

【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 7 月 2 日 (2009.7.2)

【公表番号】特表 2008-540636 (P2008-540636A)

【公表日】平成 20 年 11 月 20 日 (2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報 2008-046

【出願番号】特願 2008-511822 (P2008-511822)

【国際特許分類】

C 07D 401/04 (2006.01)

C 07D 413/04 (2006.01)

C 07D 413/14 (2006.01)

A 61K 31/454 (2006.01)

A 61K 31/4545 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 3/00 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/32 (2006.01)

A 61P 25/36 (2006.01)

A 61P 25/34 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 401/04

C 07D 413/04 C S P

C 07D 413/14

A 61K 31/454

A 61K 31/4545

A 61P 43/00 1 1 1

A 61P 25/22

A 61P 25/20

A 61P 25/28

A 61P 3/00

A 61P 9/10

A 61P 25/24

A 61P 25/18

A 61P 25/14

A 61P 25/16

A 61P 25/32

A 61P 25/36

A 61P 25/34

A 61P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月12日(2009.5.12)

【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

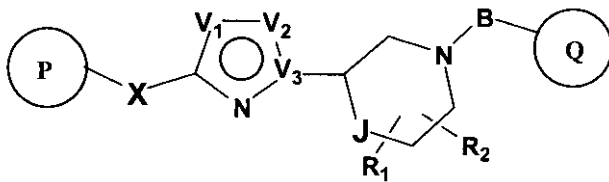
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の一般式 I - B :

【化1】



I-B

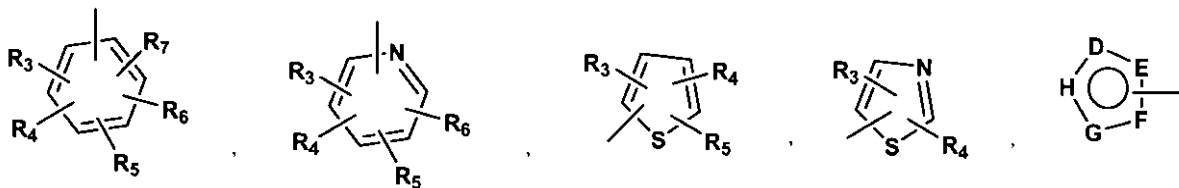
{ 式中、

V_1 、 V_2 及び V_3 は、独立して、炭素、酸素、又は窒素基を表し；

R_1 、及び R_2 は、独立して、水素、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ヒドロキシ、アミノ、アミノアルキル、ヒドロキシアルキル、 $-(C_1 - C_6)$ アルコキシを示し、あるいは R_1 と R_2 は、一緒になって、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル環、カルボニル結合 $C=O$ 又は炭素二重結合を形成し得；

P、及び Q は、各々独立して選択され、以下の式：

【化2】



のアリール又はヘテロアリール基を示し、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、及び R_7 は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $N(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CONR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-COOR_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_8)R_9$ 又は $C(=NOR_8)R_9$ 置換基であって；ここで、場合により、2つの置換基は、介在原子と結合し2環式ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール環を形成し；ここで、各環は、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-O-$ (

- C₁ - C₃) アルキルアリーール、- O - (C₁ - C₃) アルキルヘテロアリーール、- N ((C₀ - C₆) アルキル) ((C₀ - C₃) アルキルアリーール) 又は - N ((C₀ - C₆) アルキル) ((C₀ - C₃ -) アルキルヘテロアリーール) 基でさらに置換され;

R₈、R₉、R₁₀は、各々独立して、水素、(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、ハロ - (C₁ - C₆) アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリールアルキル、アリーールアルキル又はアリーールであり; そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、- CN、- (C₁ - C₆) アルキル、- O - (C₀ - C₆) アルキル、- O - (C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、- O (アリーール)、- O (ヘテロアリーール)、- N (C₀ - C₆ - アルキル)₂、- N ((C₀ - C₆) アルキル) ((C₃ - C₇ -) シクロアルキル) 又は - N ((C₀ - C₆) アルキル) (アリーール) 置換基で置換されたものであり;

P、及びQにおけるD、E、F、G、及びHは、独立して、- C (R₃) =、- C (R₃) = C (R₄) -、- C (=O) -、- C (=S) -、- O -、- N =、- N (R₃) - 又は - S - を示し;

Bは、一重結合、- C (=O) - (C₀ - C₂) アルキル -、- C (=O) - (C₂ - C₆) アルケニル -、- C (=O) - (C₂ - C₆) アルキニル -、- C (=O) - O -、- C (=O) NR₈ - (C₀ - C₂) アルキル -、- C (=NR₈) NR₉ - S (=O) - (C₀ - C₂) アルキル -、- S (=O)₂ - (C₀ - C₂) アルキル -、- S (=O)₂ NR₈ - (C₀ - C₂) アルキル -、C (=NR₈) - (C₀ - C₂) アルキル -、- C (=NOR₈) - (C₀ - C₂) アルキル - 又は - C (=NOR₈) NR₉ - (C₀ - C₂) アルキル - を示し;

