

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成21年6月18日 (2009.6.18)

【公表番号】特表2008-540637(P2008-540637A)

【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2008-511823(P2008-511823)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 413/14 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月24日 (2009.4.24)

【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

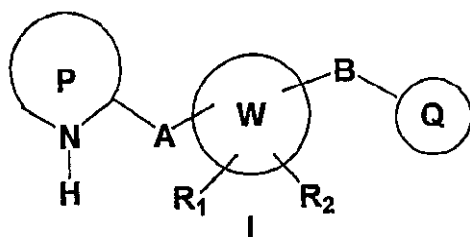
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 I :

【化 1】



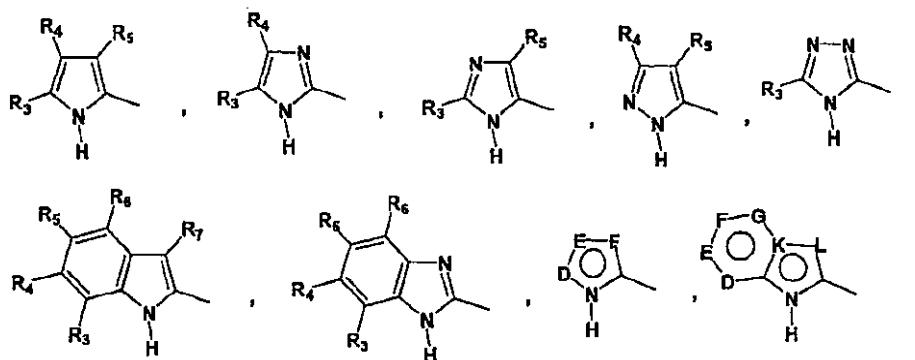
【式中、

Wは、 (C_4-C_7) シクロアルキル、 (C_3-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_3-C_7) ヘテロシクロアルキル (C_1-C_3) アルキル又は (C_3-C_7) ヘテロシクロアルケニル環を示し；

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

Pは、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 2】



(式中、

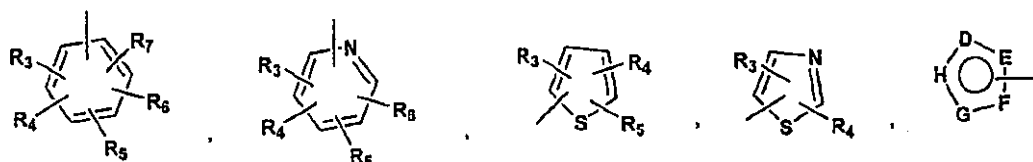
R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-(C_3-C_6)$ シクロアルキル、 $-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-(C_2-C_6)$ アルケニル、 $-(C_2-C_6)$ アルキニル、ハロ $-(C_1-C_6)$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキル、アリール、 $-\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{10})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_8\text{COR}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{SO}_2\text{R}_9$ 、 $-\text{N}\text{R}_{10}\text{CO}\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{SR}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{R}_9$ 、又は $\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{R}_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；各環は、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-(C_0-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-\text{O}(\text{アリール})$ 、 $-\text{O}(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-\text{O}-(C_1-C_3)$ アルキルアリール、 $-\text{O}-(C_1-C_3)$ アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール)又は $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) (C_0-C_3-) アルキルヘテロアリール基により更に置換される。)のヘテロアリール基を示し；

R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、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；それらのいずれかは、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)、 $-N(C_0-C_6-アルキル)_2$ 、 $-N((C_0-C_6)アルキル)((C_3-C_7-)シクロアルキル)$ 又は $-N((C_0-C_2)アルキル)$ (アリール)置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は $-S-$ を示し；

Qは、次式：

【化3】



(式中、

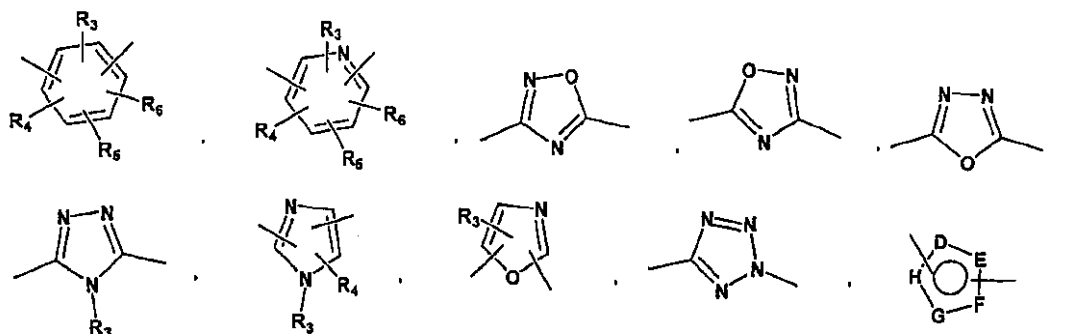
R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は $-S-$ を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Aは、アゾ- $N=N-$ 、エチル、エテニル、エチニル、 $-NR_8C(=O)-$ 、 $-NR_8C(=O)-O-$ 、 $-NR_8C(=O)-NR_9$ 、 $NR_8S(=O)_2-$ 、 $-C(=O)NR_8-$ 、 $-O-C(=O)NR_8-$ 、 $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-S(=O)_2NR_8-$ 、 $-C(=O)-O-$ 、 $-O-C(=O)-$ 、 $-C(=NR_8)NR_9-$ 、 $C(=NOR_8)NR_9-$ 、 $-NR_8C(=NOR_9)-$ 、 $=N-O-$ 、 $-O-N=C$ H-、又は次式：

