

【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

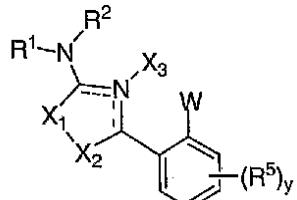
【補正の内容】

【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、=CR³-、=N-、-O-、-S-または-NR³-であり、

X_3 は、R³ 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あって、5員のヘテロアリール環を形成し、

Wは、ハロ、OR'、SR'、N(R')₂、NR₂C(O)R'、S(O)₂N(R')₂、OC(O)R'、OC(O)N(R')₂、NR(SO)₂R'、OP(O)(OR')₂、OP(O)₂OR'、OP(O)(R')₂、CHF₂、CH₂FまたはCF₃であり、

R¹ および R² は、窒素原子とともに一緒にあって、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-R⁴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、

R³、R⁴ および R⁵ 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-、-COC-、-CONR-、-NRCO-、-NRCO₂-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-CONRNR-、-NRCNR-、-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、-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、水素または場合により置換されていてもよいC₁~₆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C₁~₆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单環式環、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) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対であり、W が、R⁵ および y と一緒にになって、2,4-ジフルオロフェニルである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、場合により置換されていてもよい 2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-1-オン-2-イルではなく、

(ii) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対であり、W が、R⁵ および y と一緒にになって、2,4-ジクロロフェニルである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、場合により置換されていてもよい 2,3-ジヒドロ-1H-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) X₁ が S であり、X₂ が = C Me - であり、X³ が孤立電子対であり、W が、R⁵ および y と一緒にになって、2,4-ジメトキシフェニルである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、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) X₁ が S であり、X₂ が = C R³ - であり、X³ が孤立電子対である場合は、R¹ および R² は一緒にになって、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) X¹ が = N - であり、X² が O であり、X³ が孤立電子対であり、W がハロである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、1,4-ジアザビシクロ[3.2.2]ノナン-1-イルではなく、

(vi) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対であり、W が、R⁵ および y と一緒にになって、2-クロロフェニルである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、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) X₁ が = N - であり、X₂ が = C H - であり、X₃ が H であり、y が O であり、W が NH SO₂ 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、R¹ および R² は一緒にになって、2-ブタニアミド-ピロリジン-1-イルではなく、

(viii) X₁ が = N - であり、X₂ が = C H - または = C (C l) - であり、X₃ が H であり、W が NH SO₂ 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、R¹ および R² は一緒にになって、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-1H-イミダゾール-1-イルではなく、

(ix) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対であり、W が OH または OMe である場合は、R¹ および R² は一緒にになって、3,4-ジヒドロ-2-(1H)-キノゾリン-3-オン-2-イルではなく、

(x) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対であり、W がハロまたは OR' である場合は、R¹ および R² は一緒にになって、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) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X³ が孤立電子対である場合は、R¹ および R² は一緒にになって、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) X₁ が S であり、X₂ が = C R³ - であり、X³ が孤立電子対であり、W が OH またはハロである場合は、R¹ および R² は一緒にになって、場合により置換されていてもよい 3,4-ジヒドロ-(3H)-キナゾリン-4-オン-3-イルではなく、

(xiii) X₁ が S であり、X₂ が = C R³ - であり、X³ が孤立電子対であり、W

がハロ、O Me または N H S O₂ 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、R¹ および R² 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、

(x i v) X₁ が S であり、X₂ が = C H - であり、X₃ が孤立電子対であり、W がハロである場合は、R¹ および R² 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、

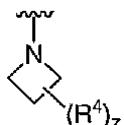
(x v) X₁ が = N - であり、X₂ が = C R³ - であり、X₃ が H である場合は、R¹ および R² は一緒になって、3, 5 - ジオキソ - 1, 2, 4 - トリアゾリジン - 4 - イルでも、2, 5 - ジオキソ - ピロリジン - 1 - イルでも 2, 5 - ジオキソ - イミダゾリジン - 1 - イルでもない、

化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 2】

R¹ および R² が一緒になって、アゼチジニル環

【化 2】



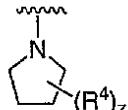
aa.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ および R² が一緒になって、ピロリジニル環

【化 3】



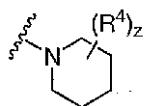
bb.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ および R² が一緒になって、ピペリジニル環

【化 4】



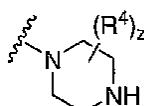
cc.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹ および R² が一緒になって、ピペラジニル環

【化 5】



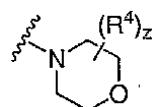
dd.