R₈、及びR₉は、独立して、上記に定義されたものであり;

Xは、- NR₁₁C (=O)O -、場合により置換された、- (C₁ - C₆) アルキル -、- (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₃ - C₈) シクロアルケニル -、- (C₁ - C₆) アルキルハロ -、- (C₁ - C₆) アルキルシアノ -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O) - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O) - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O) - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O) - (C₃ - C₇) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O) - (C₄ - C₁₀) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)O - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)O - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)O - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)O - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)O - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - C (=O)NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルキニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₂ - C₆) アルケニル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、- (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₀ - C₆) アルキル -、- (C₀ - C₆) ア

ルキル - $S(O)_2 - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $S(O)_2 NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O) - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O) - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O) - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=O)NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=O)NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=O)NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}S(O)_2 - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}S(O)_2 - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}S(O)_2 - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}S(O)_2 - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}S(O)_2 - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=S)NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=S)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=S)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=S)NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{12}C(=S)NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O) - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O) - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O) - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O) - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O) - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O)NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O)NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $OC(=O)NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O)O - (C_2 - C_6)$ アルキニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O)O - (C_2 - C_6)$ アルケニル -、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O)O - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル - 又は、 - $(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11}C(=O)O - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキルから独立して選択され；

R_{11} 、及び R_{12} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキルアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、ハロ - $C_1 - C_6$ - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、 $C_1 - C_6$ - アルキル、-O($C_0 - C_6$ - アルキル)、-O($C_3 - C_7$ - シクロアルキルアルキル)、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)

)、 $-N(C_0-C_6\text{-アルキル})(C_0-C_6\text{-アルキル})$ 、 $-N(C_0-C_6\text{-アルキル})(C_3-C_7\text{-シクロアルキル})$ 又は $-N(C_0-C_6\text{-アルキル})(\text{アリール})$ 置換基で置換されたものであり；

Jは、一重結合、 $-C(R_{13})(R_{14})$ 、 $-O-$ 、 $-N(R_{13})-$ 又は $-S-$ であり；
 R_{13} 、 R_{14} は、独立して、水素、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2-C_6)$ アルケニル、 $-(C_2-C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1-C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-O(C_0-C_6)$ アルキル、 $-O(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O(\text{アリール})$ 、 $-O(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-N(C_0-C_6)$ アルキル $-(C_0-C_6)$ アルキル、 $-N(C_0-C_6)$ アルキル $-(C_3-C_7)$ シクロアルキル又は $-N(C_0-C_6)$ アルキル $-(\text{アリール})$ 置換基で置換され；

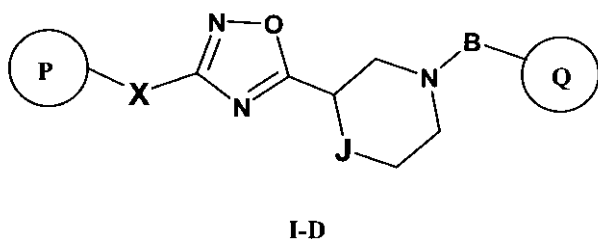
いずれかのNは、N - オキシドとなり得る}

を有する化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項2】

以下の一般式 I - D：

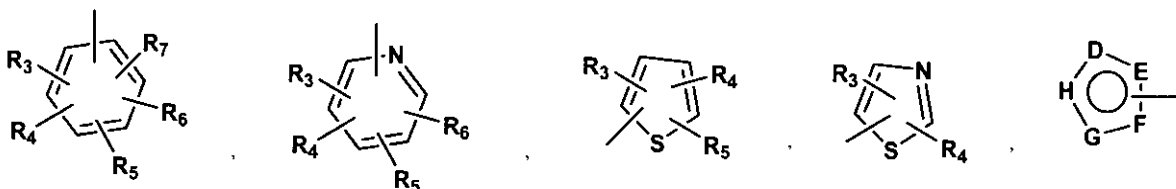
【化3】



{ 式中、

P、及びQは、各々独立して選択され、以下の式：

【化4】



のアリール又はヘテロアリール基を示し、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、及び R_7 は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2-C_6)$ アルケニル、 $-(C_2-C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1-C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $N(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $-NR_8CO_2R_9$ 、 $-NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CONR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-COOR_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_8)R_9$ 又は $C(=NOR_8)R_9$ 置換基であって；ここで、場合により、2つの置換基は、介在原子と結合し2環式ヘテロシクロアルキル、アリール又

はヘテロアリーール環を形成し；ここで、各環は、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリーール)、 $-O$ (ヘテロアリーール)、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルアリーール、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルヘテロアリーール、 $-N$ ($-(C_0 - C_6)$ アルキル)($-(C_0 - C_3)$ アルキルアリーール)又は $-N$ ($-(C_0 - C_6)$ アルキル)($-(C_0 - C_3 -)$ アルキルヘテロアリーール)基でさらに置換され；

