

【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12月20日(2018.12.20)

【公開番号】特開2018-108997(P2018-108997A)

【公開日】平成30年7月12日(2018.7.12)

【年通号数】公開・登録公報2018-026

【出願番号】特願2018-1678(P2018-1678)

【国際特許分類】

C 0 7 C	62/38	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	31/192	(2006.01)
A 6 1 K	31/198	(2006.01)
A 6 1 K	31/216	(2006.01)
A 6 1 K	31/22	(2006.01)
A 6 1 K	31/222	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/353	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/36	(2006.01)
A 6 1 K	31/365	(2006.01)
A 6 1 K	31/396	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	31/4174	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/423	(2006.01)
A 6 1 K	31/4245	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/495	(2006.01)
A 6 1 K	31/7024	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	203/06	(2006.01)
C 0 7 D	203/08	(2006.01)
C 0 7 D	203/22	(2006.01)
C 0 7 D	207/08	(2006.01)
C 0 7 D	207/337	(2006.01)
C 0 7 D	215/18	(2006.01)
C 0 7 D	233/64	(2006.01)
C 0 7 D	235/26	(2006.01)
C 0 7 D	241/08	(2006.01)
C 0 7 D	257/04	(2006.01)
C 0 7 D	263/58	(2006.01)
C 0 7 D	271/06	(2006.01)
C 0 7 D	271/07	(2006.01)

C 0 7 D 305/06 (2006.01)  
 C 0 7 D 305/08 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/54 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/79 (2006.01)  
 C 0 7 D 307/94 (2006.01)  
 C 0 7 D 311/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 317/60 (2006.01)  
 C 0 7 D 319/18 (2006.01)  
 C 0 7 D 403/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/08 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/08 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/10 (2006.01)  
 C 0 7 D 413/12 (2006.01)  
 C 0 7 C 235/82 (2006.01)  
 C 0 7 C 69/757 (2006.01)  
 C 0 7 C 229/22 (2006.01)  
 C 0 7 C 323/62 (2006.01)  
 C 0 7 C 317/44 (2006.01)  
 C 0 7 C 229/46 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 62/38 C S P  
 A 6 1 K 31/165  
 A 6 1 K 31/167  
 A 6 1 K 31/192  
 A 6 1 K 31/198  
 A 6 1 K 31/216  
 A 6 1 K 31/22  
 A 6 1 K 31/222  
 A 6 1 K 31/337  
 A 6 1 K 31/341  
 A 6 1 K 31/343  
 A 6 1 K 31/353  
 A 6 1 K 31/357  
 A 6 1 K 31/36  
 A 6 1 K 31/365  
 A 6 1 K 31/396  
 A 6 1 K 31/40  
 A 6 1 K 31/41  
 A 6 1 K 31/4174  
 A 6 1 K 31/4184  
 A 6 1 K 31/422  
 A 6 1 K 31/423  
 A 6 1 K 31/4245  
 A 6 1 K 31/47  
 A 6 1 K 31/495  
 A 6 1 K 31/7024  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D	203/06	
C 0 7 D	203/08	
C 0 7 D	203/22	
C 0 7 D	207/08	
C 0 7 D	207/337	
C 0 7 D	215/18	
C 0 7 D	233/64	1 0 6
C 0 7 D	235/26	B
C 0 7 D	235/26	C
C 0 7 D	241/08	
C 0 7 D	257/04	B
C 0 7 D	263/58	
C 0 7 D	271/06	
C 0 7 D	271/07	
C 0 7 D	305/06	
C 0 7 D	305/08	
C 0 7 D	307/54	
C 0 7 D	307/79	
C 0 7 D	307/94	
C 0 7 D	311/04	
C 0 7 D	317/60	
C 0 7 D	319/18	
C 0 7 D	403/10	
C 0 7 D	405/08	
C 0 7 D	405/10	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	413/08	
C 0 7 D	413/10	
C 0 7 D	413/12	
C 0 7 C	235/82	
C 0 7 C	69/757	A
C 0 7 C	229/22	
C 0 7 C	323/62	
C 0 7 C	317/44	
C 0 7 C	229/46	

## 【手続補正書】

【提出日】平成30年10月22日(2018.10.22)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

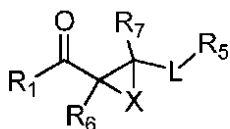
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

