')$ <sub>2</sub>、 $-P(O)(OR')$ <sub>2</sub>、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')$ <sub>2</sub>、 $-OPO(R')$ <sub>2</sub> であるか、あるいは  $C_1 - C_6$  脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリール  $C_1 - C_6$  アルキル、ヘテロアリール  $C_1 - C_6$  アルキル、脂環式  $C_1 - C_6$  アルキル又はヘテロ脂環式  $C_1 - C_6$  アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、請求項 131 ~ 169 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 171】

それぞれの  $R^5$  が、独立して、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $F$ 、 $CF_3$ 、 $Me$ 、 $Et$ 、 $CN$ 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(iPr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC(CH_3)_2$ 、 $-OCCO(CH_3)_3$ 、 $-OCOCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ 、4 -  $CH_3$  - ピペラジン - 1 - イル、 $-OCOCH(CH_3)_2$ 、 $-OCO$  (シクロペンチル)、 $-COCH_3$ 、場合により置換されていてもよいフェノキシ又は場合により置換されていてもよいベンジルオキシである、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 172】

$R^5$  が  $F$  である、請求項 171 に記載の化合物。

【請求項 173】

$R^5$  が  $OR'$  である、請求項 170 に記載の化合物。

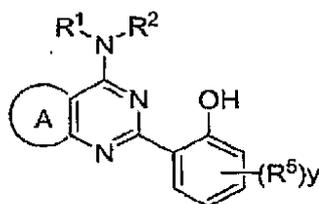
【請求項 174】

$R^5$  が  $OH$  である、請求項 173 に記載の化合物。

【請求項 175】

前記化合物が式 I - A :

【化 1 4 6】



## I-A

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $y$  及び環 A は、請求項 1 で定義した通りである) を有する、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩。

【請求項 1 7 6】

環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  の一つが水素であるか又は  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  の両方が水素である、請求項 1 7 5 に記載の化合物。

【請求項 1 7 7】

環 A が環 A 1 又は環 A 2 であり、 $R^{3A}$  又は  $R^{3B}$  のそれぞれが独立して  $Q - R^X$  である、請求項 1 7 6 に記載の化合物。

【請求項 1 7 8】

Q が C 1 - C 6 アルキリデンである、請求項 1 7 7 に記載の化合物。

【請求項 1 7 9】

Q が C 1 - C 4 アルキリデンである、請求項 1 7 7 に記載の化合物。

【請求項 1 8 0】

Q が  $-CH_2-$  である、請求項 1 7 7 に記載の化合物。

【請求項 1 8 1】

Q が結合であり及びそれぞれの  $R^X$  が、独立して、 $-R'$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')$ 、 $(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$  又は  $-OPO(R')_2$  から選択される、請求項 1 7 7 に記載の化合物。

【請求項 1 8 2】

Q が結合であり及びそれぞれの  $R^X$  が、独立して、ハロゲン、CN、 $NO_2$ 、 $-N(R')$ 、 $(R')_2$ 、 $-CH_2N(R')_2$ 、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-COOR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $COR'$ 、 $-NHCOOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$  であるか、あるいは C 1 - C 6 脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリール C 1 - C 6 アルキル、ヘテロアリール C 1 - C 6 アルキル、脂環式 C 1 - C 6 アルキル又はヘテロ脂環式 C 1 - C 6 アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、請求項 1 7 7 に記載の化合物。

【請求項 1 8 3】

それぞれの  $R^X$  が独立して  $R'$  である、請求項 1 8 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8 4】

環 A が環 A 3 又は A 4 であり及びそれぞれの  $R^5$  が水素である、請求項 1 7 5 に記載の化合物。

【請求項 1 8 5】

環 A が環 A 3 又は A 4 であり、u が 1 ~ 3 であり及びそれぞれの  $R^5$  が独立して  $Q - R^X$  である、請求項 1 7 5 に記載の化合物。

【請求項 1 8 6】

Q が C 1 - C 6 アルキリデンである、請求項 1 8 5 に記載の化合物。

【請求項 1 8 7】

QがC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキリデンである、請求項185に記載の化合物。

【請求項188】

Qが-CH<sub>2</sub>-である、請求項185に記載の化合物。

【請求項189】

Qが結合であり及びR<sup>x</sup>が、独立して、-R'、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>又は-OP(O)(R')<sub>2</sub>から選択される、請求項185に記載の化合物。

【請求項190】

R<sup>x</sup>がR'である、請求項185に記載の化合物。

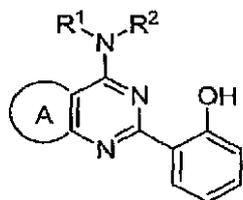
【請求項191】

Qが結合であり及びそれぞれのR<sup>x</sup>が、独立して、ハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、-N(R')<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-OR'、-CH<sub>2</sub>OR'、-SR'、-CH<sub>2</sub>SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、COR'、-NHCOOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>脂肪族基、アリール、ヘテロアリール、脂環式基、ヘテロ脂環式基、アリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル又はヘテロ脂環式C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルから選択される場合により置換されていてもよい基である、請求項185に記載の化合物。

