

【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22年12月2日(2010.12.2)

【公表番号】特表2008-523041(P2008-523041A)

【公表日】平成20年7月3日(2008.7.3)

【年通号数】公開・登録公報2008-026

【出願番号】特願2007-544984(P2007-544984)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/40 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 233/64 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

C 0 7 D 307/52 (2006.01)

C 0 7 D 277/28 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 271/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 263/32 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/417 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/405 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4535 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4184 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/423 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/517 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/502 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4192 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/453 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/421 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4418 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/498 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/428 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/429 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4375 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4985 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/38 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 21/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 7/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 5/14 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/08 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 213/40 C S P  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 233/64 1 0 5  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 409/12

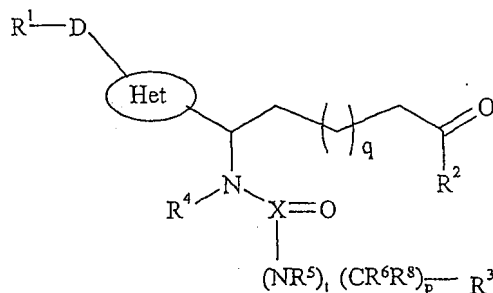
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	413/12	
C 0 7 D	513/04	3 5 5
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	513/04	3 2 1
C 0 7 D	453/02	
C 0 7 D	307/52	
C 0 7 D	277/28	
C 0 7 D	249/08	5 3 5
C 0 7 D	487/04	1 4 6
C 0 7 D	271/10	
C 0 7 D	403/14	
C 0 7 D	263/32	
C 0 7 D	513/04	3 3 1
C 0 7 D	471/04	1 1 4 A
C 0 7 D	471/04	1 1 3
C 0 7 D	471/14	1 0 1
C 0 7 D	487/04	1 4 4
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 7 E
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/417	
A 6 1 K	31/4178	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/433	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/4196	
A 6 1 K	31/405	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/4535	
A 6 1 K	31/439	
A 6 1 K	31/341	
A 6 1 K	31/426	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/502	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/4192	

A 6 1 K	31/453	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/421	
A 6 1 K	31/4418	
A 6 1 K	31/498	
A 6 1 K	31/428	
A 6 1 K	31/429	
A 6 1 K	31/4375	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4985	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	5/38	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	37/08	

**【手続補正書】****【提出日】**平成22年10月8日(2010.10.8)**【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】



(I)

[ 式中：

p は、0、1、2、3、4 または 5 であり；

q は、1、2、3 または 4 であり；

t は、0 または 1 であり；

D は、非存在、(CH<sub>2</sub>)<sub>b</sub> または (CH=CH)<sub>c</sub> であり；

b は、1、2 または 3 であり；

c は、1、2 または 3 であり；

X は、C または S=O であり；

Het は、N、O および S から独立して選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含有するが、この 1 個以下が O または S である 5 員不飽和複素環、もしくは N および O から独立して選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含有する 6 員不飽和複素環であって；シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、アミノ、C<sub>1-6</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1-6</sub> アルキル)アミノ、C<sub>1-6</sub> アルキル、ハロ C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>1-6</sub> アルコキシ、ハロ C<sub>1-6</sub> アルコキシ、C<sub>3-10</sub> シクロアルキル、C<sub>2-6</sub> アルケニル、C<sub>2-6</sub> アルキニルおよび C<sub>6-10</sub> アリールから独立して選ばれる 1 個以上の基によって場合により置換され；