## 【化 1】

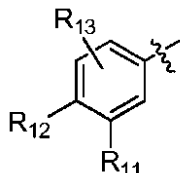


式 I

( 式中、

R<sub>1</sub> は

## 【化 2】



であり、

R<sub>11</sub> はクロロであり、R<sub>12</sub> は、水素、ハロ、トリフルオロメチル、低級アルキルもしくは低級アルコキシもしくはトリフルオロメチルで任意選択的に置換されているシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリールおよび - Z - R<sub>20</sub> から選択され、ここで、

Z は、- O -、- S -、- S ( O ) -、- S ( O )<sub>2</sub> -、- C R<sub>21</sub> R<sub>22</sub> -、- O C R<sub>21</sub> R<sub>22</sub> -、- C R<sub>21</sub> R<sub>22</sub> O -、- N R<sub>23</sub> -、- N R<sub>23</sub> C R<sub>21</sub> R<sub>22</sub> -、- C R<sub>21</sub> R<sub>22</sub> N R<sub>23</sub> -、および - C ( O ) - から選択され、

R<sub>21</sub>、R<sub>22</sub>、および R<sub>23</sub> は、独立して水素、低級アルキル、ヒドロキシルおよび低級アルコキシから選択されるか、あるいは R<sub>21</sub> と R<sub>22</sub> が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されている 3 ~ 7 員のシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環を形成しており、

R<sub>20</sub> は、水素、任意選択的に置換されている C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるか、あるいは

R<sub>20</sub> と R<sub>23</sub> が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しているか、あるいは

R<sub>11</sub> と R<sub>12</sub> が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル環を形成しており；

R<sub>13</sub> は水素またはハロであるか、あるいは

R<sub>12</sub> と R<sub>13</sub> が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しており；

X は、- C R<sub>2</sub> R<sub>3</sub> - および - N R<sub>4</sub> - から選択され；

R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> は、独立して水素、任意選択的に置換されているアミノ、ヒドロキシル、低級アルコキシおよび任意選択的に置換されている低級アルキルから選択されるか、あるいは R<sub>2</sub> と R<sub>3</sub> が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

R<sub>4</sub> は、水素および任意選択的に置換されている低級アルキルから選択され；

L は、- C ( O ) -、- C ( O ) O -、- C ( O ) N ( R<sub>17</sub> ) -、- C ( O ) N ( O R<sub>16</sub> ) -、- N ( R<sub>17</sub> ) S ( O )<sub>2</sub> -、- S ( O )<sub>2</sub> N ( R<sub>17</sub> ) -、- C ( O ) N ( R<sub>17</sub> ) - S ( O )<sub>2</sub> -、- C ( = N - O R<sub>16</sub> ) - および共有結合から選択され、こ

こで、

$R_{16}$  は、水素および低級アルキルから選択され；

$R_{17}$  は、水素および低級アルキルから選択されるか；あるいは

$R_5$  が、水素、任意選択的に置換されているアルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、任意選択的に置換されているシクロアルキル、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるが；ただし、

$L$  が  $-C(O)N(R_{17})-$  である場合、 $R_5$  もまたヒドロキシルまたは低級アルコキシであり得、

$L$  が  $-N(R_{17})S(O)_2-$  である場合、 $R_5$  は水素ではなく、

$L$  が共有結合である場合、 $R_5$  は、シアノ、任意選択的に置換されているヘテロアリール、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるものとするか、あるいは

$R_5$  と  $R_{17}$  が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている4～7員のヘテロシクロアルキル環を形成しており、該環は、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリールまたは任意選択的に置換されているヘテロアリール環と任意選択的に縮合しているか、あるいは

$R_5$  と  $R_7$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている5～7員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている5～7員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

$R_6$  および  $R_7$  は、独立して水素、ハロ、任意選択的に置換されているアミノ、ヒドロキシル、低級アルコキシおよび任意選択的に置換されている低級アルキルから選択されるか、あるいは

