

【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6月24日 (2010.6.24)

【公表番号】特表2009-535316(P2009-535316A)

【公表日】平成21年10月1日 (2009.10.1)

【年通号数】公開・登録公報2009-039

【出願番号】特願2009-507001(P2009-507001)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/52 (2006.01)

C 0 7 F 7/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/52 C S P

C 0 7 F 7/10 S

A 6 1 K 31/403

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/10
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 3/06

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月30日(2010.4.30)

【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

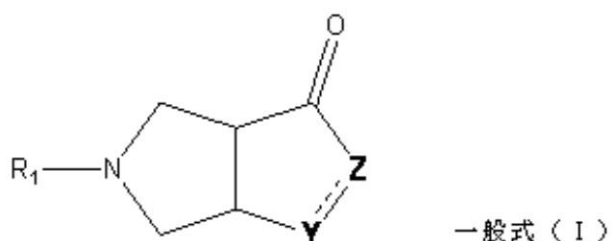
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合物。

【化 1】



式中、 R^1 は、水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基 (aliphatic radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクリル (cyclyl) 基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び/又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル (heterocyclyl) 基；任意で少なくとも一置換されたベンズヒドリル基； $(C=O)R^2$ 基； $(C=O)OR^3$ 基； $(SO_2)R^4$ 基； $(C=O)NR^5R^{5a}$ 基；トリメチルシリル基を表し；

YとZとの結合は、不飽和 ($Y=Z$) もしくは飽和 ($Y-Z$) でもよい；

YとZが ($Y=Z$) の場合、YはCHを表し、ZはC R^6 ；C CHR^7R^{7a} ；C $(C=O)R^8$ 基；C $CH_2(SO_2)R^9$ 基；C $CH_2(SO_2)NR^{10}$ 基；もしくはC $(C=O)NR^{10}R^{10a}$ 基を表し；

YとZが ($Y-Z$) の場合、YはCH₂；C $R^{11}R^{12}$ ；CH $(C=O)R^6$ 基；CH $(SO_2)R^{17}$ 基；CH $(SO_2)NR^{18}R^{18a}$ 基；もしくはCH $(C=O)NR^{18}R^{18a}$ 基を表し、ZはCH R^6 ；CH CHR^7R^{7a} ；CH $(C=O)R^8$ 基；CH $CH_2(SO_2)R^9$ 基；CH $CH_2(SO_2)NR^{10}R^{10a}$ 基；もしくはCH $(C=O)NR^{10}R^{10a}$ 基を表し；

R¹⁰ 及び R^{10a} は、同一又は異なり、水素原子；直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基 (alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び/又はシクロアルキル基が任意で

少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表し；並びに

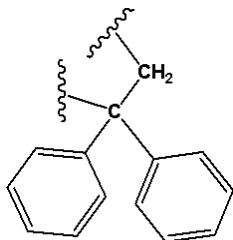
R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なり、水素原子；直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基 (alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び/又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基； (SO_2) R^{13} 基； $NR^{14}R^{15}$ 基を表し；

R^{18} 及び R^{18a} は、同一又は異なり、水素原子；直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基 (alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び/又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表し；

ただし、YとZが $(CH=CH)$ の場合、 R^1 はベンジル基を表さない；

YとZが下記式を表す場合、

【化2】



R^1 は $(C=O)O$ t ブチル基、又は、1 (2 メトキシフェニル) エタン 2 オン 2 イル基ではない、並びに、

YとZが (CH_2-CH_2) の場合、 R^1 は水素原子；分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和脂肪族基；シクロアルキル基；非置換ベンジル基；アルキル シクロアルキル基；置換された不飽和環系で任意に縮合される置換されたアリール基； $(C=O)O$ ベンジル基を表さない。

【請求項2】

一般式(I)で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合物は、立体異性体の1つの形態、ラセミ化合物、もしくは、任意の混合比率の少なくとも2つの立体異性体の混合物の形態、その塩、又はその溶媒化合物である請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 は、水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基 (aliphatic radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル (heterocyclyl) 基；任意で少なくとも一置換されたベンズヒドリル基；(C=O) R^2 基；(C=O) OR³ 基；(SO₂) R^4 基；(C=O) NR⁵ R^{5a} 基を表し；

Y と Z との結合は、不飽和 (Y = Z) であり；

Y は CH を表し、Z は C R^6 ；C CHR⁷ R^{7a} ；C (C=O) R^8 基；C CH₂ (SO₂) R^9 基；C CH₂ (SO₂) NR¹⁰ R^{10a} 基；もしくは C (C=O) NR¹⁰ R^{10a} 基を表し；並びに