【化4】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、独立に前記定義のとおりであり；

AにおけるD、E、F、G及びHは独立に、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は $-S-$ であり；

R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、独立に前記定義のとおりである。)；

のアリールもしくはヘテロアリール基であり；

Bは、単結合、 $-C(=O)-(C_0-C_2)$ 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(ここで、 R_8 及び R_9 は独立に前記定義のとおりである。);

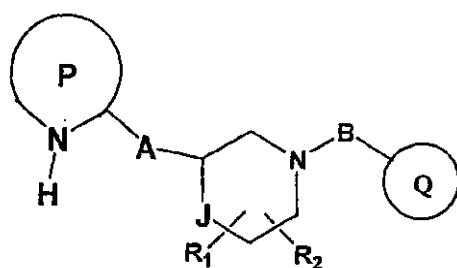
任意のNはN-オキソでよい。]

で表される化合物、又はその薬学的に許容される塩、その水和物もしくはその溶媒和物。

【請求項2】

下記式I-A:

【化5】



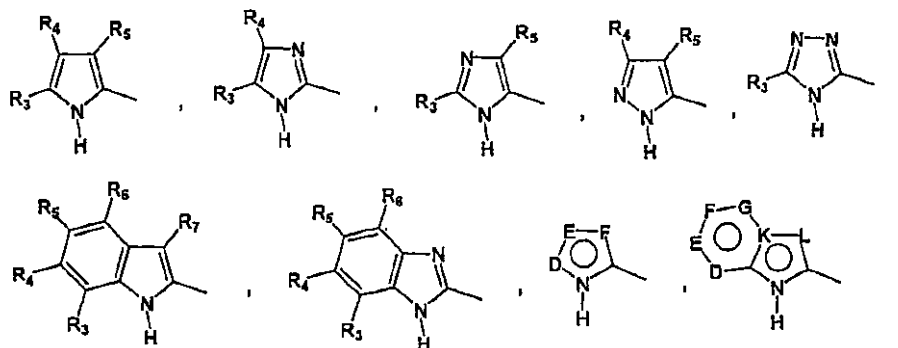
I-A

[式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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;

Pは、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式:

【化6】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CO NR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-C(O)-O-R_8$ 、 $-C(=$

O)NR₈R₉、-C(=NR₈)R₉、又はC(=NOR₈)R₉置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；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により更に置換される。)

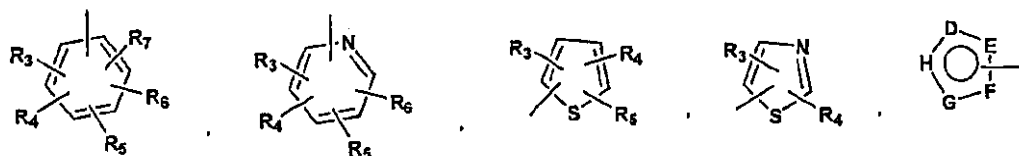
のヘテロアリール基を示し；

R₈、R₉、R₁₀は各々独立に、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；それらのいずれかは、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-C₂)アルキル)(アリール)置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Qは、次式：

【化7】



(式中、

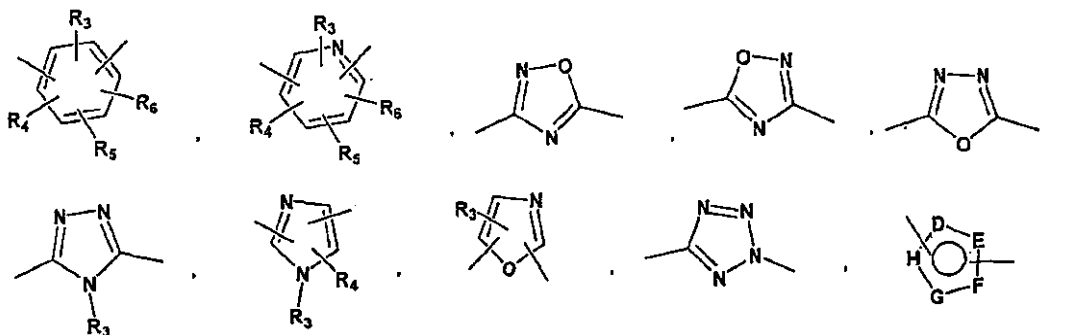
R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示す。)