R<sup>1</sup> は、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1-6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1-6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1-6</sub> アルキル、ハロ C<sub>1-6</sub> アルキル、N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub> { 式中、R<sup>h</sup> は、水素、C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>6-10</sub> アリールおよび C<sub>6-10</sub> アリール C<sub>1-6</sub> アルキルから独立して選択される }；C<sub>3-10</sub> シクロアルキル、C<sub>6-10</sub> アリール、N、O および S から独立して選択される 1、2 または 3 個のヘテロ原子を含有する 5 または 6 員飽和または部分飽和複素環、O、N および S から独立して選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含有するが、この 1 個以下が O または S である 5 員不飽和複素環、1、2 または 3 個の窒素原子を含有する 6 員不飽和複素環、もしくは O、N および S から独立して選択されるヘテロ原子を含有する 8 から 13 員不飽和または部分飽和複素環であり；前記環のいずれかが、シアノ、ハロゲン、ニトロ、オキソ、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub> アルキル、ハロ C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>1-6</sub> アルコキシ、ハロ C<sub>1-6</sub> アルコキシ、C<sub>1-6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>1-6</sub> アルコキシカルボニル、カルボキシ、C<sub>6-10</sub> アリール、C<sub>6-10</sub> アリールオキシ、C<sub>6-10</sub> アリールカルボニル、N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub> { 式中、R<sup>a</sup> は、水素、C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>6-10</sub> アリール、C<sub>1-6</sub> アルキルカルボニルおよび C<sub>6-10</sub> アリールカルボニルから独立して選択される }；C<sub>1-6</sub> アルキル N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub> および (CO)<sub>d</sub> R<sup>k</sup> { 式中、d は、0 または 1 であり、R<sup>k</sup> は、以下で定義する通りである } から独立して選ばれる 1 個以上の基によって場合により置換され；

R<sup>2</sup> は、水素、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub> アルキル、ハロ C<sub>1-6</sub> アルキル、C<sub>1-6</sub> アルコキシ、C<sub>3-10</sub> シクロアルキル、ヒドロキシ C<sub>1-6</sub> アルキル、N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-(C=O)-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub> { 式中、R<sup>c</sup> は、水素および C<sub>1-6</sub> アルキルから独立して選択される }；C<sub>1-6</sub> アルキル S(O)<sub>w</sub> R<sup>g</sup> { 式中、R<sup>g</sup> は、以下で定義する通りであり、w は、0、1 または 2 である }；N、O および S から独立して選択される 1、2、3 または 4 個のヘテロ原子を含有するが、この 1 個以下が O または S である 5 員不飽和複素環

、もしくはNおよびOから独立して選択される1、2、または3個のヘテロ原子を含有する6員不飽和複素環であり；前記環のいずれかが、シアノ、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、ニトロ、アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニルおよび $C_{6-10}$ アリールから独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換され；

$R^3$ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、ハロ $C_{3-10}$ シクロアルキル、 $C_{2-10}$ アルケニル、 $C_{2-10}$ アルキニル、ニトロ、アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{6-10}$ アリール $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール $C_{1-6}$ アルコキシ；6から13員部分飽和炭化水素環； $C_{1-4}$ アルキル基によって場合により架橋され、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する、4、5または6員飽和または部分飽和複素環；N、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がOまたはSである5員不飽和複素環；1、2または3個の窒素原子を含有する6員不飽和複素環；もしくはN、OまたはSから独立して選択されるヘテロ原子を含有する7から15員飽和、部分飽和または不飽和複素環であり；前記環のいずれかが、 $(CH_2)_m(CO)_n$   $R^d$ から独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換され；

mは、0、1、2または3であり；

nは、0、1または2であり；

$R^4$ および $R^5$ は、水素および $C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され；

$R^6$ および $R^8$ は独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する5または6員飽和または部分飽和複素環もしくは1、2または3個の窒素原子を含有する6員不飽和複素環であり；前記環のそれぞれが、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、オキソ、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-10}$ シクロアルキル、 $C_{2-6}$ アルケニルおよび $C_{2-6}$ アルキニルから独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換され；もしくは

$R^6$ および $R^8$ は共に、オキソ基を表し；

各 $R^b$ は独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキル $S(O)_w$   $R^g$ {式中、 $R^g$ は、以下で定義する通りであり、wは、0、1または2である}； $SO_2R^g$ {式中、 $R^g$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノである}；もしくは $C_{6-10}$ アリール、 $C_{6-10}$ アリール $C_{1-6}$ アルキルもしくはN、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がOまたはSである5員不飽和複素環である環であって、前記環はアミノ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、およびハロ $C_{1-6}$ アルコキシから独立して選択される1個以上の基によって場合により置換され；