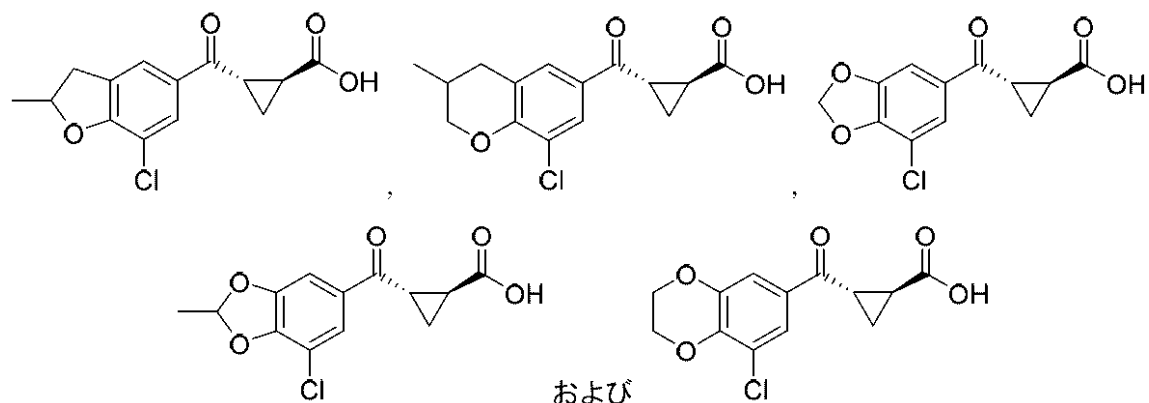
$R_6$  と  $R_7$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている5～7員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている5～7員のヘテロシクロアルキルを形成しているか、あるいは

$R_6$  と  $R_2$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている5～7員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている5～7員のヘテロシクロアルキルを形成しているが、

ただし、 $R_1$  が3-クロロフェニルまたは3,4-ジクロロフェニルであり、かつ  $X$  が  $-CH_2-$ 、 $-CF_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$  または  $-C(CH_3)_2-$  である場合、 $-L-R_5$  は  $-COOH$  でも、 $-CHO$  でも、 $-C(O)NH_2$  でも、 $-C(O)NHCH_3$  でも、 $-C(O)NHCH_2-$  フェニルでも、 $-C(O)NH-$  フェニルでも、 $-C(O)-NH(OH)$  でも、 $-C(O)NHOSO_2-$  フェニルでも、 $-C(O)O-t$ -ブチルでも、 $-C(O)OCH_3$  でも、 $-C(O)-NH-CH$  (フェニル)  $-CH_2CH_2OH$  でもないものとする)

の化合物 (但し、下記化合物

## 【化 3】



を除く) またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 2】

X が  $-C R_2 R_3-$  である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 3】

$R_2$  が、水素、ヒドロキシル、低級アルコキシ、1 個もしくは複数のアルキル基で任意選択的に置換されているアミノ、ならびにハロ、ヒドロキシル、低級アルコキシ、および 1 個もしくは複数のアルキル基で任意選択的に置換されているアミノから独立して選択される 1 個もしくは複数の基で任意選択的に置換されている低級アルキルから選択される、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 4】

$R_2$  が、水素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、ヒドロキシル、メチル、メトキシ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、メトキシメチル、アミノメチル、(メチルアミノ)メチル、および(ジメチルアミノ)メチルから選択される、請求項 3 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 5】

$R_3$  が水素および低級アルキルから選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 6】

$R_3$  が水素およびメチルから選択される、請求項 5 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 7】

$R_2$  と  $R_3$  が水素である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 8】

$R_2$  がメチルであり、 $R_3$  が水素である、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 9】

$R_2$  と  $R_3$  がメチルである、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 10】

$R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されている 5 員もしくは 6 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 員もしくは 6 員のヘテロシクロアルキル環を形成している、請求項 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 11】

$R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されているシクロペンチルまたは任意選択的に置換されているピロリジン - 3 - イルを形成している、請求項 10 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 12】

$R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、シクロペンチルまたはピロリジン - 3 - イルを形成している、請求項 11 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 13】

X が -NR<sub>4</sub>- である、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 14】

$R_4$  が水素である、請求項 13 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 15】

$R_{12}$  が、水素、クロロ、シクロプロピル、フラン - 2 - イル、フルオロ、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 3 - イル、1H - ピロール - 2 - イル、トリフルオロメチル、および 3 - メチルオキシタン - 3 - イルから選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 16】

$R_{12}$  がクロロである、請求項 15 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 17】

$R_{12}$  が -Z-R<sub>20</sub> である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 18】

