

【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19年4月5日(2007.4.5)

【公表番号】特表2006-520383(P2006-520383A)

【公表日】平成18年9月7日(2006.9.7)

【年通号数】公開・登録公報2006-035

【出願番号】特願2006-507033(P2006-507033)

【国際特許分類】

C 07 D 235/02	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 403/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 471/10	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/4184	(2006.01)
A 61 K 31/438	(2006.01)
A 61 K 31/423	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/06	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 235/02	C S P Z
C 07 D 403/12	
C 07 D 413/12	
C 07 D 401/14	
C 07 D 417/12	
C 07 D 403/14	
C 07 D 417/14	
C 07 D 409/14	
C 07 D 405/14	
C 07 D 471/10	1 0 1
C 07 D 471/04	1 0 5 C
A 61 K 31/4184	
A 61 K 31/438	
A 61 K 31/423	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/427	
A 61 K 31/4439	
A 61 K 31/506	

A 6 1 K 31/437  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年2月13日(2007.2.13)

## 【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

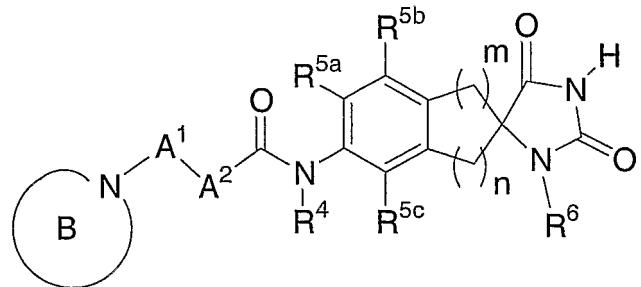
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式Iの化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステロマー。

## 【化1】

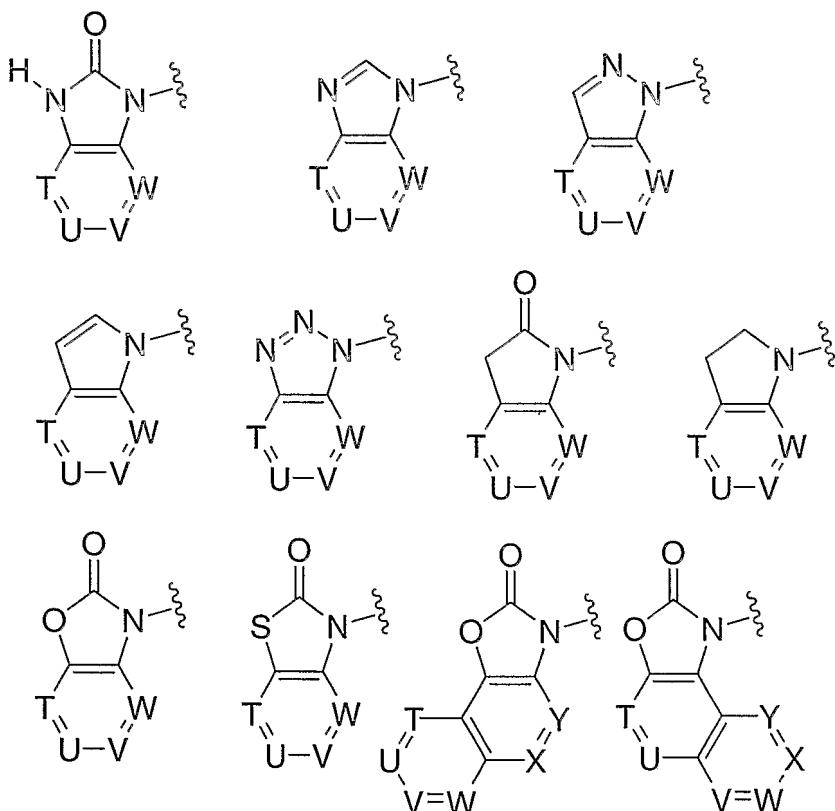


I

(式中、

Bは、

【化2】



からなる群から選択されるビシクロ複素環であって(式中、T、U、V、W、X及びYは、各々独立に炭素原子又は窒素原子であって、T、U、V及びWのうち2個以下、並びにT、U、V、W、X及びYのうち3個以下が窒素原子である。)、

Bは、非置換であるか、又はR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup><sup>a</sup>及びR<sup>3</sup><sup>b</sup>から独立に選択される1から5個の置換基で置換されており、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup><sup>a</sup>及びR<sup>3</sup><sup>b</sup>は、

(1) 非置換であるか、又は1から7個の置換基で置換された-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル(前記置換基は、

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) -O-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、
- (d) -C<sub>3</sub>-<sub>6</sub>シクロアルキル、

(e) 非置換であるか、又は1から5個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環((ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、チエニル又はモルホリニルから選択される。)前記置換基は、

- (i) -C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、
- (ii) -O-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、
- (iii) ハロ、
- (iv) ヒドロキシ、
- (v) トリフルオロメチル、及び
- (vi) -OCF<sub>3</sub>

から独立に選択される。)、

(f) -CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は、

- (i) 水素、

(ii) 非置換であるか、又は1から6個のフルオロで置換された-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、

- ( i i i ) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、  
 ( i v ) ベンジル、及び  
 ( v ) フェニル

から独立に選択される。)、

- ( g ) - N R<sup>1 0</sup> R<sup>1 1</sup> (ここで、R<sup>1 0</sup> 及び R<sup>1 1</sup> は、  
 ( i ) 水素、

( i i ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

- ( i i i ) - C<sub>5</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、  
 ( i v ) ベンジル、  
 ( v ) フェニル、  
 ( v i ) - C O R<sup>9</sup> 、及び  
 ( v i i ) - S O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup>

から独立に選択される。)、

- ( h ) - S O<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup> (ここで、R<sup>1 2</sup> は、  
 ( i ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

- ( i i ) - C<sub>5</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、  
 ( i i i ) ベンジル、及び  
 ( i v ) フェニル

から独立に選択される。)、

- ( i ) - C O N R<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> (ここで、R<sup>1 0 a</sup> 及び R<sup>1 1 a</sup> は、  
 ( i ) 水素、

( i i ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

- ( i i i ) - C<sub>5</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、  
 ( i v ) ベンジル、  
 ( v ) フェニル

から独立に選択され、

或いは、R<sup>1 0 a</sup> と R<sup>1 1 a</sup> は結合して、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル又はモルホリニルから選択される環を形成することができ、前記環は、非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されており、前記置換基は、

- ( I ) - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、  
 ( I I ) - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、  
 ( I I I ) ハロ、  
 ( I V ) ヒドロキシ、  
 ( V ) フェニル、及び  
 ( V I ) ベンジル

から独立に選択される。)、

- ( j ) トリフルオロメチル、  
 ( k ) - O C O<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、  
 ( l ) - ( N R<sup>1 0 a</sup> ) C O<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、  
 ( m ) - O ( C O ) N R<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、  
 ( n ) - ( N R<sup>9</sup> ) ( C O ) N R<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、及び  
 ( o ) - O - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル