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Aは、アゾ-N=N-、エチル、エテニル、エチニル、-NR₈C(=O)-、-NR₈C(=O)-O-、-NR₈C(=O)-NR₉、NR₈S(=O)₂-、-C(=O)NR₈-、-O-C(=O)NR₈-、-S-、-S(=O)-、-SO₂-、-S(=O)₂NR₈-、-C(=O)-O-、-O-C(=O)-、-C(=NR₈)NR₉-、C(=NOR₈)NR₉-、-NR₈C(=NOR₉)-、=N-O-、-O-N=C H-、又は次式：

【化 8】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、独立に前記定義のとおりであり；

A における D、E、F、G 及び H は独立に、 $-C(R_3)=$ 、 $-C(R_3)=C(R_4)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-N=$ 、 $-N(R_3)-$ 又は $-S-$ であり；

R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、独立に前記定義のとおりである。）

のアリールもしくはヘテロアリール基であり；

B は、単結合、 $-C(=O)-(C_0-C_2)$ 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（ここで、 R_8 及び R_9 は独立に前記定義のとおりである。）；

J は独立に、単結合、 $-(R_{10}、R_{11})$ 、 $-O-$ 、 $N(R_{10})-$ 又は $-S-$ ；

(式中、

R_{10} 、 R_{11} は独立に、水素原子、 $-(C_1-C_6)$ 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；それらのいずれかは、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) 又は $-N((C_0-C_2)$ 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)置換基により置換される。）

を示し；

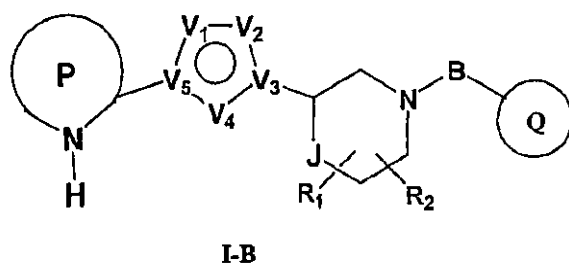
任意の N は N-オキシドでよい。]

で表される請求項 1 記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、その水和物もしくはその溶媒和物。

【請求項 3】

下記式 I-B：

【化 9】

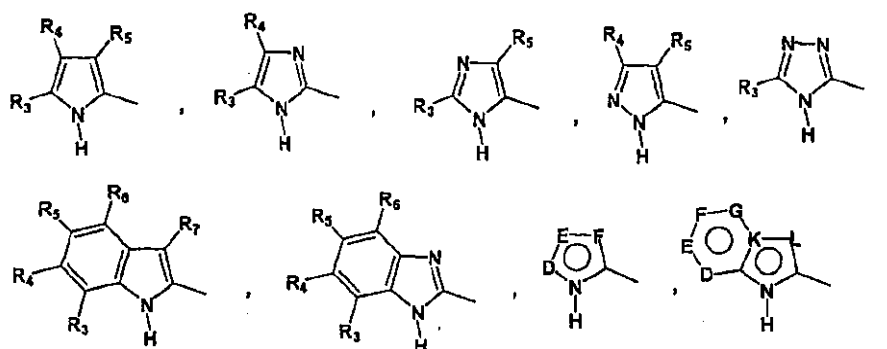


【式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

P は、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 10】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{10})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_8\text{COR}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{SO}_2\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{10}\text{CO NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{SR}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{R}_9$ 、又は $\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{R}_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；各環は、場合により、1~5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-$ (C_0-C_6) アルキル、 $-\text{O}-$ (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{O}-$ $(-C_1-C_3)$ アルキルアリール、 $-\text{O}-$ (C_1-C_3) アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}((-C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール) 又は $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) (C_0-C_3-) アルキルヘテロアリール) 基により更に置換される。) のヘテロアリール基を示し；

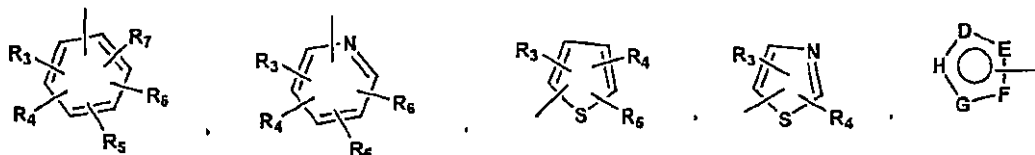
R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) アルキ

