

【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30年2月1日(2018.2.1)

【公表番号】特表2016-540792(P2016-540792A)

【公表日】平成28年12月28日(2016.12.28)

【年通号数】公開・登録公報2016-070

【出願番号】特願2016-539896(P2016-539896)

【国際特許分類】

C 07 D 231/12	(2006.01)
C 07 D 249/06	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 249/04	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 403/06	(2006.01)
A 61 K 31/4192	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
C 07 D 487/08	(2006.01)
A 61 K 31/4995	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 231/12	A
C 07 D 249/06	5 0 1
A 61 K 31/496	
C 07 D 401/14	C S P
C 07 D 249/04	5 0 3
C 07 D 401/04	
C 07 D 403/06	
A 61 K 31/4192	
C 07 D 487/04	1 3 7
C 07 D 487/08	
A 61 K 31/4995	
A 61 K 31/551	
C 07 D 401/12	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/06	
A 61 P 25/02	1 0 1
A 61 P 43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成29年12月15日(2017.12.15)

【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

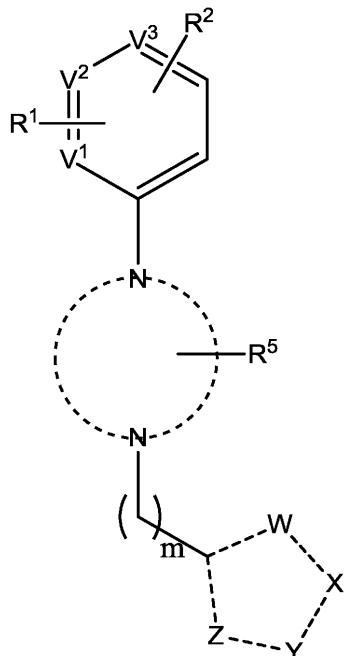
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)で表される化合物であり、

【化1】



(I)

mが1又は2であり；

V¹、V²及びV³の1つが、窒素又は炭素から選択され、それ以外の2つは炭素であり；

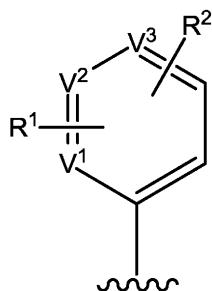
R¹が、ヒドロキシル、-NR⁶R⁷、-NR⁶S(O)₂R⁷、-NR⁶COR⁷、-NR⁶CONR⁷R⁸、-SR⁶、-S(O)₂R⁶、-S(O)₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R²が、水素、ハロゲン、-NR⁶R⁷、-SR⁶、-OR⁶、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

又は、

R¹及びR²が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式Iのコア構造の環

【化2】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

R¹における前記のアリール又はヘテロシクリル、及び／又はR²における前記のシクロアルキル、アリール又はヘテロシクリル、又はR¹及びR²によって形成される前記の環、又はそれに縮合される前記の環が、もし置換されているならば、OH、SH、=O、ハロゲン(F、Cl)

、I、Br)、CN、NO₂、COOH、R_z、O-R_z、S-R_z、-C(O)-R_z、-C(O)-O-R_z、NR_xR_y；置換又は非置換のアリール又はアルキル-アリール、置換又は非置換のシクロアルキル又はアルキル-シクロアルキル；置換又は非置換のヘテロシクリル又はアルキル-ヘテロシクリル；から選択される1つ以上の置換基で置換され；

R²における前記のアルキル、アルケニル又はアルキニルが、もし置換されているならば、F、Cl、Br、I、NH₂、SH若しくはOH、-C(O)OH、又は-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R_zが、飽和又は不飽和の、直鎖状又は分枝状の、置換又は非置換のC₁₋₆アルキル、非置換のC₂₋₆アルケニル、非置換のC₂₋₆アルキニルから選択され、

R_x及びR_yが、独立して、H、又は、飽和若しくは不飽和の、直鎖状若しくは分枝状の、置換若しくは非置換のC₁₋₆アルキルであり；

R⁵が、水素、ヒドロキシ又はCH₃であり；

R⁶、R⁷及びR⁸が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され；又は、R⁶、R⁷若しくはR⁸が、それぞれが結合する炭素又は窒素原子と一緒にシクロアルキル又はヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；

R⁶における、R⁷における、及び/又は、R⁸における前記のシクロアルキル、アリール又はヘテロシクリルが、もし置換されているならば、OH、SH、=O、ハロゲン(F、Cl、Br、I)、CN、NO₂、COOH、R_z、O-R_z、S-R_z、-C(O)-R_z、-C(O)-O-R_z、NR_xR_y；置換又は非置換のアリール又はアルキル-アリール；置換又は非置換のシクロアルキル又はアルキル-シクロアルキル；置換又は非置換のヘテロシクリル又はアルキル-ヘテロシクリルから選択される1つ以上の置換基で置換され；

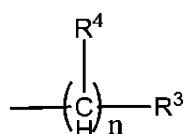
R⁶における、R⁷における、及び/又はR⁸における前記のアルキル、アルケニル又はアルキニルが、もし置換されているならば、F、Cl、Br、I、NH₂、SH若しくはOH、-C(O)OH、又は-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R_zが、飽和又は不飽和の、直鎖状又は分枝状の、置換又は非置換のC₁₋₆アルキル、非置換のC₂₋₆アルケニル、非置換のC₂₋₆アルキニルから選択され、

R_x及びR_yが、独立して、H、又は、飽和若しくは不飽和の、直鎖状若しくは分枝状の、置換若しくは非置換のC₁₋₆アルキルのいずれかであり；

及び、W、X、Y及びZが、炭素、窒素又は酸素から選択され、W-X-Y-Zが、コア骨格と結合している架橋C原子と一緒に、5員の複素環を形成し、該5員の複素環は、W、X、Y又はZの1つにおいて、

【化3】



によって置換され、

nが0又は1であり；

R³が置換又は非置換のアルキル、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R⁴が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R³において及び/又はR⁴において、前記のシクロアルキル、アリール又はヘテロシクリ

ルが、もし置換されているならば、OH、SH、=O、ハロゲン(F、Cl、Br、I)、CN、NO₂、COO H、R_z、O-R_z、S-R_z、-C(O)-R_z、-C(O)-O-R_z、NR_xR_y；置換又は非置換のアリール又はアルキルアリール；置換又は非置換のシクロアルキル又はアルキル-シクロアルキル；置換又は非置換のヘテロシクリル又はアルキル-ヘテロシクリルから選択される1つ以上の置換基で置換され；

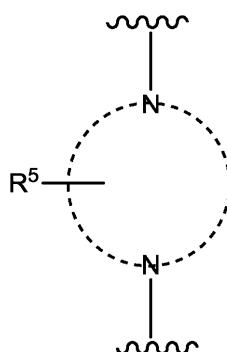
R³における及びノ又はR⁴における、前記のアルキル、アルケニル又はアルキニルが、もし置換されているならば、F、Cl、Br、I、NH₂、SH若しくはOH、-C(O)OH又は-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換され、該-OC₁₋₄アルキルは、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、Br、I)の1つ以上によって置換され；

R_zが、飽和又は不飽和の、直鎖状又は分枝状の、置換又は非置換のC₁₋₆アルキル、非置換のC₂₋₆アルケニル、非置換のC₂₋₆アルキニルから選択され、

R_x及びR_yが、独立して、H、又は、飽和若しくは不飽和の、直鎖状若しくは分枝状の、置換若しくは非置換のC₁₋₆アルキルのいずれかであり；

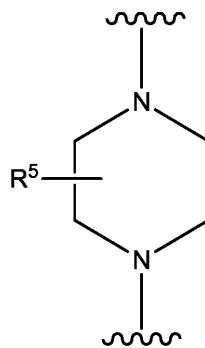
及び、

【化4】

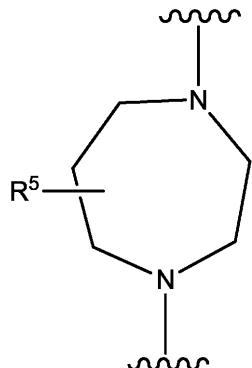


が、

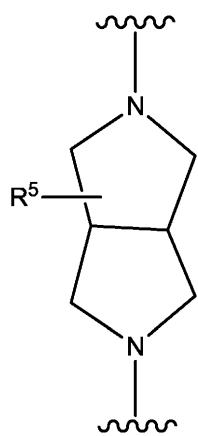
【化5】



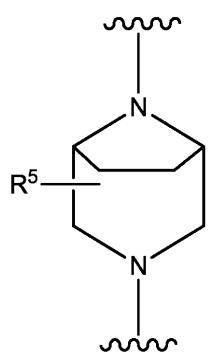
【化6】



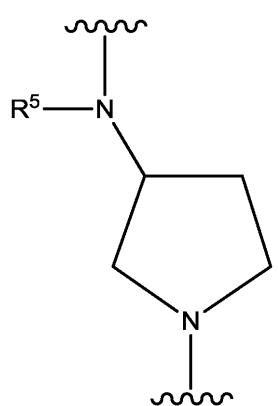
【化 7】



【化 8】

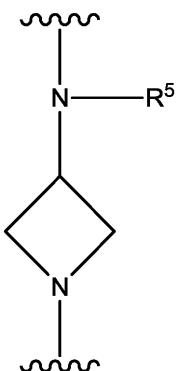


【化 9】



、及び、

【化10】



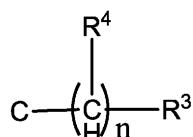
から選択され；

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩であり；

以下の条件が適用される：

- ・V¹、V²及びV³が炭素であり、及び、W、X、Y又はZの1つが、

【化11】



である場合に、R²はメタ位で-OCH₃でなくともよく；

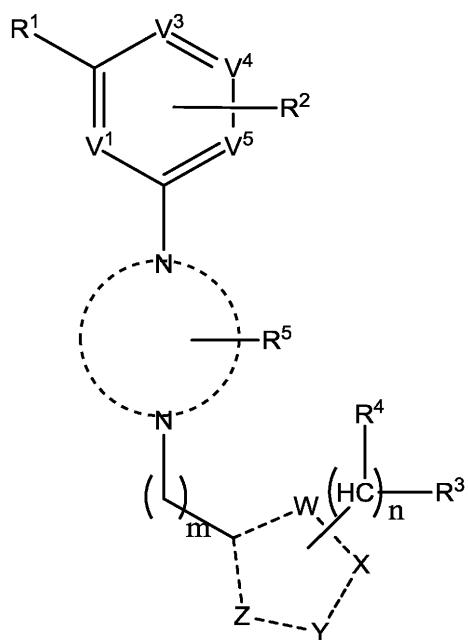
・V¹、V²及びV³が炭素であり、nが0であり、R³が-CH₃又は-C₂H₅の場合に、R¹もR²もメタ位で-NH₂でなくともよく、又は、それらの対応する溶媒和物でなくともよい。