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】



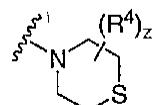
ee.

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】



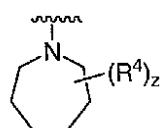
ff.

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】



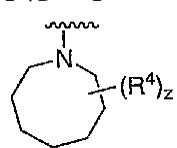
gg.

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】



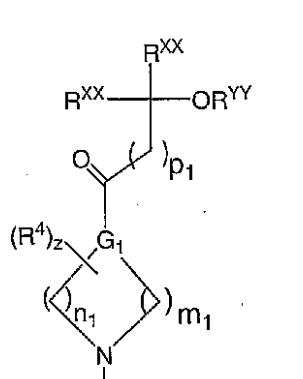
hh.

を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

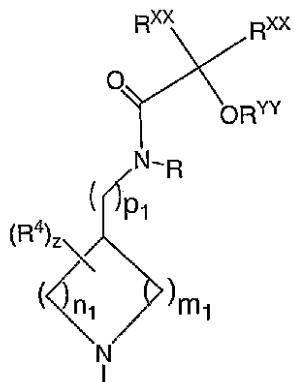
【請求項 10】

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 1 0】



(ii)



(ii)

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 $R^{x \times}$ は水素、 $C_{1 \sim 6}$ 脂肪族基、窒素、酸素もしくは硫黄から独立に選択される 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單環式環または、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、 $R^{x \times}$ は w_1 個の $R^{1 \sim 1}$ 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 は 0 ~ 3 であり、

ただし、両 $R^{X \times X}$ が同時に水素ではなく、

R^Y 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')₂ であり、

R^{1-1} 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 $C_1 - C_6$ 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、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCO NR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 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、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-NR'SO_2R'$ 、 $-NR'SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ 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单環式環、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单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 $R^{X \times X}$ が水素であり、もう一方の $R^{X \times X}$ 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 $R^{X \times X}$ 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】

$R^{X \times X}$ が $C_{1 \sim 6}$ 脂肪族基であり、 $R^{X \times X}$ が w_1 個の - $R^{1 \sim 1}$ 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】

$R^{X \times X}$ が、 w_1 個の - $R^{1 \sim 1}$ の独立した出現で場合により置換されていてもよい $C_{1 \sim C_6}$ 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】

$R^{X \times X}$ が $C_{1 \sim C_6}$ 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】

$R^{X \times X}$ 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单環式環、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、 $R^{X \times X}$ が w_1 個の - $R^{1 \sim 1}$ 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】

$R^{X \times X}$ 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单環式環であり、 $R^{X \times X}$ が w_1 個の - $R^{1 \sim 1}$ 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】

$R^{X \times X}$ 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、 $R^{X \times X}$ が w_1 個の - $R^{1 \sim 1}$ 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】

$R^{Y \times Y}$ が、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') である、請求項 1 0 ~ 2 4 のいず

れか一項に記載の化合物。

【請求項 26】

R^{Y Y} が水素である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

R^{Y Y} が - C O R' 、 - C O₂ R' 、 - C O N (R')₂ 、 - S O R' 、 - S O₂ R' 、 - S O₂ N (R')₂ 、 - C O C O R' 、 - C O C H₂ C O R' 、 - P (O) (O R')₂ 、 - P (O)₂ O R' または - P O (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^{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 C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 32】

p₁ 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 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^{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 C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

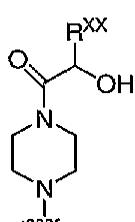
【請求項 34】

p₁ 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 C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 35】

R¹ および R² 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^{X X} が C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 35 に記載の化合物。