Z が -O- である、請求項 17 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 19】

Z が -S- である、請求項 17 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 20】

Z が -S(O)<sub>2</sub>- である、請求項 17 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 21】

Z が -CR<sub>21</sub>R<sub>22</sub>- である、請求項 17 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 22】

$R_{20}$  が、水素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチル - エチル、(2R) - ブタン - 2 - イル、(2S) - ブタン - 2 - イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、イソプロピル、およびオキシタン - 3 - イルから選択される、請求項 14 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 23】

$R_1$  が、3 - クロロフェニル、3 - クロロ - 4 - (1 - シクロプロポキシエチル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (1H - イミダゾール - 2 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (1H - ピロール - 2 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (1 - メトキシシクロプロピル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (1 - メチルシクロプロピル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (3 - メチルオキシタン - 3 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロパンスルフィニル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロパンスルホニル) フェニル、3

- クロロ - 4 - シクロプロポキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロポキシメチル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルアミノ) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルメチル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルメチル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (シクロプロピルスルファニル) フェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル、3 - クロロ - 4 - (フラン - 2 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - イソプロポキシ - フェニル、3 - クロロ - 4 - メチル - フェニル、3 - クロロ - 4 - (オキセタン - 3 - イルオキシ) フェニル、3 - クロロ - 4 - (オキセタン - 3 - イルオキシ) フェニル、3 - クロロ - 4 - (ピロリジン - 1 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - (ピロリジン - 3 - イル) フェニル、3 - クロロ - 4 - tert - ブチル - フェニル、3 - クロロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル、3 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル、3 - クロロ - 4 - [(ジメチルアミノ) メチル] フェニル、3 - クロロ - 4 - [1 - (トリフルオロメチル) シクロプロピル] フェニル、3 - クロロ - 4 - [シクロプロピル(ヒドロキシ) メチル] フェニル、3 - クロロ - 4 - [シクロプロピル(メチル) アミノ] フェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロパンカルボニルフェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロポキシフェニル、3 - クロロ - 4 - シクロプロピルフェニル、3, 4 - ジクロロフェニル、3, 5 - ジクロロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、3 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - 4 - クロロ - フェニル、3 - フルオロ - 4 - シクロプロポキシ - フェニル、3 - フルオロ - 4 - イソプロポキシ - フェニル、3 - フルオロ - 4 - メチル - フェニル、3 - フルオロ - 4 - tert - ブチル - フェニル、3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル、4 - (アジリジン - 1 - イルメチル) - 3 - クロロフェニル、4 - [(2R) - ブタン - 2 - イルオキシ] - 3 - クロロフェニル、4 - [(2S) - ブタン - 2 - イルオキシ] - 3 - クロロフェニル、および 4 - tert - ブチル - 3 - クロロフェニルから選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項 24】

R<sub>1</sub> が、2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ベンゾ[d]イミダゾール - 5 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、2H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3, 3a, 7a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 6 - イルから選択され、該 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ベンゾ[d]イミダゾール - 5 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、2H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3, 3a, 7a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 6 - イルの各々は、ハロ、任意選択的に置換されている低級アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロアリール、-OR<sub>12</sub>、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SR<sub>12</sub>、-SOR<sub>11</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、および-COR<sub>12</sub>から独立して選択される 1 個、2 個または 3 個の基で任意選択的に置換されている、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

#### 【請求項 25】

R<sub>1</sub> が、2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ベンゾ[d]イミダゾール - 5 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、2H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3, 3a, 7a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール - 6 - イル

から選択され、該 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、2 H - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2 , 3 , 3 a , 7 a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 6 - イルの各々は、ハロおよび低級アルキルから独立して選択される 1 個、2 個または 3 個の基で任意選択的に置換されている、請求項 2 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 2 6】

R<sub>1</sub> が、7 - クロロ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、8 - クロロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル、2 H - 1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 , 3 , 3 a , 7 a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、8 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、4 - クロロ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イルおよび 4 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イルから選択される、請求項 2 5 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 2 7】

R<sub>7</sub> が、水素、アミノメチル、メトキシメチル、メチル、1 - アミノエチル、1 - メトキシ - エチル、メトキシ、およびハロから選択される、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 2 8】