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{5a} , R^6 , R^7 , R^{7a} , R^8 , R^9 , R^{10} 及び R^{10a} は請求項 1 に記載の意味を有し；

ただし、Z が CH 基を表す場合、

R^1 はベンジル基を表さない請求項 1 及び 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 は、水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基 (aliphatic radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基；任意で少なくとも一置換されたベンズヒドリル基；(C=O) R^2 基；(C=O) OR³ 基；(SO₂) R^4 基；(C=O) NR⁵ R^{5a} 基を表し；

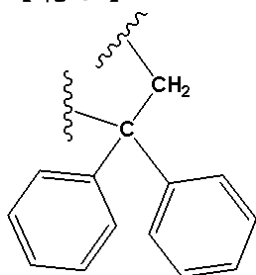
Y と Z との結合は、飽和 (Y - Z) であり；

Y は CH₂, C R^{11} R^{12} , CH (C=O) R^{16} 基；CH (SO₂) R^{17} 基；CH (SO₂) NR¹⁸ R^{18a} 基；CH (C=O) NR¹⁸ R^{18a} 基；及び Z は CH R^6 ；CH CHR⁷ R^{7a} ；CH (C=O) R^8 基；CH C H₂ (SO₂) R^9 基；CH CH₂ (SO₂) NR¹⁰ R^{10a} 基；もしくは CH (C=O) NR¹⁰ R^{10a} 基を表し；

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{5a} , R^6 , R^7 , R^{7a} , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{10a} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} 及び R^{18a} は請求項 1 に記載の意味を有し；

ただし、Y と Z が下記式を表す場合、

【化 3】



R^1 は (C=O) O t ブチル基、又は、1 (2 メトキシフェニル) エタン
2 オン 2 イル基ではない、並びに、

Y と Z が (CH₂ CH₂) の場合、 R^1 は水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和脂肪族基；シクロアルキル基；非置換ベンジル基；アルキル シクロアルキル基；置換不飽和環系で縮合されてもよい置換されたアリール基；又は (C=O) O ベンジル基を表さない請求項 1 及び 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 は、水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基 (aliphatic radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意で縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基；任意で少なくとも一置換されたベンズヒドリル基；(C=O) R² 基；(C=O) OR³ 基；(SO₂) R⁴ 基；(C=O) NR⁵ R^{5a} 基を表し；

Y と Z との結合は、不飽和 (Y = Z) であり；

Y は CH を表し、Z は C R⁶；C CHR⁷ R^{7a}；C (C=O) R⁸ 基；C CH₂ (SO₂) R⁹ 基；C CH₂ (SO₂) NR¹⁰ R^{10a} 基；もしくは C (C=O) NR¹⁰ R^{10a} 基を表し；

R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁷, R^{7a}, R⁸, R⁹, R¹⁰ 及び R^{10a} は、請求項 1 に記載の意味を有し；並びに

R⁶ は、直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表す請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 は、水素原子；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基 (aliphatic radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置

換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基；任意で少なくとも一置換されたベンズヒドリル基；(C=O) R² 基；(C=O) OR³ 基；(SO₂) R⁴ 基；(C=O) NR⁵ R^{5a} 基を表し；

YとZとの結合は、飽和(Y Z)であり；

YはCH₂；C R¹¹ R¹²，CH (C=O) R¹⁶ 基；CH (SO₂) R¹⁷ 基；CH (SO₂) NR¹⁸ R^{18a} 基；もしくはCH (C=O) NR¹⁸ R^{18a} 基；及びZはCH R⁶；CH CHR⁷ R^{7a}；CH (C=O) R⁸ 基；CH CH₂ (SO₂) R⁹ 基；CH CH₂ (SO₂) NR¹⁰ R^{10a} 基；もしくはCH (C=O) NR¹⁰ R^{10a} 基を表し；

R²，R³，R⁴，R⁵，R^{5a}，R⁷，R^{7a}，R⁸，R⁹，R¹⁰，R^{10a}，R¹¹，R¹²，R¹³，R¹⁴，R¹⁵，R¹⁶，R¹⁷，R¹⁸ 及びR^{18a}は、請求項1に記載の意味を有し；

R⁶は、直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクリル基、シクリル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；アルキル基及び/又はシクロアルキル基が任意で少なくとも一置換された分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表し；並びに

R¹¹ 及びR¹²は、同一又は異なり、水素原子；直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基(alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクロアルキル基、シクロアルキル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアリール基；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたヘテロアリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基；(SO₂) R¹³ 基；NR¹⁴ R¹⁵ 基を表し；R¹¹ 及びR¹²は同時にフェニル基を表さない、又は同時に水素原子を表さない請求項1、2及び4のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