【請求項192】

前記化合物が、式I-A-i:

【化147】



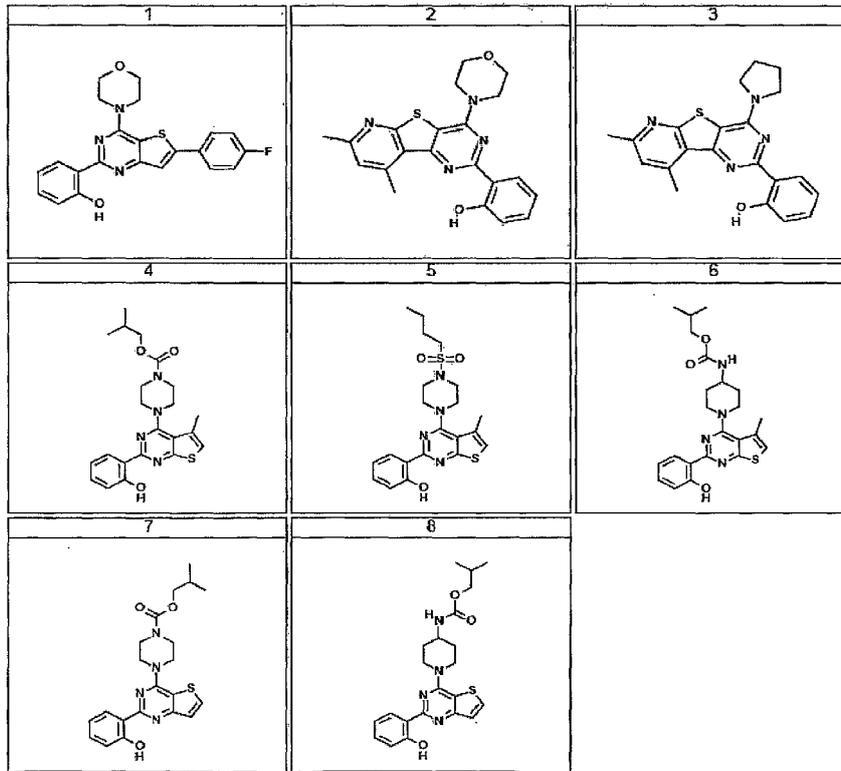
I-A-i;

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及び環Aは、請求項1で定義した通りである)を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項193】

前記化合物が、

## 【化 1 4 8】



から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 1 9 4】

請求項 1 ~ 1 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と製薬学的に許容し得る補助剤又は担体とを含有する医薬組成物。

## 【請求項 1 9 5】

急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全身神経痛、てんかん又はてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例えば不安及び鬱病、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、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛、激痛又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛あるいは癌性疼痛から選択される疾患、障害又は状態を治療又はそれらの重症度を軽減するための組成物であって、有効量の請求項 1 9 4 に記載の組成物を含む組成物。

## 【請求項 1 9 6】

前記疾患、状態又は障害が電位依存性ナトリウムチャネルの活性化又は過活動に関連している、請求項 1 9 5 に記載の組成物。

## 【請求項 1 9 7】

前記疾患、状態又は障害が急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛である、請求項 1 9 5 に記載の組成物。

## 【請求項 1 9 8】

前記疾患、状態又は障害が神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛である、請求項 1 9 5 に記載の組成物。

## 【請求項 1 9 9】

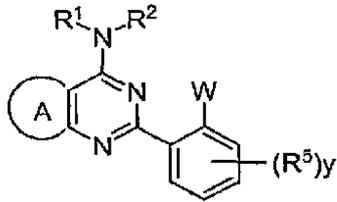
前記疾患、状態又は障害が激痛又は難治性疼痛、急性痛、術後疼痛、背痛あるいは癌性疼痛である、請求項 1 9 5 に記載の組成物。

## 【請求項 2 0 0】

急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、疱疹性神経痛、全身神経痛、てんかん又はてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例

えば不安及び鬱病、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、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、帯状疱疹後神経痛、糖尿病性神経障害、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛、激痛又は難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛あるいは癌性疼痛から選択される疾患、障害又は状態を治療又はそれらの重症度を軽減するための組成物であって、有効量の式 I：