R<sub>7</sub> がメチルである、請求項 2 7 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 2 9】

R<sub>7</sub> が水素である、請求項 2 7 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 3 0】

L が、- C ( O ) O - 、- C ( O ) N ( R<sub>1 7</sub> ) - および共有結合から選択される、請求項 1 ~ 2 9 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 3 1】

L が - C ( O ) O - である、請求項 3 0 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 3 2】

R<sub>5</sub> が、水素、任意選択的に置換されているアルキル、および任意選択的に置換されているフェニルから選択される、請求項 3 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 3 3】

R<sub>5</sub> が、水素、および、ヒドロキシル、アミノ、( アルキル ) アミノまたは ( ジアルキル ) アミノで任意選択的に置換されている低級アルキルから選択される、請求項 3 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 3 4】

L が - C ( O ) N ( R<sub>1 7</sub> ) - である、請求項 3 0 に記載の化合物またはその薬学的に

許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 35】

R<sub>17</sub> が水素である、請求項 34 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 36】

R<sub>5</sub> が、水素、ヒドロキシル、ヒドロキシルで任意選択的に置換されている、アルキル、およびフェニルから選択される、請求項 34 または 35 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 37】

R<sub>5</sub> が、水素およびヒドロキシルから選択される、請求項 36 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 38】

R<sub>5</sub> が水素である、請求項 37 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 39】

R<sub>5</sub> と R<sub>17</sub> が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている 4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成している、請求項 34 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 40】

L が共有結合である、請求項 30 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 41】

R<sub>5</sub> が、シアノおよび任意選択的に置換されているヘテロアリアルから選択される、請求項 40 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 42】

R<sub>5</sub> が、1, 2, 3, 4 - テトラゾール - 5 - イルおよび 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - オン - 3 - イルから選択される、請求項 41 に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 43】

表 1 ~ 5 のいずれか 1 つに挙げられた化合物から選択される化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 44】

請求項 1 ~ 43 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種類の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ、および少なくとも 1 種類の薬学的に許容され得る賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 45】

キヌレニン 3 - モノオキシゲナーゼ活性によって媒介される状態または障害の処置を、かかる処置を必要とする被験体において行う方法であって、該被験体に請求項 1 ~ 43 のいずれか一項に記載の治療有効量の少なくとも 1 種類の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグを投与することを含む方法。

【請求項 46】

前記状態または障害が神経変性病態を伴うものである、請求項 45 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0318

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0318】

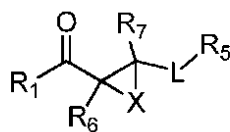
いくつかの実施形態を示し、記載したが、これらに対して、本発明の趣旨および範囲から逸脱せずに種々の改良および置き換えが行われ得る。例えば、請求項の構成の解釈では

、本明細書において以下に示す特許請求の範囲は、なんら文言よりも狭く解釈されることを意図せず、したがって、本明細書の例示的な実施形態が特許請求の範囲に読み替えられることを意図しない。したがって、本発明は、特許請求の範囲の実例として記載したものであって限定するものではないことが理解される。

以下は、本発明の実施形態の一つである。

( 1 ) 式 I

【化 5 0】

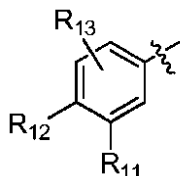


式 I

( 式中、

$R_1$  は

【化 5 1】



であり、

$R_{11}$  はクロロであり、 $R_{12}$  は、水素、ハロ、トリフルオロメチル、低級アルキルもしくは低級アルコキシもしくはトリフルオロメチルで任意選択的に置換されているシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリールおよび  $-Z-R_{20}$  から選択され、ここで、

$Z$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-CR_{21}R_{22}-$ 、 $-O-CR_{21}R_{22}-$ 、 $-CR_{21}R_{22}O-$ 、 $-NR_{23}-$ 、 $-NR_{23}CR_{21}R_{22}-$ 、 $-CR_{21}R_{22}NR_{23}-$ 、および  $-C(O)-$  から選択され、

$R_{21}$ 、 $R_{22}$ 、および  $R_{23}$  は、独立して水素、低級アルキル、ヒドロキシルおよび低級アルコキシから選択されるか、あるいは  $R_{21}$  と  $R_{22}$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されている 3 ~ 7 員のシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキル環を形成しており、