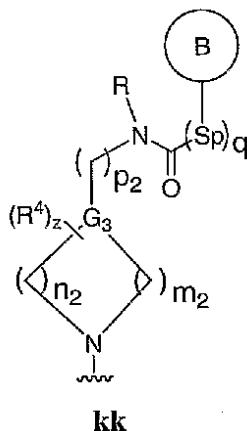
【請求項 37】

R^{X 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】

R¹ および R² が一緒になって以下に示される環 (k k)

【化12】



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、

Sp は結合であるか、または C 1 ~ 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' - 、 - SO₂ NR' - 、 NR' SO₂ - または - NR' SO₂ NR' - 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、单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 $Q - R^\times$ 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 - 、 - NR CO - 、 - NR CO₂ - 、 - SO₂ NR - 、 - NR SO₂ - 、 - CONR NR - 、 - NR CONR - 、 - OCONR - 、 - NR NR - 、 - NR SO₂ NR - 、 - 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^\times の各出現は、 - R' 、ハロゲン、 = O 、 = N R' 、 - 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 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单環式環、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 5 9】

S p が結合、O または - O - C H₂ - であり、p₂ が 1 であり、R が水素であり、n₂ およびm₂ が両方同時に 1 または 2 である、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

R が水素である、請求項 3 8 ~ 5 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 1】

R がC 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 3 8 ~ 5 9 のいずれか一項に記載の化合物。

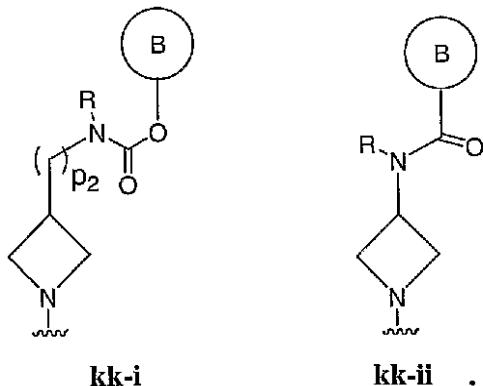
【請求項 6 2】

R がメチル、エチル、プロピルまたはブチルである、請求項 6 1 に記載の化合物。

【請求項 6 3】

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

【化 1 3】



の環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6 4】

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 員の飽和单環式複素環式環であり、環 B が w₂ 個の - R¹² の独立した出現で場合により置換されていてもよく、w₂ が 0 ~ 4 である、請求項 6 3 に記載の化合物。

【請求項 6 5】

R が水素である、請求項 6 3 ~ 6 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 6】

R が水素であり、環 B がテトラヒドロフラニルである、請求項 6 5 に記載の化合物。

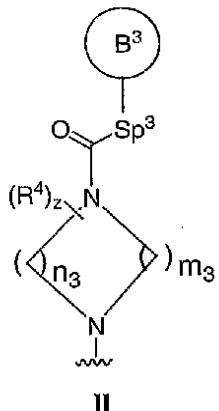
【請求項 6 7】

S p が結合、- O - または - O - C H₂ - である、請求項 6 3 ~ 6 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6 8】

R¹ および R² が一緒にになって以下の環 (II)

【化 1 4】



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、

$S p^3$ は - O - 、 - S - 、 - N R ' - または C 1 ~ 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' - 、 - SO₂ NR' - 、 - NR' SO₂ - または - NR' SO₂ NR' - 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、 $S p^3$ 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 B₃ は、O、S または N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、4 ~ 8 員の飽和、部分不飽和または芳香族单環式複素環式環であり、環 B₃ は、w₃ 個の - R^{1~3} の独立した出現で場合により置換されていてもよく、w₃ は 0 ~ 4 であり、

R^{1~3} 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_{1~6} 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 - 、 - NR CO - 、 - NR CO₂ - 、 - SO₂ NR - 、 - NR SO₂ - 、 - CONR NR - 、 - NR CONR - 、 - OCONR - 、 - NR NR - 、 - NR SO₂ NR - 、 - 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、=N R' 、 - 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 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单環式環、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单環式もしくは二環式環を形成する、

化合物。

【請求項 6 9】

$S p^3$ が - O - 、 - S - または - NR' - から選択される、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 0】

$S p^3$ が - O - である、請求項 6 8 ~ 6 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7 1】