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；それらのいずれかは、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-C₂)アルキル)(アリール)置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Qは、次式：

【化 1 1】



(式中、

R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

V₁、V₂、V₃、V₄及びV₅は独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Bは、単結合、-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(ここで、R₈及びR₉は独立に前記定義のとおりである。)；

Jは独立に、単結合、-(R₁₀、R₁₁)、-O-、N(R₁₀)-又は-S-；

(式中、

R₁₀、R₁₁は独立に、水素原子、-(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；それらのいずれかは、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)又は-N((C₀-C₂)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)置換基により置換される。)を示し；

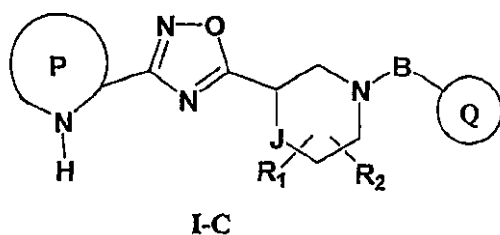
任意のNはN-オキシドでよい。]

で表される、請求項 1 又は 2 記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、当該化合物の水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 4】

下記式 I-C：

【化 1 2】

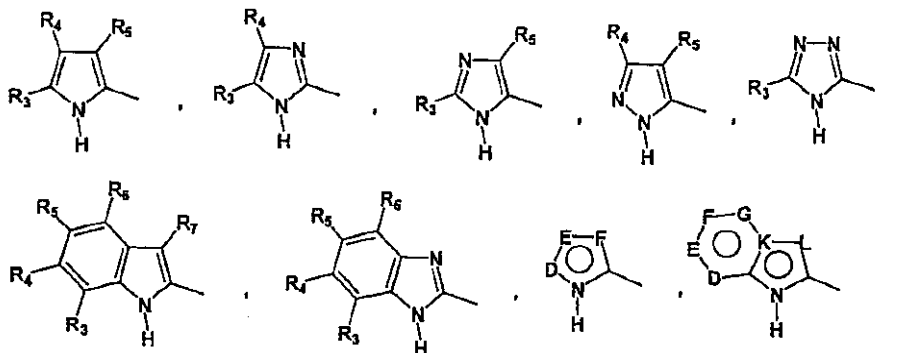


[式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

Pは、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 1 3】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{10})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_8\text{COR}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{SO}_2\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{10}\text{CO NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{SR}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{R}_9$ 、又は $\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{R}_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；各環は、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-(C_0-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-(C_3-C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $-\text{O}(\text{アリール})$ 、 $-\text{O}(\text{ヘテロアリール})$ 、 $-\text{O}-(C_1-C_3)$ アルキルアリール、 $-\text{O}-(C_1-C_3)$ アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール)又は $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) (C_0-C_3-) アルキルヘテロアリール)基により更に置換される。)のヘテロアリール基を示し；

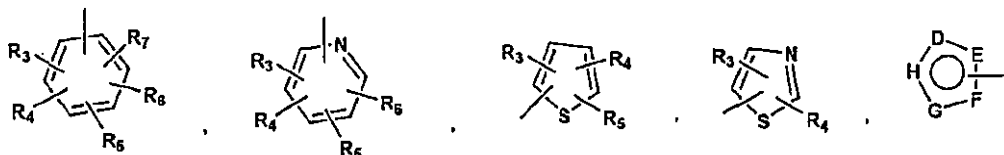
R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、ハロ $-(C_1-C_6)$ アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、アリールアルキ

ル又はアリールであり；それらのいずれかは、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-C₂)アルキル)(アリール)置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-
 、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Qは、次式：

【化 1 4】



(式中、

R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-
 、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Bは、単結合、-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(こ
 こで、R₈及びR₉は独立に前記定義のとおりである。)；

Jは独立に、単結合、-(R₁₀、R₁₁)、-O-、N(R₁₀)-又は-S-；

(式中、

R₁₀、R₁₁は独立に、水素原子、-(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
 ；それらのいずれかは、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)又は-N((C₀-C₂)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)置換基により置換される。)を
 示し；

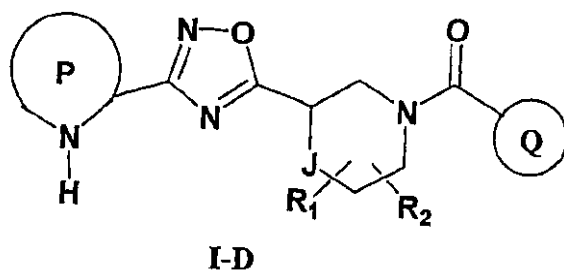
任意のNはN-オキシドでよい。]

