

【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27年6月25日 (2015.6.25)

【公表番号】特表2014-517833(P2014-517833A)

【公表日】平成26年7月24日 (2014.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2014-039

【出願番号】特願2014-510414(P2014-510414)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/06 (2006.01)

C 0 7 D 253/08 (2006.01)

C 0 7 D 401/02 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 237/32 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 265/22 (2006.01)

C 0 7 D 498/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/536 (2006.01)

A 6 1 K 31/537 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/5415 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/06 C S P

C 0 7 D 253/08

C 0 7 D 401/02

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 417/06

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 237/32

C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 265/22
 C 0 7 D 498/10 S
 C 0 7 D 405/12
 A 6 1 K 31/53
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/536
 A 6 1 K 31/537
 A 6 1 K 31/4725
 A 6 1 K 31/5415
 A 6 1 K 31/472
 A 6 1 P 9/06
 A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 9/10 1 0 3
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/08

【手続補正書】

【提出日】平成27年5月7日(2015.5.7)

【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

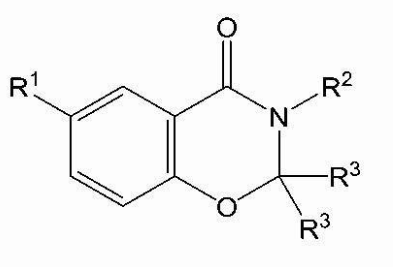
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化365】



の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体であって、式中：

R^1 は、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールであり；

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 CN 、 $-\text{SF}_5$ 、 $-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})$

$-S(O)_2-R^{22}$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-S(O)_2-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルケニル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

R^2 は、 $-R^6$ 、 $-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-C_2 \sim 6$ アルケニレン- R^6 、 $-C_2 \sim 6$ アルキニレン- R^6 、 $-L-R^6$ 、 $-L-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-C_1 \sim 6$ アルキレン- $L-R^6$ または $-C_1 \sim 6$ アルキレン- $L-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 であり；

L は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-NR^{20}S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{20}-$ 、 $-C(O)NR^{20}-$ または $-NR^{20}C(O)-$ であり；

各 R^3 は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されているか；

または2個の R^3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成し得；

R^6 は、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-N(R^{20})-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロ、アリール、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；

R^{20} および R^{22} は、各例において独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールであり；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、

ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、アラルキル、 $-N(R^{26})(R^{28})$ 、アミノアシル、 $-NO_2$ 、 $-S(O)_2-R^{26}$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-R^{26}$ 、 $-C(O)-OR^{26}$ 、アリール、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該アラルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $-CF_3$ 、アリールまたは $C_3 \sim 6$ シクロアルキルで必要に応じてさらに置換されているか；あるいは R^{20} および R^{22} が共通の窒素原子に結合している場合、 R^{20} および R^{22} は一緒になって、複素環式環またはヘテロアリール環を形成し得、該環は次いで、独立してヒドロキシル、ハロ、アルキル、アラルキル、アリール、アリールオキシ、アラルキルオキシ、ヘテロアリールオキシ、置換アミノ、アミノアシル、 $-NO_2$ 、 $-S(O)_2-R^{26}$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、ヒドロキシメチル、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、アリール、ヘテロアリールおよび $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；そして

R^{26} および R^{28} は各々独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルケニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ および $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群より選択される1個～3個の置換基でさらに置換され得る、化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項2】

R^2 は、 $-R^6$ 、 $-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-L-R^6$ 、 $-L-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 または $-C_1 \sim 6$ アルキレン- $L-R^6$ であり；

L は、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{20}-$ または $-C(O)NR^{20}-$ であり；そして

R^6 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-C(O)-OR^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

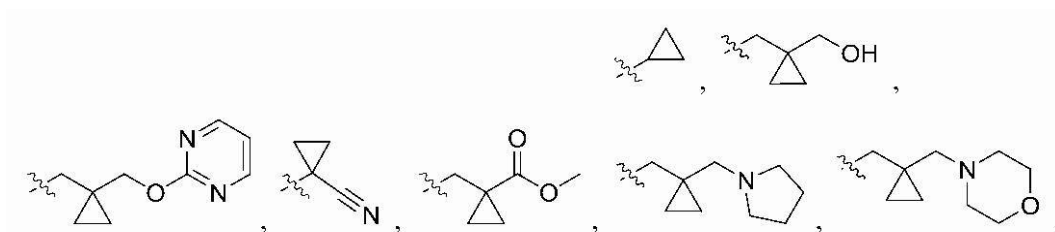
ここで該ヘテロアリールは、1個、2個または3個の $C_1 \sim 6$ アルキルで必要に応じてさらに置換されている、