【化 1 4 9】



I

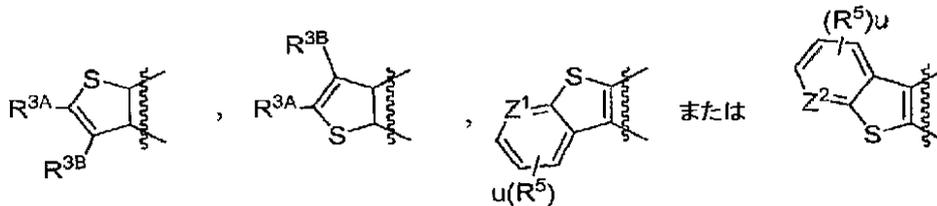
〔式中：

Wは、ハロ、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>Fであり、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、これらが結合している窒素原子と一緒に、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される0～3個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい3～8員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>と一緒に形成する環は、1個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、z個の独立して存在する-R<sup>4</sup>で場合により及び独立して置換されていてもよく、zは0～5であり；

環Aは、

【化 1 5 0】



A1

A2

A3

A4

であり；

yは0～4であり；

uは0～3であり；

Z<sup>1</sup>及びZ<sup>2</sup>は、独立してN又はC-R<sup>5</sup>であり；

それぞれ存在するR<sup>3A</sup>、R<sup>3B</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、独立してQ-R<sup>x</sup>であり；ここで、Qは、結合であるか、あるいはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であってQの最大2個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-C(=N-CN)、-NRCO-、-NRCO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR-、-NRSO<sub>2</sub>-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO<sub>2</sub>NR-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-PO-、-PO<sub>2</sub>-、-OP(O)(OR)-又は-POR-で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキリデン鎖であり；及びそれぞれ存在するR<sup>x</sup>は、独立して、-R'、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-NR'CON(R')<sub>2</sub>、-NR'CO<sub>2</sub>R'、-COR'、-CO<sub>2</sub>R'、-OCOR'、-CON(R')<sub>2</sub>、-OCON(R')<sub>2</sub>、-SOR'、-SO<sub>2</sub>R'、-SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-NR'SO<sub>2</sub>R'、-NR'SO<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、-COCOR'、-COCH<sub>2</sub>COR'、-OP(O)(OR')<sub>2</sub>、-P(O)(OR')<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR'、-P(O)<sub>2</sub>OR'、-PO(R')<sub>2</sub>又は-OP(O)(R')<sub>2</sub>から選択され；

それぞれ存在する R は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する R<sup>Y</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する R<sup>Y</sup> は、独立して、-R<sup>V</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>V</sup>、-SR<sup>V</sup>、-N(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>V</sup>COR<sup>V</sup>、-NR<sup>V</sup>CON(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>V</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>V</sup>、-COR<sup>V</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>V</sup>、-OCOR<sup>V</sup>、-CON(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>V</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>V</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>V</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>V</sup>、-NR<sup>V</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>V</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>V</sup>、-OP(O)(OR<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>V</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>V</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>V</sup>、-PO(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub> 又は -OPO(R<sup>V</sup>)<sub>2</sub> から選択され、ここで R<sup>V</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；

それぞれ存在する R' は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する R<sup>Z</sup> で場合により置換されていてもよい C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する R<sup>Z</sup> は、独立して、-R<sup>T</sup>、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>T</sup>、-SR<sup>T</sup>、-N(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>T</sup>COR<sup>T</sup>、-NR<sup>T</sup>CON(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>T</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-COR<sup>T</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-OCOR<sup>T</sup>、-CON(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>T</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>T</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-NR<sup>T</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>T</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>T</sup>、-OP(O)(OR<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>T</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>T</sup>、-PO(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub> 又は -OPO(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub> から選択され、ここで R<sup>T</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する R<sup>U</sup> で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する R<sup>U</sup> は、独立して、-R<sup>Q</sup>、ハロゲン、=O、=NR<sup>Q</sup>、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>Q</sup>、-SR<sup>Q</sup>、-N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>COR<sup>Q</sup>、-NR<sup>Q</sup>CON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-COR<sup>Q</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-OCOR<sup>Q</sup>、-CON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>Q</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-NR<sup>Q</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>Q</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>Q</sup>、-OP(O)(OR<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>Q</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>Q</sup>、-PO(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub> 又は -OPO(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub> から選択され、ここで R<sup>Q</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基であり；あるいは R 及び R'、2 個の存在する R、又は 2 個の存在する R' は、これらが結合している原子（1 個又は複数個）と一緒に、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される 0 ~ 4 個の異種原子を有する 3 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0 ~ 5 個の存在する R<sup>T1</sup> で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在する R<sup>T1</sup> は、独立して、-R<sup>S</sup>、ハロゲン、=O、=NR<sup>S</sup>、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>S</sup>、-SR<sup>S</sup>、-N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>COR<sup>S</sup>、-NR<sup>S</sup>CON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-COR<sup>S</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-OCOR<sup>S</sup>、-CON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>S</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-NR<sup>S</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>S</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>S</sup>、-OP(O)(OR<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>S</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>S</sup>、-PO(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub> 又は -OPO(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub> から選択され、ここで R<sup>S</sup> は、水素又は非置換 C<sub>1-6</sub> 脂肪族基である；