から独立に選択される。)、

( 2 ) 非置換であるか、又は 1 から 7 個の置換基で置換された - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル (前記置換基は、

- ( a ) ハロ、  
 ( b ) ヒドロキシ、

( c ) - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( d ) トリフルオロメチル、

( e ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されたフェニル（ここで、前記置換基は、

( i ) - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( i i ) - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( i i i ) ハロ、

( i v ) ヒドロキシ、及び

( v ) トリフルオロメチル

から独立に選択される。）

から独立に選択される。）、

( 3 ) フェニル又は複素環（（ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、ピリダジニル、ピロリジニル、アゼチジニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、アゼピニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾピラニル、ベンゾフリル、ベンゾチアゾリル、ベンズオキサゾリル、クロマニル、フリル、イミダゾリニル、インドリニル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロキノリニル、イソインドリニル、テトラヒドロイソキノリニル、2 - オキソピペラジニル、2 - オキソピペリジニル、2 - オキソピロリジニル、ピラゾリジニル、ピラゾリル、ピロリル、キナゾリニル、テトラヒドロフリル、チアゾリニル、ブリニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、1，3 - ジオキソラニル、オキサジアゾリル、ピペリジニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル及びモルホリニルから選択される。）非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されており、前記置換基は、

( a ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( b ) ハロ、

( c ) ヒドロキシ

( d ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( e ) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、

( f ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環（（ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル又はモルホリニルから選択される。）前記置換基は、

( i ) - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( i i ) - O - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( i i i ) ハロ、

( i v ) ヒドロキシ、及び

( v ) トリフルオロメチル

から独立に選択される。）、

( g ) - CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、

( h ) - ( CO ) R<sup>9</sup>、

( i ) - NR<sup>1</sup><sub>0</sub> R<sup>1</sup><sub>1</sub>、

( j ) - CONR<sup>1</sup><sub>0</sub> R<sup>1</sup><sub>1</sub>、

( k ) オキソ

( l ) - SR<sup>1</sup><sub>2</sub>、

( m ) - S ( O ) R<sup>1</sup><sub>2</sub>、及び

( n ) - SO<sub>2</sub> R<sup>1</sup><sub>2</sub>

から独立に選択される。）、

( 4 ) ハロ、

( 5 ) オキソ、

( 6 ) ヒドロキシ、

( 7 ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個のハロで置換された - O - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル

( 8 ) - C N 、

( 9 ) - CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、

( 10 ) - NR<sup>1 0</sup> R<sup>1 1</sup> 、

( 11 ) - SO<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup> 、

( 12 ) - CONR<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、

( 13 ) - OCO<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、

( 14 ) - (NR<sup>1 0 a</sup>) CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、

( 15 ) - O (CO) NR<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、

( 16 ) - (NR<sup>9</sup>) (CO) NR<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、

( 17 ) - (CO) - (CO) NR<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、及び

( 18 ) - (CO) - (CO) OR<sup>9</sup>

から独立に選択され、

或いは、R<sup>3 a</sup> 及び R<sup>3 b</sup> 及びそれらが結合している炭素原子は、結合して、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、フラニル、ジヒドロフラニル、ジヒドロピラニル、チエニル、ジヒドロチエニル、テトラヒドロチエニル、ジヒドロチオピラニル、テトラヒドロチオピラニル又はピペラジニルから選択される環を形成することができ、前記環は、非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されており、前記置換基は、

( a ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個の置換基で置換された - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル  
(前記置換基は、

( i ) ハロ、

( i i ) ヒドロキシ、

( i i i ) - O - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( i v ) - C<sub>3</sub> - <sub>6</sub> シクロアルキル、

( v ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環（（ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、チエニル又はモルホリニルから選択される。）前記置換基は、

( I ) - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( I I ) - O - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( I I I ) ハロ、

( I V ) ヒドロキシ、

( V ) トリフルオロメチル、及び

( V I ) - OCF<sub>3</sub>

から独立に選択される。）、

( v i ) - CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup> 、

( v i i ) - NR<sup>1 0</sup> R<sup>1 1</sup> 、

( v i i i ) - SO<sub>2</sub> R<sup>1 2</sup> 、

( i x ) - CONR<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> 、及び

( x ) - (NR<sup>1 0 a</sup>) CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>

から独立に選択され）、

( b ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環（（ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、ピリダジニル、ピロリジニル、アゼチジニル、ピペリジニル及びモルホリニルから選択される。）前記置換基は、

( i ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アル

キル、

( i i ) ハロ、

( i i i ) ヒドロキシ、

( i v ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換された - O - C<sub>1</sub> -

<sub>6</sub> アルキル、及び

( v ) - C<sub>3</sub> - <sub>6</sub> シクロアルキル

から独立に選択される。)、

( c ) ハロ、

( d ) - SO<sub>2</sub> R<sup>1</sup> <sup>2</sup>、

( e ) ヒドロキシ、

( f ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個のハロで置換された - O - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( g ) - CN、

( h ) - COR<sup>1</sup> <sup>2</sup>、

( i ) - NR<sup>1</sup> <sup>0</sup> R<sup>1</sup> <sup>1</sup>、

( j ) - CONR<sup>1</sup> <sup>0</sup> a R<sup>1</sup> <sup>1</sup> a、

( k ) - CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、

( l ) - (NR<sup>1</sup> <sup>0</sup> a) CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup>、

( m ) - O (CO) NR<sup>1</sup> <sup>0</sup> a R<sup>1</sup> <sup>1</sup> a、

( n ) - (NR<sup>9</sup>) (CO) NR<sup>1</sup> <sup>0</sup> a R<sup>1</sup> <sup>1</sup> a、及び

( o ) オキソ

から独立に選択され、

A<sup>1</sup> 及び A<sup>2</sup> は、

( 1 ) 結合、

( 2 ) - CR<sup>1</sup> <sup>3</sup> R<sup>1</sup> <sup>4</sup> - (ここで、R<sup>1</sup> <sup>3</sup> 及び R<sup>1</sup> <sup>4</sup> は、

( a ) 水素、

( b ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換された C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、及び

( c ) ヒドロキシ

から独立に選択される。)

から独立に選択され、

或いは、A<sup>1</sup> 及び A<sup>2</sup> の一方は存在せず、

R<sup>4</sup> は、

( 1 ) 水素、

( 2 ) 非置換であるか、又は 1 から 6 個のフルオロ口で置換された C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( 3 ) C<sub>5</sub> - <sub>6</sub> シクロアルキル、

( 4 ) ベンジル、及び

( 5 ) フェニル

から選択され、

R<sup>5</sup> a、R<sup>5</sup> b 及び R<sup>5</sup> c は、

( 1 ) 水素、

( 2 ) C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( 3 ) - O - C<sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、