ことを特徴とする化合物。

【請求項2】

請求項1に記載の化合物であって、該化合物は式(II)の化合物であり、

【化12】



(II)

m が1又は2であり；

n が0又は1であり；

V^1 、 V^3 、 V^4 及び V^5 の1つが、窒素又は炭素から選択され、それ以外は炭素であり；

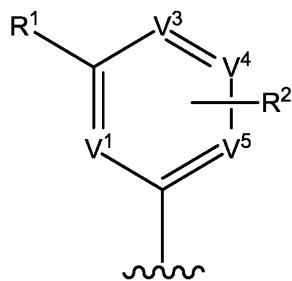
R^1 が、ヒドロキシル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^2 が、水素、ハロゲン、 $-NR^6R^7$ 、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

又は、

R^1 及び R^2 が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式IIのコア構造の環

【化13】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

R^3 が置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

及び、

R^4 が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、

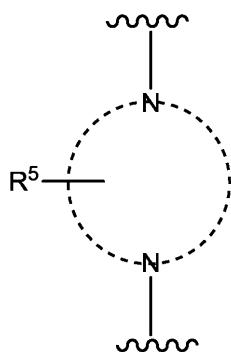
置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^5 が、水素、ヒドロキシ又は CH_3 であり；

R^6 、 R^7 及び R^8 が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され；又は、 R^6 、 R^7 若しくは R^8 が、それぞれが結合する炭素又は窒素原子と一緒にシクロアルキル又はヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；及び、

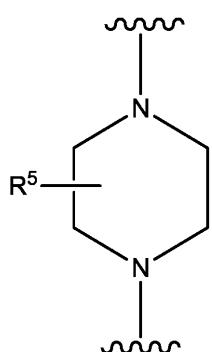
W、X、Y及びZが、炭素、窒素又は酸素から選択され、W-X-Y-Zが、コア骨格に結合する架橋C原子と一緒に、5員の複素環を形成し；及び、

【化14】

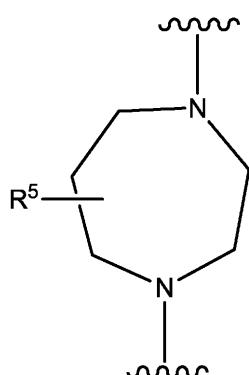


が、

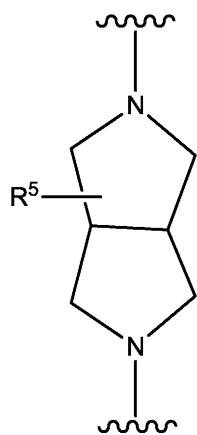
【化15】



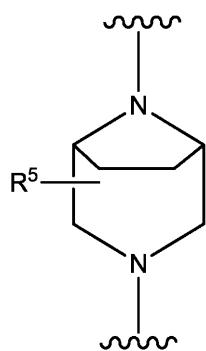
【化16】



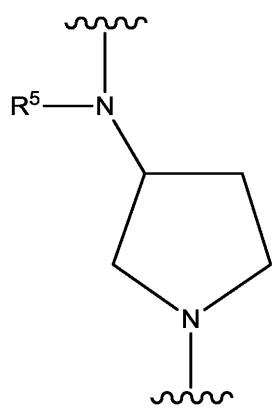
【化 1 7】



【化 1 8】

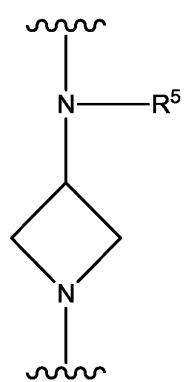


【化 1 9】



、及び、

【化 2 0】



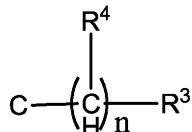
から選択され；

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物であり；

以下の条件が適用される：

- ・ V^1 、 V^3 、 V^4 及び V^5 が炭素であり、及び、 W 、 X 、 Y 又は Z のいずれかが、

【化21】



である場合に、 R^1 が $-OCH_3$ でなくともよく；

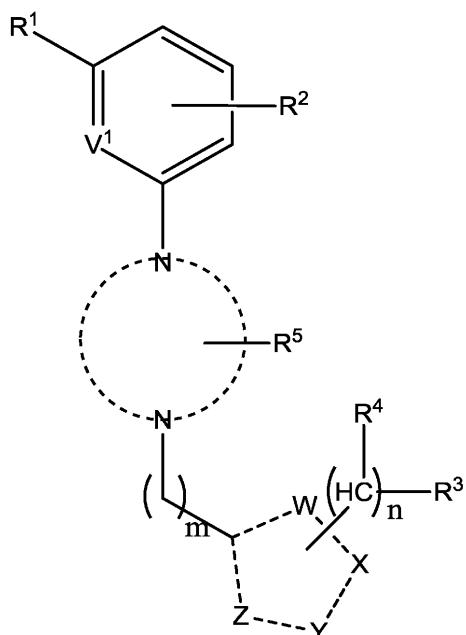
・ V^1 、 V^3 、 V^4 及び V^5 が炭素であり、 n が0であり、 R^3 が $-CH_3$ 又は $-C_2H_5$ の場合に、 R^1 が $-NH_2$ でなくともよい、

ことを特徴とする化合物。

【請求項3】

請求項1又は2のいずれか1項に記載の化合物であって、該化合物は式(III)の化合物であり、

【化22】



(III)

m が1又は2であり；

n が0又は1であり；

V^1 が、窒素又は炭素から選択され；

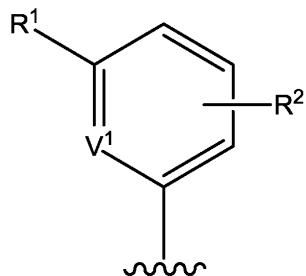
R^1 が、ヒドロキシル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^2 が、水素、ハロゲン、 $-NR^6R^7$ 、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

又は、

R^1 及び R^2 が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式IIのコア構造の環

【化23】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

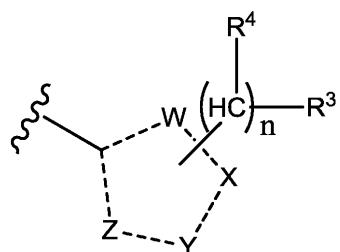
R^3 が置換又は非置換のアルキル、 $CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^4 が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^5 が、水素、ヒドロキシ又は CH_3 であり；

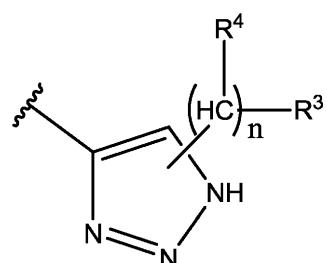
R^6 、 R^7 及び R^8 が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され；又は、 R^6 、 R^7 若しくは R^8 が、それぞれが結合する炭素又は窒素原子と一緒にシクロアルキル又はヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；及び、