R_8 、 R_9 、 R_{10} は、各々独立して、水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリールアルキル、アリーールアルキル又はアリーールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリーール)、 $-O$ (ヘテロアリーール)、 $-N(C_0 - C_6 - \text{アルキル})_2$ 、 $-N$ ($-(C_0 - C_6)$ アルキル)($-(C_3 - C_7 -)$ シクロアルキル)又は $-N$ ($-(C_0 - C_6)$ アルキル)(アリーール)置換基で置換されたものであり；

P 、及び Q における D 、 E 、 F 、 G 、及び H は、独立して、 $-C(R_3) =$ 、 $-C(R_3) = C(R_4) -$ 、 $-C(=O) -$ 、 $-C(=S) -$ 、 $-O -$ 、 $-N =$ 、 $-N(R_3) -$ 又は $-S -$ を示し；

B は、一重結合、 $-C(=O) - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-C(=O) - O -$ 、 $-C(=O)NR_8 - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=NR_8)NR_9 - S(=O) - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-S(=O)_2 - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-S(=O)_2NR_8 - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $C(=NR_8) - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=NOR_8) - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 又は $-C(=NOR_8)NR_9 - (C_0 - C_2)$ アルキル $-$ を示し；

R_8 、及び R_9 は、独立して、上記に定義されたものであり；

X は、 $-NR_{11}C(=O)O -$ 、場合により置換された、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_3 - C_8)$ シクロアルケニル $-$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキルハロ $-$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキルシアノ $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O) - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O) - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O) - (C_3 - C_7)$ アルキルシクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O) - (C_4 - C_{10})$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)O - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)O - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)O - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)O - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)O - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)NR_{11} - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)NR_{11} - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-C(=O)NR_{11} - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S - (C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S - (C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S - (C_4 - C_{10})$ アルキルシクロアルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S(O) - (C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O - (C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-S(O) -$

(C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=O) NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=O) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=O) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=O) NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=O) NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ S (O)₂ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ S (O)₂ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ S (O)₂ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=S) NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=S) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=S) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=S) NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₂ C (=S) NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - OC (=O) NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) O - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) O - (C₂ - C₆) アルキニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) O - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) O - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 又は、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ C (=O) O - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキルから独立して選択され；

R₁₁、及び R₁₂は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキルアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ - ル

アルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_1-C_6 -アルキル、 $-O(C_0-C_6$ -アルキル)、 $-O(C_3-C_7$ -シクロアルキルアルキル)、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-N(C_0-C_6$ -アルキル)(C_0-C_6 -アルキル)、 $-N(C_0-C_6$ -アルキル)(C_3-C_7 -シクロアルキル)又は $-N(C_0-C_6$ -アルキル)(アリール)置換基で置換されたものであり；

Jは、一重結合、 $-C(R_{13})(R_{14})$ 、 $-O-$ 、 $-N(R_{13})-$ 又は $-S-$ であり；
 R_{13} 、 R_{14} は、独立して、水素、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2-C_6)$ アルケニル、 $-(C_2-C_6)$ アルキニル、ハロ(C_1-C_6)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-O(C_0-C_6)$ アルキル、 $-O(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-N(C_0-C_6)$ アルキル)(C_0-C_6 アルキル)、 $-N(C_0-C_6)$ アルキル)(C_3-C_7 シクロアルキル)又は $-N(C_0-C_6)$ アルキル)(アリール)置換基で置換され；

いずれかのNは、N-オキシドとなり得る}

を有する、請求項1に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項3】

上記一般式I-Dにおいて；

Bが、 $-C(=O)-(C_0-C_2)$ アルキル-であり；

Xが、置換されていてもよい、 $-(C_1-C_6)$ アルキル-、 $-(C_0-C_6)$ アルキル-O- (C_0-C_6) アルキル-、 $-(C_0-C_6)$ アルキル-C(=O)- (C_0-C_6) アルキル-、 $-(C_0-C_6)$ アルキル-S- (C_2-C_6) アルキル-、又は $-(C_0-C_6)$ アルキル-NR₁₁- (C_0-C_6) アルキル-であり；