但し：

G. 環 A が環 A<sub>2</sub> であり、R<sup>3A</sup> 及び R<sup>3B</sup> がそれぞれ Q-R<sup>X</sup> であり、W がハロ、OR'、SR'、N(R')<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub> 又は CH<sub>2</sub>F であり、y が 0 ~ 4 であり、それぞれの R<sup>5</sup> が独立して Q-R<sup>X</sup> である場合には、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、これらが結合している窒素原子と一緒に、4-置換ピペリジン環を形成せず、ここで z が 1 であり、-R<sup>4</sup> が Q-R<sup>X</sup> であり、Q が結合であり且つ R<sup>X</sup> が -N(R')<sub>2</sub>、-NR'COR'、-N

$R'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-NR'SO_2R'$ であるか、あるいは $z$ が1であり且つ $-R^4$ が1-メトキシメチル、1-メトキシプロパン-2-オール又は1-エトキシプロパン-2-オールであることを条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩を含む組成物。

【請求項201】

前記疾患、状態又は障害が電位依存性ナトリウムチャネルの活性化又は過活動に関係している、請求項200に記載の組成物。

【請求項202】

前記疾患、状態又は障害が急性、慢性、神経障害性又は炎症性の疼痛である、請求項200に記載の組成物。

【請求項203】

前記疾患、状態又は障害が神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛又は頸痛である、請求項200に記載の組成物。

【請求項204】

前記疾患、状態又は障害が激痛又は難治性疼痛、急性痛、術後疼痛、背痛又は癌性疼痛である、請求項200に記載の組成物。

【請求項205】

前記疾患が、大腿骨癌性疼痛；非悪性慢性骨痛；関節リウマチ；変形性関節症；脊柱管狭窄症；神経障害性腰痛；神経障害性腰痛；筋筋膜痛症候群；線維筋痛症；顎関節痛；慢性内臓痛、例えば腹痛；膵臓痛；IBS痛；慢性頭痛；片頭痛；緊張性頭痛、例えば群発性頭痛；慢性神経障害性疼痛、例えば帯状疱疹後神経痛；糖尿病性神経障害；HIV関連神経障害；三叉神経痛；シャルコー・マリー・トゥース神経障害；遺伝性感覚性ニューロパシー；末梢神経損傷；有痛性神経腫；異所性近位及び遠位発射；神経根障害；化学療法誘発性神経障害性疼痛；放射線治療誘発性神経障害性疼痛；乳房切除術後疼痛；中枢痛；脊髄損傷疼痛；脳卒中後疼痛；視床痛；複合性局所疼痛症候群；幻痛；難治性疼痛；急性痛、急性術後疼痛；急性筋骨格痛；関節痛；機械的腰痛；頸痛；腱炎；外傷／運動痛；急性内臓痛、例えば腹痛；腎盂腎炎；虫垂炎；胆嚢炎；腸閉塞；ヘルニア、など；胸痛、例えば心臓痛；骨盤痛、腎仙痛、急性分娩痛、例えば陣痛；帝王切開痛；急性炎症性、熱傷及び外傷痛；急性間欠痛、例えば子宮内膜症；急性帯状疱疹疼痛；鎌状赤血球貧血；急性膵炎；突出痛；口腔顔面痛、例えば副鼻腔炎疼痛、歯痛；多発性硬化症(MS)痛；鬱病での疼痛；ハンセン病痛；ベーチェット病痛；有痛脂肪症；静脈炎痛；ギラン・バレー疼痛；痛む脚と動く足趾症候群；ハグランド症候群；先端紅痛症痛；ファブリー病痛；膀胱及び泌尿器疾患、例えば尿失禁；機能亢進膀胱；疼痛性膀胱症候群；間質性膀胱炎(IC)；又は前立腺炎から選択される、請求項200に記載の組成物。

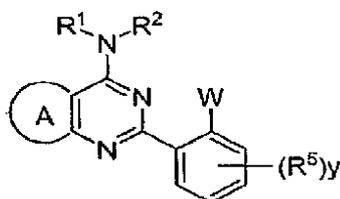
【請求項206】

(a)患者；又は

(b)生物学的試料

における $NaV1.1$ 、 $NaV1.2$ 、 $NaV1.3$ 、 $NaV1.4$ 、 $NaV1.5$ 、 $NaV1.6$ 、 $NaV1.7$ 、 $NaV1.8$ 、 $NaV1.9$ 又は $CaV2.2$ 活性の一つ又はそれ以上を阻害するための組成物であって、式I：