請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

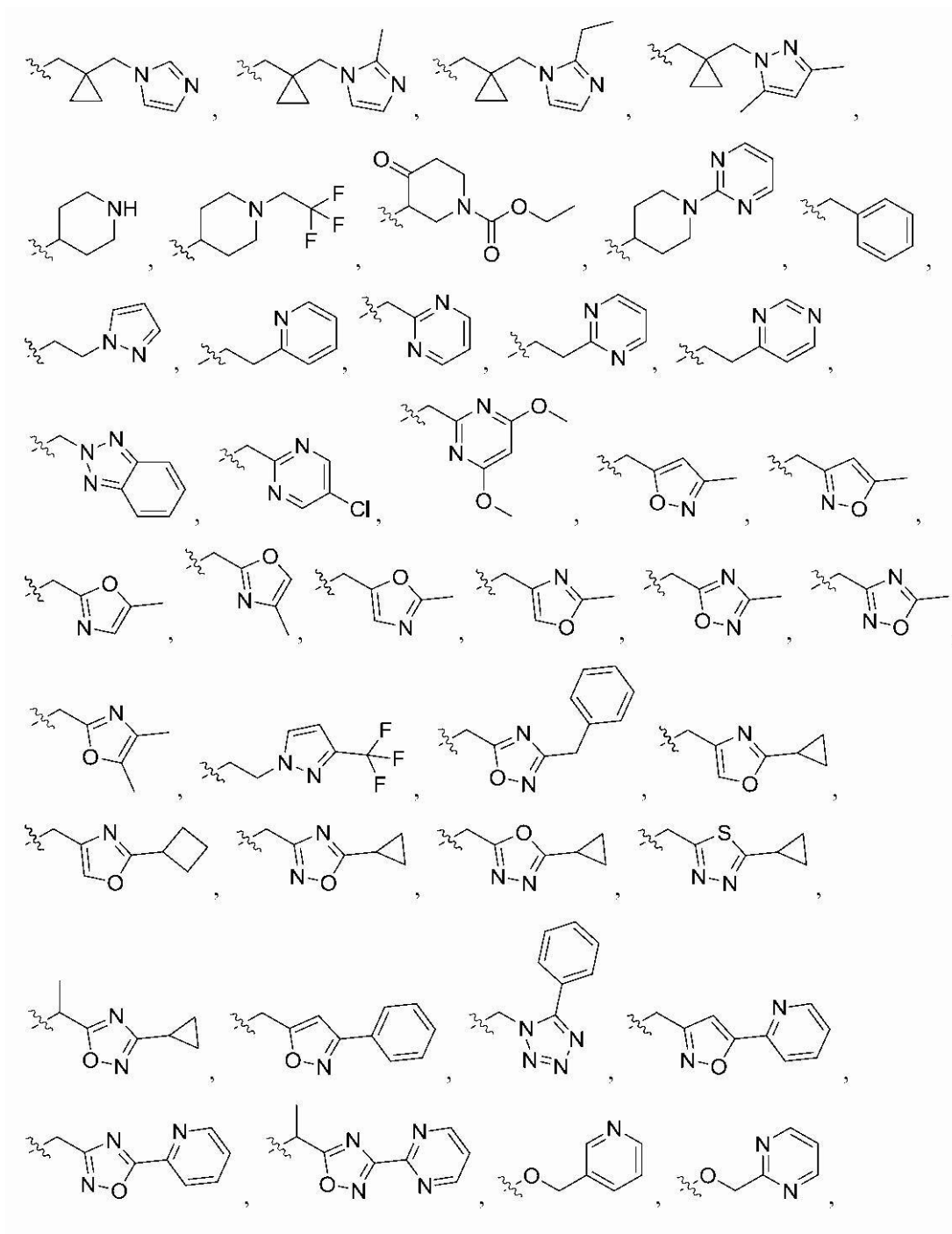
【請求項3】

R^2 は

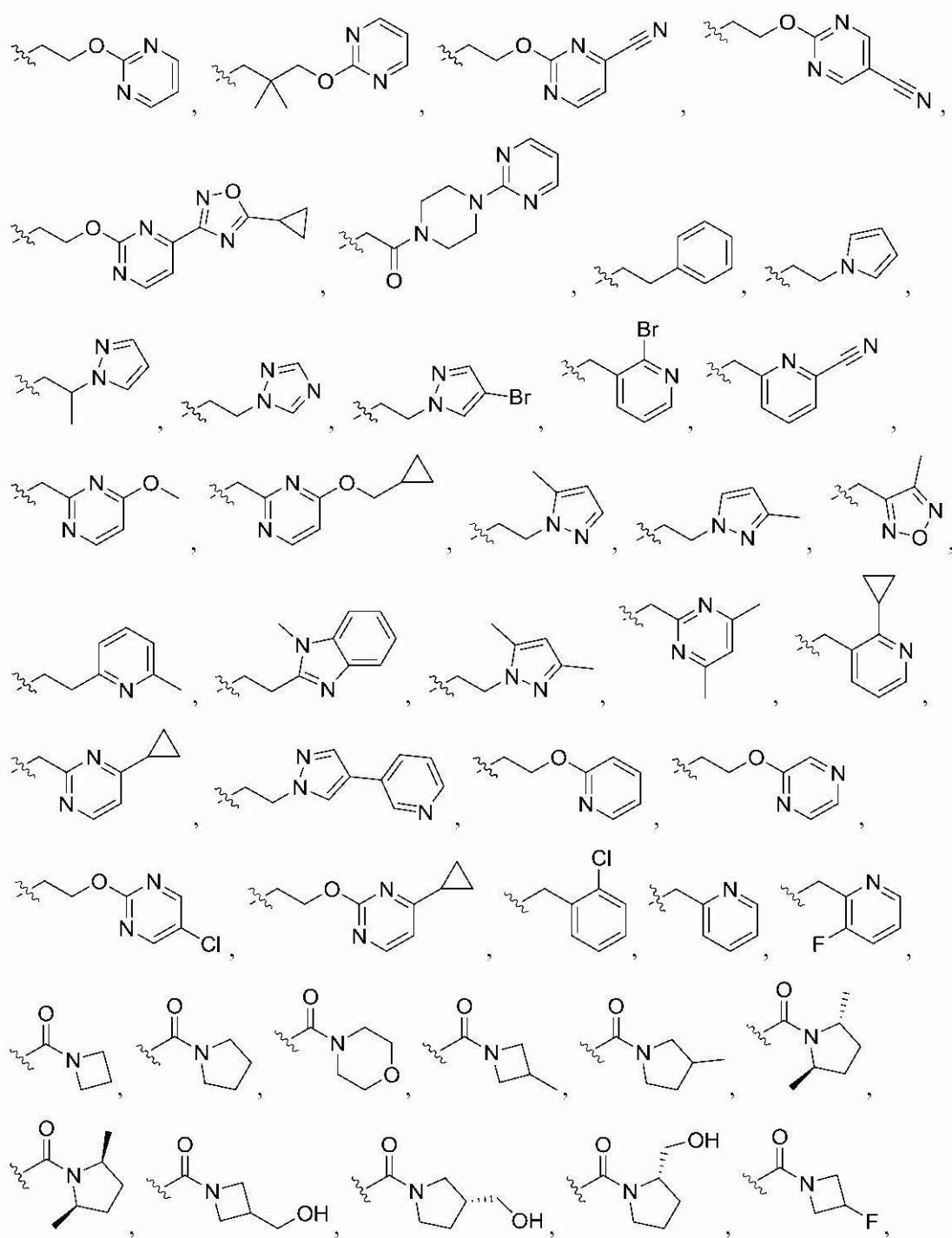
【化366】



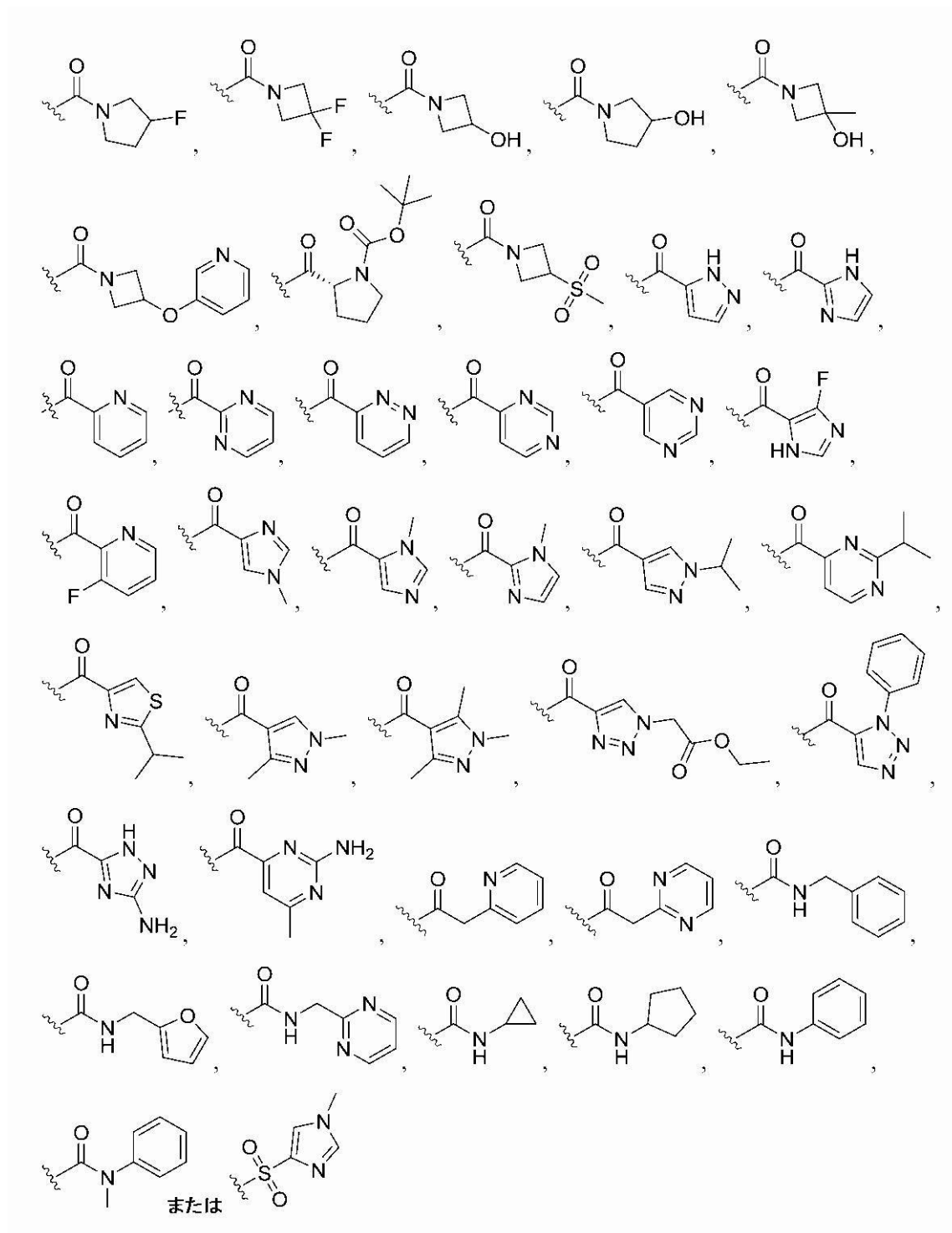
【化 3 6 7】



【化 3 6 8】



【化 3 6 9】



である、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項4】

R^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり；

ここで該アリールまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-O-R^{20}$ 、 $C_1 \sim 4$ アルキル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 4$ アルキルまたはシクロアルキルは、独立してハロおよび-CNからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、
請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異

性体。

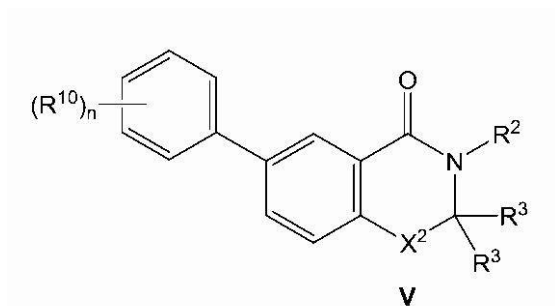
【請求項 5】

R^1 は、必要に応じてトリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルで置換されたアリールまたはヘテロアリールである、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 6】

前記化合物は、式V:

【化 3 7 1】



により表され、式Vにおいて、 R^2 および R^3 は、請求項1において定義されたとおりであり；

X^2 は、-O-であり；

nは、0、1、2または3であり；そして

R^{10} は、ハロ、-NO₂、CN、-SF₅、-Si(CH₃)₃、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-N(R²⁰)-C(O)-R²²、-N(R²⁰)-S(O)₂-R²²、-S(O)₂-R²⁰、-S(O)₂-N(R²⁰)(R²²)、C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルであり；そして

ここで該C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、-NO₂、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、C₁~₄アルキル、シクロアルキル、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-CNおよび-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、

請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 7】

R^2 は、-C₁~₆アルキレン-R⁶であり；そして

R^6 は、アリールまたはヘテロアリールであり；

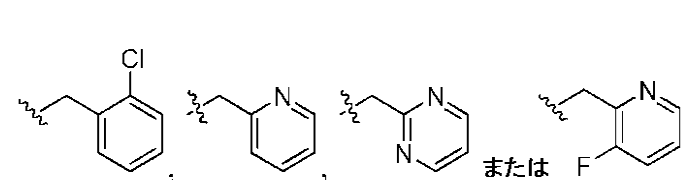
ここで該アリールまたはヘテロアリールは、1個、2個または3個のハロで必要に応じて置換されている、