R¹は、水素原子；C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F，Cl，I，Br，CF₃，CH₂F，CHF₂，CN，OH，SH，NH₂，(C=O)R'，SR'，SOR'，SO₂R'，NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR' 及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状C₁₋₆アルキル基；C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F，Cl，I，Br，CF₃，CH₂F，CHF₂，CN，OH，SH，NH₂，(C=O)R'，SR'，SOR'，SO₂R'，NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR' 及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換され、及びC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F，Cl，I，Br，

CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい飽和もしくは不飽和シクロアルキル基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 $\text{N}(\text{C}=\text{O})\text{O}$ t ブチル基、任意で、 F , Cl , I , Br もしくは CF_3 置換フェニル基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及び C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアリール基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及び C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいヘテロアリール基; アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が、 C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基; アルキル基及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が、他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基; アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が、 C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(\text{C}=\text{O})\text{R}'$, SR' , SOR' , $\text{SO}_2\text{R}'$, NHR' 及び $\text{NR}'\text{R}''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換され、及びヘテロシクリル基が、他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基; 任意で、少なくとも一置換されたベンズヒドリル基; $(\text{C}=\text{O})\text{R}^2$ 基; $(\text{C}=\text{O})\text{OR}^3$ 基; $(\text{SO}_2)\text{R}^4$ 基; $(\text{C}=\text{O})\text{NR}^5\text{R}^{5a}$ 基を表し;
 Y と Z との結合は、不飽和 ($\text{Y}=\text{Z}$) であり;
 Y は CH を表し、 Z は $\text{C}-\text{R}^6$; $\text{C}-\text{CHR}^7\text{R}^{7a}$; $\text{C}(\text{C}=\text{O})-\text{R}^8$ 基; $\text{C}-\text{CH}_2(\text{SO}_2)-\text{R}^9$ 基; $\text{C}-\text{CH}_2(\text{SO}_2)-\text{NR}^{10}\text{R}^{10a}$ 基; もしくは C

(C=O) NR¹⁰R^{10a}基を表し；
 R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁷, R^{7a}, R⁸, R⁹, R¹⁰及びR^{10a}は、請求項1に記載の意味を有し；並びに
 R⁶は、請求項5に記載の意味を有する請求項1から3及び5のいずれかに記載の化合物。

【請求項8】

R¹は、C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状C₁₋₆アルキル基；C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換され、及びC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい飽和もしくは不飽和シクロアルキル基；C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、N (C=O)O^tブチル基、任意で、F, Cl, I, BrもしくはCF₃置換フェニル基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換され、及びC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアリール基；C₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換され、及びC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される置換基により任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいヘテロアリール基；アルキル基及び/又はシクロアルキル基がC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及びNR'R'' (各置換基のR'及び任意でR''は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルキル基を表す。)からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキルシクロアルキル基；アルキル基及び/又はアリール基がC₁₋₄アルキル基、直鎖もしくは分岐状C₁₋₆アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, C

N , OH , SH , NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基; アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換され、及びヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合されてもよい分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基; 任意で、少なくとも一置換されたベンズヒドリル基; $(C=O)R^2$ 基; $(C=O)OR^3$ 基; $(SO_2)R^4$ 基; $(C=O)NR^5R^{5a}$ 基を表し;

Y と Z との結合は、飽和 ($Y-Z$) であり;

Y は $C(R^{11}R^{12})$ 基; $CH(C=O)R^{16}$ 基; $CH(SO_2)R^{17}$ 基; $CH(SO_2)NR^{18}R^{18a}$ 基; もしくは $CH(C=O)NR^{18}R^{18a}$ 基; 及び Z は $CH(R^6)$; $CHCHR^7R^{7a}$; $CH(C=O)R^8$ 基; $CHCH_2(SO_2)R^9$ 基; $CHCH_2(SO_2)NR^{10}R^{10a}$ 基; もしくは $CH(C=O)NR^{10}R^{10a}$ 基を表し;

R^6 , R^{11} 及び R^{12} は、請求項 6 に記載の意味を有し; 並びに

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{5a} , R^7 , R^{7a} , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{10a} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} 及び R^{18a} は、請求項 1 に記載の意味を有する請求項 1、2、4 及び 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

R_2 , R_3 , 及び R_4 は、水素原子; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される非分岐もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基; アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が、 C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基; アルキル基及び / 又はアリール基が、 C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH , NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基を表す請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