で表される、請求項 1 又は 2 記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、当該化合物
 の水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 5】

下記式 I-D：

【化 1 5】

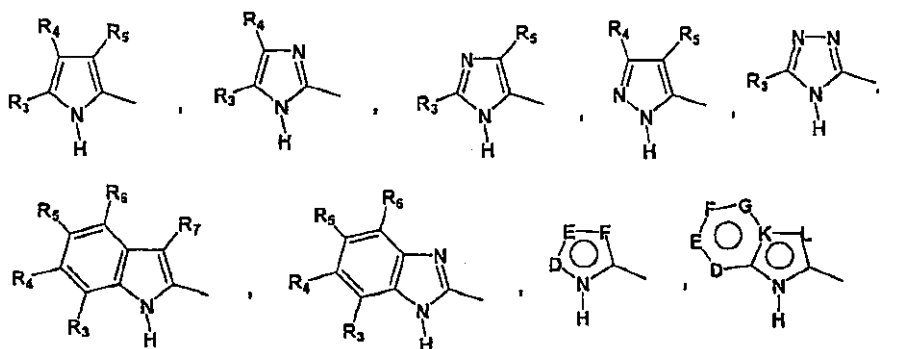


【式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

P は、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 1 6】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{10})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_8\text{COR}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{SO}_2\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{10}\text{CO NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{SR}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{R}_9$ 、又は $\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{R}_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；各環は、場合により、1~5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-$ (C_0-C_6) アルキル、 $-\text{O}-$ (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{O}-$ $(-C_1-C_3)$ アルキルアリール、 $-\text{O}-$ (C_1-C_3) アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}((-C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール) 又は $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) (C_0-C_3-) アルキルヘテロアリール) 基により更に置換される。) のヘテロアリール基を示し；

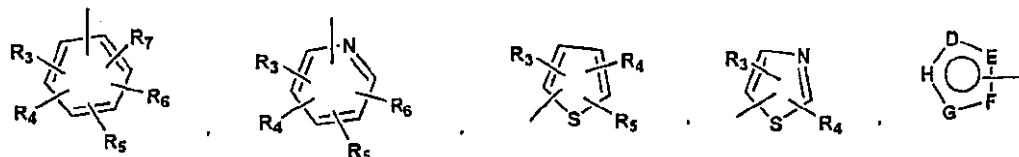
R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) アルキ

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；それらのいずれかは、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{N}(\text{C}_0-\text{C}_6\text{-アルキル})_2$ 、 $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})((\text{C}_3-\text{C}_7\text{-シクロアルキル})$ 又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_2)\text{アルキル})(\text{アリール})$ 置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、 $-\text{C}(\text{R}_3)=$ 、 $-\text{C}(\text{R}_3)=\text{C}(\text{R}_4)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}=$ 、 $-\text{N}(\text{R}_3)-$ 又は $-\text{S}-$ を示し；

Qは、次式：

【化 1 7】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、 $-\text{C}(\text{R}_3)=$ 、 $-\text{C}(\text{R}_3)=\text{C}(\text{R}_4)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}=$ 、 $-\text{N}(\text{R}_3)-$ 又は $-\text{S}-$ を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Jは独立に、単結合、 $-(\text{R}_{10}$ 、 $\text{R}_{11})$ 、 $-\text{O}-$ 、 $\text{N}(\text{R}_{10})-$ 又は $-\text{S}-$ ；

(式中、

R_{10} 、 R_{11} は独立に、水素原子、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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(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；それらのいずれかは、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})$ 又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_2)\text{アルキル})((\text{C}_3-\text{C}_7)$ シクロアルキル)又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})(\text{アリール})$ 置換基により置換される。)を示し；

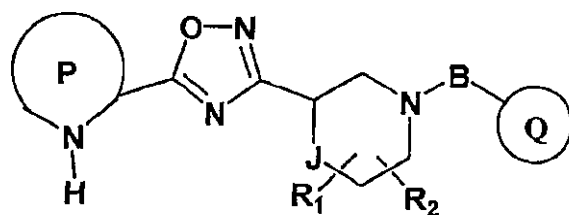
任意のNはN-オキシドでよい。]

で表される、請求項 1 又は 2 記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、その水和物もしくはその溶媒和物。