請求項6に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 8】

R^2 は

【化 3 7 5】



である、請求項6に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは

は互変異性体。

【請求項 9】

R³は独立して、水素またはメチルである、請求項6に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 10】

R¹⁰は、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシである、請求項6に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 11】

前記化合物は、

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

2-メチル-3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

2,2-ジメチル-3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

6-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(ピリミジン-2-イルメチル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 12】

前記化合物は、3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オンである、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

【請求項 13】

請求項1に記載の化合物またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体、および1種以上の薬学的に受容可能なキャリアを含有する、薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0010】

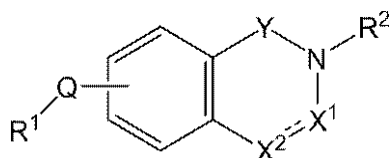
特定の実施形態において、本開示は、治療有効量の本開示の化合物(例えば、式Iの化合物)および少なくとも1種の薬学的に受容可能な賦形剤を含有する、薬学的組成物を提供する。

一実施形態において、たとえば、以下の項目が提供される。

(項目 1)

式I:

【化 3 6 5】



I

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体であって、式Iにおいて:

点線は、任意の二重結合を表し;

Yは、 $-\text{C}(\text{R}^5)_2$ -または $-\text{C}(\text{O})-$ であり;

X^1 はNであって X^2 はNであるか、 X^1 はNであって X^2 は CR^3 であるか、または X^1 は CR^3 であって X^2 はNであり、そして該点線は二重結合であるか;あるいは

X^1 は $\text{C}(\text{R}^3)_2$ であって X^2 は NR^4 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ もしくは $-\text{S}(\text{O})_2-$ であるか、または X^1 と X^2 との両方が $\text{C}(\text{R}^3)_2$ であり、そして該点線は単結合であり;

ただし:

該点線が単結合であり、かつYが $-\text{C}(\text{R}^5)_2-$ である場合; X^1 と X^2 との両方は $\text{C}(\text{R}^3)_2$ であり;そして

該点線が二重結合である場合;Yは、 $-\text{C}(\text{O})-$ であり;

Qは、共有結合または $\text{C}_2 \sim 4$ アルキニレンであり;

R^1 は、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールであり;

ここで該 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルケニル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 CN 、 $-\text{SF}_5$ 、 $-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{O}-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{22}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 4$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 4$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;そして

ここで該 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 4$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 4$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、 $-\text{NO}_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{CN}$ および $-\text{O}-\text{R}^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

R^2 は、 $-\text{R}^6$ 、 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-\text{C}_2 \sim 6$ アルケニレン- R^6 、 $-\text{C}_2 \sim 6$ アルキニレン- R^6 、 $-\text{L}-\text{R}^6$ 、 $-\text{L}-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- $\text{L}-\text{R}^6$ または $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- $\text{L}-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 であり;

Lは、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{NR}^{20}\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{20}-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{20}-$ または $-\text{NR}^{20}\text{C}(\text{O})-$ であり;ただし、Yが $-\text{C}(\text{R}^5)_2-$ である場合、Lは、 $-\text{C}(\text{O})-$ または $-\text{S}(\text{O})_2-$ であり、そして R^2 は、 $-\text{L}-\text{R}^6$ 、 $-\text{L}-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- $\text{L}-\text{R}^6$ または $-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- $\text{L}-\text{C}_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 であり;

各 R^3 は独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり;

ここで該 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキルは、独立してハロ、 $-\text{NO}_2$ 、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ 、 $-\text{CN}$ および $-\text{O}-\text{R}^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されているか；

または X^1 が $C(R^3)_2$ である場合、2個の R^3 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキルもしくはヘテロシクリルを形成し得；

R^4 は、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-N(R^{20})-S(O)_2-R^{20}$ 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、アラルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；

各 R^5 は独立して、水素または $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^6 は、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 4$ アルキニル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-N(R^{20})-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロ、アリール、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；

R^{20} および R^{22} は、各例において独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールであり；そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールまたはヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルキル、アラルキル、 $-N(R^{26})(R^{28})$ 、アミノアシル、 $-NO_2$ 、 $-S(O)_2-R^{26}$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-R^{26}$ 、 $-C(O)-OR^{26}$ 、アリール、 C

$C_3 \sim 6$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

ここで該アルキル、ヘテロシクリルまたはヘテロアリールは、 $C_1 \sim 4$ アルキル、 $-CF_3$ 、アリールまたは $C_3 \sim 6$ シクロアルキルで必要に応じてさらに置換されているか;あるいは R^{20} および R^{22} が共通の窒素原子に結合している場合、 R^{20} および R^{22} は一緒になって、複素環式環またはヘテロアリール環を形成し得、該環は次いで、独立してヒドロキシル、ハロ、アルキル、アラルキル、アリール、アリールオキシ、アラルキルオキシ、ヘテロアリールオキシ、置換アミノ、アミノアシル、 $-NO_2$ 、 $-S(O)_2-R^{26}$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、ヒドロキシメチル、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、アリール、ヘテロアリールおよび $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;そして

R^{26} および R^{28} は各々独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルケニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択され;そして

ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ および $C_3 \sim 6$ シクロアルキルからなる群より選択される1個~3個の置換基でさらに置換され得る、化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目2)

Qは結合である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

R^2 は、 $-R^6$ 、 $-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-L-R^6$ 、 $-L-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 または $-C_1 \sim 6$ アルキレン- $L-R^6$ であり;

Lは、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR^{20}$ -または $-C(O)NR^{20}-$ であり;ただし、Yが $-C(R^5)$ である場合、Lは、 $-C(O)-$ または $-S(O)_2-$ であり、そして R^2 は、 $-L-R^6$ 、 $-L-C_1 \sim 6$ アルキレン- R^6 または $-C_1 \sim 6$ アルキレン- $L-R^6$ であり;そして

R^6 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり;

ここで該シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、ハロ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

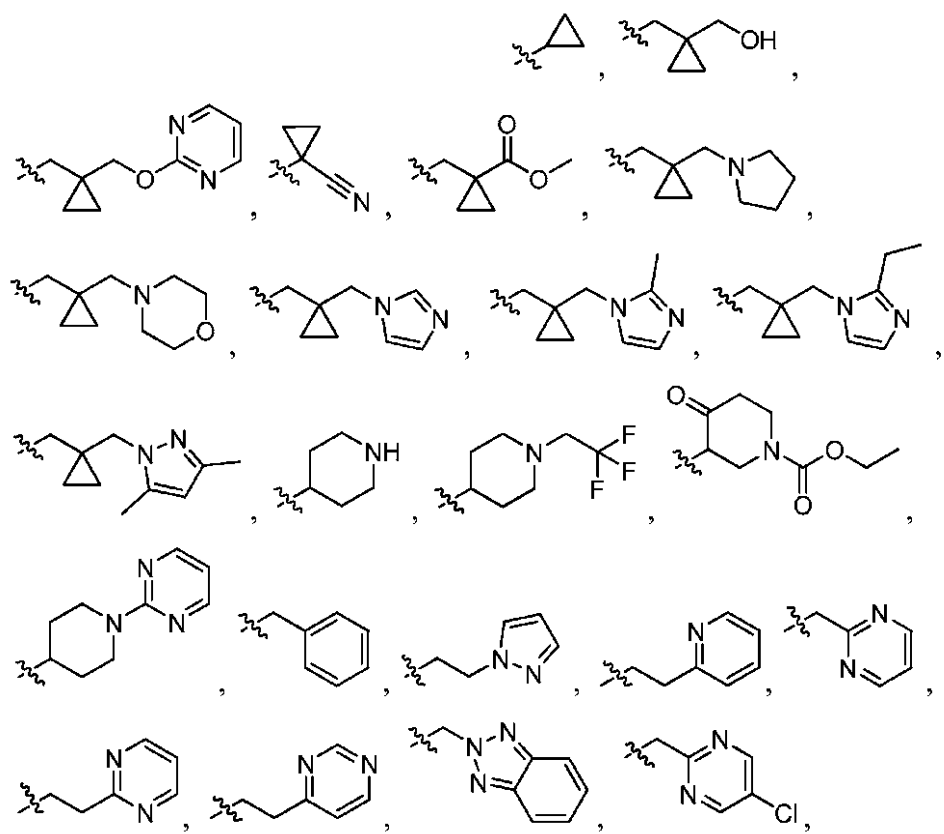
ここで該 $C_1 \sim 6$ アルキルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $-C(O)-OR^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており;そして