R^5 及び R^{5a} は、同一又は異なり、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される非分岐もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基を表す請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

R^7 及び R^{7a} は、同一又は異なり、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F、Cl、I、Br、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、CN、OH、SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換される分

岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基
を表す請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 2】

R^8 , R^9 , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} 及び R^{17} は、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される非分岐もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び / 又はシクルアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アルキル基及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基

を表す請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 3】

R^{10} 及び R^{10a} は、同一又は異なり、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F , Cl , I , Br , CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN , OH , SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基に

より任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アルキル基及び／又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び／又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基を表す請求項1から8のいずれかに記載の化合物。

【請求項14】

R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なり、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び／又はシクロアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アルキル基及び／又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び／又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基； (SO_2) R^{13} 基；又は $NR^{14}R^{15}$ 基を表し；ただし、 R^{11} 及び R^{12} は同時にフェニル基を表さない、又は同時に水素原子を表さない請求項1から8のいずれかに記載の化合物。

【請求項15】

R^{18} 及び R^{18a} は、同一又は異なり、水素原子； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルコキシ基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される飽和もしくは不飽和シクロアルキル基； C_{1-4} アルキル基、

直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるヘテロアリール基；アルキル基及び / 又はシクロアルキル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状アルキル シクロアルキル基；アルキル基及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；アルキル基及び / 又はヘテロシクリル基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により置換される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和アルキル ヘテロシクリル基を表す請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 16】

R^1 は、アルキル及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 、 NH_2 、 $(C=O)R'$ 、 SR' 、 SOR' 、 SO_2R' 、 NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるベンズヒドリル基；

Y と Z との結合は、不飽和 ($Y=Z$) であり；

Y は CH を表し、 Z は $C-R^6$ 基を表し；並びに

R^6 は F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、任意で少なくとも一置換されたフェニル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 、 NH_2 、 $(C=O)R'$ 、 SR' 、 SOR' 、 SO_2R' 、 $N(C=O)OR'$ 、 NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基；アルキル及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 、 NH_2 、 $(C=O)R'$ 、 SR' 、 SOR' 、 SO_2R' 、 NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基を表す請求項 1 から 3、5 及び 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 17】

R^1 は、アルキル及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、 F 、 Cl 、 I 、 Br 、 CF_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CN 、 OH 、 SH 、 NH_2 、 $(C=O)R'$ 、 SR' 、 SOR' 、 SO_2R' 、 NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置

換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基； C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SHからなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるベンズヒドリル基を表し；

YとZとの結合は、飽和(Y-Z)であり；

Yは CH_2 ； $C-R^{11}R^{12}$ を表し、及びZは $CH-R^6$ を表し；

R^6 はF, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH及び NH_2 からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基； C_{1-4} アルキル基、任意で少なくとも一置換されたフェニル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , $N(C=O)OR'$, NHR' 及び $NR'R''$ （各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。）からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基；アルキル及び/又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ （各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。）からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるアルキルアリール基を表し；並びに

R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なり、直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基(alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも1つのヘテロ原子を環員として含むシクロアルキル基、シクロアルキル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアリール基；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアルキルアリール基；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたヘテロアリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキルヘテロシクリル基を表し；ただし、 R^{11} 及び R^{12} は同時にフェニル基を表さない、又は同時に水素原子を表さない請求項1、2、4、6及び8のいずれかに記載の化合物。

【請求項18】

R^1 は、アルキル基及び/又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ （各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。）からなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキルアリール基；

C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SHからなる群より独立して選択される1つ以上の置換基により任意で置換されるベンズヒドリル基；

YとZとの結合は、飽和(Y-Z)であり；Yは CH_2 ； $C-R^{11}R^{12}$ を表し、及びZは $CH-R^6$ を表し；又は

YとZとの結合は、不飽和(Y=Z)であり；YはCHを表し、及びZは $C-R^6$ 基を表し；

R^6 は、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基；

C_{1-4} アルキル基、任意で少なくとも一置換されたフェニル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , $N(C=O)OR'$, NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくはアリール基；

アルキル及び/又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基；又は

トリメチルシリルを表し；並びに

R^{11} 及び R^{12} は、それぞれ独立して、水素、直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基；非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基 (alkoxy radical)；飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクロアルキル基、シクロアルキル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアリール基；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基；任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたヘテロアリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表し；ただし、 R^{11} 及び R^{12} は同時にフェニル基を表さない