$R_{20}$  は、水素、任意選択的に置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるか、あるいは

$R_{20}$  と  $R_{23}$  が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しているか、あるいは

$R_{11}$  と  $R_{12}$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル環を形成しており、

$R_{13}$  は水素またはハロであるか、あるいは

$R_{12}$  と  $R_{13}$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しており、

$X$  は、 $-CR_2R_3-$  および  $-NR_4-$  から選択され、

$R_2$  および  $R_3$  は、独立して水素、任意選択的に置換されているアミノ、ヒドロキシル、低級アルコキシおよび任意選択的に置換されている低級アルキルから選択されるか、あるいは  $R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換され

ている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

$R_4$  は、水素および任意選択的に置換されている低級アルキルから選択され；

$L$  は、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)N(R_{17})-$ 、 $-C(O)N(OR_{16})-$ 、 $-N(R_{17})S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2N(R_{17})-$ 、 $-C(O)N(R_{17})-S(O)_2-$ 、 $-C(=N-OR_{16})-$  および共有結合から選択され、ここで、

$R_{16}$  は、水素および低級アルキルから選択され；

$R_{17}$  は、水素および低級アルキルから選択されるか；あるいは

$R_5$  が、水素、任意選択的に置換されているアルキル、任意選択的に置換されているアリール、任意選択的に置換されているヘテロアリール、任意選択的に置換されているシクロアルキル、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるが；ただし、

$L$  が  $-C(O)N(R_{17})-$  である場合、 $R_5$  もまたヒドロキシルまたは低級アルコキシであり得、

$L$  が  $-N(R_{17})S(O)_2-$  である場合、 $R_5$  は水素ではなく、

$L$  が共有結合である場合、 $R_5$  は、シアノ、任意選択的に置換されているヘテロアリール、および任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキルから選択されるものとするか、あるいは

$R_5$  と  $R_{17}$  が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている 4 ~ 7 員のヘテロシクロアルキル環を形成しており、該環は、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル、任意選択的に置換されているアリールまたは任意選択的に置換されているヘテロアリール環と任意選択的に縮合しているか、あるいは

$R_5$  と  $R_7$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成しており；

$R_6$  および  $R_7$  は、独立して水素、ハロ、任意選択的に置換されているアミノ、ヒドロキシル、低級アルコキシおよび任意選択的に置換されている低級アルキルから選択されるか、あるいは

$R_6$  と  $R_7$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成しているか、あるいは

$R_6$  と  $R_2$  が、いずれかの介在原子と一体となって、任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている 5 ~ 7 員のヘテロシクロアルキルを形成しているが、

ただし、 $R_1$  が 3 - クロロフェニルまたは 3, 4 - ジクロロフェニルであり、かつ  $X$  が  $-CH_2-$ 、 $-CF_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$  または  $-C(CH_3)_2-$  である場合、 $L-R_5$  は  $-COOH$  でも、 $-CHO$  でも、 $-C(O)NH_2$  でも、 $-C(O)NHCH_3$  でも、 $-C(O)NHCH_2-$  フェニルでも、 $-C(O)NH-$  フェニルでも、 $-C(O)-NH(OH)$  でも、 $-C(O)NH SO_2-$  フェニルでも、 $-C(O)O-t-Bu$  でも、 $-C(O)OCH_3$  でも、 $-C(O)-NH-CH(フェニル)-CH_2CH_2OH$  でもないものとする）

の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(2)  $X$  が  $-CR_2R_3-$  である、(1) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(3)  $R_2$  が、水素、ヒドロキシル、低級アルコキシ、1 個もしくは複数のアルキル基で任意選択的に置換されているアミノ、ならびにハロ、ヒドロキシル、低級アルコキシ、および 1 個もしくは複数のアルキル基で任意選択的に置換されているアミノから独立して選択される 1 個もしくは複数の基で任意選択的に置換されている低級アルキルから選択され