ここで該ヘテロアリールは、1個、2個または3個の $C_1 \sim 6$ アルキルで必要に応じてさらに置換されている、項目1に記載の化合物。

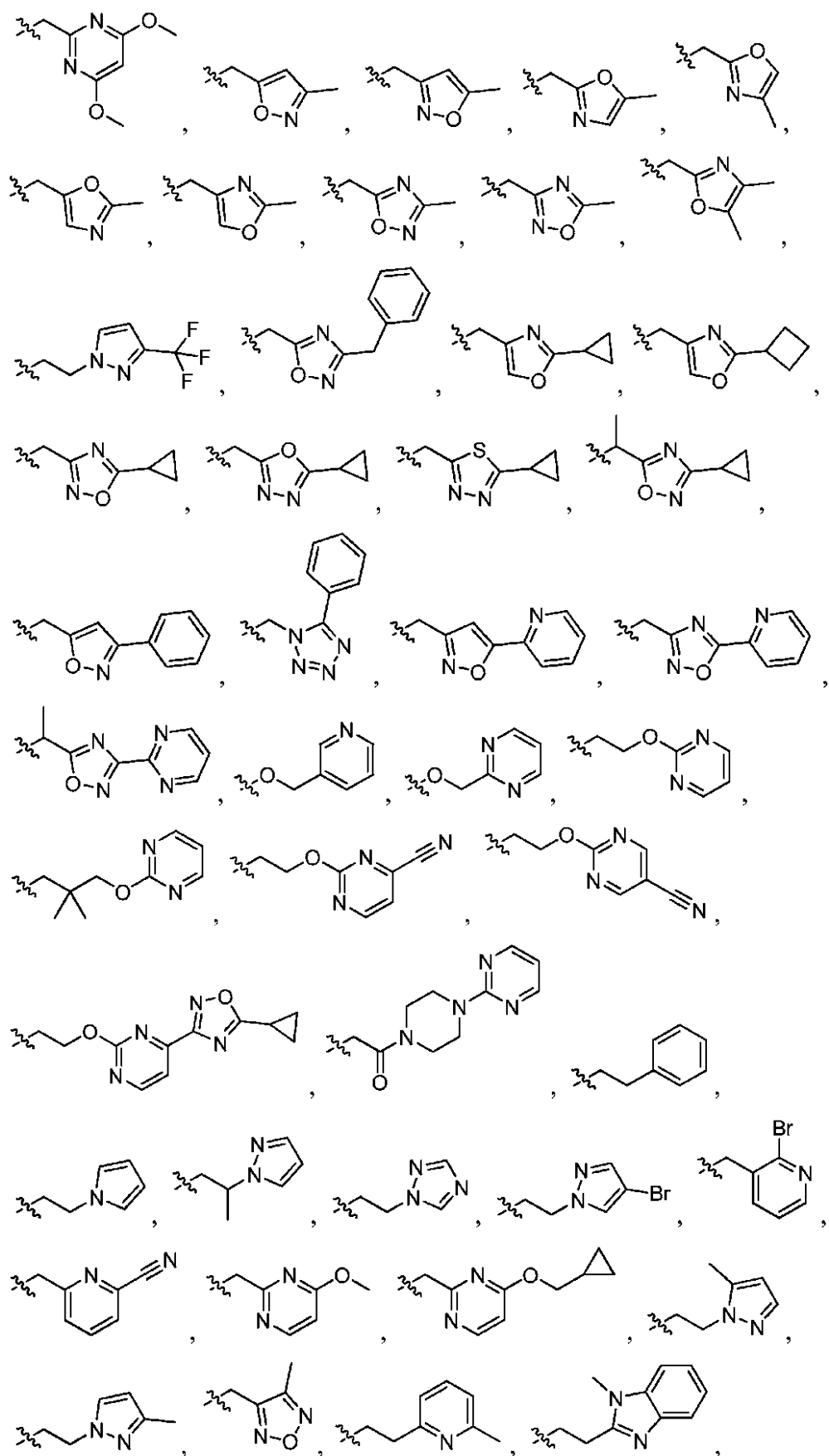
(項目4)

R^2 は

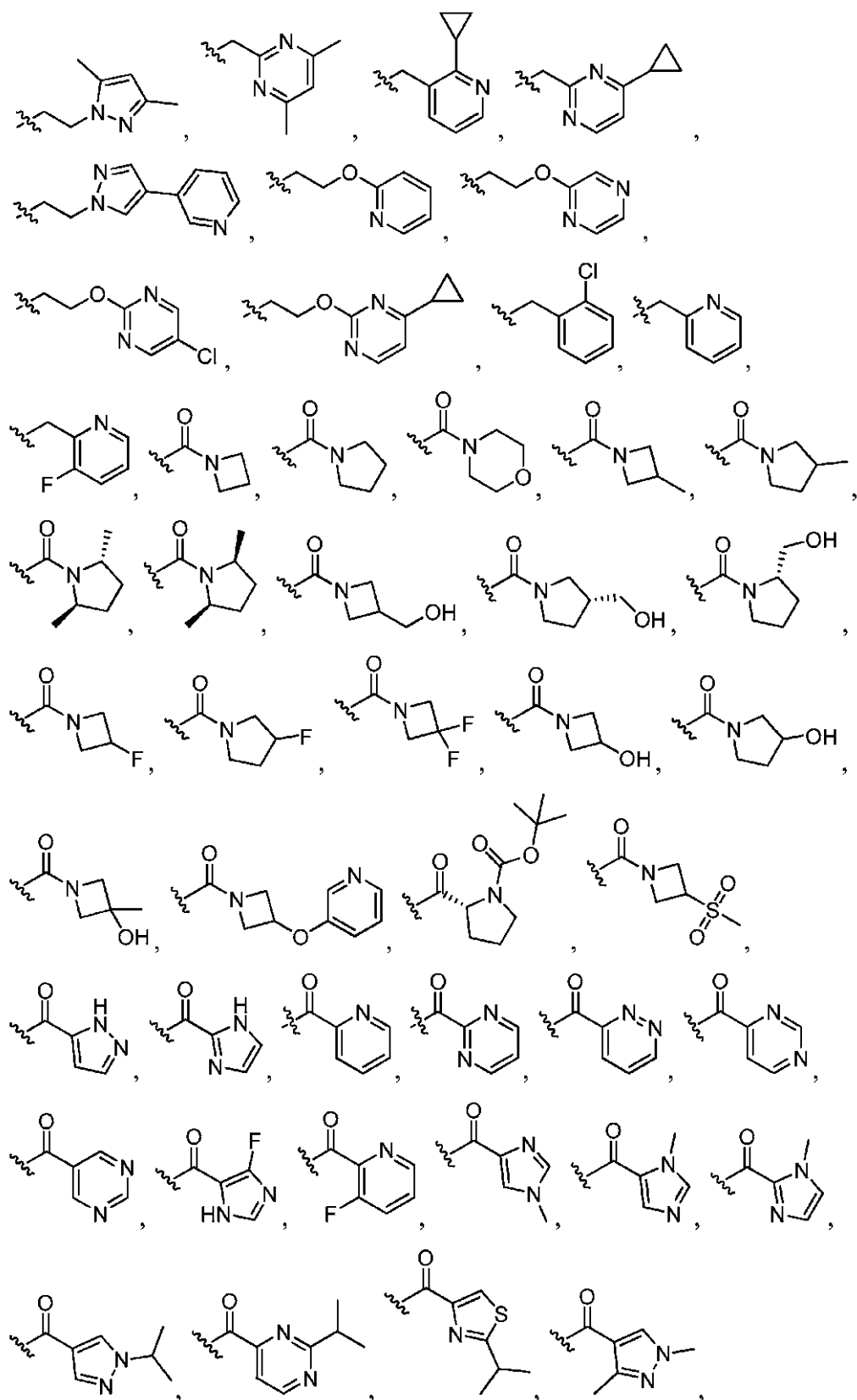
【化 3 6 6】



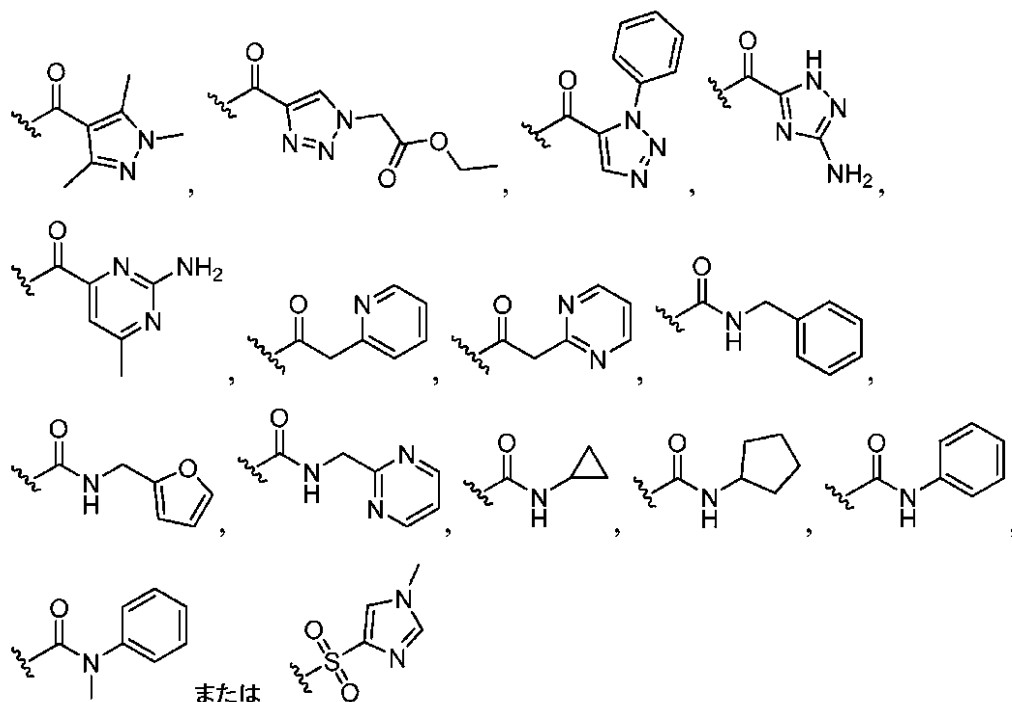
【化 3 6 7】



【化 3 6 8】



【化 3 6 9】



である、項目3に記載の化合物。

(項目 5)