( 4 ) - OCF<sub>3</sub>、

( 5 ) トリフルオロメチル、

( 6 ) ハロ、

( 7 ) ヒドロキシ、及び

( 8 ) - CN

から独立に選択され、

R<sup>6</sup> は、

(1) 水素、

(2) 非置換であるか、又は1から7個の置換基で置換された- $C_1\sim_6$ アルキル若しくは- $C_3\sim_6$ シクロアルキル(前記置換基は、

(a) ハロ、

(b) ヒドロキシ、

(c) -O- $C_1\sim_6$ アルキル、

(d) - $C_3\sim_6$ シクロアルキル、

(e) 非置換であるか、又は1から5個の置換基で置換されたフェニル(ここで、前記置換基は、

(i) - $C_1\sim_6$ アルキル、

(ii) -O- $C_1\sim_6$ アルキル、

(iii) ハロ、

(iv) ヒドロキシ、及び

(v) トリフルオロメチル

から独立に選択される。)、

(f) -CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、

(g) -NR<sup>1</sup><sub>0</sub>R<sup>1</sup><sub>1</sub>、

(h) -CONR<sup>1</sup><sub>0</sub>R<sup>1</sup><sub>1</sub>、

(i) -SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>、及び

(j) トリフルオロメチル

から独立に選択される。)、

(3) 非置換であるか、又は1から5個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環((ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル又はモルホリニルから選択される。)前記置換基は、

(a) - $C_1\sim_6$ アルキル、

(b) -O- $C_1\sim_6$ アルキル、

(c) ハロ、

(d) ヒドロキシ、及び

(e) トリフルオロメチル

から独立に選択される。)

から選択され、

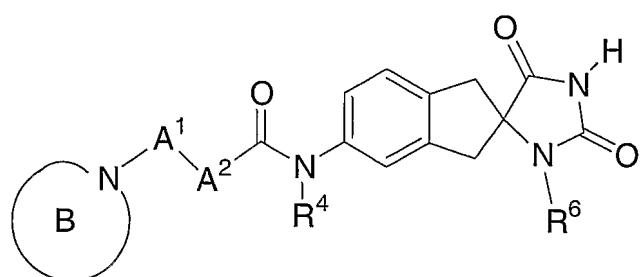
mは1又は2であり、

nは1又は2である。)

### 【請求項2】

次式の請求項1に記載の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

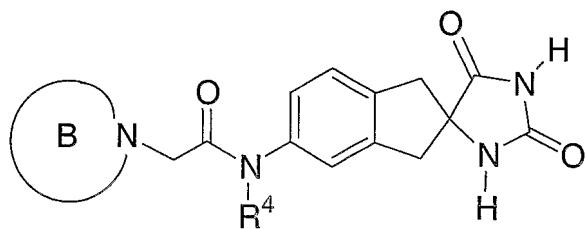
### 【化3】



### 【請求項3】

次式の請求項1に記載の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

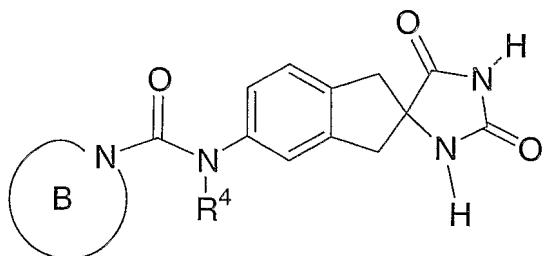
【化4】



【請求項4】

次式の請求項1に記載の化合物、その製薬上許容されるその塩、並びに個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

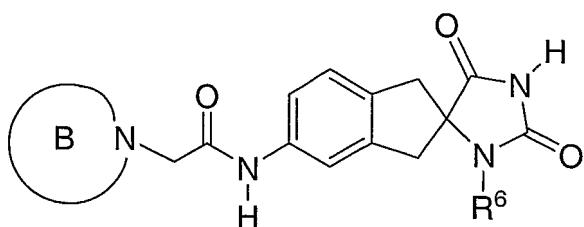
【化5】



【請求項5】

次式の請求項1に記載の化合物、その製薬上許容されるその塩、並びに個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

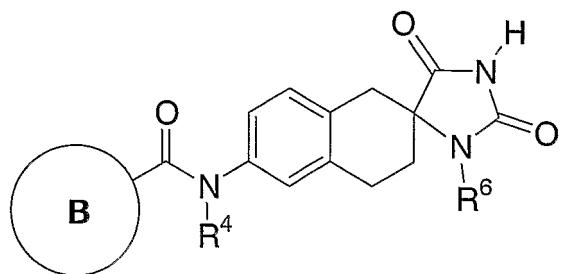
【化6】



【請求項6】

次式の請求項1に記載の化合物、その製薬上許容されるその塩、並びに個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