【化24】

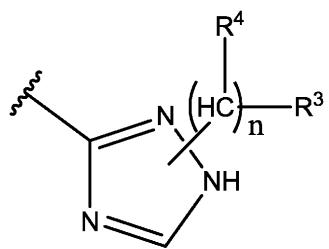


が、

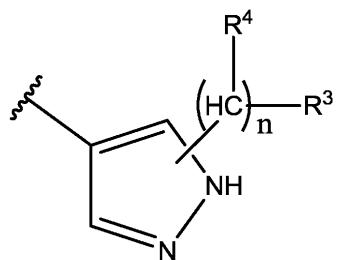
【化25】



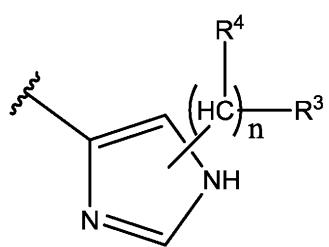
【化26】



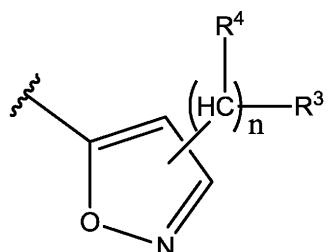
【化27】



【化28】

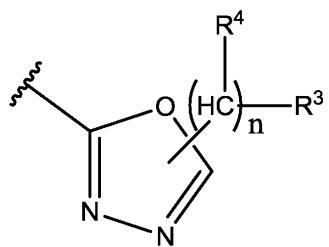


【化29】



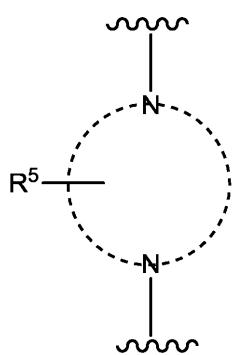
、又は、

【化30】



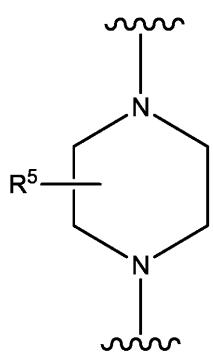
から選択され；及び、

【化 3 1】

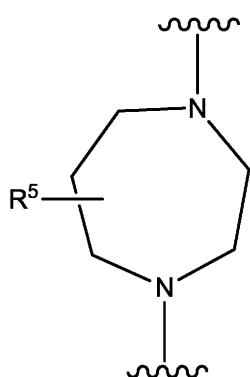


が、

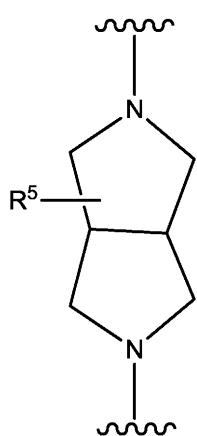
【化 3 2】



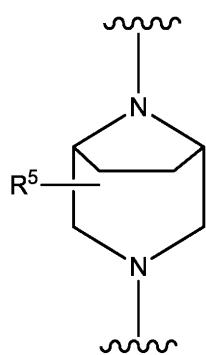
【化 3 3】



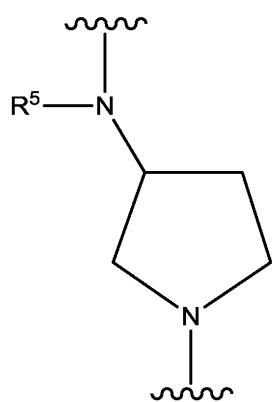
【化 3 4】



【化35】

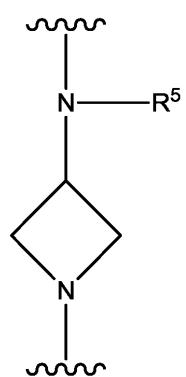


【化36】



、及び、

【化37】



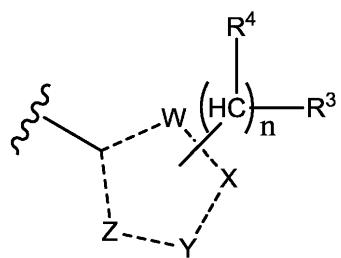
から選択され、

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物であり；

以下の条件が適用される：

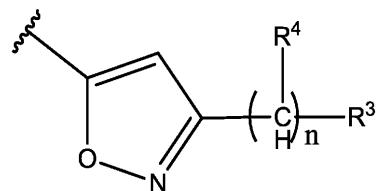
- ・V¹が炭素であり、及び、

【化38】



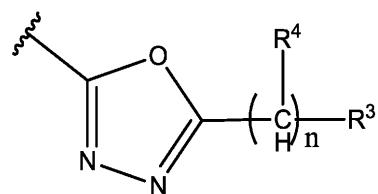
が、

【化39】



、又は、

【化40】



であり、 $n=0$ であり、及び、 R^3 が $-CH_3$ 又は C_2H_5 である場合に、 R^1 が OCH_3 でなくともよく；及び、

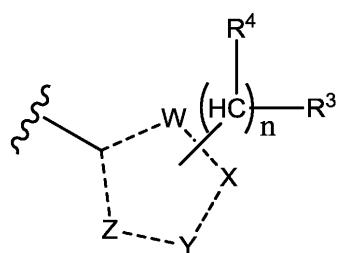
・ V^1 が炭素であり、 n が0であり、 R^3 が $-CH_3$ 又は $-C_2H_5$ である場合に、 R^1 が $-NH_2$ でなくともよい、

ことを特徴とする化合物。

【請求項4】

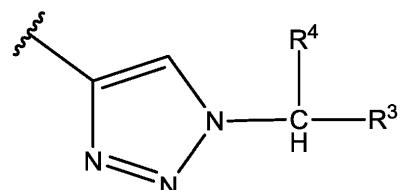
請求項3に記載の化合物であって、

【化41】

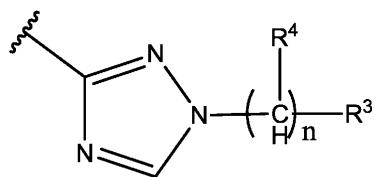


が、

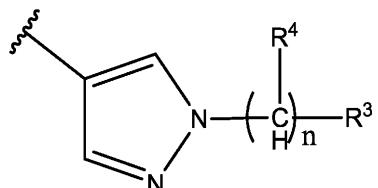
【化42】



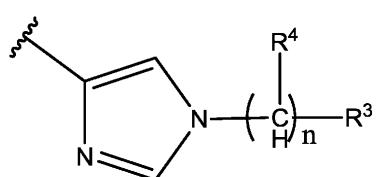
【化4-3】



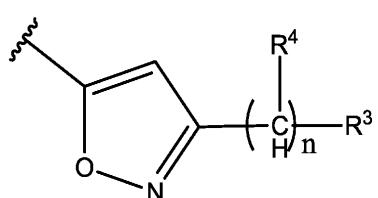
【化4-4】



【化4-5】

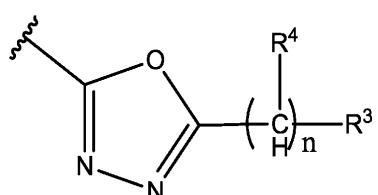


【化4-6】



、又は、

【化4-7】



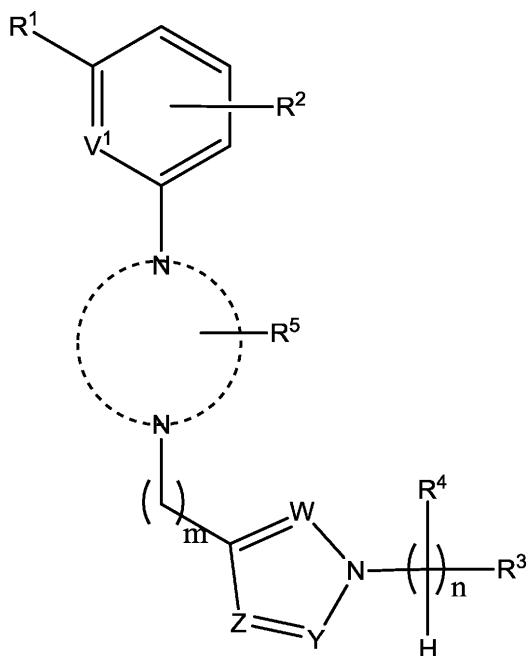
から選択される、

ことを特徴とする化合物。

【請求項5】

請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物であって、該化合物は式(IV)の化合物であり、

【化48】



(IV)

m が1又は2であり；

n が0又は1であり；

V^1 が、窒素又は炭素から選択され；

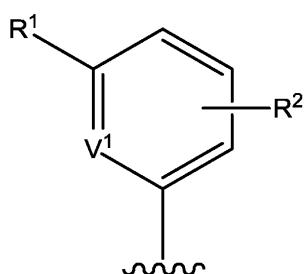
R^1 が、ヒドロキシリル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^2 が、水素、ハロゲン、 $-NR^6R^7$ 、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

又は、

R^1 及び R^2 が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式IVのコア構造の環

【化49】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

R^1 における及び/又は R^2 における前記アリール、又は、 R^1 及び R^2 によって形成される前記の環、又は、それに縮合する前記の環が、置換のアリールの場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH又はハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R^1 における前記のヘテロシクリル及び/又は R^2 における前記のヘテロシクリル若しくは

シクロアルキル、R¹及びR²によって形成される前記の環、又は、それに縮合している前記の環が、置換のヘテロシクリル又はシクロアルキルの場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、=O、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R²における前記のアルキル、アルケニル又はアルキニルが置換されている場合、F、Cl、Br、I、-NH₂、-SH若しくは-OH、-C(O)OH又は-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R³が、置換又は非置換のアルキル、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R⁴が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R³における及び／又はR⁴における前記のアリールが、置換のアリールである場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH又はハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R³における及び／又はR⁴における前記のヘテロシクリル又はシクロアルキルが、置換のヘテロシクリル又はシクロアルキルである場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、=O、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R³における及び／又はR⁴における前記のアルキル、アルケニル又はアルキニルが置換されている場合、F、Cl、Br、I、-NH₂、-SH若しくは-OH、-C(O)OH又は-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R⁵が、水素、ヒドロキシ又はCH₃であり；

R⁶、R⁷及びR⁸が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され；又は、R⁶、R⁷若しくはR⁸が、それぞれが結合する炭素又は窒素原子と一緒にシクロアルキル又はヘテロシクリルの4～7員の環を形成してもよく；

R⁶における、R⁷における及び／又はR⁸における前記のアリールが、置換のアリールである場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

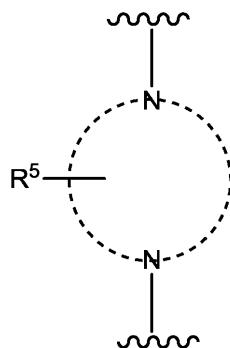
R⁶における、R⁷における及び／又はR⁸における前記のヘテロシクリル又はシクロアルキルが、置換のヘテロシクリル又はシクロアルキルである場合、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、=O、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)、-CN若しくは-C₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；

R⁶における、R⁷における及び／又はR⁸における前記のアルキル、置換のアルケニル又は

アルキニルである場合、F、Cl、Br、I、-NH₂、-SH若しくは-OH、-C(O)OH、-OC₁₋₄アルキルから選択される1つ以上の置換基によって置換され、該-OC₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；及び、

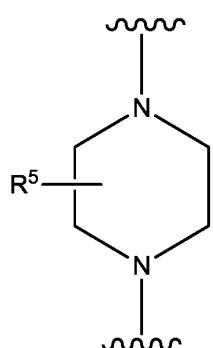
W、Y及びZが、相互に独立して、N又はCHから選択され、それらの1つ又は2つだけが、CHであり；及び、

【化50】

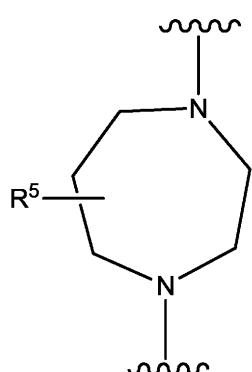


が、

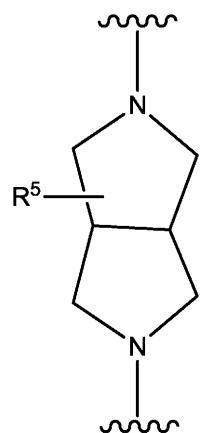
【化51】



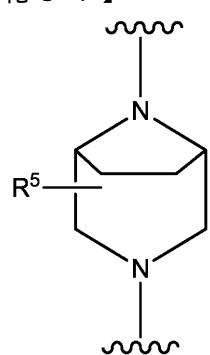
【化52】



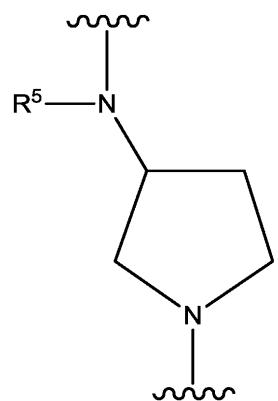
【化53】



【化54】

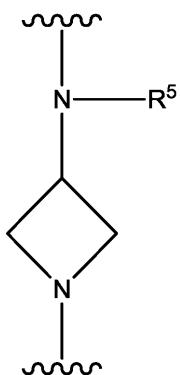


【化55】



、及び、

【化56】



から選択され、

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物であり；

以下の条件が適用される：

・V¹が炭素であり、W、Y及びZの中の2つがCHであり、nが0であり、及びR³がCH₃又は-C₂H₅である場合に、R¹は-NH₂でなくともよい、

ことを特徴とする化合物。

【請求項6】

請求項5に記載の化合物であって、前記化合物は式IVの化合物であり、R³が、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