R^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり；

ここで該アリールまたはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-O-R^{20}$ 、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、シクロアルキルおよびヘテロシクリルからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；そして

ここで該 $C_{1\sim 4}$ アルキルまたはシクロアルキルは、独立してハロおよび-CNからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、
項目1に記載の化合物。

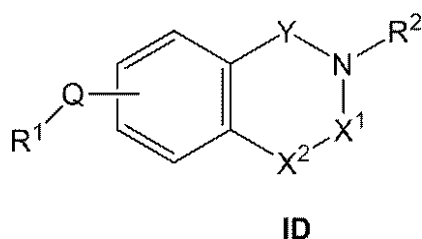
(項目 6)

R^1 は、必要に応じてトリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルで置換されたアリールまたはヘテロアリールである、項目1に記載の化合物。

(項目 7)

式Iの化合物は、式ID:

【化 3 7 0】

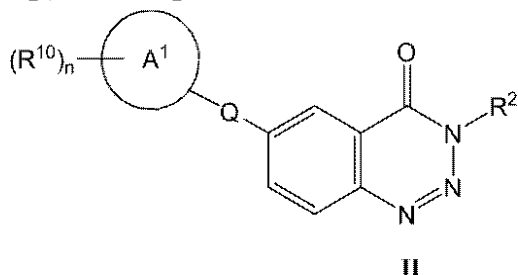


により表され、式IDにおいて、 R^1 、Q、Y、 X^1 、 X^2 および R^2 は、項目1において定義されたとおりである、項目1に記載の化合物。

(項目 8)

式Iの化合物は、式II:

【化 3 7 1】



により表され、式IIにおいて、QおよびR²は、項目1において定義されたとおりであり；

A¹は、アリールまたはヘテロアリールであり；

nは、0、1、2または3であり；そして

R¹⁰は、ハロ、-NO₂、CN、-SF₅、-Si(CH₃)₃、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰、
-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-N(R²⁰)-C(O)-R²²、-N(R²⁰)-S(O)₂-R²²、-S(O)₂-R²⁰、
-S(O)₂-N(R²⁰)(R²²)、C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、C₃~₆シクロアルキル、
アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；そして

ここで該C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、C₃~₆シクロアルキル、
アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、-NO₂、アリール、ヘテロシクリル、
ヘテロアリール、C₁~₄アルキル、C₃~₆シクロアルキル、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰、
-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-CNおよび-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、

項目1に記載の化合物。

(項目9)

Qは結合である、項目8に記載の化合物。

(項目10)

R²は、-R⁶、-C₁~₆アルキレン-R⁶または-L-C₁~₆アルキレン-R⁶であり；

Lは、-O-、-C(O)-または-C(O)NR²⁰-であり；

R⁶は、C₃~₆シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該C₃~₆シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してC₁~₆アルキル、
ハロ、C₃~₆シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-C(O)-OR²⁰、-C
Nおよび-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該C₁~₆アルキルまたはヘテロアリールは、独立してハロ、シクロアルキル、アリール、
ヘテロシクリル、ヘテロアリール、および-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

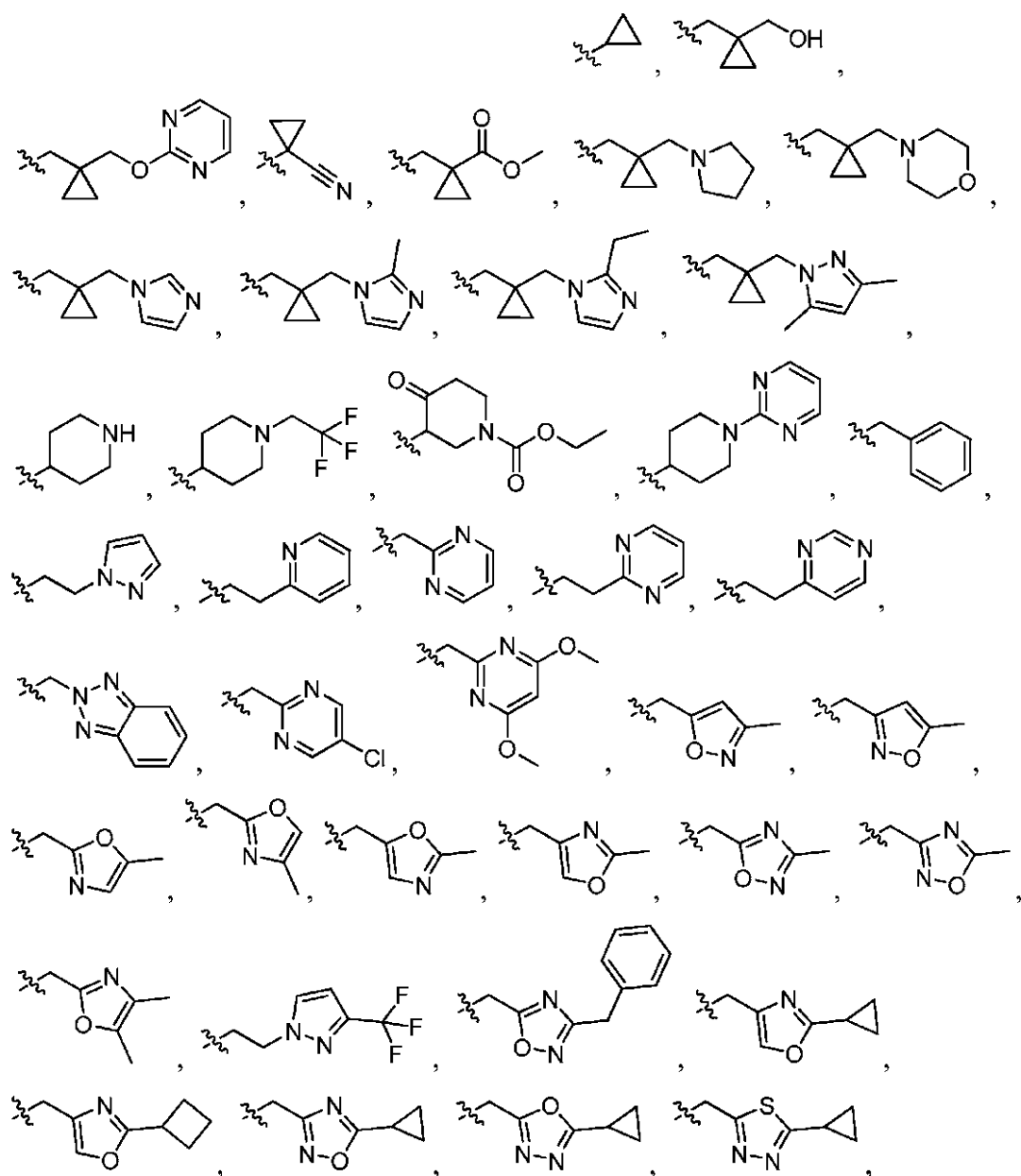
ここで該ヘテロアリールは、1個、2個または3個のC₁~₆アルキルで必要に応じてさらに置換されている、

項目8に記載の化合物。

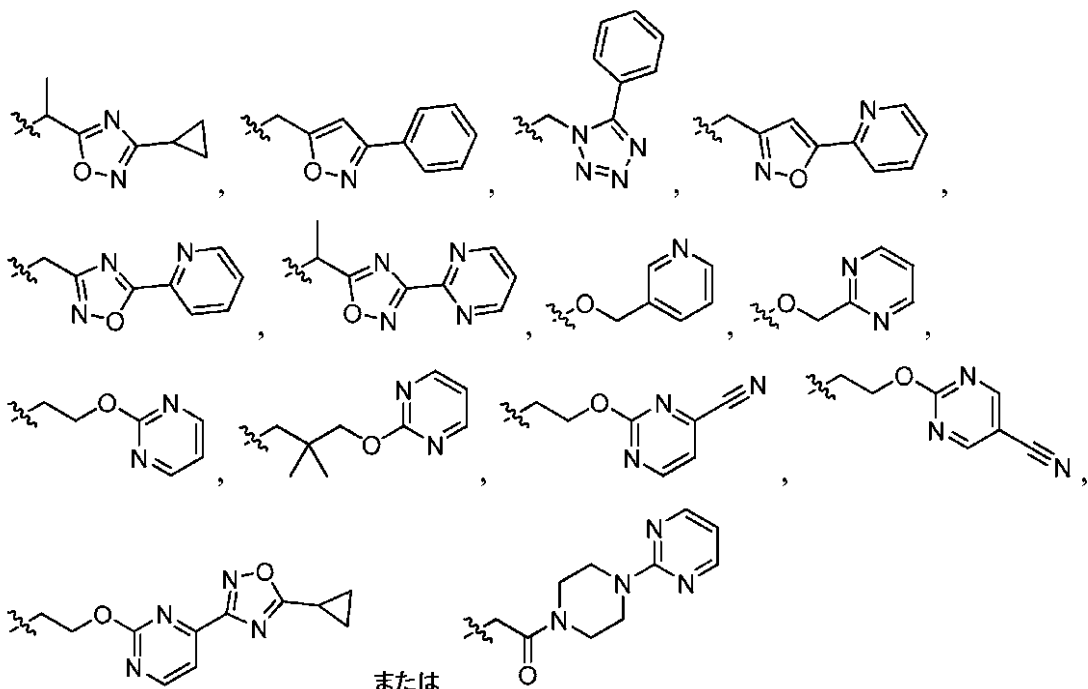
(項目11)