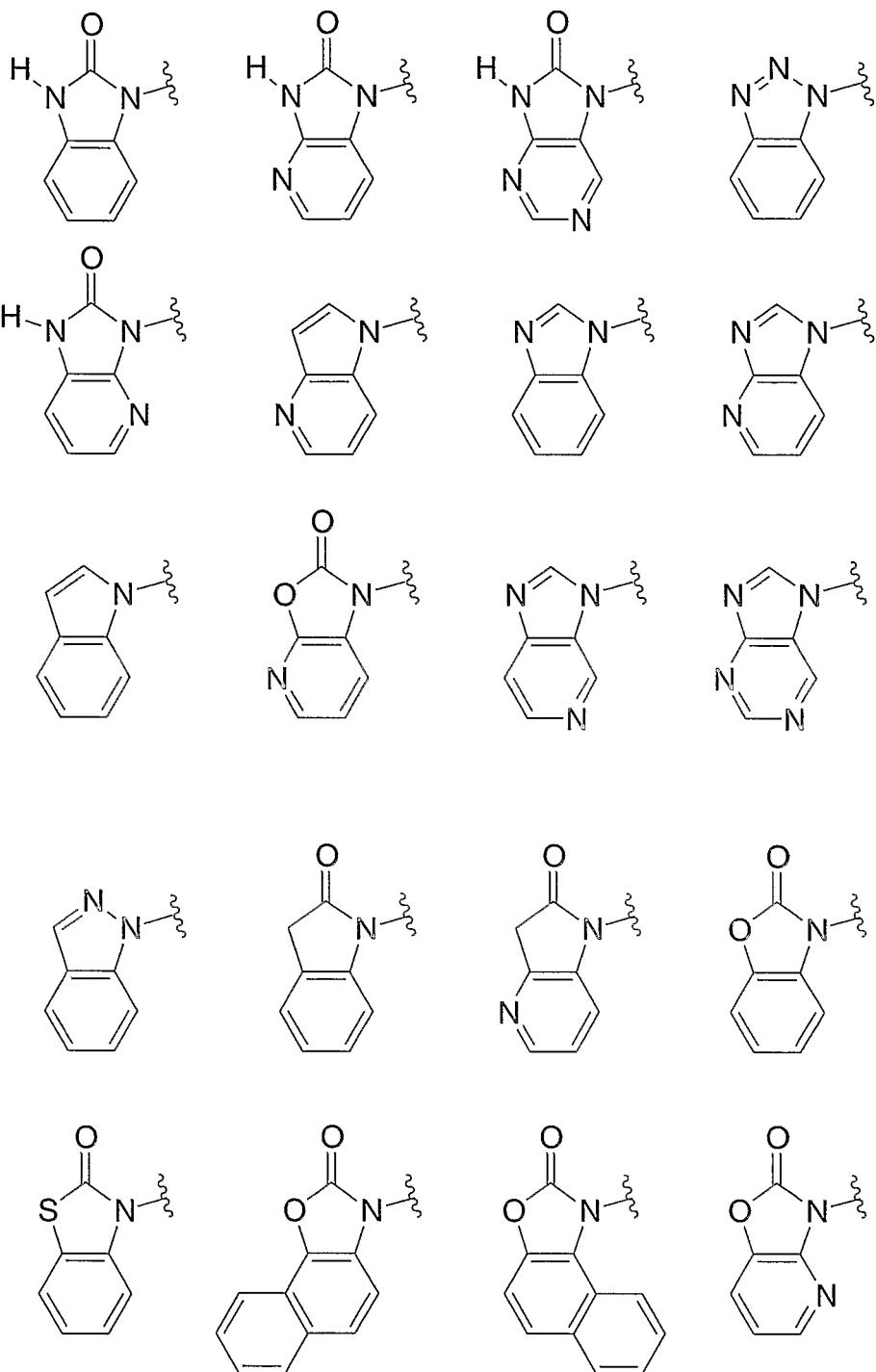
【化7】



【請求項7】

Bが、

## 【化 8】



(非置換であるか、又は R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup><sup>a</sup> 及び R<sup>3</sup><sup>b</sup> から選択される 1 から 5 個の置換基で置換されている。)

から選択される、請求項 1 に記載の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

## 【請求項 8】

B が、ベンズイミダゾリル、2 - オキソベンゾキサゾリニル、2 - オキソベンズイミダゾリニル、インドリル、2 - オキソインドリニル、2 - オキソベンゾチアゾリニル、1 , 3 - ジヒドロ - 2 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - オン、ナフト [ 2 , 1 - d ] [ 1 , 3 ] オキサゾリン - 2 ( 3 H ) - オン及びナフト [ 1 , 2 - d ] [ 1 , 3 ] オキサゾリン - 2 ( 1 H ) - オンから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ <sup>a</sup> 及び  $R^3$ <sup>b</sup> が、

(1) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換された -  $C_{1-6}$  アルキル(前記置換基は、

(a) フルオロ、

(b) フェニル又は複素環(複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、チエニル又はモルホリニルから選択される。)、

(c) -  $CO_2R^9$  (ここで、 $R^9$  は、

(i) 水素、及び

(ii) -  $C_{1-6}$  アルキル

から独立に選択される。)、

(d) -  $CONR^{10a}R^{11a}$  (ここで、 $R^{10a}$  及び  $R^{11a}$  は、

(i) 水素、及び

(ii) -  $C_{1-6}$  アルキル

から独立に選択され、

又は  $R^{10a}$  と  $R^{11a}$  は結合して、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル及びモルホリニルから選択される環を形成することができる。)、及び

(e) -  $O-C_{3-6}$  シクロアルキル

から独立に選択される。)、

(2) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環((ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、ピリダジニル、ピロリジニル、チアゾリル、イソチアゾリル、2-オキソピロリジニル、テトラヒドロフリル、ピペリジニル、テトラヒドロチエニル又はテトラヒドロチオピラニルから選択される。)前記置換基は、

(a) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された -  $C_{1-6}$  アルキル、

(b) ハロ、

(c) -  $CO_2R^9$  (ここで、 $R^9$  は、

(i) 水素、

(ii) -  $C_{1-4}$  アルキル、及び

(iii) -  $C_{3-6}$  シクロアルキル

から選択される。)、

(d) - ( $CO$ ) $R^9$ 、

(e) -  $CONR^{10a}R^{11a}$  (ここで、 $R^{10a}$  及び  $R^{11a}$  は、

(i) 水素、及び

(ii) -  $C_{1-6}$  アルキル

から独立に選択され、

又は  $R^{10a}$  と  $R^{11a}$  は結合して、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル及びモルホリニルから選択される環を形成することができる。)、

(f) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された -  $O-C_{1-6}$  アルキル、

(g) ヒドロキシ、

(h) オキソ、

(i) -  $S-C_{1-4}$  アルキル、

(j) -  $S(O)-C_{1-4}$  アルキル、及び

(k) -  $SO_2-C_{1-4}$  アルキル

から独立に選択される。)、

(3) ハロ、

(4) ヒドロキシ、

(5) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された -  $O-C_{1-6}$  アル

キル、

( 6 ) - N H<sub>2</sub> 、

( 7 ) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、

( 8 ) - ( C O ) - ( C O ) N R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> ( ここで、 R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> 及び R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> は

、  
( a ) 水素、及び

( b ) - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル

から独立に選択される。 ) 、及び

( 9 ) - C N

から独立に選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> が、

( 1 ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換された - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル ( 前記置換基は、

( a ) フルオロ、

( b ) フェニル、

( c ) - C O<sub>2</sub> R<sup>9</sup> ( ここで、 R<sup>9</sup> は、

( i ) 水素、及び

( i i ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択される。 ) 、

( d ) - C O N R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> ( ここで、 R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> 及び R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> は、

( i ) 水素、及び

( i i ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択され、

又は R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> と R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> は結合して、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル及びモルホリニルから選択される環を形成することができる。 ) 、及び

( e ) - O - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル

から独立に選択される。 ) 、

( 2 ) 非置換であるか、又は 1 から 5 個の置換基で置換されたフェニル若しくは複素環 ( ( ここで、複素環は、ビリジル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、ピリダジニル、ピロリジニル、チアゾリル、テトラヒドロフリル、ピペリジニル又はテトラヒドロチエニルから選択される。 ) 前記置換基は、

( a ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、

( b ) ハロ、

( c ) - C O<sub>2</sub> R<sup>9</sup> ( ここで、 R<sup>9</sup> は、

( i ) 水素、

( i i ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、及び

( i i i ) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル

から選択される。 ) 、

( d ) - ( C O ) R<sup>9</sup> 、

( e ) - C O N R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> ( ここで、 R<sup>1</sup><sub>0</sub><sup>a</sup> 及び R<sup>1</sup><sub>1</sub><sup>a</sup> は、

( i ) 水素、及び

( i i ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択される。 ) 、

( f ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、

( g ) ヒドロキシ、

( h ) オキソ、

( i ) - S - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、

( j ) - S ( O ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、及び

( k ) - SO<sub>2</sub> - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択される。)、

( 3 ) ハロ、

( 4 ) ヒドロキシ、

( 5 ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個のフルオロで置換された - O - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル、

( 6 ) - NH<sub>2</sub>、

( 7 ) - C<sub>3</sub> -<sub>6</sub> シクロアルキル、

( 8 ) - ( CO ) - ( CO ) N R<sup>1 0 a</sup> R<sup>1 1 a</sup> ( ここで、 R<sup>1 0 a</sup> 及び R<sup>1 1 a</sup> は