【化151】



I

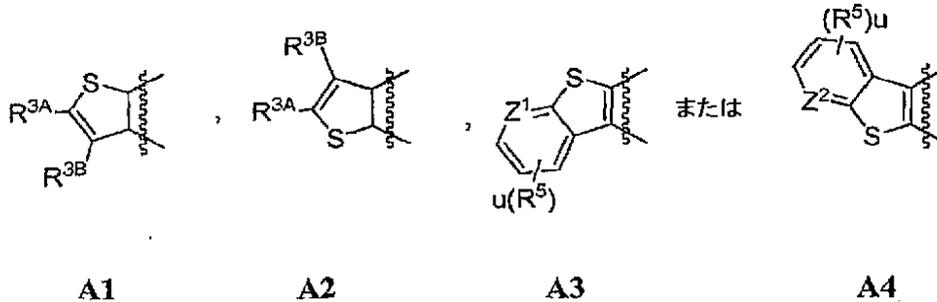
〔式中：

Wは、ハロ、OR'、SR'、 $N(R')$ 、 $CHF_2$ 又は $CH_2F$ であり、

$R^1$  及び  $R^2$  は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、窒素、硫黄又は酸素から独立して選択される 0 ~ 3 個の追加の異種原子を有する場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員単環式飽和又は部分不飽和環を形成し；ここで、 $R^1$  及び  $R^2$  が一緒にあって形成する環は、1 個又はそれ以上の置換可能な炭素原子、窒素原子又は硫黄原子において、 $z$  個の独立して存在する  $-R^4$  で場合により及び独立して置換されていてもよく、 $z$  は 0 ~ 5 であり；

環 A は、

【化 1 5 2】



であり；

$y$  は 0 ~ 4 であり；

$u$  は 0 ~ 3 であり；

$Z^1$  及び  $Z^2$  は、独立して N 又は  $C-R^5$  であり；

それぞれ存在する  $R^{3A}$ 、 $R^{3B}$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は、独立して  $Q-R^X$  であり；ここで、 $Q$  は、結合であるか、あるいは  $C_1-C_6$  アルキリデン鎖であって  $Q$  の最大 2 個までの隣り合わないメチレン単位が、場合により及び独立して、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$  又は  $-POR-$  で置換されていてもよく；及びそれぞれ存在する  $R^X$  は、独立して、 $-R'$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')$ 、 $-OCON(R')$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')$ 、 $-P(O)(OR')$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')$  又は  $-OPO(R')$  から選択され；

それぞれ存在する  $R$  は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Y$  で場合により置換されていてもよい  $C_1-6$  脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する  $R^Y$  は、独立して、 $-R^V$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^V$ 、 $-SR^V$ 、 $-N(R^V)$ 、 $-NR^VCOR^V$ 、 $-NR^VCON(R^V)$ 、 $-NR^VCO_2R^V$ 、 $-COR^V$ 、 $-CO_2R^V$ 、 $-OCOR^V$ 、 $-CON(R^V)$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^V)$ 、 $-SOR^V$ 、 $-SO_2R^V$ 、 $-SO_2N(R^V)$ 、 $-NR^VSO_2R^V$ 、 $-NR^VSO_2N(R^V)$ 、 $-COCOR^V$ 、 $-COCH_2COR^V$ 、 $-OP(O)(OR^V)$ 、 $-P(O)(OR^V)$ 、 $-OP(O)_2OR^V$ 、 $-P(O)_2OR^V$ 、 $-PO(R^V)$  又は  $-OPO(R^V)$  から選択され、ここで  $R^V$  は、水素又は非置換  $C_1-6$  脂肪族基であり；

それぞれ存在する  $R'$  は、独立して、水素であるか又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_1-6$  脂肪族基であり；及びそれぞれ存在する  $R^Z$  は、独立して、 $-R^T$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR^T$ 、 $-SR^T$ 、 $-N(R^T)$ 、 $-NR^TCOR^T$ 、 $-NR^TCON(R^T)$ 、 $-NR^TCO_2R^T$ 、 $-COR^T$ 、 $-CO_2R^T$ 、 $-OCOR^T$ 、 $-CON(R^T)$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-OCON(R^T)$

