

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載
【部門区分】第3部門第2区分
【発行日】平成21年6月25日(2009.6.25)

【公表番号】特表2008-542377(P2008-542377A)
【公表日】平成20年11月27日(2008.11.27)
【年通号数】公開・登録公報2008-047
【出願番号】特願2008-514718(P2008-514718)
【国際特許分類】

A 6 1 K 31/496 (2006.01)
C 0 7 D 277/20 (2006.01)
C 0 7 D 277/42 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (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 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/22 (2006.01)
A 6 1 P 25/24 (2006.01)
A 6 1 P 9/06 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)
C 0 7 D 285/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/496
C 0 7 D 277/42
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 9/06
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 1/12
A 6 1 K 31/454
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 417/04
C 0 7 D 285/08

【手続補正書】
【提出日】平成21年5月1日(2009.5.1)
【手続補正1】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更

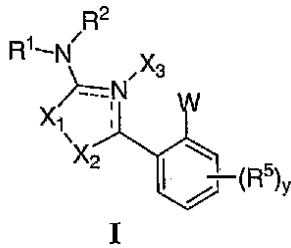
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1-1】



の化合物またはその製薬上許容される塩であって、
式中、

【化1-2】

==

は一重結合または二重結合であり、

X_1 および X_2 は、各々独立に、 $=CR^3-$ 、 $=N-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NR^3-$ であり、

X_3 は、 R^3 または孤立電子対であり、

ただし、 X_1 、 X_2 および $N(X_3)$ は、介在する炭素原子とともに一緒になって、5員のヘテロアリアル環を形成し、

Wは、ハロゲン、 OR' 、 SR' 、 $N(R')_2$ 、 $NRC(O)R'$ 、 $S(O)_2N(R')$ 、 $OC(O)R'$ 、 $OC(O)N(R')_2$ 、 $NR(S(O)_2R')$ 、 $OP(O)(OR')_2$ 、 $OP(O)_2OR'$ 、 $OP(O)(R')_2$ 、 CHF_2 、 CH_2F または CF_3 であり、

R^1 および R^2 は、窒素原子とともに一緒になって、窒素、硫黄または酸素から独立に選択される、0～3個のさらなるヘテロ原子を有する、3～12員の単環式または二環式飽和、部分不飽和または完全不飽和環を形成し、該環は、1以上の置換可能な環原子で、z個の $-R^4$ の独立した出現で場合により置換されていてもよく、zは0～5であり、

yは0～5であり、

R^3 、 R^4 および R^5 の各出現は独立に $Q-R^x$ であり、ここで、Qは結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、Qの最大2個の隣接していないメチレン単位は、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ または $-POR-$ によって場合により、独立に置換されていてもよく、 R^x の各出現は、 $-R'$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ または $-OPO(R')_2$ から独立に選択され、

Rの各出現は独立に、水素または場合により置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり、

R' の各出現は独立に、水素または場合により置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される0～3個のヘテロ原子を有する、3～8員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から

独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であるか、あるいは、R および R'、R の 2 個の出現または R' の 2 個の出現は、それらが結合している原子とともに一緒になって、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、場合により置換されていてもよい 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和単環式または二環式環を形成し、

ただし、

(i) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が、 R^5 および y と一緒になって、2, 4 - ジフルオロフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよい 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 1 - オン - 2 - イルではなく、

(ii) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が、 R^5 および y と一緒になって、2, 4 - ジクロロフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよい 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イルでも、場合により置換されていてもよい四環式環系でもなく、

(iii) X_1 が S であり、 X_2 が = CMe - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が、 R^5 および y と一緒になって、2, 4 - ジメトキシフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよいピリダジン環と融合している場合により置換されていてもよいピロール - 1 - イル環ではなく、

(iv) X_1 が S であり、 X_2 が = CR³ - であり、 X_3 が孤立電子対である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよいピロール - 1 - イルではなく、

(v) X^1 が = N - であり、 X^2 が O であり、 X^3 が孤立電子対であり、W が八口である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、1, 4 - ジアザピシクロ [3.2.2] ノナン - 1 - イルではなく、

(vi) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が、 R^5 および y と一緒になって、2 - クロロフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよいイミダゾール - 1 - イルではなく、

(vii) X_1 が = N - であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が H であり、y が 0 であり、W が NH₂ Ar' であり、Ar' が場合により置換されていてもよいフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、2 - ブタンアミド - ピロリジン - 1 - イルではなく、

(viii) X_1 が = N - であり、 X_2 が = CH - または = C(Cl) - であり、 X_3 が H であり、W が NH₂ Ar' であり、Ar' が場合により置換されていてもよいフェニルまたは NHC(O)R であり、R が場合により置換されていてもよい脂肪族である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、3 - [(ジメチルアミノ)スルホニル]アミノ - モルホリン - 4 - イルでも 2 - (メトキシカルボニル)アミノ - 4, 5 - ジクロロ - 1 H - イミダゾール - 1 - イルでもなく、

(ix) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が OH または OMe である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、3, 4 - ジヒドロ - 2 - (1 H) - キノゾリン - 3 - オン - 2 - イルではなく、

(x) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が八口または OR' である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよい 2 - イミノ - チアゾリジン - 4 - オン - 3 - イルではなく、

(xi) X_1 が S であり、 X_2 が = CH - であり、 X_3 が孤立電子対である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよいアゼチジン - 2 - オン - 1 - イルではなく、

(xii) X_1 が S であり、 X_2 が = CR³ - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W が OH または八口である場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよい 3, 4 - ジヒドロ - (3 H) - キナゾリン - 4 - オン - 3 - イルではなく、