( a ) 水素、及び

( b ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択される。)、及び

( 9 ) - CN

から独立に選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 1】

R<sup>3 a</sup> 及び R<sup>3 b</sup> 及びそれらが結合している炭素原子が結合して、ペリジニル、シクロヘキセニル、シクロヘキシル及びピロリジニルから選択される環を形成し、前記環が、非置換であるか、或いは

( a ) 非置換であるか、又は

( i ) ハロ、及び

( ii ) フェニル

から独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル、

( b ) フェニル又は複素環 ( ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル及びピラジニルから選択される。)、

( c ) - CO<sub>2</sub> R<sup>9</sup> ( ここで、 R<sup>9</sup> は、

( i ) 水素、及び

( ii ) - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から選択される。)

から独立に選択される 1 から 3 個の置換基で置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 2】

R<sup>3 a</sup> 及び R<sup>3 b</sup> 及びそれらが結合している炭素原子が結合してペリジン環を形成し、前記環が、非置換であるか、又は 1 から 3 個の置換基で置換されており、前記置換基が、

( a ) 非置換であるか、又は 1 から 3 個の置換基で置換された - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル ( 前記置換基は、

( i ) フルオロ、及び

( ii ) フェニル

から独立に選択される。)

( b ) - CO<sub>2</sub> - C<sub>1</sub> -<sub>4</sub> アルキル

から独立に選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 3】

R<sup>4</sup> が水素及び - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルから選択され、前記 - C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキルが非置換であるか、又はフルオロで置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 4】

R<sup>5 a</sup>、R<sup>5 b</sup> 及び R<sup>5 c</sup> が水素、C<sub>1</sub> -<sub>6</sub> アルキル及びハロから独立に選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 1 5】

R<sup>6</sup> が、

(1) 水素、

(2) 非置換であるか、又は1から5個の置換基で置換された-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル(前記置換基は、

- (a) ハロ、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、及び
- (d) フェニル

から独立に選択される。)、及び

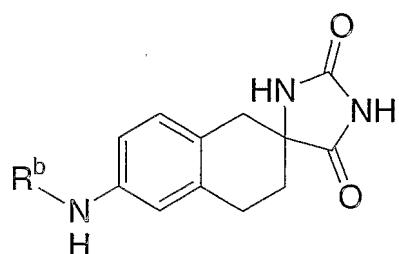
(3) フェニル又は複素環(ここで、複素環は、ピリジル、ピリミジニル又はピラジニルから選択される。)

から選択される、請求項1に記載の化合物。

**【請求項16】**

次式の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステロマー:

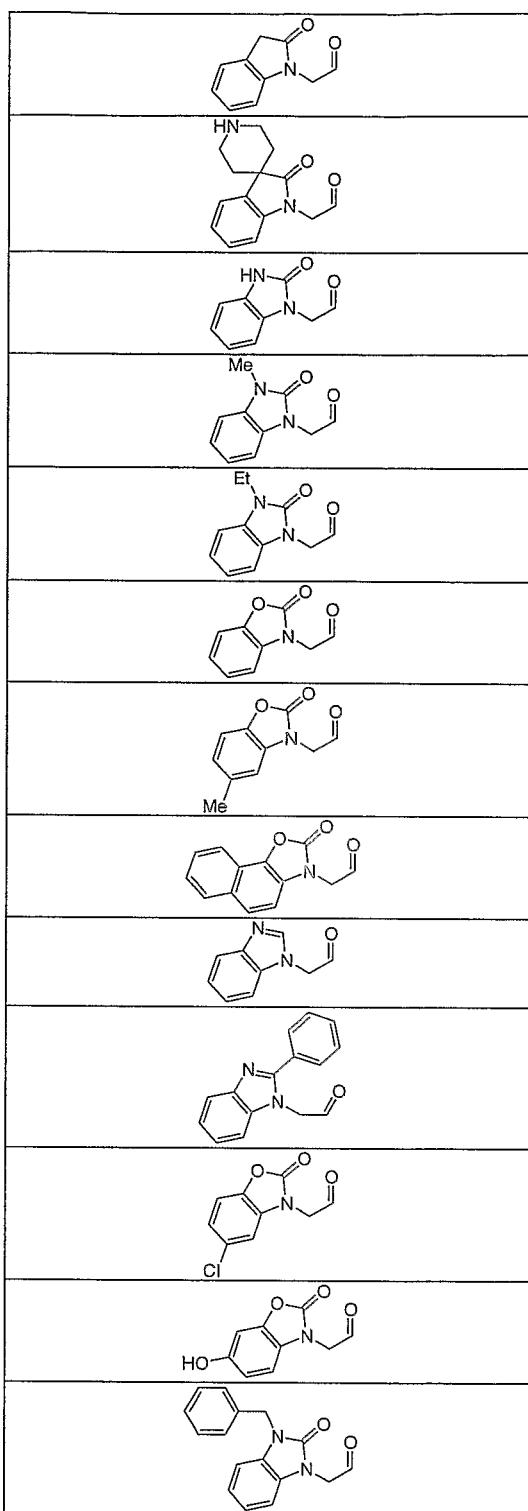
**【化9】**

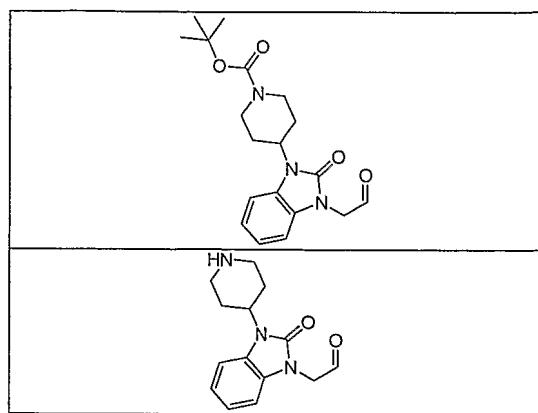


(ここで、R<sup>b</sup>は以下から選択される。)。

**【表1】**

R <sup>b</sup>

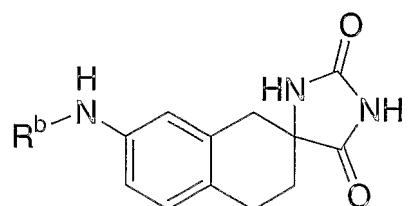




## 【請求項 17】

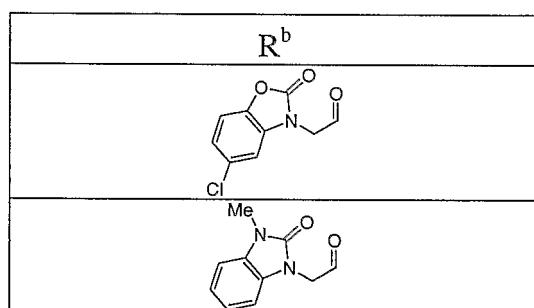
次式の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステロマー：