R²は

【化 3 7 2】



【化 3 7 3】



である、項目8に記載の化合物。

(項目 1 2)

R^{10} は、 $-O-R^{20}$ 、 $C_1 \sim 4$ アルキル、シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり；そしてここで該 $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_3 \sim 6$ シクロアルキルは、独立してハロおよび-CNからなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、項目8に記載の化合物。

(項目 1 3)

R^{10} は、1-シアノシクロプロピル、2,2,2-トリフルオロエトキシ、4-クロロフェノキシ、シクロプロピル、フェノキシ、ピペリジン-1-イル、トリフルオロメトキシまたはトリフルオロメチルである、項目8に記載の化合物。

(項目 1 4)

前記化合物は、

3-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-クロロピリミジン-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)-6-(4-フェノキシフェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((3-フェニルイソオキサゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((3-ベンジル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-シクロプロピル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,

2,3] トリアジン-4(3H)-オン

6-(4-(4-クロロフェノキシ)フェニル)-3-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリミジン-4-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリミジン-2-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-フェニル-1H-テトラゾール-1-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-シクロプロピル-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((4,5-ジメチルオキサゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((3-メチルイソオキサゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-メチルイソオキサゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((2H-ベンゾ[d][1,2,3] トリアゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-6-(4-(4-クロロフェノキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

1-(4-オキソ-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-3(4H)-イル)シクロプロパンカルボニトリル

3-((1-((2-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

2-(2-(4-オキソ-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-3(4H)-イル)エトキシ)ピリミジン-4-カルボニトリル

3-(ピペリジン-4-イル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(1-(ピリミジン-2-イル)ピペリジン-4-イル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((1-(モルホリノメチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-オキソ-2-(4-(ピリミジン-2-イル)ピペラジン-1-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-(ピリジン-2-イル)イソオキサゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-4(3H)-オン

1-(4-(4-オキソ-3-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-3,4-ジヒドロベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-6-イル)フェニル)シクロプロパンカルボニトリル

2-(2-(4-オキソ-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3] トリアジン-3(4H)-イル)エトキシ)ピリミジン-5-カルボニトリル

6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3-(2-(3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール

ル-1-イル)エチル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(1-(3-(ピリミジン-2-イル)-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)エチル)-6-(4-(トリフル
ロオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((5-(ピリジン-2-イル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオ
ロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
1-((4-オキソ-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-3(
4H)-イル)メチル)シクロプロパンカルボン酸メチル
3-(ピリミジン-2-イルメトキシ)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,
2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((1-((2-エチル-1H-イミダゾール-1-イル)メチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(ト
リフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((1-((1H-イミダゾール-1-イル)メチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオ
ロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(ピリジン-3-イルメトキシ)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,
3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(2-(4-(5-シクロプロピル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)ピリミジン-2-イルオキ
シ)エチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-
オン
3-((1-(ピロリジン-1-イルメチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキ
シ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((1-((3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)メチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(
トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
6-(4-(4-クロロフェノキシ)フェニル)-3-(2-オキソ-2-(4-(ピリミジン-2-イル)ピペラ
ジン-1-イル)エチル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((5-シクロプロピル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメ
トキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((5-シクロプロピル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロ
メトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(1-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペリジン-4-イル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)
フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
4-オキソ-3-(4-オキソ-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリ
アジン-3(4H)-イル)ピペリジン-1-カルボン酸エチル
6-(4-シクロプロピルフェニル)-3-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル
)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((1-(ヒドロキシメチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェ
ニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(1-(3-シクロプロピル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)エチル)-6-(4-(トリフルオ
ロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((1-((ピリミジン-2-イルオキシ)メチル)シクロプロピル)メチル)-6-(4-(トリフルオ
ロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-(2,2-ジメチル-3-(ピリミジン-2-イルオキシ)プロピル)-6-(4-(トリフルオロメトキ
シ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((2-メチルオキサゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベ
ンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((5-メチルオキサゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベ
ンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((4-メチルオキサゾール-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベ
ンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン
3-((2-シクロブチルオキサゾール-4-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェ
ニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((2-メチルオキサゾール-4-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((2-シクロプロピルオキサゾール-4-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-((5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(6-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリジン-3-イル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-6-(6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

6-(2-(ピペリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

3-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-6-((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)エチニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オン

である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目15)

前記化合物は、

2-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-ベンジル-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-フェネチル-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(1H-ピロール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4-メチル-1,2,5-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

6-((1-オキソ-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-2(1H)-イル)メチル)ピコリノニトリル

2-((2-プロモピリジン-3-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(3-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(6-メチルピリジン-2-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((2-シクロプロピルピリジン-3-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4,6-ジメチルピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4-シクロプロピルピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(3,5-ジメチル-1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(1-メチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4-(シクロプロピルメトキシ)ピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(ピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(4-シクロプロピルピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((4-メトキシピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(4-プロモ-1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(5-メチル-1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(4-(2-メトキシピリミジン-5-イル)-1H-ピラゾール-1-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((5-クロロピリミジン-2-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(ピリミジン-4-イル)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(5-クロロピリミジン-2-イルオキシ)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(1H-ピラゾール-1-イル)プロピル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(ピラジン-2-イルオキシ)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-(2-(ピリジン-2-イルオキシ)エチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

2-((5-(ピリジン-2-イル)イソオキサゾール-3-イル)メチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)フタラジン-1(2H)-オン

である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目16)

前記化合物は、

3-((4-メチル-1,2,5-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)キナゾリン-4(3H)-オン

3-((3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)キナゾリン-4(3H)-オン

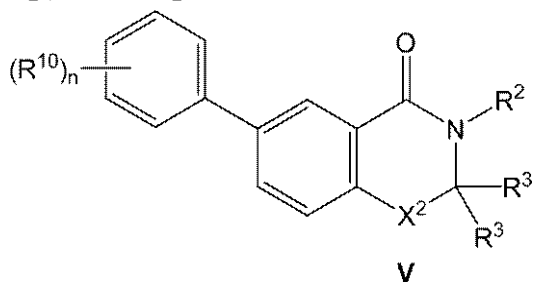
3-((5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)キナゾリン-4(3H)-オン

である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目17)

式Iの化合物は、式V:

【化 3 7 4】



により表され、式Vにおいて、 R^2 および R^3 は、項目1において定義されたとおりであり；

X^2 は、-O-または-S-であり；

n は、0、1、2または3であり；そして

R^{10} は、ハロ、-NO₂、CN、-SF₅、-Si(CH₃)₃、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰、
-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-N(R²⁰)-C(O)-R²²、-N(R²⁰)-S(O)₂-R²²、-S(O)₂-R²⁰、
-S(O)₂-N(R²⁰)(R²²)、C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、シクロ
アルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルであり；そして

ここで該C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、シクロアルキル、アリ
ール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、-NO₂、アリール、ヘテロ
シクリル、ヘテロアリール、C₁~₄アルキル、シクロアルキル、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-R²⁰
、-C(O)-OR²⁰、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-CNおよび-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2
個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、
項目1に記載の化合物。

(項目 1 8)

X^2 は-O-である、項目17に記載の化合物。

(項目 1 9)

X^2 は-S-である、項目17に記載の化合物。

(項目 2 0)

R^2 は、-C₁~₆アルキレン-R⁶であり；そして

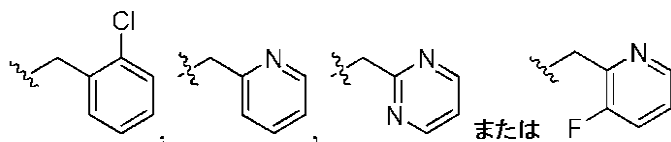
R^6 は、アリールまたはヘテロアリールであり；

ここで該アリールまたはヘテロアリールは、1個、2個または3個のハロで必要に応じ
て置換されている、
項目17に記載の化合物。

(項目 2 1)

R^2 は

【化 3 7 5】



である、項目17に記載の化合物。

(項目 2 2)

R^3 は独立して、水素またはメチルである、項目17に記載の化合物。

(項目 2 3)

R^{10} は、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシである、項目17に記載の化
合物。

(項目 2 4)

前記化合物は、

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

2-メチル-3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

2,2-ジメチル-3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

6-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3-(ピリミジン-2-イルメチル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-ベンジル-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オン