R₁₁は、水素又は (C_1-C_6) アルキルであり；

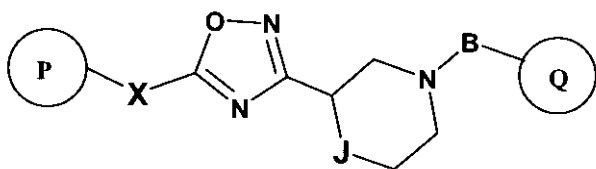
いずれかのNが、N-オキシドであってもよい、

請求項2に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項4】

以下の一般式II-B：

【化5】

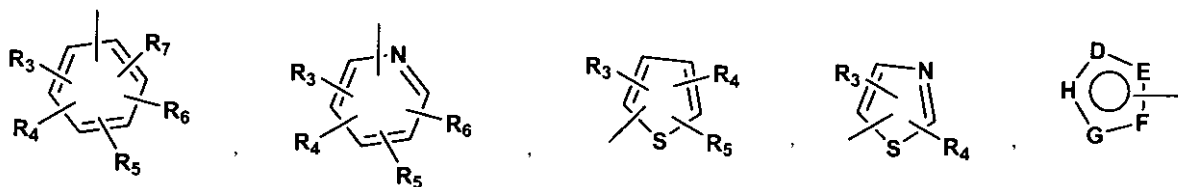


II-B

{ 式中、

P、及びQは、各々独立して選択され、以下の式：

【化 6】



のアリール又はヘテロアリール基を示し、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、及び R_7 は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $N(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CONR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-COOR_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_8)R_9$ 又は $C(=NOR_8)R_9$ 置換基であって；ここで、場合により、2つの置換基は、介在原子と結合し2環式ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール環を形成し；ここで、各環は、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルアリール、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルヘテロアリール、 $-N((C_0 - C_6) \text{アルキル}) ((C_0 - C_3) \text{アルキルアリール})$ 又は $-N((C_0 - C_6) \text{アルキル}) ((C_0 - C_3 -) \text{アルキルヘテロアリール})$ 基でさらに置換され；

R_8 、 R_9 、 R_{10} は、各々独立して、水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-N((C_0 - C_6 - \text{アルキル})_2)$ 、 $-N((C_0 - C_6) \text{アルキル}) ((C_3 - C_7 -) \text{シクロアルキル})$ 又は $-N((C_0 - C_6) \text{アルキル}) (\text{アリール})$ 置換基で置換されたものであり；

P、及びQにおけるD、E、F、G、及びHは、独立して、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は $-S-$ を示し；

Bは、一重結合、 $-C(=O)-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=O)-(C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-C(=O)-(C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-C(=O)NR_8-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=NR_8)NR_9-S(=O)-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-S(=O)_2-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-S(=O)_2NR_8-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $C(=NR_8)-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 、 $-C(=NOR_8)-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ 又は $-C(=NOR_8)NR_9-(C_0 - C_2)$ アルキル $-$ を示し；

R_8 、及び R_9 は、独立して、上記に定義されたものであり；

Xは、 $-NR_{11}C(=O)O-$ 、場合により置換された、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$ 、 $-(C_3 - C_8)$ シクロアルケニル $-$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキルハロ $-$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキルシアノ $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O-(C_2 - C_6)$ アルキニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O-(C_2 - C_6)$ アルケニル $-$ 、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキル $-$

[illegible]

ル - $\text{NR}_{12}\text{C}(=\text{S})\text{NR}_{11} - (\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{12}\text{C}(=\text{S})\text{NR}_{11} - (\text{C}_4 - \text{C}_{10})$ アルキルシクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O}) - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O}) - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O}) - (\text{C}_4 - \text{C}_{10})$ アルキルシクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O}) - (\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_{11} - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_{11} - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_{11} - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_{11} - (\text{C}_4 - \text{C}_{10})$ アルキルシクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}_{11} - (\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11}\text{C}(=\text{O})\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11}\text{C}(=\text{O})\text{O} - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11}\text{C}(=\text{O})\text{O} - (\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11}\text{C}(=\text{O})\text{O} - (\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル - 又は、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11}\text{C}(=\text{O})\text{O} - (\text{C}_4 - \text{C}_{10})$ アルキルシクロアルキルから独立して選択され；

R_{11} 、及び R_{12} は、各々独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_7$ - シクロアルキルアルキル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ - アルケニル、 $\text{C}_2 - \text{C}_6$ - アルキニル、ハロ - $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ - アルキル、- $\text{O}(\text{C}_0 - \text{C}_6 - \text{アルキル})$ 、- $\text{O}(\text{C}_3 - \text{C}_7 - \text{シクロアルキルアルキル})$ 、- $\text{O}(\text{アリール})$ 、- $\text{O}(\text{ヘテロアリール})$ 、- $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6 - \text{アルキル})(\text{C}_0 - \text{C}_6 - \text{アルキル})$ 、- $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6 - \text{アルキル})(\text{C}_3 - \text{C}_7 - \text{シクロアルキル})$ 又は - $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6 - \text{アルキル})(\text{アリール})$ 置換基で置換されたものであり；

J は、一重結合、- $\text{C}(\text{R}_{13})(\text{R}_{14})$ 、- O -、- $\text{N}(\text{R}_{13})$ - 又は -S- であり；