## 【化 10】



(ここで、R<sup>b</sup>は以下から選択される。)。

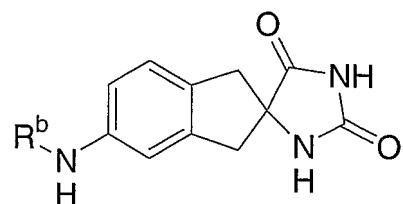
## 【表 2】



## 【請求項 18】

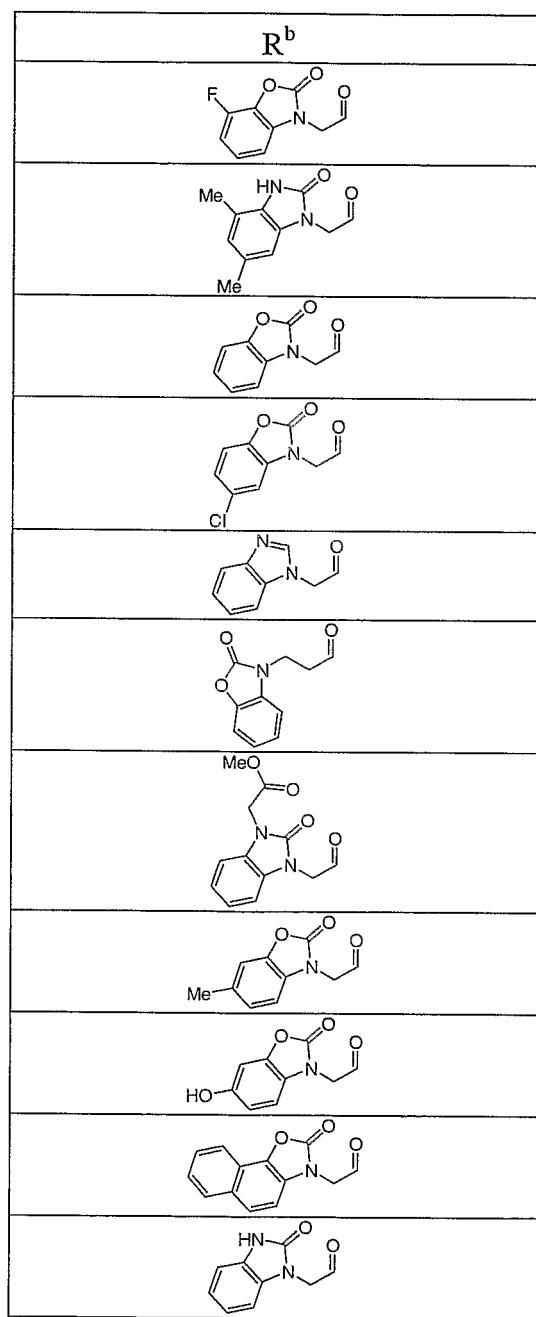
次式の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステロマー：