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

3-(ピリジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

3-(2-クロロベンジル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

3-((3-フルオロピリジン-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

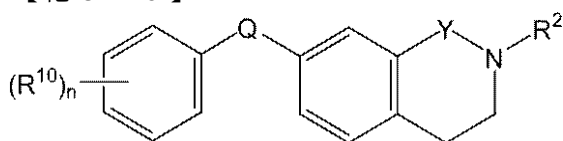
3-((3-フルオロピリジン-2-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]チアジン-4(3H)-オン

である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目25)

式Iの化合物は、式VI:

【化376】



VI

により表され、式VIにおいて、Q、YおよびR²は、項目1において定義されたとおりであり；

nは、0、1、2または3であり；そして

R¹⁰は、ハロ、-NO₂、CN、-SF₅、-Si(CH₃)₃、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-C(O)-R²⁰、-C(O)-OR²⁰

、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$ 、 $-N(R^{20})-S(O)_2-R^{22}$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ 、 $-S(O)_2-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_2\sim 4$ アルケニル、 $C_2\sim 4$ アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルであり；そして

ここで該 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_2\sim 4$ アルケニル、 $C_2\sim 4$ アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $C_1\sim 4$ アルキル、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されている、
項目1に記載の化合物。

(項目26)

R^2 は、 $-C_1\sim 6$ アルキレン- R^6 、 $-L-R^6$ または $-L-C_1\sim 6$ アルキレン- R^6 であり；ただし、 Y が $-C(R^5)_2-$ である場合、 R^2 は、 $-L-R^6$ または $-L-C_1\sim 6$ アルキレン- R^6 であり；

L は、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ または $-C(O)NR^{20}-$ であり；

R^6 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールまたはヘテロシクリルであり；

ここで該ヘテロアリールまたはヘテロシクリルは、独立して $C_1\sim 6$ アルキル、ハロ、 $-C(O)-OR^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

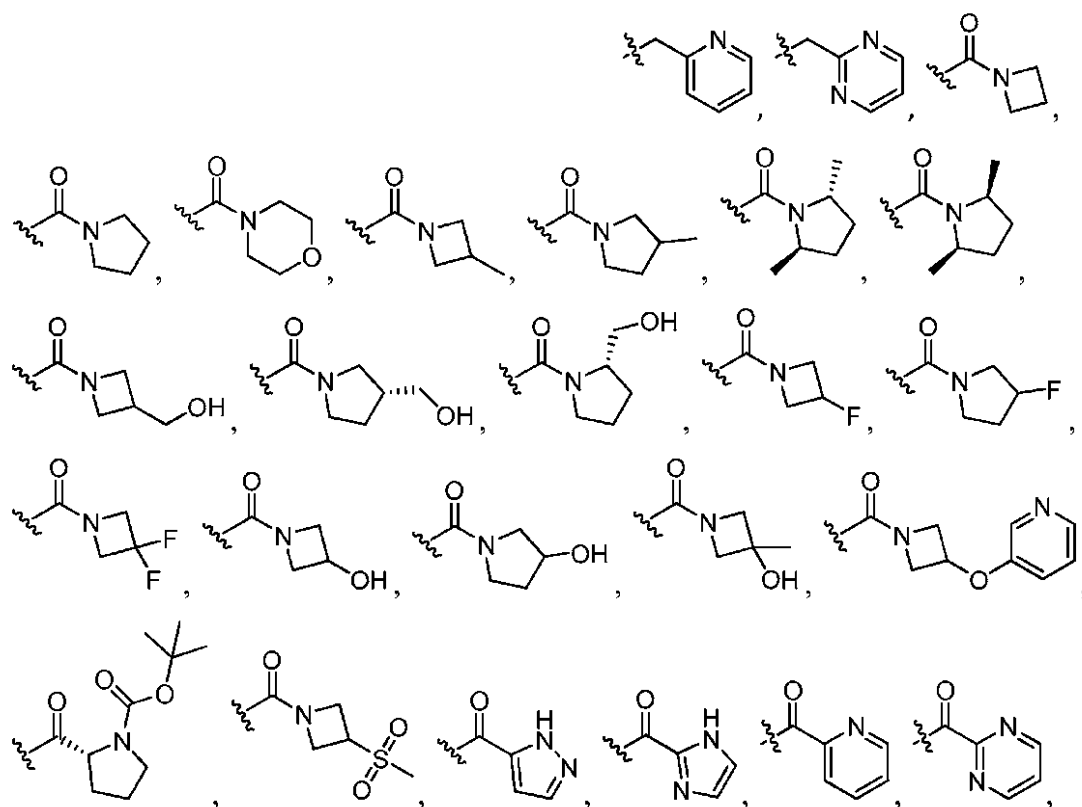
ここで該 $C_1\sim 6$ アルキルは、独立してアリール、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されている、

項目25に記載の化合物。

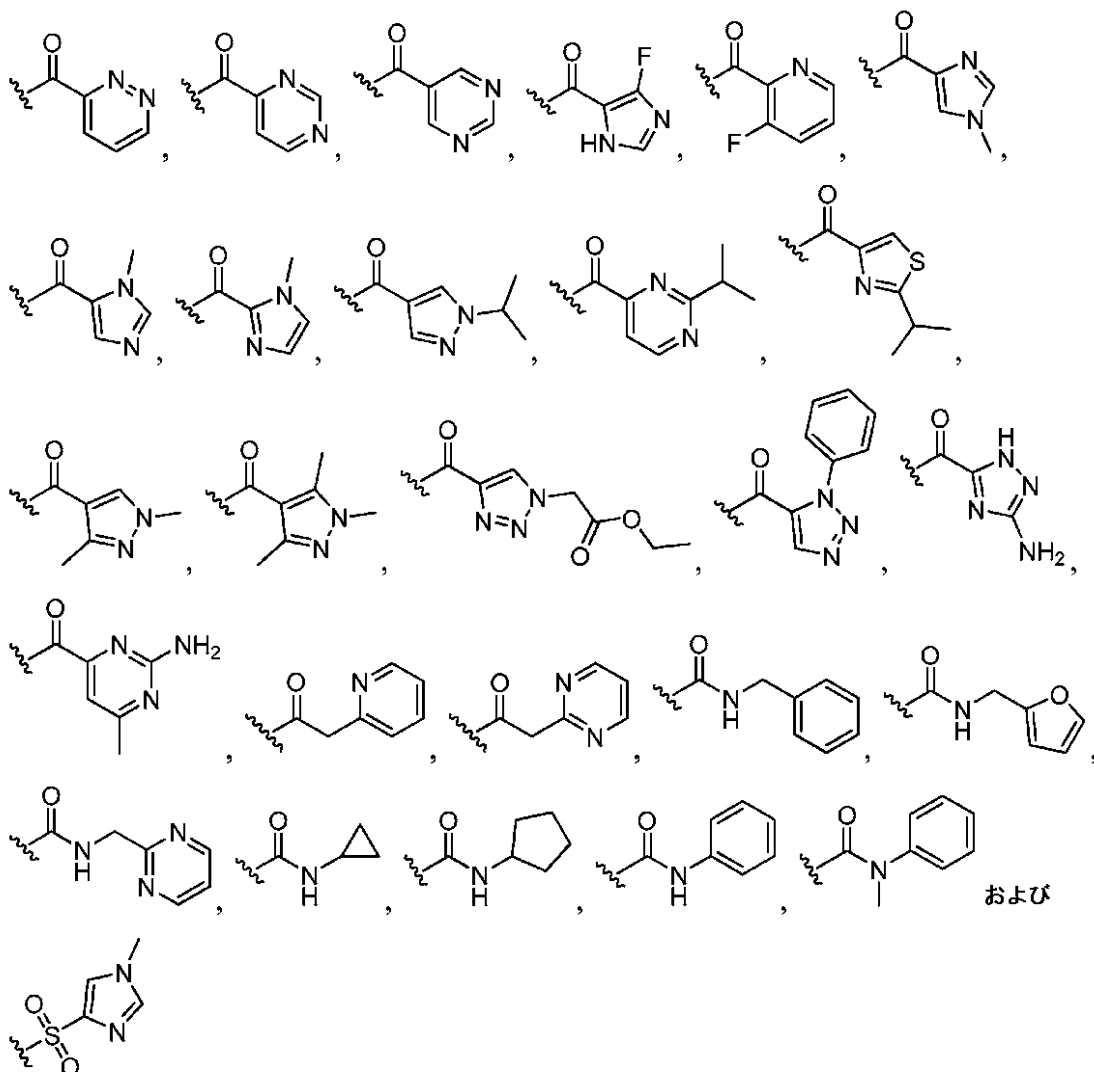
(項目27)

R^2 は

【化377】



【化 3 7 8】



である、項目25に記載の化合物。

(項目 2 8)

各R¹⁰は、クロロ、フルオロ、トリフルオロメチルまたはトリフルオロメトキシである、項目25に記載の化合物。

(項目 2 9)

前記化合物は、

2-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1(2H)-オン

2-(ピリジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1(2H)-オン

2-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1(2H)-オン

2-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-((4-(トリフルオロメチル)フェニル)エチニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1(2H)-オン

2-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)エチニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-1(2H)-オン