R_{13} 、 R_{14} は、独立して、水素、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、- $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$ シクロアルキル、- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキルアルキル、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル、ハロ $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、- $\text{O}(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル、- $\text{O}(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキルアルキル、- $\text{O}(\text{アリール})$ 、- $\text{O}(\text{ヘテロアリール})$ 、- $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル、- $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル 又は - $\text{N}(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル (アリール) 置換基で置換され；

いずれかの N は、N - オキシドとなり得る；

を有する、請求項 1 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 5】

上記一般式 II - B において；

B が、- $\text{C}(=\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_2)$ アルキル - であり；

X が、置換されていてもよい、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{C}(=\text{O}) - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - 、 - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - S - $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキル - 、又は - $(\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - $\text{NR}_{11} - (\text{C}_0 - \text{C}_6)$ アルキル - であり；

R_{11} は、水素又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり；

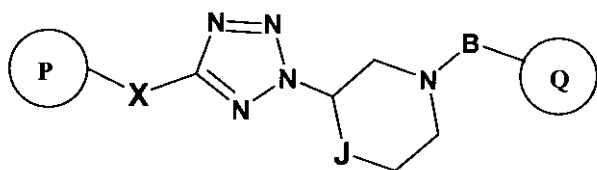
いずれかの N が、N - オキシドであってもよい、

請求項 4 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 6】

以下の一般式 III - A :

【化 7】

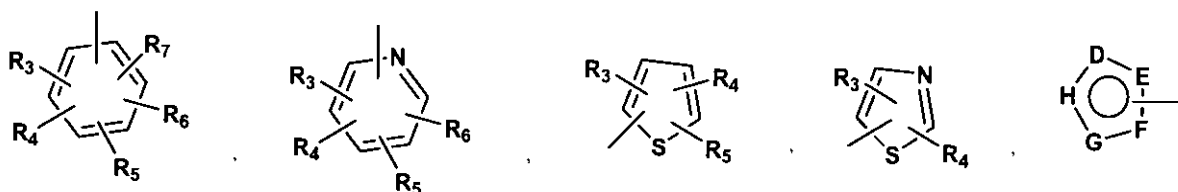


III-A

{ 式中、

P、及び Q は、各々独立して選択され、以下の式：

【化 8】



のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し、
 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、及び R_7 は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $N(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CONR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-COOR_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_8)R_9$ 又は $C(=NOR_8)R_9$ 置換基であって；ここで、場合により、2つの置換基は、介在原子と結合し2環式ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール環を形成し；ここで、各環は、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルアリール、 $-O-(C_1 - C_3)$ アルキルヘテロアリール、 $-N((C_0 - C_6) \text{ アルキル }) ((C_0 - C_3) \text{ アルキルアリール })$ 又は $-N((C_0 - C_6) \text{ アルキル }) ((C_0 - C_3) \text{ アルキルヘテロアリール })$ 基でさらに置換され；

R_8 、 R_9 、 R_{10} は、各々独立して、水素、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_0 - C_6)$ アルキル、 $-O-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-N((C_0 - C_6) \text{ アルキル })_2$ 、 $-N((C_0 - C_6) \text{ アルキル }) ((C_3 - C_7) \text{ シクロアルキル })$ 又は $-N((C_0 - C_6) \text{ アルキル }) (\text{アリール})$ 置換基で置換されたものであり；

P、及び Q における D、E、F、G、及び H は、独立して、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は

- S - を示し；

B は、一重結合、- C (= O) - (C₀ - C₂) アルキル - 、 - C (= O) - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - C (= O) - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - C (= O) - O - 、 - C (= O) NR₈ - (C₀ - C₂) アルキル - 、 - C (= NR₈) NR₉ - S (= O) - (C₀ - C₂) アルキル - 、 - S (= O)₂ - (C₀ - C₂) アルキル - 、 - S (= O)₂ NR₈ - (C₀ - C₂) アルキル - 、 C (= NR₈) - (C₀ - C₂) アルキル - 、 - C (= NOR₈) - (C₀ - C₂) アルキル - 又は - C (= NOR₈) NR₉ - (C₀ - C₂) アルキル - を示し；

R₈、及び R₉は、独立して、上記に定義されたものであり；

X は、場合により置換された、- (C₁ - C₆) アルキル - 、 - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 、 - (C₃ - C₈) シクロアルケニル - 、 - (C₁ - C₆) アルキルハロ - 、 - (C₁ - C₆) アルキルシアノ - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - C (= O) - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - C (= O) - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - C (= O) - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - C (= O) - (C₃ - C₇) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - C (= O) - (C₄ - C₁₀) シクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - O - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O) - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - S (O)₂ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルキニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル - 、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 又は - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - を示し；