$S p^3$ が - O - CH₂ - である、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

$S p^3$ が - NR' - である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

$S p^3$ が - NH - である、請求項 6 9 に記載の化合物。

【請求項 7 4】

$S p^3$ が - NH - CH₂ - である、請求項 6 8 に記載の化合物。

【請求項 7 5】

m_3 および n_3 が各々 1 である、請求項 6 8 ~ 7 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7 6】

m_3 および n_3 が 2 である、請求項 7 5 に記載の化合物。

【請求項 7 7】

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 - $R^{1 \sim 3}$ の独立した出現で場合により置換されてもよく、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7 8】

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 - $R^{1 \sim 3}$ の独立した出現で場合により置換されてもよく、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 7 7 に記載の化合物。

【請求項 7 9】

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 - $R^{1 \sim 3}$ の独立した出現で場合により置換されてもよく、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 0】

w_3 が 0 である、請求項 6 8 ~ 7 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 1】

環 B_3 がテトラヒドロフラニルである、請求項 6 8 ~ 8 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 2】

$S p^3$ が結合、O または - O - C H 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 6 8 に記載の化合物。

【請求項 8 3】

R が水素である、請求項 6 8 ~ 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 4】

R が C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 6 8 ~ 8 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 5】

R がメチル、エチル、プロピルまたはブチルを含む、請求項 8 4 に記載の化合物。

【請求項 8 6】

z が 0 である、請求項 6 8 ~ 8 5 のいずれか一項に記載の化合物。

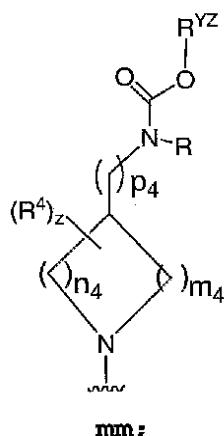
【請求項 8 7】

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 - $R^{1 \sim 3}$ の独立した出現で場合により置換されてもよく、 w_3 が 0 ~ 4 である、請求項 6 8 ~ 7 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8 8】

R^1 および R^2 が一緒になって、以下の環 (m m)

【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^Y^Z は、 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 $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり、 w_4 は 0 ~ 3 であり、

$R^{1~4}$ 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、 $-NR-$ 、 $-S-$ 、 $-O-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-CO-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR-$ 、 $-NRCO-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-SO_2NR-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-CONRNR-$ 、 $-NRCONR-$ 、 $-OCONR-$ 、 $-NRNR-$ 、 $-NRSO_2NR-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-PO-$ 、 $-PO_2-$ 、 $-OP(O)(OR)-$ 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、 $=O$ 、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')_2$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR'$ 、 $-CON(R')_2$ 、 $-OCON(R')_2$ 、 $-SOR'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-SO_2N(R')_2$ 、 $-COCOR'$ 、 $-COCH_2COR'$ 、 $-OP(O)(OR')_2$ 、 $-P(O)(OR')_2$ 、 $-OP(O)_2OR'$ 、 $-P(O)_2OR'$ 、 $-PO(R')_2$ または $-OPO(R')_2$ から独立に選択され、

R の各出現は独立に、水素または最大 3 個の置換基を有する $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり、 R' の各出現は独立に、水素または $C_1 \sim C_6$ 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单環式環、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单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。

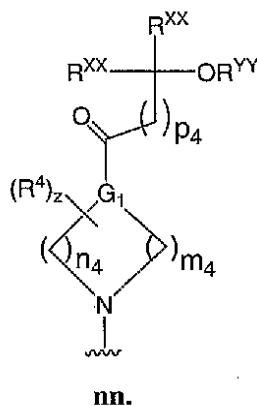
【請求項 9 9】

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 1 0 0】

R^1 および R^2 が一緒にになって以下の環 (n n)

【化 1 6】



を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 0 1】

G_1 が - N - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 2】

G_1 が - C H - N H - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 3】

G_1 が - C H - C H₂ - N H - である、請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 4】

R^{Y^Y} 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 C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 1 0 0 ~ 1 0 3 のいずれか一項に記載の化合物。