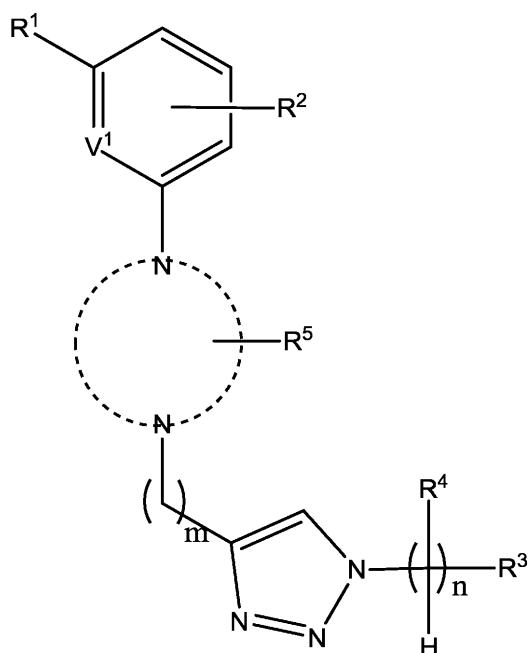
又は、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルである、

ことを特徴とする化合物。

【請求項7】

請求項1～5に記載の化合物であって、該化合物は式Vの化合物であり、

【化57】



(V)

 m が1又は2であり； n が0又は1であり； V^1 が、窒素又は炭素から選択され；

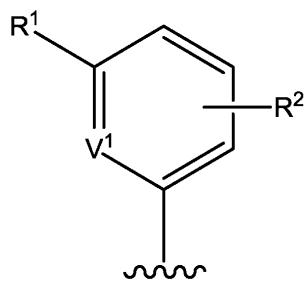
R^1 が、ヒドロキシリル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^2 が、水素、ハロゲン、 $-NR^6R^7$ 、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

又は、

R^1 及び R^2 が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式Vのコア構造の環

【化58】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

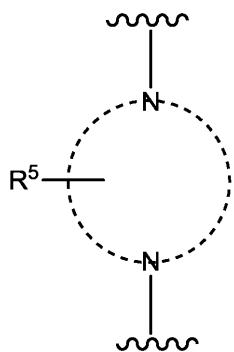
R^3 が置換又は非置換のアルキル、 $CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^4 が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

R^5 が、水素、ヒドロキシ又は CH_3 であり；

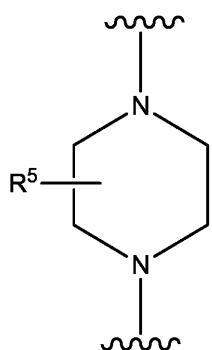
R^6 、 R^7 及び R^8 が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され；又は、 R^6 、 R^7 若しくは R^8 が、それぞれが結合する炭素又は窒素原子と一緒に、シクロアルキル又はヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；及び、

【化59】

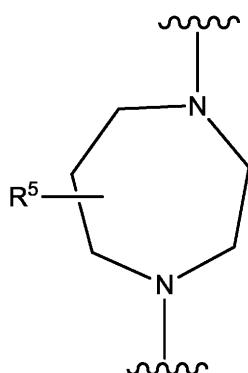


が、

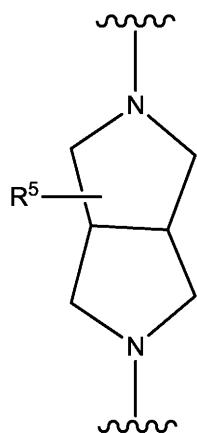
【化60】



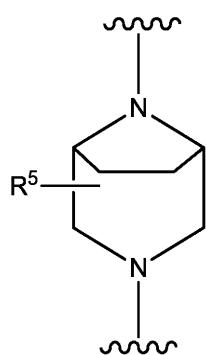
【化61】



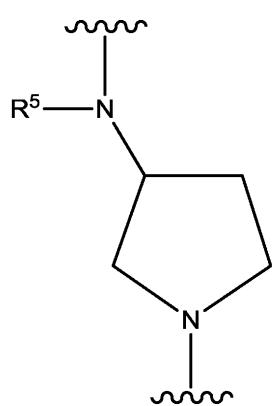
【化 6 2】



【化 6 3】

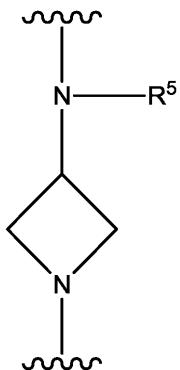


【化 6 4】



、及び、

【化65】



から選択され；

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物である、

ことを特徴とする化合物。

【請求項8】

請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物であって、

R^1 が、ヒドロキシル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンから選択され；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含み；又は1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含み；又は、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンからなる群から選択され；

及び／又は、

R^1 が、ヒドロキシル、 $-NR^6R^7$ 、 $-NR^6S(O)_2R^7$ 、 $-NR^6COR^7$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-S(O)_2R^6$ 、 $-S(O)_2NR^6R^7$ 、 $-CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のフェニルを含むアリール、及び、置換又は非置換のイミダゾールを含むヘテロシクリルであり；

及び／又は、

R^2 が、水素、ハロゲン、 $-NR^6R^7$ 、 $-SR^6$ 、 $-OR^6$ 、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり、

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ

原子を含み；又は、1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含み；又は、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンからなる群から選択され；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルを含むC₁₋₈アルキル；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンを含むC₂₋₈-アルケニルであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀-アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンを含むC₂₋₈-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルを含むC₃₋₈シクロアルキルであり；

及び／又は、

ハロゲンが、フッ素、塩素、ヨウ素又は臭素のいずれかであり；

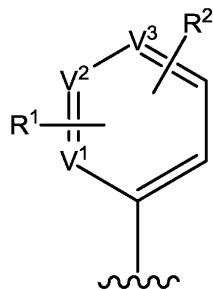
及び／又は、

R²が、水素、フッ素を含むハロゲン、又は、CH₃を含むC₁₋₄アルキル若しくはCF₃から選択され；

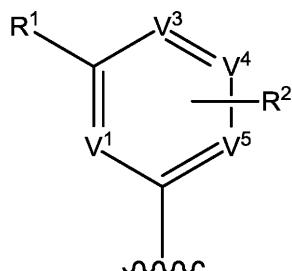
及び／又は、

R¹及びR²が、隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式I、II、III、IV又はVのそれぞれのコア構造の環

【化66】

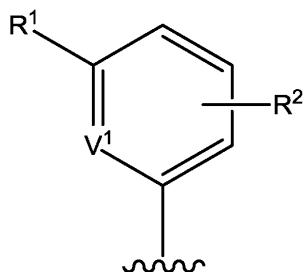


【化67】



、又は、

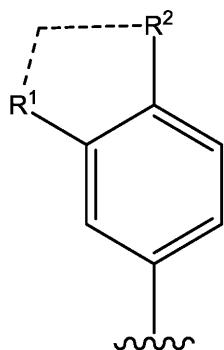
【化68】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

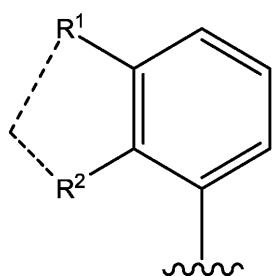
前記環は、非置換か、又は、ハロゲン、-OH、-NH₂、-SH、=O、-OC₁₋₄アルキルの1つ以上で置換され、該-OC₁₋₄アルキルは、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン、-CN、若しくはC₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該C₁₋₄アルキルは、非置換か、又は、OH若しくはハロゲンの1つ以上によって置換され；又は、前記環は、V¹、V²、V³、V⁴及びV⁵で形成され、これらの全てが炭素であり、コア構造

【化69】



又は

【化70】



のフェニル環に縮合し、2環を形成し、

又は、二環式複素環を形成し、又は、R¹及びR²によってコア構造とともに形成された二環式複素環であり、非置換か、又は、ハロゲン、-OH、-NH₂、-SH、=O、-OC₁₋₄アルキルの1つ以上で置換されたベンズイミダゾール、インダゾール、インドリン及びベンゾチアゾールから選択され、該-OC₁₋₄アルキルは、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン、-CN若しくはC₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され；該C₁₋₄アルキルが、非置換か、又はOH若しくはハロゲンの1つ以上で置換され；

及び／又は、

R³が、置換又は非置換のアルキル、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり、

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；

及び / 又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び / 又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含み；又は、1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び / 又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含み；又は、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され；

及び / 又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルを含むC₁₋₈アルキルであり；又はR³がアルキルではなく；

及び / 又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンを含むC₂₋₈アルケニルであり；

及び / 又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンを含むC₂₋₈-アルキニルであり；

及び / 又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルを含むC₃₋₈シクロアルキルであり；

及び / 又は、

R³が、アルキルではなく；

及び / 又は、

R³が、置換又は非置換のプロピル若しくはブチルを含むアルキルから、ジエチルアセタミドを含むCONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルを含むシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルを含むアリールから、又は、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンを含むヘテロシクリルから選択され、

又は、R³が、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルを含むシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルを含むアリールから、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンを含むヘテロシクリルから選択され；