【請求項 6】

下記式 II-A：

【化 1 8】



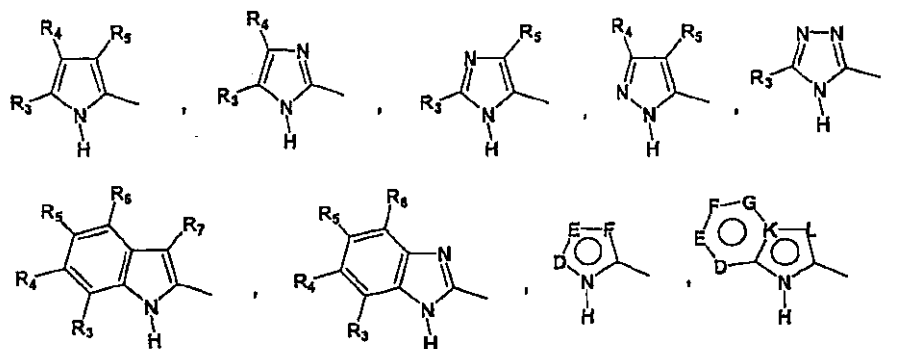
II-A

【式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

Pは、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 1 9】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-OR_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_{10})NR_8R_9$ 、 $-NR_8COR_9$ 、 $NR_8CO_2R_9$ 、 $NR_8SO_2R_9$ 、 $-NR_{10}CO NR_8R_9$ 、 $-SR_8$ 、 $-S(=O)R_8$ 、 $-S(=O)_2R_8$ 、 $-S(=O)_2NR_8R_9$ 、 $-C(=O)R_8$ 、 $-C(O)-O-R_8$ 、 $-C(=O)NR_8R_9$ 、 $-C(=NR_8)R_9$ 、又は $C(=NOR_8)R_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；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、 $-N((C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール)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ル基により更に置換される。) のヘテロアリール基を示し；

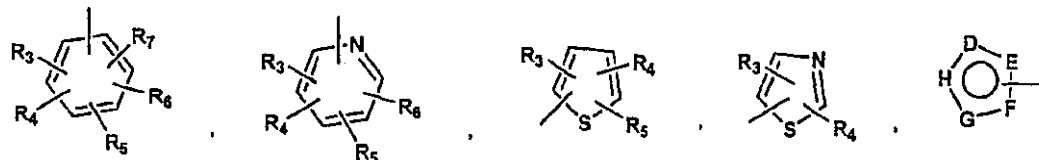
R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) アルキ

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；それらのいずれかは、場合により、1～5個の独立したハロゲン、
 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{N}(\text{C}_0-\text{C}_6\text{-アルキル})_2$ 、 $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})((\text{C}_3-\text{C}_7\text{-シクロアルキル})$ 又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_2)\text{アルキル})(\text{アリール})$ 置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、 $-\text{C}(\text{R}_3)=$ 、 $-\text{C}(\text{R}_3)=\text{C}(\text{R}_4)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}=$ 、 $-\text{N}(\text{R}_3)-$ 又は $-\text{S}-$ を示し；

Qは、次式：

【化 2 0】



(式中、

R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、 $-\text{C}(\text{R}_3)=$ 、 $-\text{C}(\text{R}_3)=\text{C}(\text{R}_4)-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{C}(=\text{S})-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}=$ 、 $-\text{N}(\text{R}_3)-$ 又は $-\text{S}-$ を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Bは、単結合、 $-\text{C}(=\text{O})-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $-\text{C}(=\text{O})-(\text{C}_2-\text{C}_6)$ アルケニル-、 $-\text{C}(=\text{O})-(\text{C}_2-\text{C}_6)$ アルキニル-、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{NR}_9$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $-\text{S}(=\text{O})_2-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $\text{C}(=\text{NR}_8)-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-、 $-\text{C}(=\text{NOR}_8)-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-又は $-\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{NR}_9-(\text{C}_0-\text{C}_2)$ アルキル-を示し(ここで、R₈及びR₉は独立に前記定義のとおりである。)；

Jは独立に、単結合、 $-(\text{R}_{10}、\text{R}_{11})$ 、 $-\text{O}-$ 、 $\text{N}(\text{R}_{10})-$ 又は $-\text{S}-$ ；

(式中、

R₁₀、R₁₁は独立に、水素原子、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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(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；それらのいずれかは、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 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、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})$ 又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_2)\text{アルキル})((\text{C}_3-\text{C}_7)$ シクロアルキル)又は $-\text{N}((\text{C}_0-\text{C}_6)\text{アルキル})(\text{アリール})$ 置換基により置換される。)を示し；

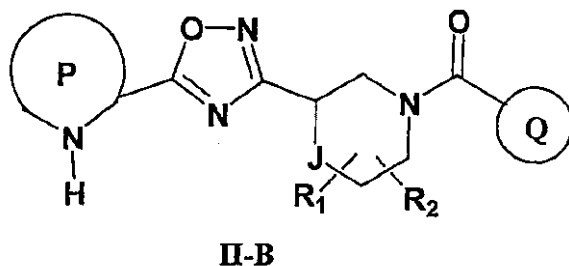
任意のNはN-オキシドでよい。]