る、(2)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(4)  $R_2$  が、水素、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、ヒドロキシル、メチル、メトキシ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、メトキシメチル、アミノメチル、(メチルアミノ)メチル、および(ジメチルアミノ)メチルから選択される、(3)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(5)  $R_3$  が水素および低級アルキルから選択される、(1)～(4)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(6)  $R_3$  が水素およびメチルから選択される、(5)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(7)  $R_2$  と  $R_3$  が水素である、(2)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(8)  $R_2$  がメチルであり、 $R_3$  が水素である、(2)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(9)  $R_2$  と  $R_3$  がメチルである、(2)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(10)  $R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されている5員もしくは6員のシクロアルキルまたは任意選択的に置換されている5員もしくは6員のヘテロシクロアルキル環を形成している、(2)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(11)  $R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、任意選択的に置換されているシクロペンチルまたは任意選択的に置換されているピロリジン-3-イルを形成している、(10)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(12)  $R_2$  と  $R_3$  が、これらが結合している炭素と一体となって、シクロペンチルまたはピロリジン-3-イルを形成している、(11)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(13) X が  $-NR_4-$  である、(1)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(14)  $R_4$  が水素である、(13)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(15)  $R_{12}$  が、水素、クロロ、シクロプロピル、フラン-2-イル、フルオロ、ピロリジン-1-イル、ピロリジン-3-イル、1H-ピロール-2-イル、トリフルオロメチル、および3-メチルオキセタン-3-イルから選択される、(1)～(14)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(16)  $R_{12}$  がクロロである、(15)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(17)  $R_{12}$  が  $-Z-R_{20}$  である、(1)～(14)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(18) Z が  $-O-$  である、(17)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(19) Z が  $-S-$  である、(17)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(20) Z が  $-S(O)_2-$  である、(17)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(21) Z が  $-CR_{21}R_{22}-$  である、(17)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(22)  $R_{20}$  が、水素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、エチル、2,2,2-トリフルオロ-1-メチル-エチル、(2R)-ブタン-2-イル、(2S)-ブタン-2-イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、イソプロピル、およびオキセタン-3-イルから選択される、(14)～(21)のいずれかに記載の化

合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(23)  $R_1$  が、3-クロロフェニル、3-クロロ-4-(1-シクロプロポキシエチル)フェニル、3-クロロ-4-(1H-イミダゾール-2-イル)フェニル、3-クロロ-4-(1H-ピロール-2-イル)フェニル、3-クロロ-4-(1-メトキシシクロプロピル)フェニル、3-クロロ-4-(1-メチルシクロプロピル)フェニル、3-クロロ-4-(3-メチルオキセタン-3-イル)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロパンスルフィニル)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロパンスルホニル)フェニル、3-クロロ-4-シクロプロポキシ-フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロポキシメチル)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロピルアミノ)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロピルメチル)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロピルメチル)フェニル、3-クロロ-4-(シクロプロピルスルファニル)フェニル、3-クロロ-4-フルオロ-フェニル、3-クロロ-4-(フラン-2-イル)フェニル、3-クロロ-4-イソプロポキシ-フェニル、3-クロロ-4-メチル-フェニル、3-クロロ-4-(オキセタン-3-イルオキシ)フェニル、3-クロロ-4-(オキセタン-3-イルオキシ)フェニル、3-クロロ-4-(ピロリジン-1-イル)フェニル、3-クロロ-4-(ピロリジン-3-イル)フェニル、3-クロロ-4-tert-ブチル-フェニル、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル、3-クロロ-4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェニル、3-クロロ-4-[シクロプロピル(ヒドロキシ)メチル]フェニル、3-クロロ-4-[シクロプロピル(メチル)アミノ]フェニル、3-クロロ-4-シクロプロパンカルボニルフェニル、3-クロロ-4-シクロプロポキシフェニル、3-クロロ-4-シクロプロピルフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-クロロ-フェニル、3-フルオロ-4-シクロプロポキシ-フェニル、3-フルオロ-4-イソプロポキシ-フェニル、3-フルオロ-4-メチル-フェニル、3-フルオロ-4-tert-ブチル-フェニル、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル、4-(アジリジン-1-イルメチル)-3-クロロフェニル、4-[(2R)-ブタン-2-イルオキシ]-3-クロロフェニル、4-[(2S)-ブタン-2-イルオキシ]-3-クロロフェニル、および4-tert-ブチル-3-クロロフェニルから選択される、(1)~(14)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(24)  $R_1$  が、2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-イル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、2H-1,3-ベンゾジオキソール-5-イル、2,3,3a,7a-テトラヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-イル、および2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イル、および2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-6-イルから選択され、該2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-イル、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-イル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル、2H-1,3-ベンゾジオキソール-5-イル、2,3,3a,7a-テトラヒドロ-1-ベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-6-イル、および2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イル、および2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-6-イルの各々は、ハロ、任意選択的に置換されている低級アルキル、任意選択的に置換されているシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロシクロアルキル、任意選択的に置換されているヘテロアリール、-OR<sub>12</sub>、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SR<sub>12</sub>、-SOR<sub>11</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>11</sub>、および-COR<sub>12</sub>から独立して選択される1個、2個または3個の基で任意選択的に置換されている、(1)~(14)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(25)  $R_1$  が、2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5

- イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシシ - 6 - イル、2 H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3, 3 a, 7 a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 6 - イルから選択され、該 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシシ - 6 - イル、2 H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、2, 3, 3 a, 7 a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、および 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 6 - イルの各々は、ハロおよび低級アルキルから独立して選択される 1 個、2 個または 3 個の基で任意選択的に置換されている、( 2 4 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 2 6 ) R<sub>1</sub> が、7 - クロロ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾ [ d ] イミダゾール - 5 - イル、8 - クロロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イル、2, 3 - ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾジオキシシ - 6 - イル、2 H - 1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、7 - クロロ - 2, 3, 3 a, 7 a - テトラヒドロ - 1 - ベンゾフラン - 5 - イル、8 - クロロ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 - ベンゾピラン - 6 - イル、7 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、7 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロベンゾ [ d ] オキサゾール - 5 - イル、4 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イルおよび 4 - クロロ - 3 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イルから選択される、( 2 5 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 2 7 ) R<sub>7</sub> が、水素、アミノメチル、メトキシメチル、メチル、1 - アミノエチル、1 - メトキシ - エチル、メトキシ、およびハロから選択される、( 1 ) ~ ( 2 6 ) のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 2 8 ) R<sub>7</sub> がメチルである、( 2 7 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 2 9 ) R<sub>7</sub> が水素である、( 2 7 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 0 ) L が、- C ( O ) O - 、- C ( O ) N ( R<sub>17</sub> ) - および共有結合から選択される、( 1 ) ~ ( 2 9 ) のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 1 ) L が - C ( O ) O - である、( 3 0 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 2 ) R<sub>5</sub> が、水素、任意選択的に置換されているアルキル、および任意選択的に置換されているフェニルから選択される、( 3 1 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 3 ) R<sub>5</sub> が、水素、および、ヒドロキシル、アミノ、( アルキル ) アミノまたは ( ジアルキル ) アミノで任意選択的に置換されている低級アルキルから選択される、( 3 2 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 4 ) L が - C ( O ) N ( R<sub>17</sub> ) - である、( 3 0 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 5 ) R<sub>17</sub> が水素である、( 3 4 ) に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

( 3 6 ) R<sub>5</sub> が、水素、ヒドロキシル、ヒドロキシルで任意選択的に置換されている、ア

ルキル、およびフェニルから選択される、(34)または(35)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(37) R<sub>5</sub>が、水素およびヒドロキシルから選択される、(36)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(38) R<sub>5</sub>が水素である、(37)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(39) R<sub>5</sub>とR<sub>17</sub>が、これらが結合している窒素と一体となって、任意選択的に置換されている4～7員のヘテロシクロアルキル環を形成している、(34)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(40) Lが共有結合である、(30)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(41) R<sub>5</sub>が、シアノおよび任意選択的に置換されているヘテロアリアルから選択される、(40)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(42) R<sub>5</sub>が、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルおよび4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-5-オン-3-イルから選択される、(41)に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(43) 表1～5のいずれか1つに挙げられた化合物から選択される化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ。

(44) (1)～(43)のいずれかに記載の少なくとも1種類の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグ、および少なくとも1種類の薬学的に許容され得る賦形剤を含む医薬組成物。

(45) キヌレニン3-モノオキシゲナーゼ活性によって媒介される状態または障害の処置を、かかる処置を必要とする被験体において行う方法であって、該被験体に(1)～(43)のいずれかに記載の治療有効量の少なくとも1種類の化合物またはその薬学的に許容され得る塩もしくはプロドラッグを投与することを含む方法。

(46) 前記状態または障害が神経変性病態を伴うものである、(45)に記載の方法。