及び / 又は、

R⁴が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり、

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；

及び / 又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び / 又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；又は、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び / 又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含有する1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；又は、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール

、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され；及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルを含むC₁₋₈アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ベンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンを含むC₂₋₈アルケニルであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ベンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンを含むC₂₋₈-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルを含むC₃₋₈シクロアルキルであり；

又は、R⁴が、水素から、又は、CH₃若しくはCH₂OHを含む置換又は非置換のC₁₋₄アルキルから選択され；

及び／又は、

R⁵が、水素、ヒドロキシ若しくはCH₃であり、又は、水素若しくはCH₃のみであり；

及び／又は、

R⁶、R⁷又はR⁸が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され、又は、R⁶、R⁷若しくはR⁸が、それぞれの結合する炭素若しくは窒素原子と一緒に、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルの4～7員の環を形成してもよく、

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；

及び／又は、

前記アルキル-アリールが、C₁₋₄-アルキル-アリールであり；又は、ベンジルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；又は、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；又は、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルを含むC₁₋₈アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ベンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンを含むC₂₋₈アルケニルであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ベンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンを含むC₂₋₈-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルを含むC₃~₈シクロアルキルであり；

及び／又は、

R⁶、R⁷又はR⁸が、各々が結合する炭素又は窒素原子と一緒に、シクロアルキル又はヘテロシクリルの環を形成する場合に、この環は5又は6員であり、又は、飽和、非置換のシクロヘキシルを含む飽和の5又は6員のシクロアルキル環を形成し；

及び／又は、

R⁶、R⁷及びR⁸が、相互に独立して、水素から、メチル、エチル、プロピル又はブチルを含む置換又は非置換のC₁~₄アルキルから、置換又は非置換のフェニルを含むアリールから、置換又は非置換のピロリジンを含むヘテロシクリルから、又は、置換若しくは非置換のベンジルを含むアルキル-アリールから選択され、又は、R⁶及びR⁷が結合する炭素原子と一緒にシクロヘキシルを含むシクロアルキルの5又は6員の環を形成する、

ことを特徴とする化合物。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、該化合物が、一般式I、II、III、IV又はVの化合物であり、

mが1又は2であり；

nが0又は1であり；

V¹が窒素又は炭素から選択され；

R¹が、ヒドロキシル、-NR⁶R⁷、-NR⁶S(O)₂R⁷、-NR⁶COR⁷、-NR⁶CONR⁷R⁸、-S(O)₂R⁶、-S(O)₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、置換又は非置換のフェニルを含むアリール、及び、置換又は非置換のイミダゾールを含むヘテロシクリルであり；

R²が、水素、フッ素を含むハロゲン、又は、CH₃を含むC₁~₄アルキル若しくはCF₃であり；

又は、

R¹及びR²が、2環式複素環をコア構造と共に形成し、好ましくは又は、非置換か、ハロゲン、-OH、-NH₂、-SH、=O、-OC₁~₄アルキルの1つ以上によって置換されたベンゾイミダゾール、インダゾール、インドリン及びベンゾチアゾールから選択され、該-OC₁~₄アルキルが、非置換か、又は、-OH若しくはハロゲン、-CN若しくは-C₁~₄アルキルの1つ以上によって置換され、該-C₁~₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲンの1つ以上によって置換され；

R³が、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルを含むシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルを含むアリールから、又は、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インден、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ビリミジンを含むヘテロシクリルから選択され；

R⁴が、水素、又は、CH₃若しくはCH₂OHを含む置換又は非置換のC₁~₄アルキルであり；

R⁵が、水素、ヒドロキシ又はCH₃であり；

R⁶、R⁷及びR⁸が、各々が独立して、水素から、置換又は非置換のメチル、エチル、プロピル若しくはブチルを含むC₁~₄アルキルから、置換又は非置換のフェニルを含むアリールから、置換又は非置換のピロリジンを含むヘテロシクリルから、置換又は非置換のベンジルを含むアルキル-アリールから選択され、又は、R⁶及びR⁷が、それらが結合する炭素原子と一緒に、シクロヘキシルを含むシクロアルキルの5又は6員の環を形成する、

ことを特徴とする化合物。

【請求項 10】

請求項 5 又は 6 に記載の化合物であって、該化合物が一般式IVの化合物であり、

mが1又は2であり；

nが0又は1であり；

V¹が窒素又は炭素から選択され；

R¹が、ヒドロキシル、-NR⁶R⁷、-NR⁶S(O)₂R⁷、-NR⁶COR⁷、-NR⁶CONR⁷R⁸、-S(O)₂R⁶、-S(O)₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、置換又は非置換のフェニル、及び、置換又は非置換のイミダゾール

であり；

R²が、水素であり；

又は、

R³が、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルから、又は、置換又は非置換のフェニルから、又は、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インден、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンを含むヘテロシクリルから選択され；

R⁴が、水素又は置換又は非置換のC₁₋₄アルキルであり；

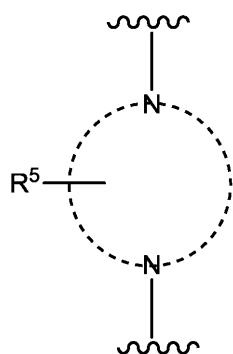
R⁵が、水素、ヒドロキシ又はCH₃であり；

R⁶、R⁷及びR⁸が、各々が独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のフェニルからなる群から選択され、又は、水素、置換又は非置換のC₁₋₄アルキル、置換又は非置換のC₃₋₆シクロアルキルから選択され；及び、

W、Y及びZが、相互に独立して、N又はCHから選択され、それらの1つ又は2つのみがCHであり；

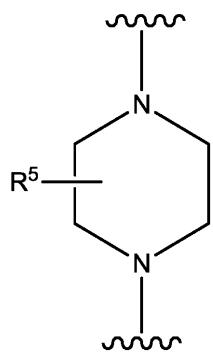
及び、

【化71】

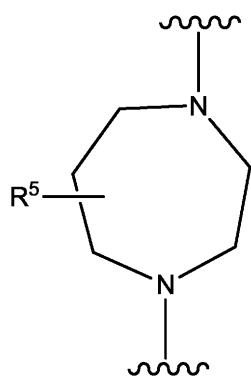


が、

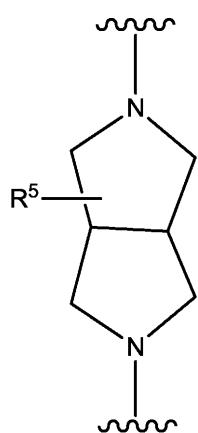
【化72】



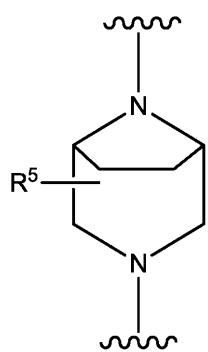
【化73】



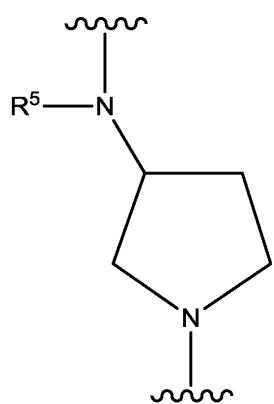
【化74】



【化75】

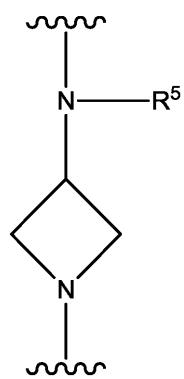


【化76】



、及び、

【化77】



から選択され；

任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物である

ことを特徴とする化合物。

【請求項11】

- 式I、II、III及びIVの請求項1～6及び10に記載の化合物であって、
 ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
 ・N-(6-(4-((1-(5-クロロピリジン-3-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 ・N-(3-(4-((1-ベンジル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
 ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
 ・3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェノール、
 ・3-(4-((1-ベンジル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェノール、
 ・3-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェノール、
 ・N-(3-(4-((1-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)メタンスルホアミド、

- ・N-(3-(4-((1-(2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)エタンスルホアミド、
- ・N-(3-(1-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピロリジン-3-イルアミノ)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(1-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)アゼチジン-3-イルアミノ)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(5-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(メチル(1-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピロリジン-3-イル)アミノ)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(メチル(1-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)アゼチジン-3-イル)アミノ)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・1,1,1-トリフルオロ-N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(5-フルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)シクロプロパンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(3-フルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(4-フルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-((1R,5S)-3-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((2-(ピリジン-2-イル)-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)-1,4-ジアゼパン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(メチル(1-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピロリジン-3-イル)アミノ)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(3-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(4-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(6-フルオロピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(5-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)アニリン、
- ・N-tert-ブチル-3-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ベンゼンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、

- ・N-(3-(4-((1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・3-(4-((1-フェニル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェノール、
- ・N-(3-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)メタンスルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
- ・N-(3-(4-((1-ベンジル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)メタンスルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)シクロプロパンスルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロピオニアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(2-ヒドロキシフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(2,6-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(3,4-ジフルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)シクロプロパンスルホアミド、
 - ・N-(5-クロロ-6-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(5-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(5-((1-ベンジル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(5-((1-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(5-メトキシピリジン-3-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)-1,4-ジアゼパン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(5-クロロピリジン-2-イル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 - ・N-(6-(4-((1-(ピリジン-2-イルメチル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)-1,4-

ジアゼパン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 • N-(6-(4-((1-(2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)-1,4-ジアゼパン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、
 • N-(6-(5-((1-(2-フルオロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル)ヘキサヒドロピロ口[3,4-c]ピロール-2(1H)-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド、及び、
 • N-(6-(4-((1-(ピリジン-2-イル)-1H-イミダゾール-4-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-2-イル)プロパン-2-スルホアミド