(xiii) X_1 が S であり、 X_2 が = CR³ - であり、 X_3 が孤立電子対であり、W

がハロ、OMeまたは $\text{NHSO}_2\text{Ar}'$ であり、 Ar' が場合により置換されていてもよいフェニルである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、場合により置換されていてもよい、チアゾリジン-4-オン-3-イル、2,4-ジオキソ-イミダゾリン-1-イル、4,5-ジヒドロ-5-オキソ-(1H)-イミダゾール-1-イルまたはアゼチジン-1-イルから選択される環ではなく、

(xiv) X_1 がSであり、 X_2 が $=\text{CH}-$ であり、 X_3 が孤立電子対であり、Wがハロである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、1,2,3,4-テトラヒドロ-(1H)-キナゾリン-2,4-ジオキソ-3-イルではなく、

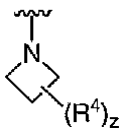
(xv) X_1 が $=\text{N}-$ であり、 X_2 が $=\text{CR}^3-$ であり、 X_3 がHである場合は、 R^1 および R^2 は一緒になって、3,5-ジオキソ-1,2,4-トリアゾリジン-4-イルでも、2,5-ジオキソ-ピロリジン-1-イルでも2,5-ジオキソ-イミダゾリジン-1-イルでもない、

化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項2】

R^1 および R^2 が一緒になって、アゼチジニル環

【化2】



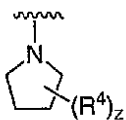
aa.

を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピロリジニル環

【化3】



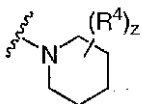
bb.

を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピペリジニル環

【化4】



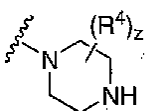
cc.

を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^1 および R^2 が一緒になって、ピペラジニル環

【化5】



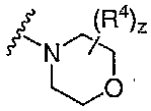
dd.

を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R¹ および R² が一緒になって、モルホリニル環

【化 6】



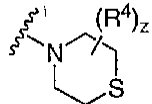
ee.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R¹ および R² が一緒になって、チオモルホリニル環

【化 7】



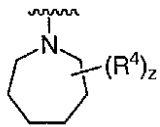
ff.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R¹ および R² が一緒になって、アゼパニル環

【化 8】



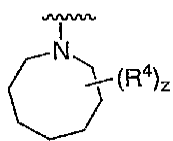
gg.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R¹ および R² が一緒になって、アゾカニル環

【化 9】



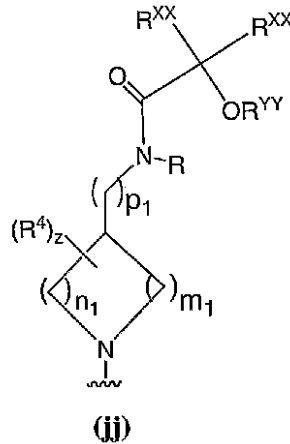
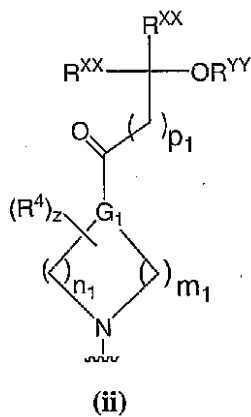
hh.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R¹ および R² が一緒になって、以下に示される環 (i i) または (j j)

【化10】



を形成する、請求項1に記載の化合物であって、ここで

G_1 は - N -、- CH - NH - または - CH - CH₂ - NH - であり、

m_1 および n_1 は各々独立に 0 ~ 3 であり、ただし、 $m_1 + n_1$ は 2 ~ 6 であり、

p_1 は 0 ~ 2 であり、

z は 0 ~ 4 であり、

各 R^{XX} は水素、 C_{1-6} 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環または、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和二環式環系であり、 R^{XX} は w_1 個の R^{11} の独立した出現で場合により置換されていてもよく、 w_1 は 0 ~ 3 であり、

ただし、両 R^{XX} が同時に水素ではなく、

R^{YY} は水素、- COR'、- CO₂R'、- CON(R')₂、- SOR'、- SO₂R'、- SO₂N(R')₂、- COCOR'、- COCH₂COR'、- P(O)(OR')₂、- P(O)₂OR' または - PO(R') であり、

R^{11} の各出現は独立に Q - R^x であり、ここで、Q は結合であるか、または C_{1-6} アルキリデン鎖であり、Q の最大 2 個の隣接していないメチレン単位は、- NR -、- S -、- O -、- CS -、- CO₂ -、- OCO -、- CO -、- COCO -、- CONR -、- NRCO -、- NRCO₂ -、- SO₂NR -、- NRSO₂ -、- CONRNR -、- NRCONR -、- OCONR -、- NRNR -、- NRSO₂NR -、- SO₂ -、- PO -、- PO₂ -、- OP(O)(OR) - または - POR - によって場合により、独立に置換されていてもよく、 R^x の各出現は、- R'、ハロゲン、= O、= NR'、- NO₂、- CN、- OR'、- SR'、- N(R')₂、- NR'COR'、- NR'CON(R')₂、- NR'CO₂R'、- COR'、- CO₂R'、- OCOR'、- CON(R')₂、- OCON(R')₂、- SOR'、- SO₂R'、- SO₂N(R')₂、- NR'SO₂R'、- NR'SO₂N(R')₂、- COCOR'、- COCH₂COR'、- OP(O)(OR')₂、- P(O)(OR')₂、- OP(O)₂OR'、- P(O)₂OR'、- PO(R')₂ または - OPO(R')₂ から独立に選択され、