)<sub>2</sub>、-SOR<sup>T</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>T</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>T</sup>、-NR<sup>T</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>T</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>T</sup>、-OP(O)(OR<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>T</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>T</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>T</sup>、-PO(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>又は-OPO(R<sup>T</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここでR<sup>T</sup>は、水素又は非置換C<sub>1-6</sub>脂肪族基であるか；窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される0~3個の異種原子を有する3~8員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される0~5個の異種原子を有する8~12員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり、前記の単環式環又は二環式環は、0~5個の存在するR<sup>U</sup>で場合により置換されていてもよく；及びそれぞれ存在するR<sup>U</sup>は、独立して、-R<sup>Q</sup>、ハロゲン、=O、=NR<sup>Q</sup>、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>Q</sup>、-SR<sup>Q</sup>、-N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>COR<sup>Q</sup>、-NR<sup>Q</sup>CON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-COR<sup>Q</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-OCOR<sup>Q</sup>、-CON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>Q</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>Q</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>Q</sup>、-NR<sup>Q</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>Q</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>Q</sup>、-OP(O)(OR<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>Q</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>Q</sup>、-PO(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>又は-OPO(R<sup>Q</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここでR<sup>Q</sup>は、水素又は非置換C<sub>1-6</sub>脂肪族基であり；あるいはR及びR'、2個の存在するR、又は2個の存在するR'は、これらが結合している原子(1個又は複数個)と一緒に、窒素、酸素又は硫黄から独立してから選択される0~4個の異種原子を有する3~12員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式又は二環式環を形成し、前記の単環式又は二環式環は、0~5個の存在するR<sup>T1</sup>で場合により置換されていてもよく；且つそれぞれ存在するR<sup>T1</sup>は、独立して、-R<sup>S</sup>、ハロゲン、=O、=NR<sup>S</sup>、-NO<sub>2</sub>、-CN、-OR<sup>S</sup>、-SR<sup>S</sup>、-N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>COR<sup>S</sup>、-NR<sup>S</sup>CON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-COR<sup>S</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-OCOR<sup>S</sup>、-CON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-C(=N-CN)、-OCON(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-SOR<sup>S</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>S</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>S</sup>、-NR<sup>S</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-COCOR<sup>S</sup>、-COCH<sub>2</sub>COR<sup>S</sup>、-OP(O)(OR<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>S</sup>)<sub>2</sub>、-OP(O)<sub>2</sub>OR<sup>S</sup>、-P(O)<sub>2</sub>OR<sup>S</sup>、-PO(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>又は-OPO(R<sup>S</sup>)<sub>2</sub>から選択され、ここでR<sup>S</sup>は、水素又は非置換C<sub>1-6</sub>脂肪族基である；

但し：

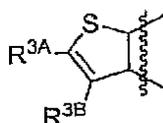
G. 環Aが環A<sub>2</sub>であり、R<sup>3A</sup>及びR<sup>3B</sup>がそれぞれQ-R<sup>X</sup>であり、Wがハロ、OR<sup>'</sup>、SR<sup>'</sup>、N(R<sup>'</sup>)<sub>2</sub>、CHF<sub>2</sub>又はCH<sub>2</sub>Fであり、yが0~4であり、それぞれのR<sup>5</sup>が独立してQ-R<sup>X</sup>である場合には、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>が、これらが結合している窒素原子と一緒に、4-置換ピペリジン環を形成せず、ここでzが1であり、-R<sup>4</sup>がQ-R<sup>X</sup>であり、Qが結合であり且つR<sup>X</sup>が-N(R<sup>'</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>'</sup>COR<sup>'</sup>、-NR<sup>'</sup>CON(R<sup>'</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>'</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>'</sup>、-NR<sup>'</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>'</sup>であるか、あるいはzが1であり且つ-R<sup>4</sup>が1-メトキシメチル、1-メトキシプロパン-2-オール又は1-エトキシプロパン-2-オールであることを条件とする]

の化合物又はその製薬学的に許容し得る塩を含む、組成物。

【請求項207】

環Aが環A<sub>1</sub>：

【化153】



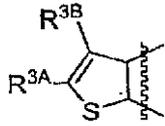
A1;

であり；並びにR<sup>3A</sup>及びR<sup>3B</sup>が請求項200又は206で定義した通りである、請求項202又は208に記載の組成物。

【請求項 208】

環 A が環 A 2 :

【化 154】



**A2;**

であり；並びに  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が請求項 200 又は 206 で定義した通りである、請求項 200 又は 206 に記載の組成物。

【請求項 209】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、並びに  $R^X$  が  $-R'$  である、請求項 207 又は 208 に記載の組成物。

【請求項 210】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が、水素、0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 5 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環から選択される、請求項 209 に記載の組成物。

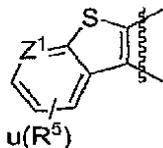
【請求項 211】

$R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり並びに  $-R'$  が水素、非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択されるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有し、0 ~ 3 個の存在する  $R^U$  で場合により置換されていてもよい 5 ~ 6 員完全不飽和単環式環から選択される、請求項 210 に記載の組成物。

【請求項 212】

環 A が環 A 3 :

【化 155】



**A3;**

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が請求項 200 又は 206 で定義した通りである、請求項 200 又は 206 に記載の組成物。

【請求項 213】

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が水素、又は 0 ~ 5 個の存在する  $R^Z$  で場合により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、請求項 212 に記載の組成物。

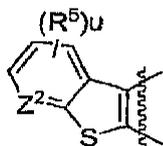
【請求項 214】

$Z^1$  が N であり、 $u$  が 1 ~ 3 であり、 $R^5$  が  $Q - R^X$  であり、 $Q$  が結合であり、 $R^X$  が  $-R'$  であり及び  $-R'$  が非置換  $C_{1-6}$  脂肪族基から選択される、請求項 213 に記載の組成物。