R₁₁、及び R₁₂は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキルアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、- CN、C₁ - C₆ - アルキル、- O (C₀ - C₆ - アルキル)、- O (C₃ - C₇ - シクロアルキルアルキル)、- O (アリール)、- O (ヘテロアリール)、- N (C₀ - C₆ - アルキル) (C₀ - C₆ - アルキル)、- N (C₀ - C₆ - アルキル) (C₃ - C₇ - シクロアルキル) 又は - N (C₀ - C₆ - アルキル) (アリール) 置換基で置換されたものであり；

J は、一重結合、- C (R₁₃) (R₁₄)、- O - 、- N (R₁₃) - 又は - S - であり；

R₁₃、R₁₄は、独立して、水素、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₃ - C₆) シクロアルキル、- (C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、- (C₂ - C₆) アルケニル、- (C₂ - C₆) アルキニル、ハロ (C₁ - C₆) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、- CN、- (C₁ - C₆) アルキル、- O (C₀ - C₆) アルキル、- O (C

$_3 - C_7$) シクロアルキルアルキル、 $-O$ (アリール)、 $-O$ (ヘテロアリール)、 $-N$ ($C_0 - C_6$) アルキル) ($C_0 - C_6$) アルキル)、 $-N$ ($C_0 - C_6$) アルキル) ($C_3 - C_7$) シクロアルキル) 又は $-N$ ($C_0 - C_6$) アルキル) (アリール) 置換基で置換され;

いずれかの N は、 N - オキシドとなり得る}

を有する、請求項 1 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 7】

上記一般式 III - A において:

B が、 $-C(=O) - (C_0 - C_2)$ アルキル - であり;

X が、置換されていてもよい、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル -、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル - $O - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル - $C(=O) - (C_0 - C_6)$ アルキル -、 $-(C_0 - C_6)$ アルキル - $S - (C_2 - C_6)$ アルキル -、又は $-(C_0 - C_6)$ アルキル - $NR_{11} - (C_0 - C_6)$ アルキル - であり;

R_{11} は、水素又は $(C_1 - C_6)$ アルキルであり;

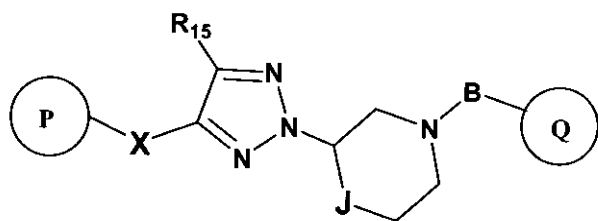
いずれかの N が、 N - オキシドであってもよい、

請求項 6 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 8】

以下の一般式 IV - A :

【化 9】

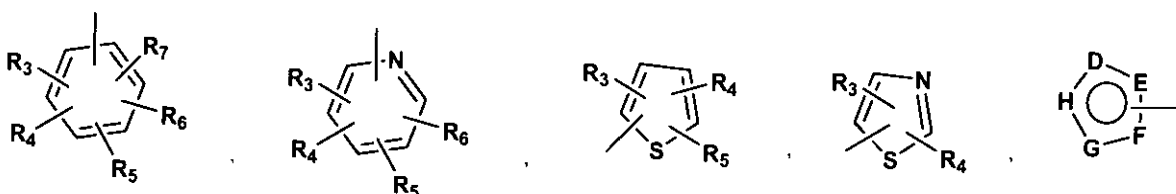


IV-A

{ 式中、

P 、及び Q は、各々独立して選択され、以下の式:

【化 10】



のシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、及び R_7 は、独立して、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $-(C_2 - C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1 - C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $N(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CONR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、

- S(=O)₂R₈、- S(=O)₂NR₈R₉、- C(=O)R₈、- COOR₈、- C(=O)NR₈R₉、- C(=NR₈)R₉又はC(=NOR₈)R₉置換基であって；ここで、場合により、2つの置換基は、介在原子と結合し2環式ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール環を形成し；ここで、各環は、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₆)アルキル、-O-(C₀-C₆)アルキル、-O-(C₃-C₇)シクロアルキルアルキル、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-O-(C₁-C₃)アルキルアリール、-O-(C₁-C₃)アルキルヘテロアリール、-N((-C₀-C₆)アルキル)((C₀-C₃)アルキルアリール)又は-N((-C₀-C₆)アルキル)((C₀-C₃-)アルキルヘテロアリール)基でさらに置換され；

R₈、R₉、R₁₀は、各々独立して、水素、(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、ハロ-(C₁-C₆)アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1～5個の独立した、ハロゲン、-CN、-(C₁-C₆)アルキル、-O-(C₀-C₆)アルキル、-O-(C₃-C₇)シクロアルキルアルキル、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-N(C₀-C₆-アルキル)₂、-N((C₀-C₆)アルキル)((C₃-C₇-)シクロアルキル)又は-N((C₀-C₆)アルキル)(アリール)置換基で置換されたものであり；