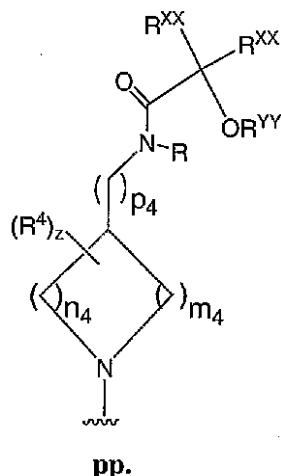
【請求項 1 0 5】

p_4 が 0 であり、 R^{Y^Y} 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 C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 1 0 0 ~ 1 0 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 0 6】

R^1 および R^2 が一緒にになって、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^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C1～C6アルキルである、請求項106に記載の化合物。

【請求項108】

p₄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NH₂である、請求項114に記載の化合物。

【請求項116】

WがCHF₂またはCH₂Fである、請求項1～108のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項117】

WがCHF₂である、請求項116に記載の化合物。

【請求項118】

WがCH₂F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】

R^4 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、-OC(=O)N(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1～122のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2 4】

R^4 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123に記載の化合物。

【請求項 1 2 5】

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チジン-1-イル(aa)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-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】

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チジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、 R^4 が-NRSO₂R' である、請求項125に記載の化合物。

【請求項 1 2 7】

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チジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、 R^4 が-NRCOOR' である、請求項125に記載の化合物。

【請求項 1 2 8】

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チジン-1-イル(aa)であり、zが1であり、 R^4 が-NRCOR' である、請求項125に記載の化合物。

【請求項 1 2 9】

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ピロリジン-1-イル(bb)であり、zが1または2であり、 R^4 がCl、Br、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 1 3 0】

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ピペリジン-1-イル(cc)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Cl、Br、F、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'、または -CH₂OR'、-NRSO₂R'、-NRCOOR' または -OC(=O)N(R')₂ である、請求項125に記載の化合物。

【請求項 1 3 1】

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ピペリジン-1-イル(cc)であり、zが1であり、 R^4 がF、CF₃、CH₃、-CH₂CH₃、-OR'

または - C H₂ O R' である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 3 2】

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 (c c) であり、z が 1 であり、R⁴ が - N R S O₂ R' である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 3 3】

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 (c c) であり、z が 1 であり、R⁴ が - N R C O O R' である、請求項 1 2 5 に記載の化合物。

【請求項 1 3 4】

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 (d d) 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 - S O R' 、 - C O N (R')₂ 、 - S O₂ N (R')₂ 、 - C O R' または - C O O R' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3 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ピペラジン - 1 - イル (d d) であり、z が 1 であり、R⁴ が - S O R' である、請求項 1 3 4 に記載の化合物。

【請求項 1 3 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ピペラジン - 1 - イル (d d) であり、z が 1 であり、R⁴ が - C O O R' である、請求項 1 3 4 に記載の化合物。

【請求項 1 3 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ピペラジン - 1 - イル (d d) であり、z が 1 であり、R⁴ が - C O N (R')₂ である、請求項 1 3 4 に記載の化合物。

【請求項 1 3 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ピペラジン - 1 - イル (d d) であり、z が 1 であり、R⁴ が - S O₂ N (R')₂ である、請求項 1 3 4 に記載の化合物。

【請求項 1 3 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ペラジン - 1 - イル (d d) であり、z が 1 であり、R⁴ が - C O R' である、請求項 1 3 4 に記載の化合物。

【請求項 1 4 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モルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、z が 1 または 2 であり、R⁴ の少なくとも 1 個の出現が - S O R' 、 - C O N (R')₂ 、 - S O₂ N (R')₂ 、 - C O R' または - C O O R' である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4 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モルホリン - 1 - イル (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、z が 1 であり、R⁴ が - S O R' である、請求項 1 4 0 に記載の化合物。

【請求項 1 4 2】

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 (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、z が 1 であり、R⁴ が - C O O R' である、請求項 1 4 0 に記載の化合物。

【請求項 1 4 3】

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 (e e) またはチオモルホリン - 1 - イル (f f) であり、z が 1 であり、R⁴ が - C O