【請求項 215】

環 A が環 A 4 :

【化 1 5 6】

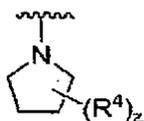
**A4;**

であり並びに  $Z^1$ 、 $R^5$  及び  $u$  が請求項 1 で定義した通りである、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 1 6】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピロリジニル環：

【化 1 5 7】

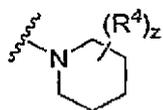
**bb.**

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 1 7】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペリジニル環：

【化 1 5 8】

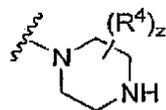
**cc.**

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 1 8】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってピペラジニル環：

【化 1 5 9】

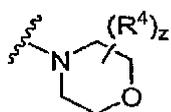
**dd.**

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 1 9】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になってモルホリニル環：

【化 1 6 0】

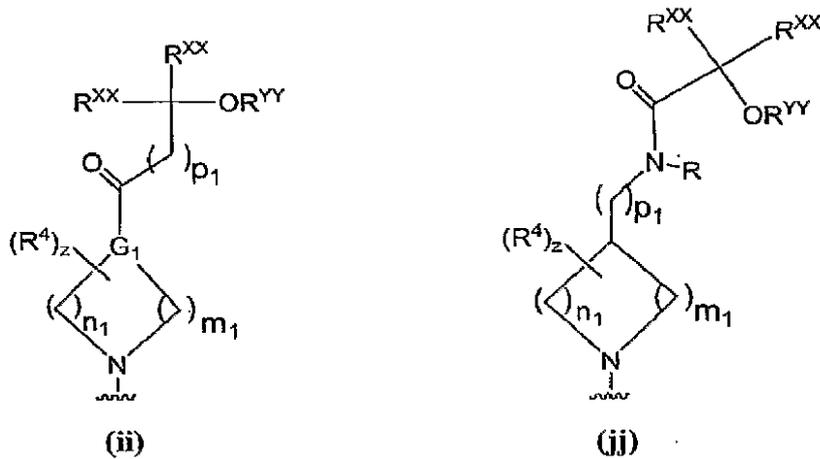
**ee.**

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 2 0】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環 ( i i ) 又は ( j j ) :

## 【化 1 6 1】



〔式中：

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

$m_1$  及び  $n_1$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり（但し、 $m_1 + n_1$  が 2 ~ 6 であることを条件とする）；

$p_1$  は 0 ~ 2 であり；

$z$  は 0 ~ 4 であり；

それぞれの  $R^{XX}$  は、水素であるか、 $C_{1-6}$  脂肪族基であるか、窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 3 個の異種原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和単環式環であるか、あるいは窒素、酸素又は硫黄から独立して選択される 0 ~ 5 個の異種原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和又は完全不飽和二環式環系であり；ここで  $R^{XX}$  は、 $w_1$  個の独立して存在する  $-R^{11}$  で場合により置換されていてもよく、 $w_1$  は 0 ~ 3 であり（但し、両方の  $R^{XX}$  が同時に水素でないことを条件とする）；

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

それぞれ存在する  $R^{11}$  は、独立して  $Q-R^X$  である〕

を形成する、請求項 200 又は 206 に記載の組成物。

【請求項 221】

$R^{XX}$  が  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 220 に記載の組成物。

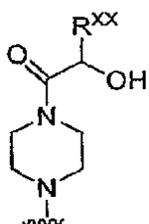
【請求項 222】

$R^{YY}$  が水素である、請求項 220 に記載の組成物。

【請求項 223】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって以下に示す環：

【化 1 6 2】



を形成する、請求項 220 に記載の組成物。

【請求項 224】

$R^{XX}$  が  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 223 に記載の組成物。

【請求項 225】

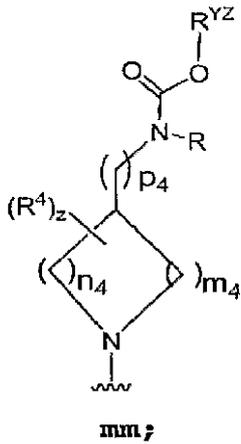
$R^{XX}$  がメチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、 $n$ -ブチル、イソブチル又は  $t$ -ブチ

ルである、請求項 2 2 4 に記載の組成物。

【請求項 2 2 6】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (mm) :

【化 1 6 3】



〔式中：

$m_4$  及び  $n_4$  のそれぞれは、独立して 0 ~ 3 であり (但し、 $m_4 + n_4$  が 2 ~ 6 であることを条件とする) ;

$p_4$  は 1 ~ 2 であり ;

$R^{YZ}$  は、 $w_4$  個の独立して存在する  $-R^{14}$  で場合により置換されていてもよい  $C_1$  -  $C_6$  脂肪族基であり、 $w_4$  は 0 ~ 3 であり ;