P、及びQにおけるD、E、F、G、及びHは、独立して、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Bは、一重結合、-C(=O)-(C₀-C₂)アルキル-、-C(=O)-(C₂-C₆)アルケニル-、-C(=O)-(C₂-C₆)アルキニル-、-C(=O)-O-、-C(=O)NR₈-(C₀-C₂)アルキル-、-C(=NR₈)NR₉-S(=O)-(C₀-C₂)アルキル-、-S(=O)₂-(C₀-C₂)アルキル-、-S(=O)₂NR₈-(C₀-C₂)アルキル-、C(=NR₈)-(C₀-C₂)アルキル-、-C(=NOR₈)-(C₀-C₂)アルキル-又は-C(=NOR₈)NR₉-(C₀-C₂)アルキル-を示し；

R₈、及びR₉は、独立して、上記に定義されたものであり；

Xは、場合により置換された、-(C₁-C₆)アルキル-、-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₃-C₇)シクロアルキル-、-(C₃-C₈)シクロアルケニル-、-(C₁-C₆)アルキルハロ-、-(C₁-C₆)アルキルシアノ-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₀-C₆)アルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₃-C₇)シクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₄-C₁₀)アルキルシクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-C(=O)-(C₀-C₆)アルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-C(=O)-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₀-C₆)アルキル-C(=O)-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₀-C₆)アルキル-C(=O)-(C₃-C₇)アルキルシクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-C(=O)-(C₄-C₁₀)シクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S-(C₀-C₆)アルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S-(C₃-C₇)シクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S-(C₄-C₁₀)アルキルシクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)-(C₀-C₆)アルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-O-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)-(C₃-C₇)シクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)-(C₄-C₁₀)アルキルシクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)₂-(C₀-C₆)アルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)₂-(C₂-C₆)アルキニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)₂-(C₂-C₆)アルケニル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)₂-(C₃-C₇)シクロアルキル-、-(C₀-C₆)アルキル-S(O)₂-(C₄-C₁₀)アルキルシクロアル

キル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₂ - C₆) アルケニル -、 - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₃ - C₇) シクロアルキル - 又は - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₄ - C₁₀) アルキルシクロアルキル - を示し、；

R₁₁、及び R₁₂は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキルアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、ハロ - C₁ - C₆ - アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ - ルアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、C₁ - C₆ - アルキル、-O(C₀ - C₆ - アルキル)、-O(C₃ - C₇ - シクロアルキルアルキル)、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-N(C₀ - C₆ - アルキル)(C₀ - C₆ - アルキル)、-N(C₀ - C₆ - アルキル)(C₃ - C₇ - シクロアルキル)又は -N(C₀ - C₆ - アルキル)(アリール)置換基で置換されたものであり；

Jは、一重結合、-C(R₁₃)(R₁₄)、-O-、-N(R₁₃) - 又は -S- であり；

R₁₃、R₁₄は、独立して、水素、-(C₁ - C₆) アルキル、-(C₃ - C₆) シクロアルキル、-(C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、-(C₂ - C₆) アルケニル、-(C₂ - C₆) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ - ルアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、-(C₁ - C₆) アルキル、-O(C₀ - C₆) アルキル、-O(C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-N(C₀ - C₆) アルキル)(C₀ - C₆) アルキル、-N(C₀ - C₆) アルキル)(C₃ - C₇) シクロアルキル)又は -N(C₀ - C₆) アルキル)(アリール)置換基で置換され；

R₁₅は、水素、-(C₁ - C₆) アルキル、-(C₃ - C₆) シクロアルキル、-(C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、-(C₂ - C₆) アルケニル、-(C₂ - C₆) アルキニル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリ - ルアルキル、アリールアルキル又はアリールであり；そのいずれかは、場合により、1 ~ 5 個の独立した、ハロゲン、-CN、-(C₁ - C₆) アルキル、-O(C₀ - C₆) アルキル、-O(C₃ - C₇) シクロアルキルアルキル、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-N(C₀ - C₆) アルキル)(C₀ - C₆) アルキル、-N(C₀ - C₆) アルキル)(C₃ - C₇) シクロアルキル)又は -N(C₀ - C₆) アルキル)(アリール)置換基で置換され、

いずれかのNは、N - オキシドとなり得る}

を有する、請求項 1 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 9】

上記一般式 IV - A において：

B が、-C(=O) - (C₀ - C₂) アルキル - であり；

X が、置換されていてもよい、-(C₁ - C₆) アルキル -、-(C₀ - C₆) アルキル - O - (C₀ - C₆) アルキル -、-(C₀ - C₆) アルキル - C(=O) - (C₀ - C₆) アルキル -、-(C₀ - C₆) アルキル - S - (C₂ - C₆) アルキル -、又は - (C₀ - C₆) アルキル - NR₁₁ - (C₀ - C₆) アルキル - であり；

R₁₁は、水素又は(C₁ - C₆) アルキルであり；

いずれかのNが、N - オキシドであってもよい、

請求項 8 に記載される化合物、あるいはかかる化合物の医薬として認容される塩、水和物又は溶媒和物。

【請求項 10】

ラセミ混合物又は単一の光学異性体のいずれかである、光学異性体として存在し得る、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