R の各出現は独立に、水素または最大 3 個の置換基を有する C_{1-6} 脂肪族基であり、 R' の各出現は独立に、水素または C_{1-6} 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、ここで、 R' は最大 4 個の置換基を有するか、あるいは R および R' 、 R の 2 個の出現または R' の 2 個の出現は、それらが結合している原子とともに一緒になって、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、場合により置換されていてもよい 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式もしくは二環式環を

形成する、
化合物。

【請求項 1 1】

一方の $R^{X X}$ が水素であり、もう一方の $R^{X X}$ が水素ではない、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

両 $R^{X X}$ が水素ではない、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

p_1 が 0 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

p_1 が 1 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

p_1 が 2 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

m_1 および n_1 が各々 1 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

m_1 および n_1 が各々 2 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

m_1 および n_1 が各々 3 である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

$R^{X X}$ が C_{1-6} 脂肪族基であり、 $R^{X X}$ が w_1 個の $-R^{1 1}$ の独立した出現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 1 0 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

$R^{X X}$ が、 w_1 個の $-R^{1 1}$ の独立した出現で場合により置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基であり、 w_1 が 0 ~ 3 である、請求項 1 0 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

$R^{X X}$ が C_{1-6} アルキル基である、請求項 1 0 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 2】

$R^{X X}$ が、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、 $R^{X X}$ が w_1 個の $-R^{1 1}$ の独立した出現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 1 0 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

$R^{X X}$ が、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環であり、 $R^{X X}$ が w_1 個の $-R^{1 1}$ の独立した出現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 1 0 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

$R^{X X}$ が、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、 $R^{X X}$ が w_1 個の $-R^{1 1}$ の独立した出現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 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

$R^{Y Y}$ が、水素、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ または $-PO(R')$ である、請求項 1 0 ~ 2 4 のい

れか一項に記載の化合物。

【請求項 26】

R^{YY} が水素である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

R^{YY} が $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)_2OR'$ または $-PO(R')$ である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 28】

R が水素である、請求項 10 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 29】

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

【請求項 30】

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

【請求項 31】

R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 32】

p_1 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 33】

R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

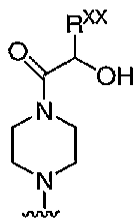
【請求項 34】

p_1 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 35】

R^1 および R^2 が一緒になって、以下に示される環

【化 11】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 36】

R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 35 に記載の化合物。

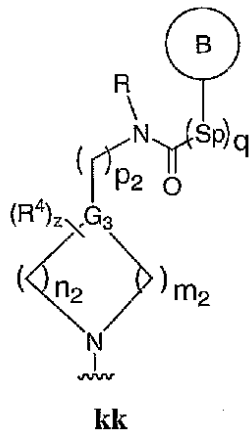
【請求項 37】

R^{XX} がメチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチルまたは *t*-ブチルである、請求項 35 に記載の化合物。

【請求項 38】

R^1 および R^2 が一緒になって以下に示される環 (kk)

【化 1 2】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

G_3 は - N - または CH であり、

m_2 および n_2 は各々独立に 0 ~ 3 であり、ただし、 $m_2 + n_2$ は 2 ~ 6 であり、

p_2 は 0 ~ 2 であり、ただし、 G_3 が N である場合は、 p_2 は 0 ではなく、

q_2 は 0 または 1 であり、

z は 0 ~ 4 であり、

S_p は結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデンリンカーであり、最大 2 個のメチレン単位は - O -、- S -、- CO -、- CS -、- COCO -、- CONR' -、- CONR'NR' -、- CO₂ -、- OCO -、- NR'CO₂ -、- NR'CONR' -、- OCONR' -、- NR'NR' -、- NR'NR'CO -、- NR'CO -、- SO -、- SO₂ -、- NR' -、- SO₂NR' -、NR'SO₂ - または - NR'SO₂NR' - によって場合により、独立に置換されていてもよく、

環 B は、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和または芳香族、単環式複素環式環であり、環 B は、 w_2 個の - R^{1 2} の独立した出現で場合により置換されていてもよく、 w_2 は 0 ~ 4 であり、

R^{1 2} の各出現は独立に Q - R^x であり、Q は結合であるか、または $C_1 \sim C_6$ アルキリデン鎖であり、Q の最大 2 個の隣接していないメチレン単位は、- NR -、- S -、- O -、- CS -、- CO₂ -、- OCO -、- CO -、- COCO -、- CONR -、- NRCO -、- NRCO₂ -、- SO₂NR -、- NRSO₂ -、- CONRNR -、- NRCONR -、- OCONR -、- NRNR -、- NRSO₂NR -、- SO -、- SO₂ -、- PO -、- PO₂ -、- OP(O)(OR) - または - POR - によって場合により、独立に置換されていてもよく、R^x の各出現は、- R'、ハロゲン、= O、= NR'、- NO₂、- CN、- OR'、- SR'、- N(R')₂、- NR'COR'、- NR'CON(R')₂、- NR'CO₂R'、- COR'、- CO₂R'、- OCOR'、- CON(R')₂、- OCON(R')₂、- SOR'、- SO₂R'、- SO₂N(R')₂、- NR'SO₂R'、- NR'SO₂N(R')₂、- COCOR'、- COCH₂COR'、- OP(O)(OR')₂、- P(O)(OR')₂、- OP(O)₂OR'、- P(O)₂OR'、- PO(R')₂ または - OPO(R')₂ から独立に選択され、

R の各出現は独立に、水素または最大 3 個の置換基を有する $C_1 \sim 6$ 脂肪族基であり、R' の各出現は独立に、水素または $C_1 \sim 6$ 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、R' は最大 4 個の置換基を有するか、あるいは、R および R'、R の 2 個の出現または R' の 2 個の出現は、それらが結合している原子とともに一緒になって、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、場合により置換されていても