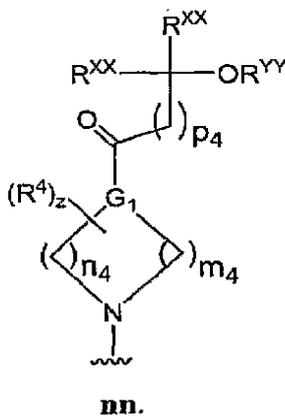
それぞれ存在する  $-R^{14}$  は独立して  $Q-R^X$  である]

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 2 7】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (nn) :

【化 1 6 4】

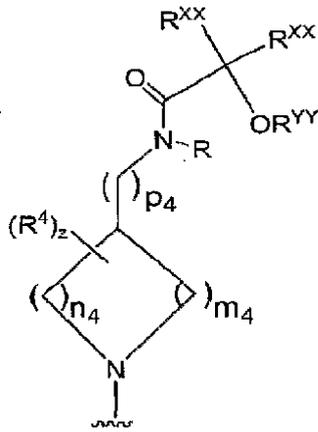


を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 2 8】

$R^1$  及び  $R^2$  が一緒になって環 (pp) :

【化 1 6 5】



pp.

を形成する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 2 9】

W が OR' である、請求項 2 0 0 ~ 2 2 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 3 0】

W が OH である、請求項 2 2 9 に記載の組成物。

【請求項 2 3 1】

y が 0 である、請求項 2 0 0 ~ 2 3 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 3 2】

y が 1 である、請求項 2 0 0 ~ 2 3 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

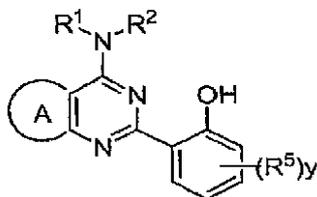
【請求項 2 3 3】

R<sup>5</sup> が F である、請求項 2 3 2 に記載の組成物。

【請求項 2 3 4】

前記化合物が式 I - A :

【化 1 6 6】



I-A

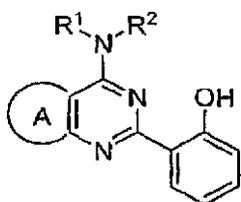
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>、y 及び環 A は、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 で定義した通りである)

を有する、請求項 2 0 0 又は 2 0 6 に記載の組成物。

【請求項 2 3 5】

前記化合物が、式 I - A - i :

【化 1 6 7】



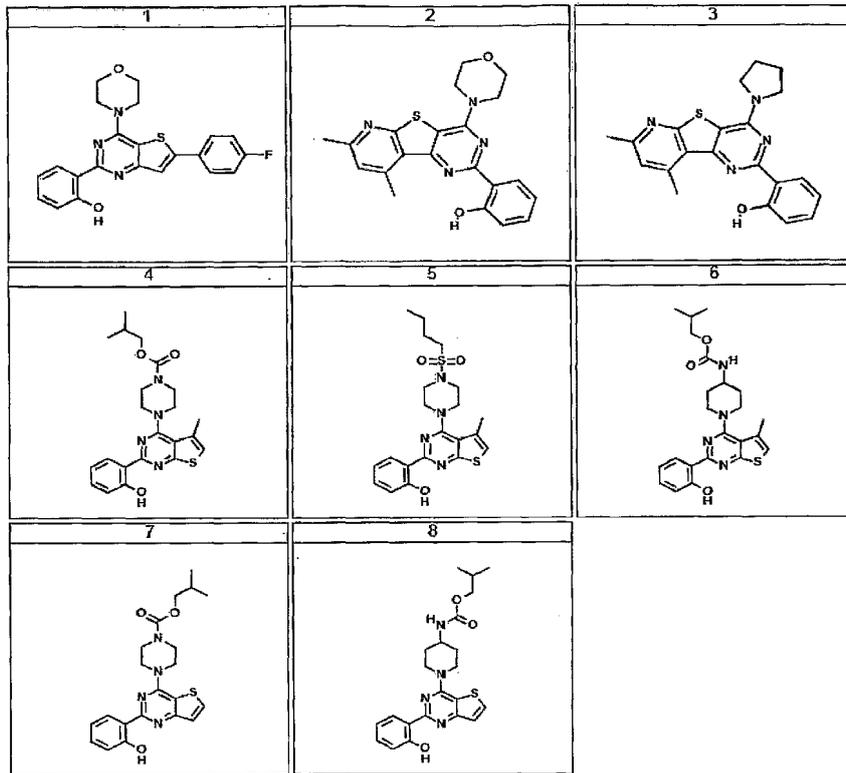
I-A-i;

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び環 A は、請求項 200 又は 206 で定義した通りである) を有する、請求項 200 又は 206 に記載の組成物。

【請求項 236】

前記化合物が、

【化 168】



から選択される、請求項 200 又は 206 に記載の組成物。