$N(R')$ 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もよいモルホリン - 1 - イル ($e e$) またはチオモルホリン - 1 - イル ($f f$) であり、 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もよいモルホリン - 1 - イル ($e e$) またはチオモルホリン - 1 - イル ($f f$) であり、 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) 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' 、 - $C ON(R')$ 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - $C ON(R')$ 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) 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もよいアゼパン - 1 - イル ($g g$) 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もよいアゾカン - 1 - イル ($h h$) 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' 、 - $C ON(R')$ 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もよいアゾカン - 1 - イル ($h h$) 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もよいアゾカン - 1 - イル ($h h$) 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もよいアゾカン - 1 - イル ($h h$) であり、 z が 1 であり、 R^4 が - $C ON(R')$ 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もよいアゾカン - 1 - イル (

$h\ h$) であり、 z が 1 であり、 R^4 が $-SO_2N(R')$ 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、NO₂、-N(R')₂、-CH₂N(R')₂、-O R'、-CH₂OR'、-SR'、-CH₂SR'、-NRCOR'、-CON(R')₂、-S(O)₂N(R')₂、-OCOR'、-COR'、-CO₂R'、-OCON(R')₂、-NR'SO₂R'、-OP(O)(OR')₂、-P(O)(OR')₂、-OP(O)OR'、-P(O)₂OR'、-PO(R')₂、-OPO(R')₂または場合により置換されてもよい、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 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、CF₃、Me、Et、CN、-COOH、-NH₂、-N(CH₃)₂、-N(Et)₂、-N(ipr)₂、-O(CH₂)₂OCH₃、-CONH₂、-COOCH₃、-OH、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-CH₂OH、-NHCOCH₃、-SO₂NH₂、-SO₂NHC(CH₃)₂、-OCOC(CH₃)₃、-OCOCH₂C(CH₃)₃、-O(CH₂)₂N(CH₃)₂、4-CH₃-ピペラジン - 1 - イル、OCOCH(C₂H₅)₂、OCO(シクロペンチル)、-COCH₃、場合により置換されてもよいフェノキシまたは場合により置換され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 C₁ ~ C₆ アルキリデンである、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 172】

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

【請求項 173】

X が -CH₂- である、請求項 170 に記載の化合物。

【請求項 174】

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

【請求項 175】

R^Q が R' である、請求項 174 に記載の化合物。

【請求項 176】

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、-ペリジニル、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。

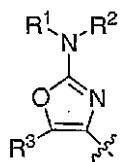
【請求項 183】

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

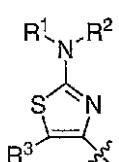
【請求項 1 8 4】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

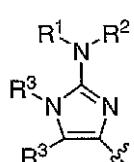
【化 1 8】



i



ii または



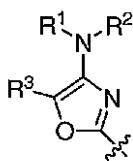
iii.

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。

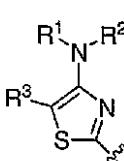
【請求項 1 8 5】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

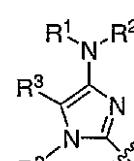
【化 1 9】



iv



v または



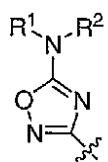
vi.

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。

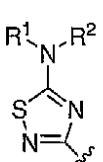
【請求項 1 8 6】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

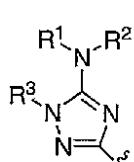
【化 2 0】



vii



viii または



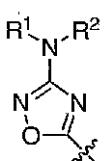
ix.

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。

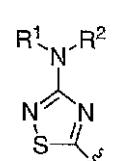
【請求項 1 8 7】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

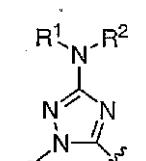
【化 2 1】



x



xi または



xii.

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 8】

X_1 、 X_2 および X_3 が一緒になって、以下

【化22】



xiii.

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189】

R³が水素である、請求項184～188のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項190】

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191】

請求項1～190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192】

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191に記載の組成物。

【請求項193】

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192に記載の組成物。

【請求項194】

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193に記載の組成物。

【請求項195】

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193に記載の組成物。

【請求項196】

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193に記載の組成物。

【請求項197】

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、頸関節痛、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・マリートウース神経障害、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、腎孟腎炎、虫垂炎、胆囊炎、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（M S）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（I C）または前立腺炎から選択される、請求項 1 9 3 に記載の組成物。