各 $R^d$ は、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、ハロ $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、ニトロ、オキソ、 $SO_2N(R^e)_2$ 、 $N(R^e)_2$ {式中、 $R^e$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、カルボキシおよび $C_{1-6}$ アルキルオキシカルボニルから独立して選択される}； $C_{1-6}$ アルキル $N(R^e)_2$ 、 $C_{6-10}$ アリール； $C_{6-10}$ アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-4}$ アルキル基によって場合により架橋され、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する5または6員飽和または部分飽和複素環；N、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がO

またはSである5員不飽和複素環；N、OまたはSから独立して選択される0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5または6員スピロ環、もしくは1、2または3個の窒素原子を含有する6員不飽和複素環であり；前記環のいずれかが、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシおよびハロ $C_{1-6}$ アルコキシから独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換でき；

$R^k$ は、 $NHSO_2R^g$ 、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する5または6員飽和または部分飽和複素環もしくはN、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がOまたはSである5員不飽和複素環であり；前記環のいずれかが、ハロゲンおよび $C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される1個以上の基によって場合により置換される]の化合物、またはこの医薬的に許容される塩もしくは互変異性体。

【請求項2】

$R^2$ が $C_{1-6}$ アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

$R^1$ がN、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する5または6員飽和または部分飽和複素環、O、NおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がOまたはSである5員不飽和複素環、1、2または3個の窒素原子を含有する6員不飽和複素環、もしくはO、NおよびSから独立して選択されるヘテロ原子を含有する8~13員不飽和または部分飽和複素環であり；前記環のいずれかが、シアノ、ハロゲン、ニトロ、オキソ、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{6-10}$ アリールオキシ、 $C_{6-10}$ アリールカルボニル、 $N(R^a)_2$  {式中、 $R^a$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルおよび $C_{6-10}$ アリールカルボニルから独立して選択される}； $C_{1-6}$ アルキル $N(R^a)_2$ および $(CO)_dR^k$  {式中、dは、0または1であり、 $R^k$ は、請求項1で定義した通りである}から独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換される、請求項1または2に記載の化合物。

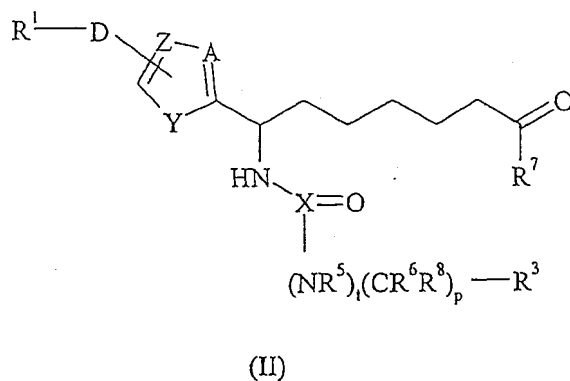
【請求項4】

$R^3$ が、アゾニアビシクロ[2.2.1]ヘプタニル、アゾニアビシクロ[2.2.2]オクタニル、チアゾリル、ピラゾリル、イソキサゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチエニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズオキサジアゾリル、ジヒドロベンゾフリル、ジヒドロチアゾロピリミジニル、ジヒドロベンゾジオキシニル、ジヒドロベンズオキサジニル、ベンズイミダゾリル、トリアゾロピリミジニル、ジヒドロベンズオキサゾリル、ジヒドロインドリル、ジヒドロキナゾリニル、ジヒドロフタラジニル、インダゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンゾトリアゾリル、テトラヒドロベータカルボリニル、ジヒドロイソインドリル、テトラヒドロナフチリジニル、テトラゾリル、チオモルホリニル、アゼチジニル、ジヒドロイソクロメニル、ジヒドロクロメニル、テトラヒドロキノリニル、インデニル、ジヒドロベンゾチアゾリル、イミダゾチアゾリル、ナフチリジニル、テトラヒドロインダゾリル、テトラヒドロベンゾチエニル、ヘキサヒドロナフチリジニル、テトラヒドロピリドナフチリジニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロイミダゾピリジニル、テトラヒドロイミダゾピラジニルまたはピロピリジニルであり；前記環のいずれかが、 $(CH_2)_m(CO)_nR^d$  {式中、m、nおよび $R^d$ は、請求項1で定義した通りである}から独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換される、請求項1~3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