ピリジン-2-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

ピリミジン-2-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-

2(1H)-イル)メタノン

ピリミジン-2-イル(7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

ピリダジン-3-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(7-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(ピリミジン-2-イル)メタノン

(7-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(ピリミジン-2-イル)メタノン

(7-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(ピリミジン-2-イル)メタノン

(3-フルオロピリミジン-2-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)(1,3,5-トリメチル-1H-ピラゾール-4-イル)メタノン

(1-イソプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

2-(ピリミジン-2-イル)-1-(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)エタノン

2-(ピリミジン-2-イル)-1-(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)エタノン

(2-イソプロピルピリミジン-4-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

ピリミジン-4-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

ピリミジン-5-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(2-アミノ-6-メチルピリミジン-4-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(1H-ピラゾール-5-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

N-ベンジル-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

N-フェニル-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

N-シクロプロピル-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

N-(フラン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

N-メチル-N-フェニル-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

モルホリノ(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

ピロリジン-1-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(1-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒ

ドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(1H-イミダゾール-2-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(4-フルオロ-1H-イミダゾール-5-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

N-シクロペンチル-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

アゼチジン-1-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

N-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

(3-メチルピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-ヒドロキシピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-(ピリジン-3-イルオキシ)アゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-フルオロピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-フルオロアゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

2-(1-メチル-1H-イミダゾール-4-イルスルホニル)-7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン

(R)-(3-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(S)-(2-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-(メチルスルホニル)アゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

((2R,5R)-2,5-ジメチルピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

((2R,5S)-2,5-ジメチルピロリジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-メチルアゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-アミノ-1H-1,2,4-トリアゾール-5-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-ヒドロキシ-3-メチルアゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(3-(ヒドロキシメチル)アゼチジン-1-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

(R)-2-(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル)ピロリジン-1-カルボン酸tert-ブチル

(1-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-5-イル)(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3

,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

2-(4-(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-カルボニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)酢酸エチル

ピロリジン-1-イル(7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノン

N-(ピリミジン-2-イルメチル)-7-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-カルボキサミド

である、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目30)

前記化合物は、3-(ピリミジン-2-イルメチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-2H-ベンゾ[e][1,3]オキサジン-4(3H)-オンである、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目31)

前記化合物は、ピリミジン-2-イル(7-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル)メタノンである、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

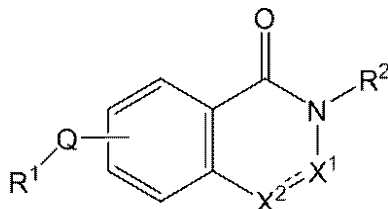
(項目32)

前記化合物は、3-((5-シクロプロピル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)-6-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ベンゾ[d][1,2,3]トリアジン-4(3H)-オンである、項目1に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、立体異性体、もしくは互変異性体。

(項目33)

式IB:

【化379】



IB

の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、エステル、水和物、溶媒和物、多形、および／もしくはプロドラッグであって、式IBにおいて:

点線は、任意の二重結合を表し;

R¹は、アリールまたはヘテロアリールであり;

ここで該アリールまたはヘテロアリールは、独立してハロ、-NO₂、CN、-SF₅、-Si(CH₃)₃、-O-CF₃、-O-R²⁰、-S-R²⁰、-C(O)-R²⁰、C(O)OH、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-N(R²⁰)-C(O)-R²²、-N(R²⁰)-S(=O)₂-R²⁶、-S(=O)₂-R²⁰、-S(=O)₂-N(R²⁰)(R²²)、C₁~₄アルキル、C₂~₄アルケニル、C₂~₄アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルからなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており;そして

ここで該アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、またはヘテロシクリルは、独立してハロ、-NO₂、-O-CF₃、-O-CHF₂、フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、C₁~₄アルキル、シクロアルキル、-N(R²⁰)(R²²)、-C(O)-R²⁰、-C(O)-O-R²⁰、-C(O)-N(R²⁰)(R²²)、-CN、および-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

R²は、水素、C₁~₁₅アルキル、C₁~₄アルコキシ、-C(O)-O-R²⁶、-C(O)-N(R²⁶)(R²⁸)、-

$N(R^{20})-S(=O)_2-R^{20}$ 、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロシクリルであり；

ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、およびヘテロシクリルは、独立してヒドロキシル、アルキル、アルコキシ、アルキニル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、オキソ、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-O-CF_3$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキルは、独立してヒドロキシル、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-O-CF_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、 $-S(O)_2-R^{20}$ および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；

Qは、共有結合または $C_2\sim 4$ アルキニレンであり；

X^1 はNであって X^2 はNであるか、 X^1 はNであって X^2 は CR^3 であるか、または X^1 は CH_2 であって X^2 は NR^4 であり；

R^3 は、水素、 $C_1\sim 15$ アルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロシクリルであり；

ここで該アルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1\sim 6$ アルキル、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；

R^4 は、水素、 $C_1\sim 15$ アルキル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、 $-C(O)-O-R^{26}$ 、 $-C(O)-N(R^{26})(R^{28})$ 、 $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{20}$ 、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、またはヘテロシクリルであり；

ここで該アルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており；

ここで該シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリールは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキル、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-OR^{20}$ 、 $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-CN$ 、および $-O-R^{20}$ からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており；そして

ここで該 $C_1\sim 6$ アルキル、ベンジル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、シクロアルキルは、独立してハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{20})(R^{22})$ 、 $-C(O)-R^{20}$ 、 $-C(O)-O-R^{20}$ 、 $-C(O)-$

N(R²⁰)(R²²)、-CN、および-O-R²⁰からなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じてさらに置換されており;

R²⁰およびR²²は、各例において独立して、水素、C₁~C₁₅アルキル、C₂~C₁₅アルケニル、C₂~C₁₅アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され;そして

ここで該アルキル、アルケニル、アルキニル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールは、独立してヒドロキシル、ハロ、C₁~₄アルキル、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミド、ヘテロアリールアミド、-NO₂、-SO₂R²⁶、-CN、C₁~₃アルコキシ、-CF₃、-OCF₃、-OCH₂CF₃、-C(O)-NH₂、アリール、シクロアルキル、およびヘテロアリールからなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

ここで該ヘテロアリールは、C₁~₄アルキル、またはシクロアルキルで必要に応じてさらに置換されているか;あるいは

R²⁰およびR²²が共通の窒素原子に結合している場合、R²⁰およびR²²は一緒になって、複素環式環またはヘテロアリール環を形成し得、該環は次いで、独立してヒドロキシル、ハロ、アルキル、ベンジル、フェニル、フェノキシ、ベンジルオキシ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルアミド、アリールアミド、ヘテロアリールアミド、-NO₂、-SO₂R²⁶、-CN、C₁~₃アルコキシ、-CF₃、-OCF₃、アリール、ヘテロアリールおよびシクロアルキルからなる群より選択される1個、2個、または3個の置換基で必要に応じて置換されており;

R²⁵は、各例において独立して、共有結合、または1個もしくは2個のC₁~C₃アルキル基で必要に応じて置換されたC₁~C₃アルキレンであり;そして

R²⁶およびR²⁸は、各例において独立して、水素、アルキル、およびシクロアルキルからなる群より選択され;そして

ここで該アルキル、フェニルおよびシクロアルキルは、独立してヒドロキシル、ハロ、C₁~₄アルコキシ、-CF₃、および-OCF₃からなる群より選択される1個~3個の置換基でさらに置換され得る、

化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、エステル、水和物、溶媒和物、多形、および/もしくはプロドラッグ。

(項目34)

項目1~33のいずれか1項に記載の化合物、および1種以上の薬学的に受容可能なキャリアを含有する、薬学的組成物。

(項目35)

哺乳動物において、遅延ナトリウム電流を減少させることが可能な剤での処置により軽減可能な疾患状態を処置する方法であって、その必要がある哺乳動物に、治療有効用量の項目1~33のいずれか1項に記載の化合物を投与する工程を包含する、方法。

(項目36)

前記疾患状態が、心房および心室の不整脈、心不全(うっ血性心不全、拡張期心不全、収縮期心不全、急性心不全が挙げられる)、プリンズメタル型(異型)狭心症、安定狭心症および不安定狭心症、運動誘発性狭心症、うっ血性心疾患、虚血、再発性虚血、再灌流傷害、心筋梗塞、急性冠状動脈症候群、末梢動脈疾患、肺高血圧症、ならびに間欠性跛行のうちの1つ以上から選択される心臓血管疾患である、項目35に記載の方法。

(項目37)

前記疾患状態が、糖尿病または糖尿病性末梢神経障害である、項目36に記載の方法。

(項目38)

前記疾患状態が、神経因性疼痛、癲癇、発作、または麻痺のうちの1つ以上をもたらす、項目36に記載の方法。

(項目39)

治療において使用するための、項目1~33のいずれか1項に記載の化合物。

(項目40)

心臓血管疾患を処置するための医薬の製造のための、項目1～33のいずれか1項に記載の化合物の使用。

(項目41)

項目1～33のいずれか1項に記載の化合物、さらなる活性薬剤、および1種以上のキャリアを含有する、組成物。