よい 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和単環式または二環式環を形成する、化合物。

【請求項 39】

G_3 が N である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 40】

G_3 が CH である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 41】

p_2 が 0 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 42】

p_2 が 1 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 43】

p_2 が 2 である、請求項 38 ~ 40 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 44】

q_2 が 0 である、請求項 38 ~ 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 45】

q_2 が 1 である、請求項 38 ~ 43 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 46】

p_2 が 1 であり、 q_2 が 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 47】

G_3 が CH であり、 p_2 が 0 であり、 q_2 が 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 48】

m_2 および n_2 が各々 1 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 49】

m_2 および n_2 が各々 2 である、請求項 38 ~ 48 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 50】

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

【請求項 51】

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

【請求項 52】

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

【請求項 53】

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

【請求項 54】

環 B が、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和、または芳香族、単環式複素環式環であり、環 B が w_2 個の -R^{1 2} の独立した出現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 38 ~ 53 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 55】

環 B が、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B が w_2 個の -R^{1 2} の独立した出現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 38 ~ 54 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 56】

環 B が、O、S または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B が w_2 個の -R^{1 2} の独立した出現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 38 ~ 55 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 57】

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

【請求項 58】

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

【請求項 59】

S p が結合、O または $-O-CH_2-$ であり、 p_2 が 1 であり、R が水素であり、 n_2 および m_2 が両方同時に 1 または 2 である、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 60】

R が水素である、請求項 38 ~ 59 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 61】

R が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 38 ~ 59 のいずれか一項に記載の化合物。

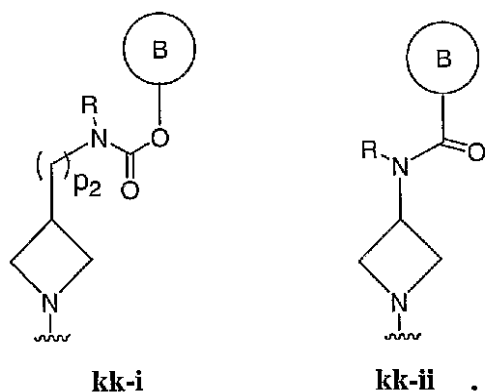
【請求項 62】

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

【請求項 63】

R¹ および R² が一緒になって、式 (kk-i) または式 (kk-ii)

【化 13】



の環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 64】

環 B が、O、S または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B が w_2 個の $-R^{1,2}$ の独立した出現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 63 に記載の化合物。

【請求項 65】

R が水素である、請求項 63 ~ 64 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 66】

R が水素であり、環 B がテトラヒドロフランルである、請求項 65 に記載の化合物。

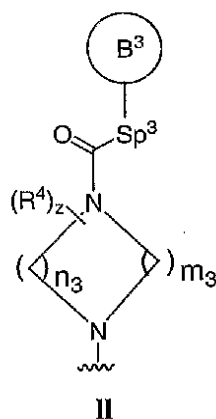
【請求項 67】

S p が結合、 $-O-$ または $-O-CH_2-$ である、請求項 63 ~ 66 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 68】

R¹ および R² が一緒になって以下の環 (II)

【化 14】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

m_3 および n_3 は各々独立に 0 ~ 3 であり、ただし、 $m_3 + n_3$ は 2 ~ 6 であり、

z は 0 ~ 4 であり、

Sp^3 は -O-、-S-、-NR'- または C1 ~ C6 アルキリデンリンカーであり、最大 2 個のメチレン単位は、-O-、-S-、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR'-、-CONR'NR'-、-CO₂-、-OCO-、-NR'CO₂-、-NR'CONR'-、-OCONR'-、-NR'NR'、-NR'NR'CO-、-NR'CO-、-SO-、-SO₂-、-NR'-、-SO₂NR'-、NR'SO₂- または -NR'SO₂NR'- によって場合により、独立に置換されていてもよく、ただし、 Sp^3 は炭素以外の原子を介して該カルボニル基と結合しており、

環 B_3 は、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和または芳香族単環式複素環式環であり、環 B_3 は、 w_3 個の $-R^{13}$ の独立した出現で場合により置換されていてもよく、 w_3 は 0 ~ 4 であり、

R^{13} の各出現は独立に $Q-R^x$ であり、 Q は結合であるか、または C₁ ~ C₆ アルキリデン鎖であり、 Q の最大 2 個の隣接していないメチレン単位は、-NR-、-S-、-O-、-CS-、-CO₂-、-OCO-、-CO-、-COCO-、-CONR-、-NRCO-、-NRCO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCONR-、-OCONR-、-NRNR-、-NRSO₂NR-、-SO-、-SO₂-、-PO-、-PO₂-、-OP(O)(OR)- または -POR- によって場合により、独立に置換されていてもよく、 R^x の各出現は、-R'、ハロゲン、=O、=NR'、-NO₂、-CN、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NR'COR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂ または -OPO(R')₂ であり、

R の各出現は独立に、水素または最大 3 個の置換基を有する C₁ ~ C₆ 脂肪族基であり、 R' の各出現は独立に、水素または C₁ ~ C₆ 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、ここで、 R' は最大 4 個の置換基を有するか、あるいは R および R' 、 R の 2 個の出現または R' の 2 個の出現は、それらが結合している原子とともに一緒になって、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、場合により置換されていてもよい 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式もしくは二環式環を形成する、

化合物。

【請求項 69】

Sp^3 が -O-、-S- または -NR'- から選択される、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 70】