から選択され；

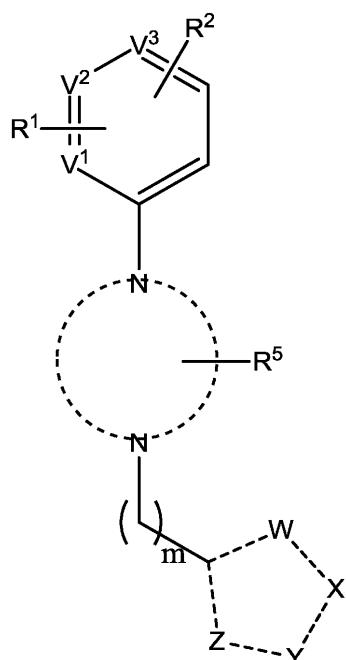
任意に、立体異性体、又は、エナンチオマー若しくはジアステレオマー、ラセミ体の1つの形態であり、又は、立体異性体、又は、エナンチオマー及び／又はジアステレオマーのいかなる混合割合の少なくとも2つの混合物の形態、又は、それらの対応する塩、又はそれらの対応する溶媒和物である、

ことを特徴とする化合物。

【請求項 1 2】

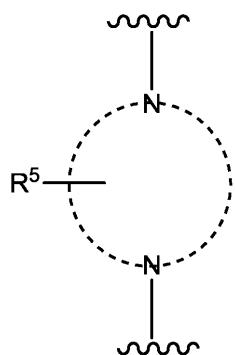
式1の請求項1に記載の化合物の製造方法であって、

【化78】



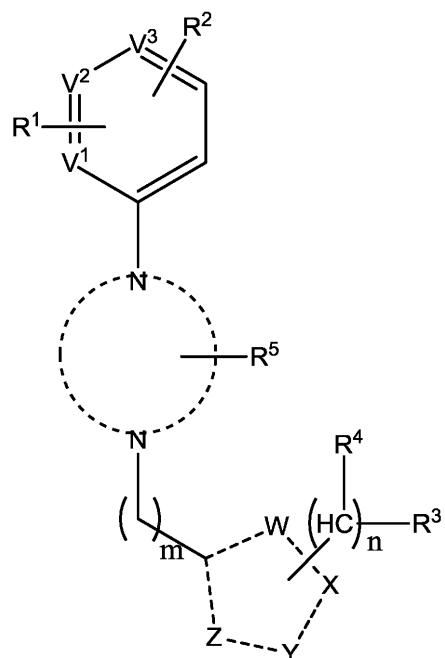
R^1 、 R^2 、 R^5 、 V^1 、 V^2 、 V^3 、 W 、 X 、 Y 、 Z 及び m 、並びに、⁽¹⁾

【化79】



が、請求項1のとおりに定義されるか、又は、式1aで表され、

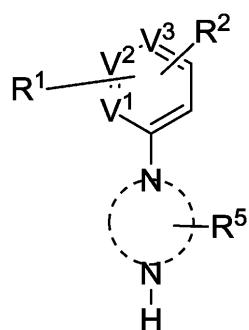
【化 8 0】

(Ia)

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 V^1 、 V^2 、 V^3 、 W 、 X 、 Y 、 Z 、 n 及び m が、請求項1のとおりに定義され、

式VIの化合物又は塩酸塩を含むその適切な塩が

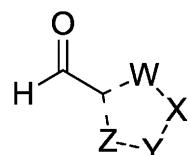
【化 8 1】



(VII)

R^1 、 R^2 、 R^5 、 V^1 、 V^2 及び V^3 が、請求項1のとおりに定義され、(式Iの化合物に対して)式VIIの、又は、(式Iaの化合物に対して)式VIIaの化合物とステップ1の条件下、反応され、

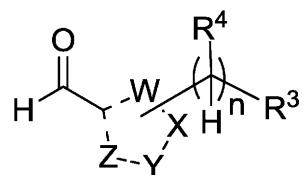
【化 8 2】



(VII)

又は、

【化 8 3】



(VIIa)

(R³、R⁴、W、X、Y、Z及びnが、請求項1のとおりに定義され)、各々、式(I)又は式(Ia)の化合物をもたらし、

ステップ1の式(VI)及び(VII又はVIIa)の化合物の還元的アミノ化反応が、還元剤で、非プロトン系溶媒中において有機塩基の存在下で実施され、

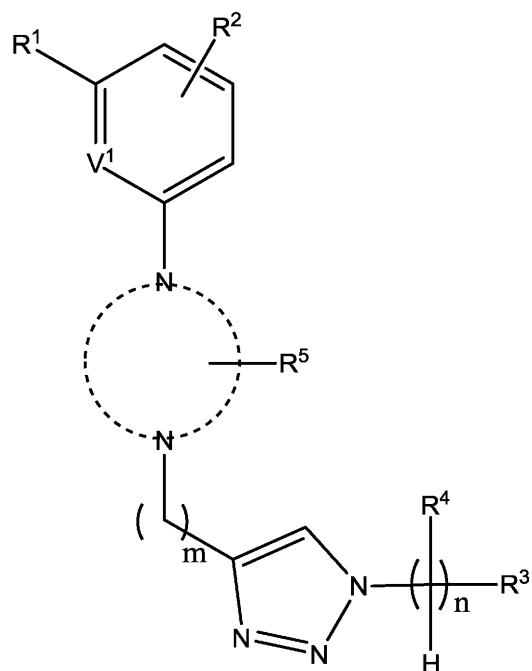
又は、前記還元剤がトリアセトキシボロヒドリドであり、非プロトン系溶媒がジクロロエタンであり、及び/又は、有機塩基がジイソプロピルエチルアミンである、

ことを特徴とする、製造方法。

【請求項 1 3】

式Vの請求項7に記載の化合物の製造方法であって、

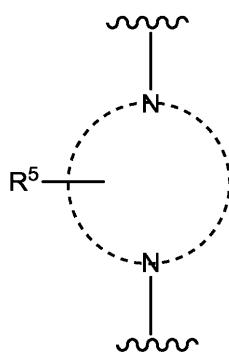
【化 8 4】



(V)

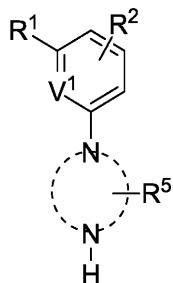
R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、n及びm、並びに、

【化85】



が、請求項7に定義のとおりであり、
式VIII又は塩酸塩を含むその適切な塩、

【化86】



(VIII)

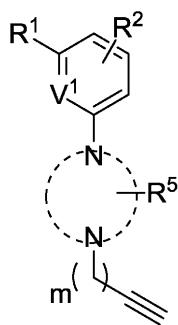
(R¹、R²及びR⁵が、請求項7のとおりに定義され)が、式Xの化合物と、ステップ2の条件下、反応され、

【化87】



(X)

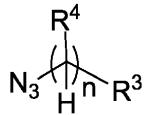
(mは請求項7のとおりに定義され)、式IXの化合物をもたらし、
【化88】



(IX)

(R¹、R²、R⁵及びmが請求項7のとおりに定義され)、
次に、式IXの前記化合物が、式IXXIの化合物とステップ3の条件下で反応し、

【化89】



(XI)

(R³、R⁴及びnが、請求項7のとおりに定義され)、ステップ3の条件下、式(V)の化合物をもたらし、

Xが、塩素を含むハロゲン又は硫酸エステルを含む脱離基であり、

一般式(VIII)の前記化合物のステップ2の前記式(X)の化合物との反応が、塩基の存在下、非プロトン性溶媒中で実施され、又は、前記塩基がEt₃Nであり、非プロトン性溶媒がテトラヒドロフラン(THF)であり、及び/又は、前記反応が25~75℃の温度範囲で実施され、

一般式(IX)の前記化合物のステップ3の式(XI)の前記化合物との反応が、銅塩及びアスコルビン酸ナトリウムの存在下、プロトン性有機溶媒と水との混合溶媒中で実施され、及び/又は、前記銅塩がCuSO₄·5H₂Oであり、プロトン性有機溶媒と水との混合溶媒がt-BuOH:H₂O 1:1であり、前記反応が室温下実施される、

ことを特徴とする製造方法。

【請求項14】

請求項1~11のいずれかに定義される化合物又はその薬学的に許容可能な塩、及び、薬学的に許容可能な担体、アジュバント又はビヒクリルを含有することを特徴とする、医薬組成物。

【請求項15】

医薬としての使用のための請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項16】

疼痛、又は、中等度から重度の疼痛、内臓痛、慢性疼痛、がん性疼痛、偏頭痛、炎症性疼痛、急性疼痛又は神経因性疼痛、異痛症または痛覚過敏の治療に対する医薬としての使用のための請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0001

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0001】

本発明は、シグマ()受容体及びμ-オピオイド受容体(MOR又はμ-オピオイド)の両方に対する二重の薬理学的活性を有する化合物、特に、この薬理活性を有するピペラジン化合物、係る化合物の製造方法、それらを含む医薬組成物、及びそれらの治療のための使用、特に、疼痛治療におけるそれらの使用に関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

アルケニルは、不飽和の、直鎖状又は分枝状の炭化水素を意味すると理解され、非置換か、又は1回若しくは複数回置換されてもよい。それは、例えば、-CH=CH-CH₃などの基を包含する。アルケニルラジカルは、好ましくは、ビニル(エテニル)、アリル(2-プロペニル)である。好ましくは、本発明との関連で、アルケニルは、C_{2~10}-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチ

レンなどのC₂₋₈アルケニルであり；又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン若しくはヘキシレンなどのC₂₋₆-アルケニルであり；又は、エチレン、プロピレン若しくはブチレンなどのC₂₋₄アルケニルである。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0038

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0038】

アルキニルは、不飽和の、直鎖状又は分枝状の炭化水素を意味するものと理解され、非置換か、又は一回若しくは複数回置換されていてもよい。それは、例えば、-C=C-CH₃(1-プロピニル)などの基を包含する。好ましくは、本発明との関連で、アルキニルは、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり；又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン若しくはヘキシンなどのC₂₋₆-アルキニルであり；又は、エチン、プロピン若しくはブチンなどのC₂₋₄-アルキニルである。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0089

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0089】

一般式I、II、III、IV又はVの本発明の化合物のもう1つの好ましい実施態様において、前記化合物は、化合物であり、

R¹が、ヒドロキシリ、-NR⁶R⁷、-NR⁶S(O)₂R⁷、-NR⁶COR⁷、-NR⁶CONR⁷R⁸、-SR⁶、-S(O)₂R⁶、-S(O)₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンから選択され；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；好ましくは1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンからなる群から選択され；