式I I：

## 【化 2】



[ 式中：

$R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $X$ 、 $p$ および $t$ は、請求項1、3または4のいずれか一項で定義した通りであり；

$D$ は、非存在、 $CH_2$ 、 $CH_2CH_2$ または $CH=CH$ であり；

$A$ は、 $CH$ または $N$ を表し；

$Y$ は、 $NR^e$ 、 $O$ または $S$ を表し；

$Z$ は、 $N$ または $CR^f$ を表し；

$R^7$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ、 $N(R^b)_2$ 、ヒドロキシ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{3-7}$ シクロアルキル、 $C_{1-6}$ アルキル $S(O)_mR^g$ 、チエニル、フリルまたはピリジニルを表し；

$R^b$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキル $S(O)_wR^g$ 、 $SO_2R^g$ 、フェニル、ベンジル、チアゾリルまたはチアジアゾリルを表し、前記環のいずれかが、アミノによって場合により置換され；

$R^e$ は、水素または $C_{1-6}$ アルキルを表し；

$R^f$ は、ハロゲン、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルキルまたはハロ $C_{1-6}$ アルコキシから選択される最大2個の基によって場合により置換された水素、 $C_{1-6}$ アルキルまたは $C_{6-10}$ アリールを表し；

$R^g$ は、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノであり；

$m$ は、0、1、2または3であり；

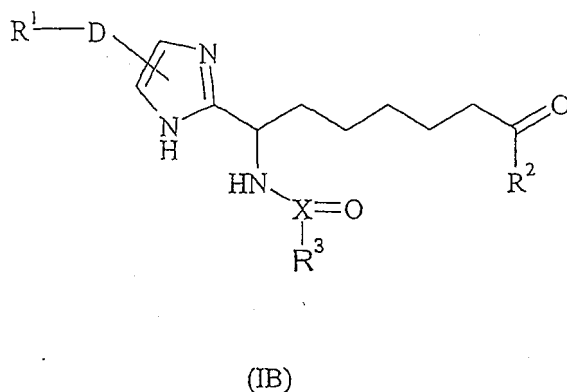
$w$ は、0、1または2である]

の化合物またはこの医薬的に許容される塩もしくは互変異性体の、請求項1、3または4のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 6】

式 I B：

## 【化 3】



[ 式中、 $D$ 、 $R^2$ および $X$ は、請求項1または2で定義した通りであり；



$R^1$  は、O、NおよびSから独立して選択されるヘテロ原子を含有する8～13員不飽和または部分飽和複素環であり；前記環のいずれかが、シアノ、ハロゲン、ニトロ、オキソ、ヒドロキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、カルボキシ、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{6-10}$ アリールオキシ、 $C_{6-10}$ アリールカルボニル、 $N(R^a)_2$  {式中、 $R^a$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルおよび $C_{6-10}$ アリールカルボニルから独立して選択される}； $C_{1-6}$ アルキル $N(R^a)_2$ および $(CO)_dR^k$  {式中、 $d$ は、0または1である}から独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換され；

$R^k$  は、 $NHSO_2R^g$ 、N、OおよびSから独立して選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有する5または6員飽和または部分飽和複素環もしくはN、OおよびSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有するが、この1個以下がOまたはSである5員不飽和複素環であり；前記環のいずれかが、ハロゲンおよび $C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される1個以上の基によって場合により置換され；