Sp^3 が -O- である、請求項 68 ~ 69 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 71】

Sp^3 が -O-CH₂- である、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 72】

Sp^3 が -NR'- である、請求項 69 に記載の化合物。

【請求項 73】

Sp^3 が -NH- である、請求項 69 に記載の化合物。

【請求項 74】

Sp^3 が -NH-CH₂- である、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 75】

m_3 および n_3 が各々 1 である、請求項 68 ~ 74 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 76】

m_3 および n_3 が 2 である、請求項 75 に記載の化合物。

【請求項 77】

環 B_3 が、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和または芳香族単環式複素環式環であり、環 B_3 が、 w_3 個の $-R^{1,3}$ の独立した出現で場合により置換されているにもかかわらず、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 78】

環 B_3 が、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B_3 が、 w_3 個の $-R^{1,3}$ の独立した出現で場合により置換されているにもかかわらず、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 77 に記載の化合物。

【請求項 79】

環 B_3 が、O、S または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B_3 が w_3 個の $-R^{1,3}$ の独立した出現で場合により置換されているにもかかわらず、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 80】

w_3 が 0 である、請求項 68 ~ 79 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 81】

環 B_3 がテトラヒドロフランである、請求項 68 ~ 80 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 82】

Sp^3 が結合、O または $-O-CH_2-$ であり、R が水素であり、 n_3 および m_3 が双方とも同時に 1 または 2 である、請求項 68 に記載の化合物。

【請求項 83】

R が水素である、請求項 68 ~ 83 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 84】

R が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 68 ~ 83 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 85】

R がメチル、エチル、プロピルまたはブチルを含む、請求項 84 に記載の化合物。

【請求項 86】

z が 0 である、請求項 68 ~ 85 のいずれか一項に記載の化合物。

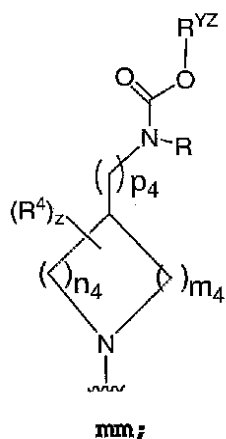
【請求項 87】

環 B_3 が、O、S または N から選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、5 ~ 6 員の飽和単環式複素環式環であり、環 B_3 が w_3 個の $-R^{1,3}$ の独立した出現で場合により置換されているにもかかわらず、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 68 ~ 76 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 88】

R^1 および R^2 が一緒になって、以下の環 (mm)

【化 15】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物であって、ここで、

m_4 および n_4 は各々独立に 0 ~ 3 であり、ただし、 $m_4 + n_4$ は 2 ~ 6 であり、

p_4 は 1 ~ 2 であり、

R^{YZ} は、 w_4 個の $-R^{14}$ の独立した出現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、

R^{14} の各出現は独立に $Q - R^X$ であり、 Q は結合であるか、または $C_1 - C_6$ アルキリデン鎖であり、 Q の最大 2 個の隣接していないメチレン単位は、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ または $-POR-$ によって場合により、独立に置換されていてもよく、 R^X の各出現は、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')$ 、 $-OCON(R')$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')$ 、 $-P(O)(OR')$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')$ または $-OPO(R')$ から独立に選択され、

R の各出現は独立に、水素または最大 3 個の置換基を有する $C_1 - 6$ 脂肪族基であり、 R' の各出現は独立に、水素または $C_1 - 6$ 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、3 ~ 8 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式環、または窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和二環式環系であり、ここで、 R' は最大 4 個の置換基を有するか、あるいは R および R' 、 R の 2 個の出現または R' の 2 個の出現は、それらが結合している原子とともに一緒になって、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 0 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、場合により置換されていてもよい 3 ~ 12 員の飽和、部分不飽和もしくは完全不飽和単環式もしくは二環式環を形成する、化合物。

【請求項 89】

p_4 が 1 である、請求項 88 に記載の化合物。

【請求項 90】

p_4 が 2 である、請求項 89 に記載の化合物。

【請求項 91】

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

【請求項 9 2】

m_4 および n_4 が各々 2 である、請求項 8 7 ~ 9 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 3】

m_4 および n_4 が各々 3 である、請求項 8 7 ~ 9 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 4】

$R^{Y Z}$ が、 w_4 個の $-R^{1 4}$ の独立した出現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_4 が 0 ~ 3 である、請求項 8 8 ~ 9 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 5】

$R^{Y Z}$ が、 w_4 個の $-R^{1 4}$ の独立した出現で場合により置換されていてもよい C 1 ~ C 4 アルキルであり、 w_4 が 0 ~ 3 である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 6】

R^Y が C 1 ~ C 6 アルキル基である、請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 7】

R が水素である、請求項 8 7 ~ 9 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 8】

R が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 8 7 ~ 9 6 のいずれか一項に記載の化合物。

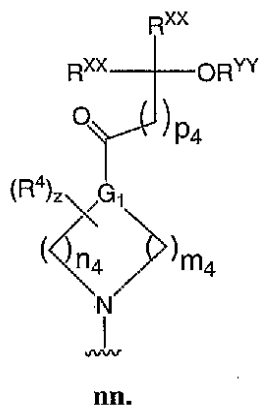
【請求項 9 9】

メチル、エチル、プロピルまたはブチルである、請求項 9 8 に記載の化合物。

【請求項 10 0】

R^1 および R^2 が一緒になって以下の環 (n n)