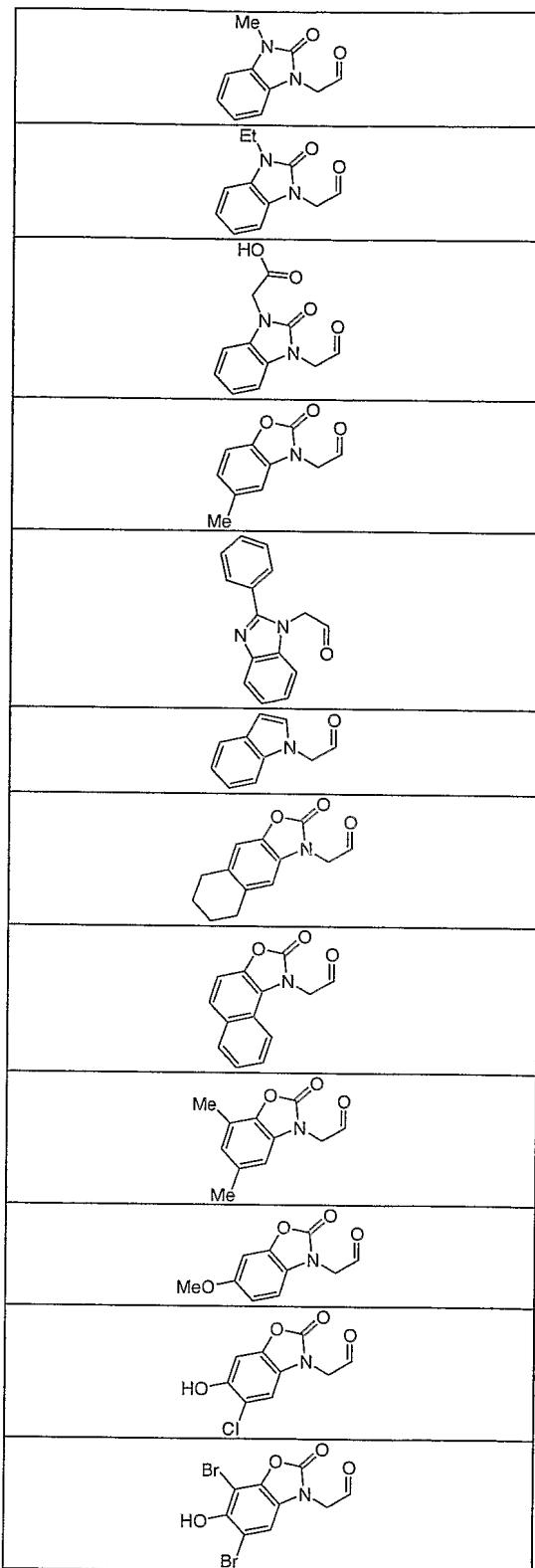
## 【化 11】

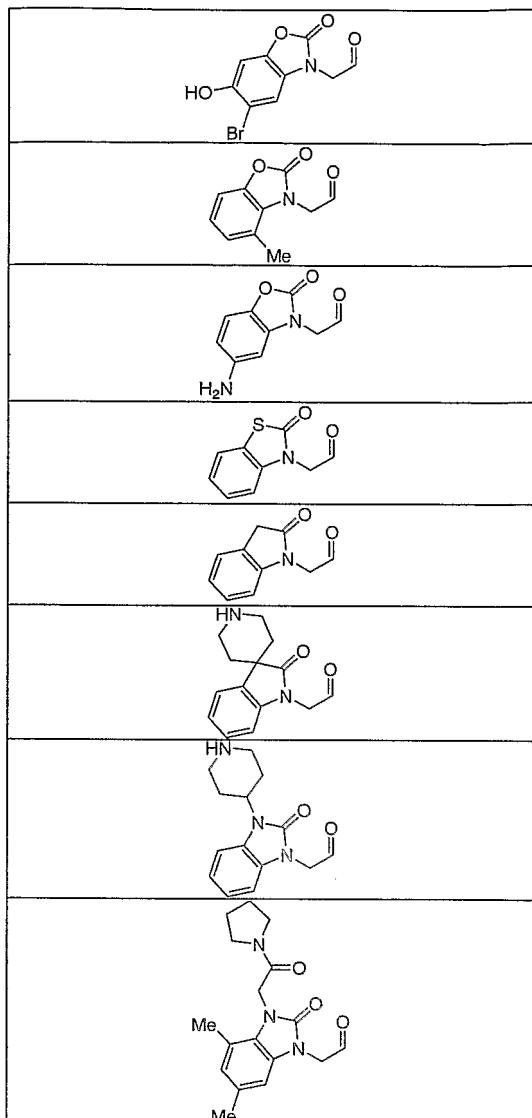


(ここで、R<sup>b</sup>は以下から選択される。)。

【表3】



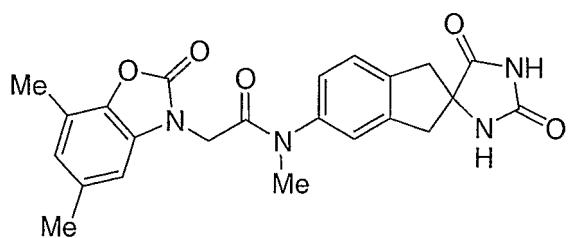




## 【請求項 19】

次式の化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

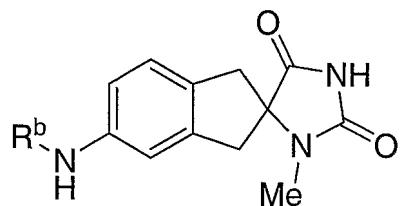
## 【化 12】



## 【請求項 20】

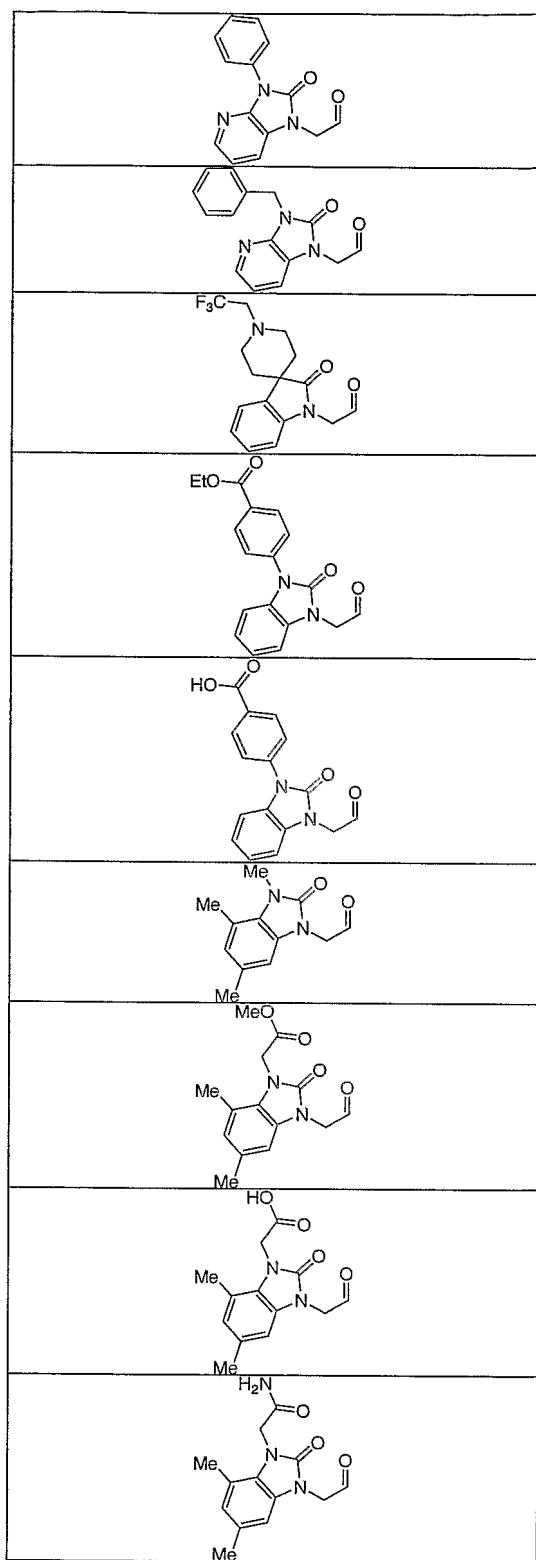
次式の化合物、薬剤として許容されるその塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー：