前記化合物が、以下の：

{ (S) - 3 - [3 - (4 - フルオロ - ベンジル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

(3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [3 - (4 - フルオロ - ベンジル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

(3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [5 - (4 - フルオロ - ベンジル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

{ (S) - 3 - [5 - (4 - フルオロ - ベンジル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [5 - ((S) - 1 - フェニル - エチル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [5 - ((R) - 1 - フェニル - エチル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

[(S) - 3 - (5 - ベンジル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [5 - ((S) - ヒドロキシ - フェニル - メチル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [5 - ((R) - ヒドロキシ - フェニル - メチル) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - [(S) - 3 - (5 - フェネチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - メタノン ;

{ 3 - [(S) - 1 - (4 - フルオロ - ベンゾイル) - ピペリジン - 3 - イル] - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル } - フェニル - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - [(S) - 3 - (5 - フェニルアミノ - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - メタノン ;

{ (S) - 3 - [5 - (4 - フルオロ - ベンジルアミノ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 3 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

[(S) - 3 - (5 - ベンジル - テトラゾル - 2 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

{ 3 - [3 - (4 - フルオロ - フェノキシ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - [3 - (3 - フェノキシ - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - メタノン ;

(6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - [(S) - 3 - (3 - フェノキシ - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - メタノン ;

{ (S) - 3 - [3 - (2 - フルオロ - フェノキシ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - メタノン ;

{ (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - メタノン ;

(4 - フルオロ - フェニル) - [(S) - 3 - (3 - フェニルスルファニル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル) - ピペリジン - 1 - イル] - メタノン ;

{ 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

{ 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1 , 2 , 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル } - (4 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;

[illegible]

5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (3H - イミダゾル - 4 - イル) - メタノン ;
 (3, 5 - ジフルオロ - フェニル) - { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (5 - メチル - イソキサゾル - 4 - イル) - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - チアゾル - 5 - イル - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - ピリジン - 2 - イル - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - フェニル - メタノン ;
 (4 - クロロ - フェニル) - { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (4 - メトキシ - フェニル) - メタノン ;
 (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (3 - メトキシ - フェニル) - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - o - トリル - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (2 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (3 - フルオロ - フェニル) - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - ピリジン - 3 - イル - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - ピリジン - 4 - イル - メタノン ;
 { (S) - 3 - [3 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - [1, 2, 4] オキサジアゾル - 5 - イル] - ピペリジン - 1 - イル} - (3, 5 - ジメチル - イソキサゾル - 4 - イル) - メタノン、

から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、及びその医薬として許容される塩。

【請求項 12】

治療有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物、及び医薬として許容される担体、及び / 又は賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 13】

m G l u R 5 アロステリック調節因子 (エンハンサー) の神経調節作用により影響を与えられ又は促進される、ヒトを含む哺乳類における症状を治療、及び予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

不安障害：広場恐怖症、全般性不安障害 (GAD)、強迫性障害 (OCD)、パニック障害、心的外傷後ストレス障害 (PTSD)、社会恐怖、他の恐怖症、物質誘発性不安障害からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 15】

小児期障害：注意欠陥／過活動性障害から選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 16】

摂食障害（神経性食欲不振、神経性大食症）から選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 17】

気分障害：双極性障害（I & II）、循環病、うつ病、気分変調性障害、大うつ病性障害、物質誘発性気分障害からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 18】

精神病性障害：統合失調症、妄想性障害、統合失調感情障害、統合失調症様障害、物質誘発性精神病性障害からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 19】

認識障害：せん妄、物質誘発性持続せん妄、痴呆、HIV 疾患による痴呆、ハンチントン病による痴呆、パーキンソン病による痴呆、アルツハイマー型の痴呆、物質誘発性持続痴呆、軽度認識障害からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 20】

人格障害：強迫性人格障害、統合失調質、統合失調型障害からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 21】

物質関連障害：アルコール乱用、アルコール依存、アルコール離脱、アルコール離脱せん妄、アルコール誘発精神病性障害、アンフェタミン依存、アンフェタミン離脱、コカイン依存、コカイン離脱、ニコチン依存、ニコチン離脱、オピオイド依存、オピオイド離脱からなる群より選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 22】

良性多発性硬化症、再発性寛解型多発性硬化症、続発進行性多発性硬化症、原発進行性多発性硬化症、進行性再発性多発性硬化症の如き多発性硬化症型から選択される中枢神経系疾患を治療又は予防するための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 23】

請求項 13 ~ 22 のいずれか 1 項に記載される治療又は予防のための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物／組成物の使用。

【請求項 24】

代謝型グルタミン酸受容体をイメージ化するためのトレーサーを製造するための請求項 1 に記載の化合物の使用。