$R^g$  は、 $C_{1-6}$ アルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノであり；

$R^3$  は、アゾニアビシクロ[2.2.1]ヘプタニル、アゾニアビシクロ[2.2.2]オクタニル、チアゾリル、ピラゾリル、イソキサゾリル、チアジアゾリル、ベンゾチエニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズオキサジアゾリル、ジヒドロベンゾフリル、ジヒドロチアゾロピリミジニル、ジヒドロベンゾジオキシニル、ジヒドロベンズオキサジニル、ベンズイミダゾリル、トリアゾロピリミジニル、ジヒドロベンズオキサゾリル、ジヒドロインドリル、ジヒドロキナゾリニル、ジヒドロフタラジニル、インダゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンゾトリアゾリル、テトラヒドロベータカルボリニル、ジヒドロイソインドリル、テトラヒドロナフチリジニル、テトラゾリル、チオモルホリニル、アゼチジニル、ジヒドロイソクロメニル、ジヒドロクロメニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロベンゾチアゾリル、イミダゾチアゾリル、ナフチリジニル、テトラヒドロインダゾリル、テトラヒドロベンゾチエニル、ヘキサヒドロナフチリジニル、テトラヒドロピリドナフチリジニル、テトラヒドロイソキノリニル、テトラヒドロイミダゾピリジニル、テトラヒドロイミダゾピラジニルまたはピロロピリジニルであり；前記環のいずれかが、 $(CH_2)_m$   $(CO)_nR^d$  から独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換され；

$m$  は、0、1、2または3であり；

$n$  は、0、1または2であり；

$R^d$  は、ハロゲン、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、カルボキシ、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル、ニトロ、アミノスルホニル、( $C_{1-6}$ アルキルカルボニル)アミノ、モルホリニル、ピペラジニル、チアゾリル、ピラゾリル、イソキサゾリル、ピリジニル、オキソ、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、フェニルまたはピロリジニル、ヒドロキシ、ピペリジンスピロ、 $C_{6-10}$ アリール $C_{1-6}$ アルコキシ、ジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルまたはジ( $C_{1-6}$ アルキル)アミノ $C_{1-6}$ アルキルであり；前記環のいずれかが、 $C_{1-6}$ アルキルおよびハロ $C_{1-6}$ アルキルから独立して選ばれる1個以上の基によって場合により置換される]の化合物またはこの医薬的に許容される塩もしくは互変異性体の、請求項1または2に記載の化合物。

#### 【請求項7】

2 - {(1S) - 1 - [(カルボキシカルボニル)アミノ] - 7 - オキソノニル} - 5 - (2 - ナフチル) - 1H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート；

2 - ((1S) - 1 - {[モルホリン - 4 - イル(オキソ)アセチル]アミノ} - 7 - オキソノニル) - 5 - (2 - ナフチル) - 1H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート；

5 - (2 - ナフチル) - 2 - {(1S) - 7 - オキソ - 1 - [(トリフルオロアセチル)アミノ]ノニル} - 1H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート；

2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 1 - メチルアゼチジニウム - 3 - イル ) カルボニル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムジクロライド ;

2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 5 - [ 4 - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) フェニル ] - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムトリフルオロアセテート ;

5 - ( 2 - メトキシキノリン - 3 - イル ) - 2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 1 - メチルアゼチジニウム - 3 - イル ) カルボニル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムビス ( トリフルオロアセテート ) ;

2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ 3 - ( ジメチルアンモニオ ) プロパノイル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムジクロライド ;

4 - メトキシ - 2 - [ 2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 1 - メチルアゼチジニウム - 3 - イル ) カルボニル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウム - 5 - イル ] キノリニウムトリクロライド ;

N - { ( 1 S ) - 1 - [ 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ] - 5 - オキソヘプチル } キヌクリジン - 4 - カルボキサミド ;

N - { ( 1 S ) - 1 - [ 5 - ( 4 - メトキシキノリン - 2 - イル ) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル ] - 7 - オキソノニル } - 1 - メチルアゼチジン - 3 - カルボキサミド ;

5 - ( ヒドロキシメチル ) - 2 - ( 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

4 - { [ 2 - ( 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウム - 5 - イル ] メチル } モルホリン - 4 - イウムビス ( トリフルオロアセテート ) ;

2 - ( 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 5 - [ ( 1 E ) - 3 - メトキシ - 3 - オキソプロパ - 1 - エン - 1 - イル ] - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

5 - ( 2 - カルボキシエチル ) - 2 - ( 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