【化 1 6】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10 1】

G_1 が $-N-$ である、請求項 10 0 に記載の化合物。

【請求項 10 2】

G_1 が $-CH-NH-$ である、請求項 10 0 に記載の化合物。

【請求項 10 3】

G_1 が $-CH-CH_2-NH-$ である、請求項 10 0 に記載の化合物。

【請求項 10 4】

$R^{Y Y}$ が水素であり、一方の $R^{X X}$ が水素であり、もう一方の $R^{X X}$ が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 10 0 ~ 10 3 のいずれか一項に記載の化合物。

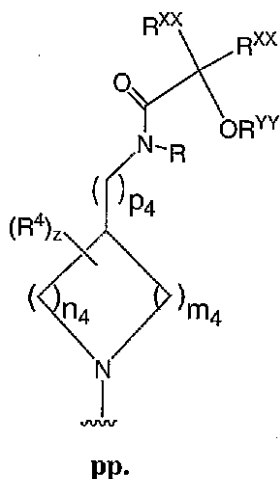
【請求項 10 5】

p_4 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、もう一方の $R^{X X}$ が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 10 0 ~ 10 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10 6】

R^1 および R^2 が一緒になって、以下の環 (p p)

【化 17】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 107】

R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 106 に記載の化合物。

【請求項 108】

p_4 が 0 であり、 R^{YY} が水素であり、一方の R^{XX} が水素であり、もう一方の R^{XX} が C1 ~ C6 アルキルである、請求項 100 ~ 107 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 109】

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

【請求項 110】

W が OH である、請求項 109 に記載の化合物。

【請求項 111】

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

【請求項 112】

W が SH である、請求項 111 に記載の化合物。

【請求項 113】

W が $N(R')_2$ である、請求項 1 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 114】

W が NHR' である、請求項 113 に記載の化合物。

【請求項 115】

W が NH_2 である、請求項 114 に記載の化合物。

【請求項 116】

W が CHF_2 または CH_2F である、請求項 1 ~ 108 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 117】

W が CHF_2 である、請求項 116 に記載の化合物。

【請求項 118】

W が CH_2F である、請求項 116 に記載の化合物。

【請求項 119】

z が 0 ~ 5 である、請求項 1 ~ 118 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 120】

z が 1 ~ 3 である、請求項 119 に記載の化合物。

【請求項 121】

z が 1 ~ 2 である、請求項 120 に記載の化合物。

【請求項 122】

z が 1 である、請求項 121 に記載の化合物。

【請求項 1 2 3】

R⁴が独立に、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂または場合により置換されていてもよい、C₁~C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁~C₆アルキル、ヘテロアリールC₁~C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁~C₆アルキルもしくはヘテロシクロ脂肪族C₁~C₆アルキルから選択される基である、請求項 1 ~ 1 2 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 4】

R⁴が独立に、Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、CN、-COOH、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂(CH₂)₃CH₃、-SO₂CH(CH₃)₂、-SO₂N(CH₃)₂、-SO₂CH₂CH₃、-C(O)OCH₂CH(CH₃)₂、-C(O)NHCH₂CH(CH₃)₂、-NHCOOCH₃、-C(O)C(CH₃)₃、-COO(CH₂)₂CH₃、-C(O)NHCH(CH₃)₂、-C(O)CH₂CH₃、または場合により置換されていてもよい、-ピペリジニル、ピペリジニル、モルホリノ、C₁-₄アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、-CH₂シクロヘキシル、ピリジル、-CH₂ピリジルもしくは-CH₂チアゾリルから選択される基である、請求項 1 2 3 に記載の化合物。

【請求項 1 2 5】

R¹およびR²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または2であり、R⁴の少なくとも1個の出現が-NRSO₂R'、-NRCOOR'または-NRCOR'である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2 6】

R¹およびR²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、R⁴が-NRSO₂R'である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 2 7】

R¹およびR²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、R⁴が-NRCOOR'である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 2 8】

R¹およびR²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、R⁴が-NRCOR'である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 2 9】

R¹およびR²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または2であり、R⁴がCl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'または-CH₂OR'である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 3 0】

R¹およびR²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または2であり、R⁴の少なくとも1個の出現がCl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または-CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOOR'または-OCON(R')₂である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 3 1】

R¹およびR²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、R⁴がF、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'

または -CH₂OR' である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 132】

R¹ および R² 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、R⁴ が -NRSO₂R' である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 133】

R¹ および R² 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、R⁴ が -NRCOOR' である、請求項 125 に記載の化合物。

【請求項 134】

R¹ および R² 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 または 2 であり、R⁴ の少なくとも 1 個の出現が -SOR', -CON(R')₂, -SO₂N(R')₂, -COR' または -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 135】

R¹ および R² 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、R⁴ が -SOR' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 136】

R¹ および R² 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、R⁴ が -COOR' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 137】

R¹ および R² 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、R⁴ が -CON(R')₂ である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 138】

R¹ および R² 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、R⁴ が -SO₂N(R')₂ である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 139】

R¹ および R² 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、R⁴ が -COR' である、請求項 134 に記載の化合物。

【請求項 140】

R¹ および R² 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) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 または 2 であり、R⁴ の少なくとも 1 個の出現が -SOR', -CON(R')₂, -SO₂N(R')₂, -COR' または -COOR' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 141】

R¹ および R² 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) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり、R⁴ が -SOR' である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 142】

R¹ および R² 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) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり、R⁴ が -COR' である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 143】

R¹ および R² 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) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、z が 1 であり、R⁴ が -CO

$N(R')_2$ である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 144】

R^1 および R^2 が一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-SO_2N(R')_2$ である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 145】

R^1 および R^2 が一緒になって、場合により置換されていてもよいモルホリン - 1 - イル (ee) またはチオモルホリン - 1 - イル (ff) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-COR'$ である、請求項 140 に記載の化合物。