で表される、請求項1又は2記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、当該化合物の水和物もしくは溶媒和物。

【請求項7】

下記式II-B：

【化 2 1】

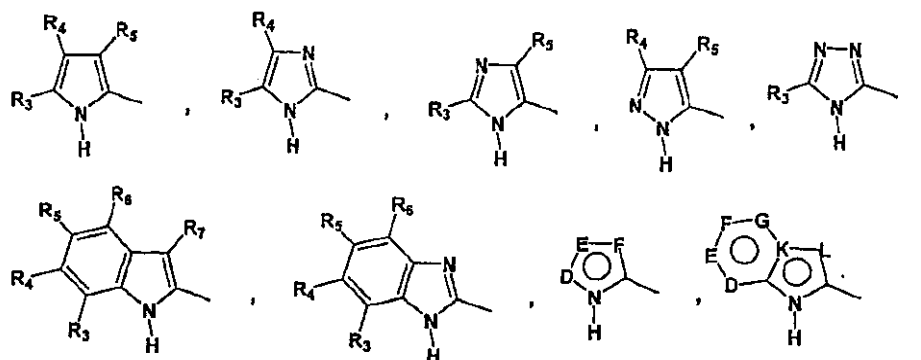


【式中、

R_1 及び R_2 は独立に、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、 $-(C_1-C_6)$ アルコキシを示すか、あるいは R_1 及び 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；

P は、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルキル、 (C_5-C_7) ヘテロシクロアルケニル環、又は次式：

【化 2 2】



(式中、

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 及び R_7 は独立に、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-(C_1-C_6)$ 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、 $-\text{OR}_8$ 、 $-\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_{10})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_8\text{COR}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{CO}_2\text{R}_9$ 、 $\text{NR}_8\text{SO}_2\text{R}_9$ 、 $-\text{NR}_{10}\text{CO NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{SR}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}_8$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}_8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}_8)\text{R}_9$ 、又は $\text{C}(=\text{NOR}_8)\text{R}_9$ 置換基であり；ここで、場合により2個の置換基は介在原子と一緒に二環性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；各環は、場合により、1～5個の独立したハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-(C_1-C_6)$ アルキル、 $-\text{O}-$ (C_0-C_6) アルキル、 $-\text{O}-$ (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 $-\text{O}$ (アリール)、 $-\text{O}$ (ヘテロアリール)、 $-\text{O}-$ $(-C_1-C_3)$ アルキルアリール、 $-\text{O}-$ (C_1-C_3) アルキルヘテロアリール、 $-\text{N}((-C_0-C_6)$ アルキル) $((C_0-C_3)$ アルキルアリール) 又は $-\text{N}((C_0-C_6)$ アルキル) (C_0-C_3-) アルキルヘテロアリール) 基により更に置換される。) のヘテロアリール基を示し；

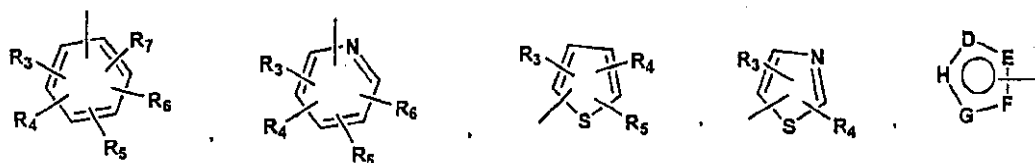
R_8 、 R_9 、 R_{10} は各々独立に、水素、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキルアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、ハロ- (C_1-C_6) アルキ

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；それらのいずれかは、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-C₂)アルキル)(アリール)置換基により置換される；

PにおけるD、E、F、G、K及びLは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示し；

Qは、次式：

【化 2 3】



(式中、

R₃、R₄、R₅、R₆及びR₇は独立に前記定義のとおりであり；

QにおけるD、E、F、G及びHは独立に、-C(R₃)=、-C(R₃)=C(R₄)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-N=、-N(R₃)-又は-S-を示す。)；

のシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール基を示し；

Jは独立に、単結合、-(R₁₀、R₁₁)、-O-、N(R₁₀)-又は-S-；

(式中、

R₁₀、R₁₁は独立に、水素原子、-(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；それらのいずれかは、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)又は-N((C₀-C₂)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)置換基により置換される。)を示し；

任意のNはN-オキシドでよい。]

で表される、請求項 1 又は 2 記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩、当該化合物の水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 8】

光学異性体として存在することができ、そして、ラセミ混合物又は各光学異性体のいずれかである、請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 9】