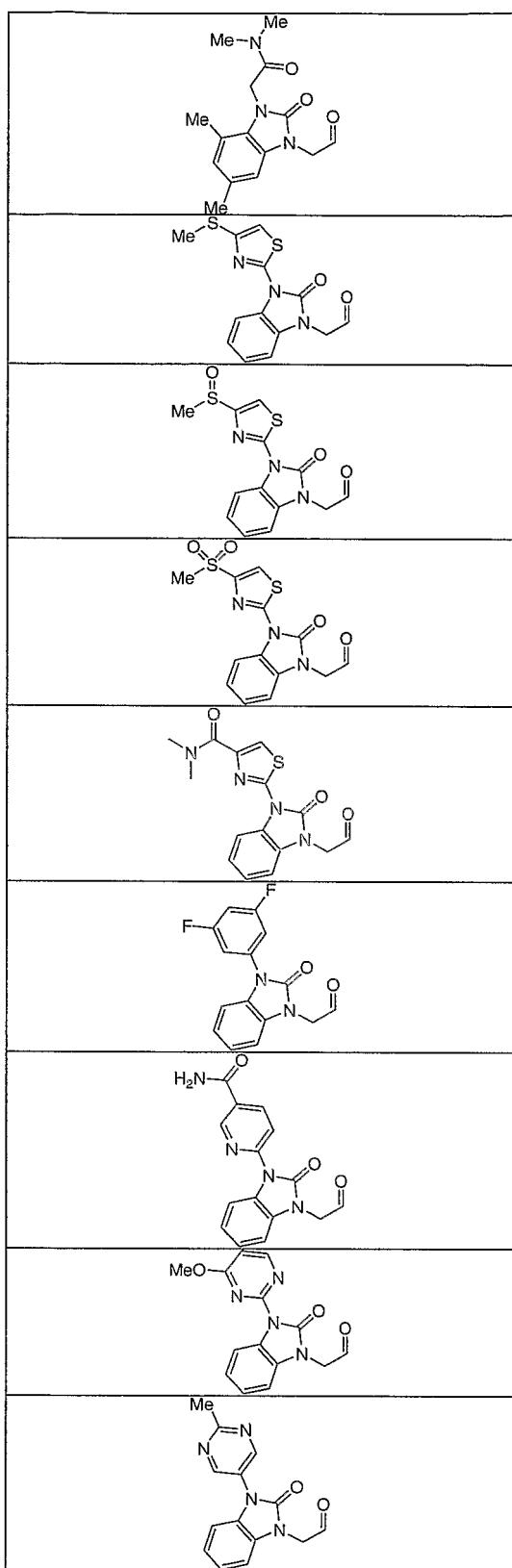
【化13】

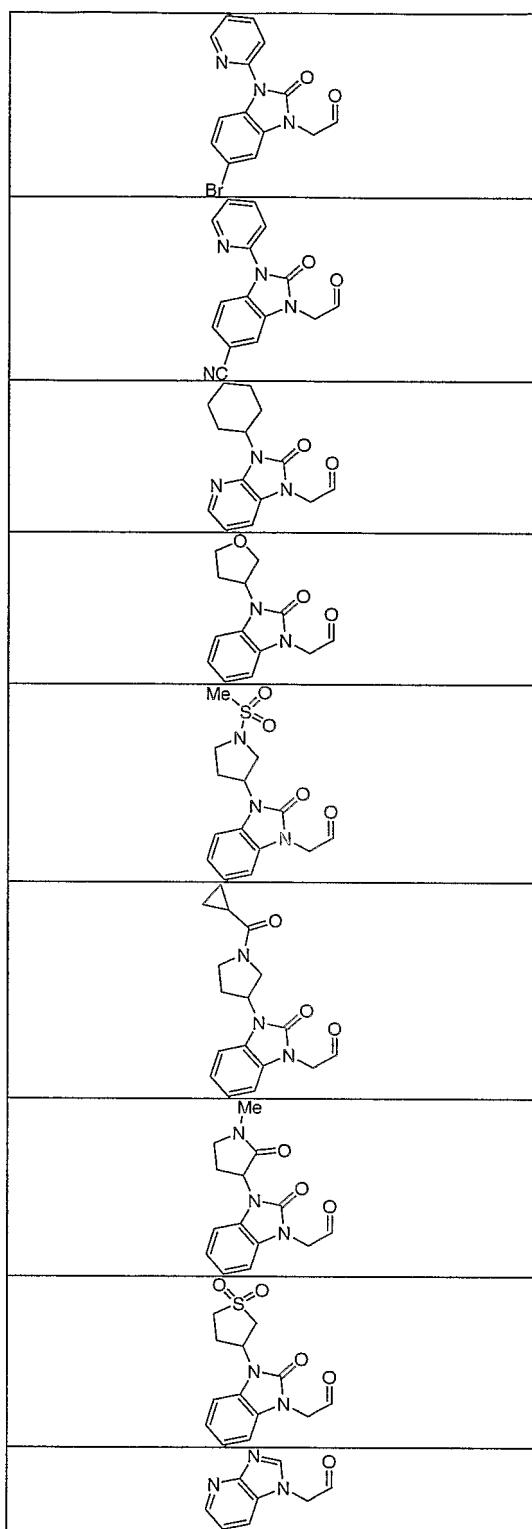
(ここで、R<sup>b</sup>は以下から選択される。)。

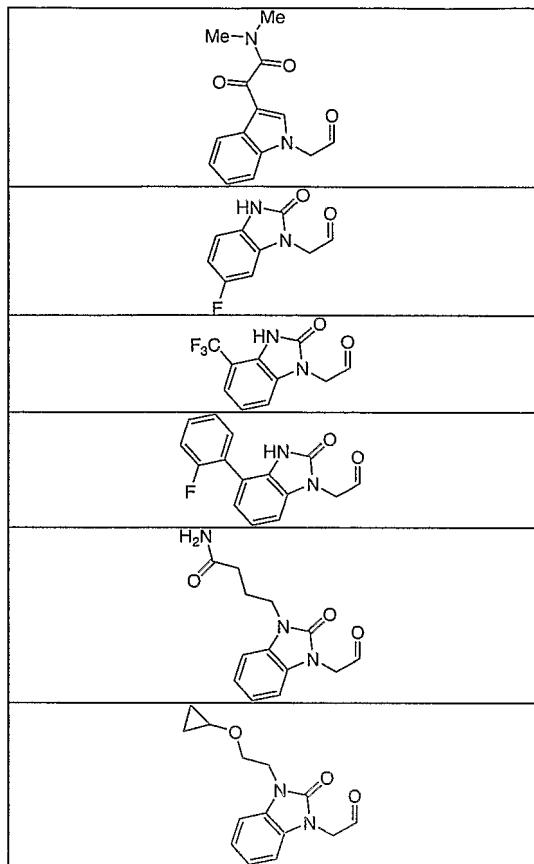
【表4】

R <sup>b</sup>



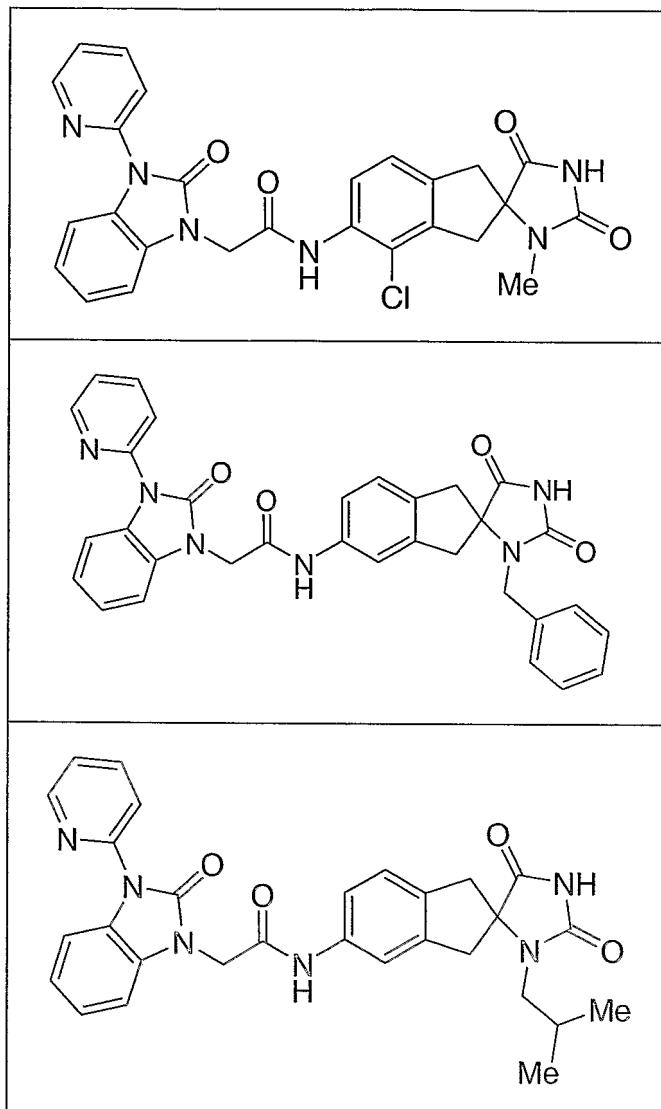






【請求項 2 1】

【表5】



から選択される化合物、その製薬上許容される塩、並びにその個々の鏡像異性体及びジアステレオマー。

【請求項22】

不活性担体及び請求項1に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項23】

頭痛、片頭痛又は群発性頭痛の治療に有用な医薬品を調製するための、請求項1に記載の化合物の使用。