【請求項 146】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 または 2 であり、 R^4 の少なくとも 1 個の出現が $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ または $-COOR'$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 147】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-SOR'$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 148】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-COOR'$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 149】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-CON(R')_2$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 150】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-SO_2N(R')_2$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 151】

R^1 および 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ゼパン - 1 - イル (gg) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-COR'$ である、請求項 146 に記載の化合物。

【請求項 152】

R^1 および 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 または 2 であり、 R^4 の少なくとも 1 個の出現が $-SOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COR'$ または $-COOR'$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 153】

R^1 および 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、 R^4 が $-SOR'$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 154】

R^1 および 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、 R^4 が $-COOR'$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 155】

R^1 および 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、 R^4 が $-CON(R')_2$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 156】

R^1 および 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、 R^4 が $-CON(R')_2$ である、請求項 152 に記載の化合物。

h h) であり、z が 1 であり、 R^4 が $-SO_2N(R')_2$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 157】

R^1 および 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 (h h) であり、z が 1 であり、 R^4 が $-COR'$ である、請求項 152 に記載の化合物。

【請求項 158】

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

【請求項 159】

y が 0 である、請求項 158 に記載の化合物。

【請求項 160】

y が 1 ~ 3 である、請求項 158 に記載の化合物。

【請求項 161】

y が 1 ~ 2 である、請求項 160 に記載の化合物。

【請求項 162】

y が 1 である、請求項 161 に記載の化合物。

【請求項 163】

R^5 が独立に、ハロゲン、CN、 NO_2 、 $-N(R')_2$ 、 $-CH_2N(R')_2$ 、 $-OR'$ 、 $-CH_2OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-CH_2SR'$ 、 $-NRCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-S(O)_2N(R')_2$ 、 $-OCOR'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 、 $-OPO(R')_2$ または場合により置換されていてもよい、 $C_1 - C_6$ 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、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、シクロ脂肪族 $C_1 - C_6$ アルキルもしくはヘテロシクロ脂肪族 $C_1 - C_6$ アルキルから選択される基である、請求項 124 ~ 162 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 164】

R^5 が独立に、Cl、Br、F、 CF_3 、Me、Et、CN、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(Et)_2$ 、 $-N(iPr)_2$ 、 $-O(CH_2)_2OCH_3$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOCH_3$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-NHCOCH_3$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NHC(CH_3)_2$ 、 $-OCOCH_3$ 、 $-OCOCH_2C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ 、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また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 163 に記載の化合物。

【請求項 165】

R^5 が F である、請求項 164 に記載の化合物。

【請求項 166】

R^5 が OR' である、請求項 163 に記載の化合物。

【請求項 167】

R^5 が OH である、請求項 166 に記載の化合物。

【請求項 168】

W が OH である、請求項 165 に記載の化合物。

【請求項 169】

R^3 が水素である、請求項 168 に記載の化合物。

【請求項 170】

R^3 が $X - R^Q$ である、請求項 168 に記載の化合物。

【請求項 171】

X が $C_1 - C_6$ アルキリデンである、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 172】

XがC₁～C₄アルキリデンである、請求項170に記載の化合物。

【請求項173】

Xが-CH₂-である、請求項170に記載の化合物。

【請求項174】

R^Qが独立に、-R'、-OR'、-SR'、-N(R')₂、-NRCOR'、-NR'CON(R')₂、-NR'CO₂R'、-COR'、-CO₂R'、-OCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、-SOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂、-NR'SO₂R'、-NR'SO₂N(R')₂、-COCOR'、-COCH₂COR'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)₂OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂または-OPO(R')₂から選択される、請求項170に記載の化合物。

【請求項175】

R^QがR'である、請求項174に記載の化合物。

【請求項176】

R³が水素である、請求項170に記載の化合物。

【請求項177】

R³が各々、ハロゲン、CN、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-OR'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-COOR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-OCON(R')₂、COR'、-NHCOOR'、-SO₂R'、-SO₂N(R')₂または場合により置換されていてもよい、C₁～C₆脂肪族、アリール、ヘテロアリール、シクロ脂肪族、ヘテロシクロ脂肪族、アリールC₁～C₆アルキル、ヘテロアリールC₁～C₆アルキル、シクロ脂肪族C₁～C₆アルキルもしくはヘテロシクロ脂肪族C₁～C₆アルキルから選択される基である、請求項170に記載の化合物。

【請求項178】

R³の各出現が、Cl、Br、F、CF₃、-OCF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(iPr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-NHCOCH(CH₃)₂、-SO₂NH₂、-CONH(シクロプロピル)、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃または場合により置換されていてもよい、-ピペリジニル、ピペリジニル、モルホリノ、フェニル、フェニルオキシ、ベンジルもしくはベンジルオキシから選択される基である、請求項177に記載の化合物。

【請求項179】

R³の各出現が独立に、ハロゲン、CN、場合より置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、OR'、N(R')₂、CON(R')₂またはNRCOR'である、請求項177に記載の化合物。

【請求項180】

各R³が独立に、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃または-CNである、請求項179に記載の化合物。

【請求項181】

R³が、-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-CONHCH₃、-CONHCH₂CH₃、-CONH(シクロプロピル)、-OCH₃、-NH₂、-OCH₂CH₃または-CNから選択される、請求項180に記載の化合物。

【請求項182】

R³が-Cl、-CH₃、-CH₂CH₃、-F、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃または-OCH₂CH₃から選択される、請求項181に記載の化合物。