及び／又は、

もっとも好ましくは、R¹が、ヒドロキシリ、-NR⁶R⁷、-NR⁶S(O)₂R⁷、-NR⁶COR⁷、-NR⁶CONR⁷R⁸、-SR⁶、-S(O)₂NR⁶R⁷、-CONR⁶R⁷、置換又は非置換のフェニルなどのアリール、及び、置換又は非置換のイミダゾールなどのヘテロシクリルであり；

及び／又は、

R²が、水素、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-NR⁶R⁷、-SR⁶、-OR⁶、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり

、ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；好ましくは1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソラン、カルバゾール及びキナゾリンからなる群から選択され；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどの $C_{1\sim 8}$ -アルキル；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどの $C_{1\sim 6}$ -アルキル；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどの $C_{1\sim 4}$ -アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、 $C_{2\sim 10}$ -アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどの $C_{2\sim 8}$ -アルケニルであり；好ましく、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルケニル；より好ましくは、エチレン、プロピレン若しくはブチレンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルケニルであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、 $C_{2\sim 10}$ -アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどの $C_{2\sim 8}$ -アルキニルであり；好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン若しくはヘキシンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン若しくはブチンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルキニルであり、

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどの $C_{3\sim 8}$ シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどの $C_{3\sim 7}$ シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル若しくはシクロヘキシルなどの $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルであり；

及び／又は、

ハロゲンが、フッ素、塩素、ヨウ素又は臭素のいずれかであり；好ましくは、塩素又はフッ素であり；

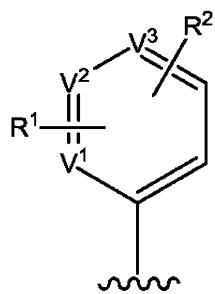
及び／又は、

もっとも好ましくは、 R^2 が、水素、フッ素などのハロゲン、又は、 CH_3 などの $C_{1\sim 4}$ アルキル若しくは CF_3 から選択され；

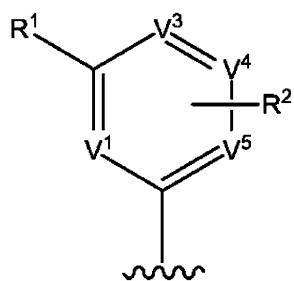
及び／又は、

R^1 及び R^2 が隣接する環中の原子に結合し、これらの原子と一緒に、飽和又は不飽和の、置換又は非置換の環を形成し、式I、II、III、IV又はVのそれぞれのコア構造の環

【化124】

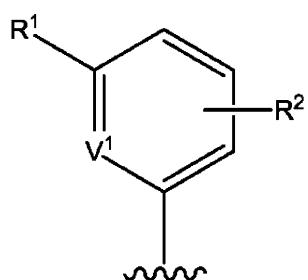


【化125】



、又は、

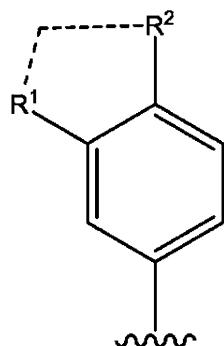
【化126】



に縮合し、さらなる非置換又は置換の環系に縮合してもよく；

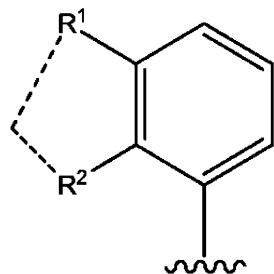
前記環は、非置換か、又は、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、=O、-OC₁₋₄アルキルの1つ以上で置換され、該-OC₁₋₄アルキルは、非置換か、又はOH、ハロゲン、-CN、若しくはC₁₋₄アルキルの1つ以上によって置換され、該C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上によって置換され；好ましくは、前記環は、V¹、V²、V³、V⁴及びV⁵で形成され、これらの全てが炭素であり、コア構造

【化127】



又は

【化128】



のフェニル環と縮合し、2環を形成し、より好ましくは、二環式複素環を形成し、もっとも好ましくは、R¹及びR²によってコア構造とともに形成された二環式複素環であり、非置換か、又は、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-OH、-NH₂、-SH、=O、-OC₁₋₄アルキルの1つ以上で置換されたベンズイミダゾール、インダゾール、インドリン及びベンゾチアゾールから選択され、該-OC₁₋₄アルキルは、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン、-CN又はC₁₋₄アルキルの1つ以上で置換され；該C₁₋₄アルキルが、非置換か、又は、OH若しくはハロゲン(F、Cl、I、Br)の1つ以上で置換され；

及び／又は、

R³が、置換又は非置換のアルキル、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくはナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；好ましくは1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソラン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどのC₁₋₈アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどのC₁₋₆アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル若しくはブチルなどのC₁₋₄アルキルであり、又はR³がアルキルではなく；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどのC₂₋₈アルケニルであり；好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどのC₂₋₆-アルケニルであり、より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどのC₂₋₄アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり；好ましくは、エチ

ン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどの $C_{2\sim6}$ -アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン又はブチンなどの $C_{2\sim4}$ -アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどの $C_{3\sim8}$ シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル又はシクロヘプチルなどの $C_{3\sim7}$ シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシリル、特にシクロペンチル又はシクロヘキシリルなどの $C_{3\sim6}$ シクロアルキルであり；

及び／又は、

好ましくは、 R^3 がアルキルではなく；

及び／又は、

もっとも好ましくは、 R^3 が、置換又は非置換のプロピル若しくはブチルなどのアルキルから、ジエチルアセタミドなどの $CONR^6R^7$ 、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシリルなどのシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、又は、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンなどのヘテロシクリルから選択され、又は、もっとも好ましくは、 R^3 が、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシリルなどのシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンなどのヘテロシクリルから選択され；

及び／又は、

R^4 が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；好ましくは、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含有する1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、ヘプチル又はオクチルなどの $C_{1\sim8}$ アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシリルなどの $C_{1\sim6}$ アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどの $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、 $C_{2\sim10}$ -アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどの $C_{2\sim8}$ アルケニルであり；好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどの $C_{2\sim6}$ -アル

ケニルであり；より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどのC₂₋₄-アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり、好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどのC₂₋₆-アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン又はブチンなどのC₂₋₄-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどのC₃₋₈シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ又はシクロヘプチルなどのC₃₋₇シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシリ、特にシクロペンチル又はシクロヘキシリなどのC₃₋₆シクロアルキルであり；

もっとも好ましくは、R⁴が水素から、又は、CH₃若しくはCH₂OHなどの置換又は非置換のC₁₋₄アルキルから選択され；

及び／又は、

R⁵が、水素、ヒドロキシ若しくはCH₃であり、又は、水素若しくはCH₃のみであり；

及び／又は、

R⁶、R⁷及びR⁸が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され、又は、R⁶、R⁷若しくはR⁸が、それぞれの結合する炭素若しくは窒素原子と一緒に、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくは、フェニルであり；

及び／又は、

前記アルキル-アリールが、C₁₋₄-アルキル-アリールであり；好ましくは、ベンジルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；好ましくは、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ビペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、ヘプチル又はオクチルなどのC₁₋₈アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシリなどのC₁₋₆アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどのC₁₋₄アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペン

チレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどのC₂₋₈アルケニルであり、好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどのC₁₋₆-アルケニルであり；より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどのC₁₋₄-アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり；好ましくは、エチエン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどのC₂₋₆-アルキニルであり；より好ましくは、エチエン、プロピン又はブチンなどのC₂₋₄-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどのC₃₋₈シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどのC₃₋₇シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル、特にシクロペンチル又はシクロヘキシルなどのC₃₋₆シクロアルキルであり、

及び／又は、

R⁶、R⁷又はR⁸が、各々が結合する炭素又は窒素原子と一緒に、シクロアルキル又はヘテロシクリルの環を形成する場合に、この環は5又は6員であり、好ましくは、飽和、非置換のシクロヘキシルなどの飽和の5又は6員のシクロアルキル環を形成し；

及び／又は、

もっとも好ましくは、R⁶、R⁷及びR⁸が、相互に独立して、水素から、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどの置換又は非置換のC₁₋₄アルキルから、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、置換又は非置換のピロリジンなどのヘテロシクリルから、又は、置換若しくは非置換のベンジルなどのアルキル-アリールから選択され、又は、R⁶及びR⁷が結合する炭素原子と一緒にシクロヘキシルなどのシクロアルキルの5又は6員の環を形成する。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0091

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0091】

一般式I、II、III、IV又はVの本発明の化合物のもう1つの好ましい実施態様において、前記化合物は、化合物であり、

R²が、水素、ハロゲン(F、Cl、I、Br)、-NR⁶R⁷、-SR⁶、-OR⁶、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり、

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；好ましくは1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾー

ル、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどのC₁₋₈アルキル；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどのC₁₋₆アルキル；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどのC₁₋₄アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどのC₂₋₈-アルケニルであり；好ましく、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどのC₂₋₆-アルケニル；より好ましくは、エチレン、プロピレン若しくはブチレンなどのC₂₋₄-アルケニルであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀-アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり；好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン若しくはヘキシンなどのC₂₋₆-アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン若しくはブチンなどのC₂₋₄-アルキニルであり、

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどのC₃₋₈シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどのC₃₋₇シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル若しくはシクロヘキシルなどのC₃₋₆シクロアルキルであり；

及び／又は、

ハロゲンが、フッ素、塩素、ヨウ素又は臭素のいずれかであり；好ましくは、塩素又はフッ素であり；

及び／又は、

もっとも好ましくは、R²が、水素、フッ素などのハロゲン、又は、CH₃などのC₁₋₄アルキル若しくはCF₃から選択される。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0093

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0093】

一般式I、II、III、IV又はVの本発明の化合物のもう1つの好ましい実施態様において、前記化合物は、化合物であり、

R³が、置換又は非置換のアルキル、CONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくはナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；好ましくは1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり、少なくとも1つの環

は、環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含み；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどのC₁₋₈アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどのC₁₋₆アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル若しくはブチルなどのC₁₋₄アルキルであり、又はR³がアルキルではなく；