以下：

(4-フルオロ-フェニル)-{(S)-3-[3-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

(2,4-ジフルオロ-フェニル)-{(S)-3-[3-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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-[3-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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)-{3-[5-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-

(2-フルオロ-ヒリシブ-4-イル)- Σ (S)-3-[5-(4-メチル-1H-ヒロ-ル-2-イル)-[1,2,4]

(4-フルオロ-フェニル)-{(S)-3-[5-(4-トリフルオロメチル-1H-イミダゾール-2-イル)]}

-[1,2,4]オキサジアゾール-3-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-[5-(4-イソプロピル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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-[3-(1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピロリジン-1-イル}-メタノン

(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[5-(4-メチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

{(S)-3-[5-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-メタノン

(2-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[5-(4-フルオロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

{(S)-3-[5-(4-ブromo-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-メタノン

(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[5-(4-フルオロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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-(4-フルオロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-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-[5-(4-フルオロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

{(S)-3-[3-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-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-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-(2-フルオロ-ピリジン-4-イル)-メタノン

{(S)-3-[3-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-メタノン

{(S)-3-[3-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-(5-メチル-イソオキサゾール-4-イル)-メタノン

{(S)-3-[3-(4-ブromo-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-メタノン

(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[3-(4-フルオロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[3-(4-メチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-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-(4-シアノ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

5-{3-[(S)-1-(6-フルオロ-ピリジン-3-カルボニル)-ピペリジン-3-イル]-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル}-1H-ピロール-3-カルボニトリル

5-{3-[(S)-1-(2-フルオロ-ピリジン-4-カルボニル)-ピペリジン-3-イル]-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル}-1H-ピロール-3-カルボニトリル

5-{3-[(S)-1-(3-フルオロ-ピリジン-4-カルボニル)-ピペリジン-3-イル]-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル}-1H-ピロール-3-カルボニトリル

(4-フルオロ-フェニル)-{(S)-3-[5-(4-トリフルオロメチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

(3-フルオロ-ピリジン-4-イル)-{(S)-3-[5-(4-トリフルオロメチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-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-[5-(4-トリフルオロメチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-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-[3-(4-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン

{(S)-3-[5-(4-クロロ-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-3-イル]-ピペ

リジン-1-イル}-ピリジン-4-イル-メタノン

(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-{(S)-3-[3-(4-トリフルオロメチル-1H-ピロール-2-イル)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル]-ピペリジン-1-イル}-メタノン、から選ばれる、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の治療上有効量、及び薬学的に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 11】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、ヒトを含む哺乳動物における症状を治療又は予防するための医薬組成物であって、そのような治療又は予防に必要な哺乳動物に投与され、当該治療又は予防は、mGluR5アロステリックモジュレーターの神経調節系効果により影響又は促進される、前記医薬組成物。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、ヒトを含む哺乳動物の症状を治療又は予防するための医薬組成物であって、そのような治療又は予防に必要な哺乳動物に投与され、当該治療又は予防は、陽性のmGluR5アロステリックモジュレーター（エンハンサー）の神経調節系効果により影響又は促進される、前記医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、不安障害：広所恐怖症、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)、対人恐怖、他の恐怖症、及び物質誘発性不安障害からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、小児期障害：注意欠陥多動性障害からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、摂食障害（神経性無食欲症、神経性大食症）からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、気分障害：双極性障害(I型及びII型)、循環病、鬱病、気分変調性障害、大鬱病性障害、及び物質誘発性気分障害からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、精神異常：統合失調症、妄想性障害、分裂情動障害、分裂病様障害、及び物質誘発性精神病からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、認知機能障害：精神錯乱、物質誘発性持続的精神錯乱、痴呆、HIV病に起因する痴呆、ハンチントン病に起因する痴呆、パーキンソン病に起因する痴呆、アルツハイマー型の痴呆、物質誘発性持続性痴呆、及び軽度認知機能障害からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、人格障害：強迫性人格障害、統合失調質障害、及び統合失調型障害からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、物質関連障害：アルコール中毒、アルコール依存、アルコール離脱、アルコール離脱精神錯乱、アルコール誘導精神

病、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、及びオピオイド離脱からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 2 1】

請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の有効量を含む、多発性硬化症、例えば良性の多発性硬化症、再発寛解型多発性硬化症、二次性進行型多発性硬化症、一次性進行型多発性硬化症、及び進行性再発型多発性硬化症からなる群より選ばれる中枢神経系疾患を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項記載の化合物を含む、請求項 1 3 ～ 2 1 のいずれか 1 項に記載の中枢神経系疾患の治療又は予防のための医薬組成物。

【請求項 2 3】

代謝型グルタミン酸受容体を画像化するためのトレーサーを製造するための請求項 1 ～ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。