5 - アセチル - 2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

5 - シクロヘキシル - 2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソウンデシル ) - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

2 - ( ( 1 S ) - 7 - シクロプロピル - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソヘプチル ) - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 9 - メチル - 7 - オキソデシル ) - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

2 - ( ( 1 S ) - 8 - ヒドロキシ - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル ] アミノ } - 7 - オキソオクチル ) - 5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;

2 - ( ( 1 S ) - 7 - ( 2 - フリル ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - イ

ンドール - 3 - イル) アセチル] アミノ} - 7 - オキソヘブチル) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - [ ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル] アミノ} - 8 - ( メチルスルフィニル ) - 7 - オキソオクチル ] - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - [ ( 1 S ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル] アミノ} - 8 - ( メチルスルホニル ) - 7 - オキソオクチル ] - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - ( ( 1 S ) - 8 - ( アミノスルホニル ) - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル] アミノ} - 7 - オキソオクチル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 1 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 1 - メチル - 4 - ( { [ ( 1 S ) - 7 - オキソ - 1 - ( 4 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - 2 - イル ) - 7 - ピリジン - 2 - イルヘブチル] アミノ} カルボニル ) ピペリジニウムビス ( トリフルオロアセテート ) ;  
 2 - ( ( 1 S ) - 7 - アミノ - 1 - { [ ( 5 - メトキシ - 2 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) アセチル] アミノ} - 7 - オキソヘブチル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - ( ( 1 S ) - 6 - カルボキシ - 1 - { [ ( ジメチルアミノ ) スルホニル] アミノ} ヘキシル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - ( ( 1 S ) - 7 - ( メチルアミノ ) - 7 - オキソ - 1 - { [ ( 1 - ピリジン - 2 - イルピペリジン - 3 - イル ) カルボニル] アミノ} ヘブチル ) - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 2 - [ ( 1 S ) - 1 - { [ ( ベンジルアミノ ) カルボニル] アミノ} - 7 - ( メチルアミノ ) - 7 - オキソヘブチル ] - 5 - ( 2 - ナフチル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウムトリフルオロアセテート ;  
 5 - ( 2 - メトキシキノリン - 3 - イル ) - 2 - ( ( 1 S ) - 1 - { [ ( 1 - メチルアゼチジニウム - 3 - イル ) カルボニル] アミノ} - 7 - オキソノニル ) - 1 H - イミダゾール - 3 - イウム - L - タートレート ;

並びにこの医薬的に許容される遊離塩基、塩、代替塩および立体異性体から選択される化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物のタートレート塩。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物またはこの医薬的に許容される塩と、医薬的に許容される担体と、を含む薬学的組成物。

【請求項 10】

療法によるヒトまたは動物の体の処置方法で使用するための、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物、またはこの医薬的に許容される塩。

【請求項 11】

H D A C 活性を調節することによって緩和される疾患を処置または防止する医薬品を製造するための、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物またはこの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 12】

癌、神経変性疾患、統合失調症、脳卒中、再狭窄および精神遅滞から選択される疾患を処置または防止する医薬品製造のための、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物またはこの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 13】

対象の癌、神経変性疾患、統合失調症、脳卒中、再狭窄および精神遅滞から選択される疾患を処置または防止する方法であって、前記対象への請求項 1 に記載の化合物またはこ

の医薬的に許容される塩の有効量の投与を含む方法。

【請求項 14】

5 - (2 - メトキシキノリン - 3 - イル) - 2 - ((1S) - 1 - {[ (1 - メチルアゼチジニウム - 3 - イル) カルボニル] アミノ} - 7 - オキソノニル) - 1H - イミダゾール - 3 - イウム - L - タートレート、またはこの立体異性体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

N - {(1S) - 1 - [5 - (2 - メトキシキノリン - 3 - イル) - 1H - イミダゾール - 2 - イル] - 7 - オキソノニル} - 1 - メチルアゼチジン - 3 - カルボキサミド、またはこの医薬的に許容される塩もしくは立体異性体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

請求項 14 または請求項 15 に記載の化合物と、医薬的に許容される担体と、を含む薬学的組成物。