及び／又は、

前記アルケニルが、C₂₋₁₀-アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどのC₂₋₈アルケニルであり；好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどのC₂₋₆-アルケニルであり、より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどのC₂₋₄-アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、C₂₋₁₀アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどのC₂₋₈-アルキニルであり；好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどのC₂₋₆-アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン又はブチンなどのC₂₋₄-アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどのC₃₋₈シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどのC₃₋₇シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル、特にシクロペンチル又はシクロヘキシルなどのC₃₋₆シクロアルキルであり；

及び／又は、

好ましくは、R³がアルキルではなく；

及び／又は、

もっとも好ましくは、R³が、置換又は非置換のプロピル若しくはブチルなどのアルキルから、ジエチルアセタミドなどのCONR⁶R⁷、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルなどのシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、又は、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンなどのヘテロシクリルから選択され、

又は、もっとも好ましくは、R³が、置換又は非置換のシクロペンチル若しくはシクロヘキシルなどのシクロアルキルから、又は、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、置換又は非置換のピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンなどのヘテロシクリルから選択される。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0094

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0094】

一般式I、II、III、IV又はVの本発明の化合物のもう1つの好ましい実施態様において、前記化合物は、化合物であり、

R^4 が、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルであり；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくはフェニルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；好ましくは、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含有する1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどの $C_{1\sim 8}$ アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどの $C_{1\sim 6}$ アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどの $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、 $C_{2\sim 10}$ -アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどの $C_{2\sim 8}$ アルケニルであり；好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルケニルであり；より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、 $C_{2\sim 10}$ アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどの $C_{2\sim 8}$ -アルキニルであり、好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン又はブチンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどの $C_{3\sim 8}$ シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどの $C_{3\sim 7}$ シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル、特にシクロペンチル又はシクロヘキシルなどの $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルであり；

及び／又は、

もっとも好ましくは、 R^4 が水素から、又は、 CH_3 若しくは CH_2OH などの置換又は非置換の $C_{1\sim 4}$ アルキルから選択される。

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0096

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0096】

一般式I、II、III、IV又はVの本発明の化合物のもう1つの好ましい実施態様において、前記化合物は、化合物であり、

R^6 、 R^7 及び R^8 が、相互に独立して、水素、置換又は非置換のアルキル、置換又は非置換のシクロアルキル、置換又は非置換のアルケニル、置換又は非置換のアルキニル、置換又は非置換のアリール、及び、置換又は非置換のヘテロシクリルからなる群から選択され、又は、 R^6 、 R^7 若しくは R^8 が、それぞれの結合する炭素若しくは窒素原子と一緒に、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルの4~7員の環を形成してもよく；

ここで、

前記アリールが、フェニル、ナフチル又はアントラセンであり；好ましくは、ナフチル及びフェニルであり；より好ましくは、フェニルであり；

及び／又は、

前記アルキル-アリールが、 $C_{1\sim 4}$ -アルキル-アリールであり；好ましくは、ベンジルであり；

及び／又は、

前記ヘテロシクリルが、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ以上の飽和又は不飽和の環の複素環系であり；好ましくは、少なくとも1つの環が環中に窒素、酸素及び／又は硫黄からなる群からの1つ以上のヘテロ原子を含む1つ又は2つの飽和又は不飽和の環の複素環系であり；より好ましくは、イミダゾール、オキサジアゾール、テトラゾール、ピリジン、ピリミジン、ピペリジン、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ベンズイミダゾール、インダゾール、ベンゾチアゾール、インドリン、フラン、トリアゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピロール、ピラジン、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ベンゾ-1,2,5-チアジアゾール、インドール、ベンゾトリニアゾール、ベンゾジオキソラン、ベンゾジオキサン、カルバゾール及びキナゾリンから選択され、特にピリジン、イミダゾール、インデン、2,3-ジヒドロインデン、ベンゾフラン、ピリミジンであり；

及び／又は、

前記アルキルが、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル又はオクチルなどの $C_{1\sim 8}$ アルキルであり；好ましくは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル又はヘキシルなどの $C_{1\sim 6}$ アルキルであり；より好ましくは、メチル、エチル、プロピル又はブチルなどの $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

及び／又は、

前記アルケニルが、 $C_{2\sim 10}$ -アルケニル、又は、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン、ヘキシレン、ヘプチレン若しくはオクチレンなどの $C_{2\sim 8}$ アルケニルであり、好ましくは、エチレン、プロピレン、ブチレン、ペンチレン又はヘキシレンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルケニルであり；より好ましくは、エチレン、プロピレン又はブチレンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルケニルからであり；

及び／又は、

前記アルキニルが、 $C_{2\sim 10}$ アルキニル、又は、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン、ヘキシン、ヘプチン若しくはオクチンなどの $C_{2\sim 8}$ -アルキニルであり；好ましくは、エチン、プロピン、ブチン、ペンチン又はヘキシンなどの $C_{2\sim 6}$ -アルキニルであり；より好ましくは、エチン、プロピン又はブチンなどの $C_{2\sim 4}$ -アルキニルであり；

及び／又は、

前記シクロアルキルが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル又はシクロオクチルなどの $C_{3\sim 8}$ シクロアルキルであり；好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル又はシクロヘプチルなどの $C_{3\sim 7}$ シクロアルキルであり；より好ましくは、シクロプロピル、シクロブチル、シ

クロペンチル又はシクロヘキシリであり、

及び／又は、

R^6 、 R^7 又は R^8 が、各々が結合する炭素又は窒素原子と一緒に、シクロアルキル又はヘテロシクリルの環を形成する場合に、この環は5又は6員であり、好ましくは、飽和、非置換のシクロヘキシリなどの飽和の5又は6員のシクロアルキル環を形成し；

及び／又は、

もっとも好ましくは、 R^6 、 R^7 及び R^8 が、相互に独立して、水素から、置換又は非置換のメチル、エチル、プロピル又はブチルなどの C_{1-4} アルキルから、置換又は非置換のフェニルなどのアリールから、置換又は非置換のピロリジンなどのヘテロシクリルから、又は、置換若しくは非置換のベンジルなどのアルキル-アリールから選択され、又は、 R^6 及び R^7 が結合する炭素原子と一緒にシクロヘキシリなどのシクロアルキルの5又は6員の環を形成する。

【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0119

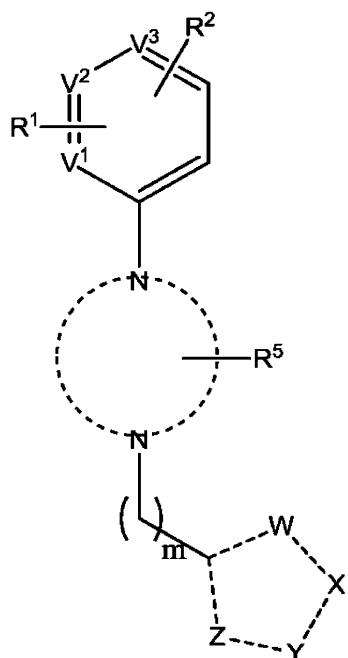
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0119】

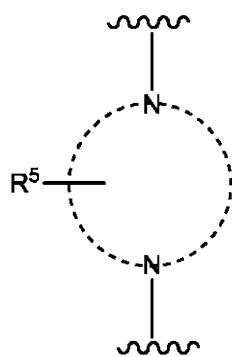
本発明のもう1つの好ましい態様は、また、式Iの本発明の化合物の製造方法であり、

【化154】



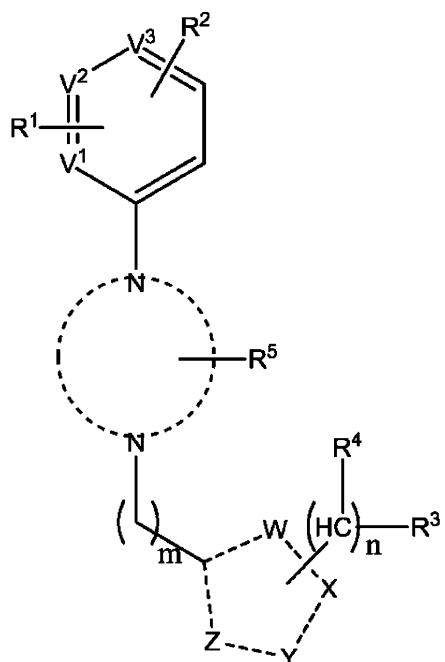
R^1 、 R^2 、 R^5 、 V^1 、 V^2 、 $\frac{(1)}{V^3}$ 、 W 、 X 、 Y 、 Z 及び m 、並びに、

【化155】



が、請求項1又は式Iaに定義されているとおりであり、

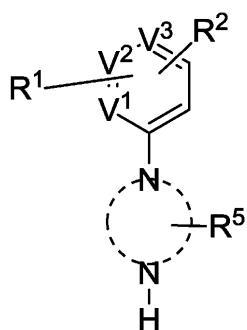
【化156】



$\frac{(Ia)}$
R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、V¹、V²、V³及びmが、請求項1に定義されているとおりであり、

式VIの化合物又はその塩酸塩などの適切な塩が、

【化157】



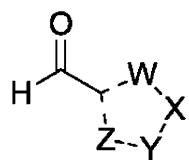
(VI)

(R¹、R²、R⁵、V¹、V²及びV³は、式Iに対して定義されるとおりであり)、

(式Iの化合物に対して)式VIIの化合物と、又は、(式Iaの化合物に対して)式VIIaの化合

物とステップ1の条件下、反応され、

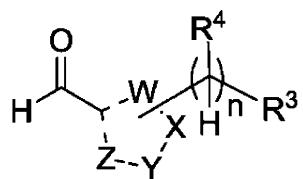
【化158】



(VII)

又は、

【化159】



(VIIa)

(R³、R⁴、W、X、Y、Z及びnは、式Iに対して定義されているとおりである)

式(I)又は式(Ia)のそれぞれの化合物をもたらし、

ステップ1の式(VI)及び(VII又はVIIa)の化合物の還元的アミノ化反応が、還元試薬で、非プロトン溶媒中で、有機塩基の存在下、実施される。