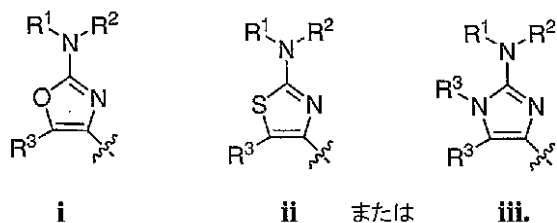
【請求項183】

R³が-CON(R')₂または-NRCOR'である、請求項170に記載の化合物。

【請求項 184】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化 18】

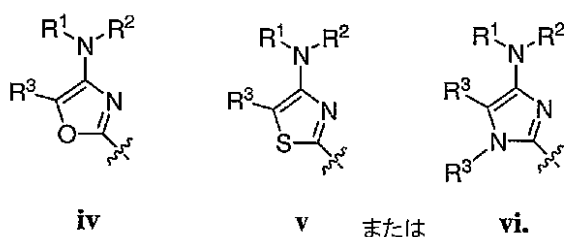


から選択される環を形成する、請求項 1 ~ 183 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 185】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化 19】

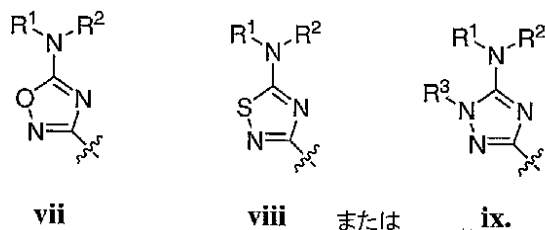


から選択される環を形成する、請求項 1 ~ 183 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 186】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化 20】

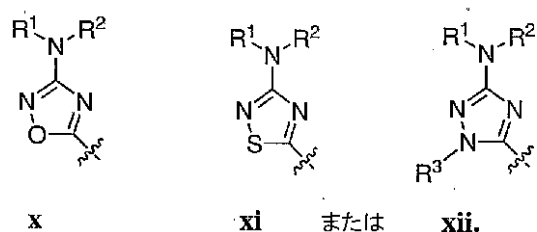


から選択される環を形成する、請求項 1 ~ 183 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 187】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化 21】

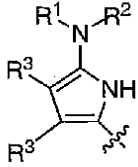


から選択される環を形成する、請求項 1 ~ 183 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 188】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化 2 2】



xiii.

から選択される環を形成する、請求項 1 ~ 1 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8 9】

R³ が水素である、請求項 1 8 4 ~ 1 8 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 9 0】

前記化合物が表 1 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 9 1】

請求項 1 ~ 1 9 0 のいずれか一項に記載の化合物と、製薬上許容されるアジュバントまたは担体とを含む薬剤組成物。

【請求項 1 9 2】

急性、慢性、神経障害性もしくは炎症性疼痛、関節炎、片頭痛、群発頭痛、三叉神経痛、ヘルペス性神経痛、全身神経痛、てんかんもしくはてんかん状態、神経変性疾患、精神障害、例えば、不安神経症およびうつ病、ミオトニー、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調、多発性硬化症、過敏性腸症候群、失禁、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、頭部もしくは頸部疼痛、激痛もしくは難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、手術後疼痛または癌性疼痛から選択される疾患、障害あるいは状態を治療するか、またはそれらの重症度を減少させる、請求項 1 9 1 に記載の組成物。

【請求項 1 9 3】

前記疾患、状態または障害が、電位依存性ナトリウムチャネルの活性化または機能亢進と関係している、請求項 1 9 2 に記載の組成物。

【請求項 1 9 4】

前記疾患、状態または障害が、急性、慢性、神経障害性または炎症性疼痛である、請求項 1 9 3 に記載の組成物。

【請求項 1 9 5】

前記疾患、状態または障害が、神経根痛、坐骨神経痛、背痛、頭痛または頸痛である、請求項 1 9 3 に記載の組成物。

【請求項 1 9 6】

前記疾患、状態または障害が、激痛または難治性疼痛、急性疼痛、手術後疼痛、背痛または癌性疼痛である、請求項 1 9 3 に記載の組成物。

【請求項 1 9 7】

前記疾患が大腿骨癌性疼痛、非悪性慢性骨痛、慢性関節リウマチ、変形性関節症、脊柱管狭窄症、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、腹部、膵臓、IBS疼痛、慢性頭痛、片頭痛、緊張性頭痛、例えば、群発頭痛、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、異所性近位および遠位分泌、神経根症、化学療法誘発性神経障害性疼痛、放射線療法誘発性神経障害性疼痛、乳房切除後疼痛、中枢痛、脊髄損傷疼痛、卒中後痛、視床痛、複合性局所疼痛症候群、幻痛、難治性疼痛、急性疼痛、急性手術後疼痛、急性筋骨格疼痛、関節痛、機械的な腰痛、頸痛、腱炎、損傷/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、腎疝痛、急性産科痛、例えば、陣痛、帝王切開痛、急性炎症性、熱傷および外傷痛、急性間欠的疼痛、例えば、子宮内膜症、急性帯状疱疹痛、鎌形赤

血球貧血、急性膵炎、突出痛、口腔顔面痛、例えば、副鼻腔炎痛、歯痛、多発性硬化症（MS）疼痛、うつ病における疼痛、らい病の疼痛、ベーチェット病の疼痛、有痛性脂肪症、静脈炎痛、ギランバレーの疼痛、痛む脚と動く足趾症候群、ハグランド症候群、先端紅痛症の疼痛、ファブリー病の疼痛、膀胱および泌尿生殖器疾患、例えば、尿失禁、機能亢進膀胱、有痛性膀胱症候群、間質性膀胱炎（IC）または前立腺炎から選択される、請求項 193 に記載の組成物。