請求項 1 および 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 19】

R^1 は、アルキル基及び/又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基；

C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるベンズヒドリル基；

Y と Z との結合は、飽和 (Y-Z) であり；Y は CH_2 ；C $R^{11}R^{12}$ を表し、及び Z は $CH-R^6$ を表し；又は

Y と Z との結合は、不飽和 (Y=Z) であり；Y は CH を表し、及び Z は C R^6 基を表し；

R^6 は、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基；

C_{1-4} アルキル基、任意で少なくとも一置換されたフェニル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH

, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', N(C=O)OR', NHR' 及び NR'R" (各置換基の R' 及び任意で R" は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C₁₋₆ アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基;

アルキル及び/又はアリール基が C₁₋₄ アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C₁₋₆ アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF₃, CH₂F, CHF₂, CN, OH, SH, NH₂, (C=O)R', SR', SOR', SO₂R', NHR' 及び NR'R" (各置換基の R' 及び任意で R" は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C₁₋₆ アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキル アリール基; 又は
トリメチルシリルを表し;

R^{1 1} は水素を表し; 並びに

R^{1 2} は、水素; 直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された C₁₋₆ 脂肪族基; 非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された C₁₋₆ アルコキシ基 (alkoxy radical); 飽和もしくは一価不飽和、任意で少なくとも一置換された C₄₋₈ シクロアルキル基; 飽和もしくは一価不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキル C₄₋₈ シクロアルキル基; 任意で少なくとも一置換されたアリール基; 任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基; 任意で少なくとも一置換されたヘテロアリール基; 任意で少なくとも一置換されたアルキル ヘテロシクリル基を表す請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

下記 [1] ~ [38] からなる群より選択される請求項 1 および 2 のいずれかに記載の化合物。

[1] 2 ベンジル 5 フェニル (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[2] 5 フェニル 2 ((S) 1 フェニルエチル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[3] 2 (4 メトキシベンジル) 5 フェニル (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[4] 2 ベンジル 5 (4 フルオロフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[5] 2 ベンジル 5 (4 エチルフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[6] 2 ベンジル 5 (2 クロロフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[7] 2 ベンジル 5 (4 クロロフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[8] 2 ベンジル 5 (3 クロロフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[9] 2 ベンジル 5 (4 メトキシフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[10] 2 ベンジル 5 (ピフェニル 4 イル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[11] 2 ベンジル 5 (4 t ブチルカルバメートフェニル) (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[12] 2 ベンジル 5 ブチル (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

[13] 2 ベンズヒドリル 5 フェニル (3a, 6a シス) 1, 2, 3, 3a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6a H) オン、

- [1 4] 2, 5 ジベンジル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6 a H) オン、
- [1 5] 2 (4 フルオロベンジル) 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6 a H) オン、
- [1 6] 2 ベンジル 5 (トリメチルシリル) (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6 a H) オン、
- [1 7] 2 ベンジル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6 a H) オン、
- [1 8] 2 ベンジル 5 t ブチル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (6 a H) オン、
- [1 9] 2 ベンジル 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 0] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 メチル 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a テトラヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (1 H, 2 H, 5 H) オン、
- [2 1] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 ブチル 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 2] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 エチル 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 3] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 イソプロピル 5 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 4] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 フェニル 6 プロピル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 5] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 エチル 5 (4 フルオロフェニル) (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 6] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 (4 フルオロフェニル) 6 プロピル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 7] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 6 ブチル 5 (4 フルオロフェニル) (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 8] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 (4 フルオロフェニル) 6 メチル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [2 9] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5, 6 ジブチル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [3 0] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 ブチル 6 エチル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [3 1] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 ブチル 6 メチル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H) オン、
- [3 2] ((R, S) 5, 6) 2 ベンジル 5 ブチル 6 フェニル (3 a, 6 a シス) 1, 2, 3, 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5

H) オン、

[3 3] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 5 (4 クロロフェニル) 6
メチル (3 a , 6 a シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピ
ロール 4 (5 H) オン、

[3 4] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 5 (4 フルオロフェニル) 6
フェニル (3 a , 6 a シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c]
] ピロール 4 (5 H) オン、

[3 5] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 5 , 6 ジフェニル (3 a , 6 a
シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c] ピロール 4 (5 H)
オン、

[3 6] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 6 (3 , 5 ジメチルフェニル)
5 フェニル (3 a , 6 a シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ
[c] ピロール 4 (5 H) オン、

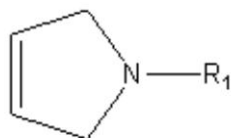
[3 7] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 6 (4 メトキシフェニル) 5
フェニル (3 a , 6 a シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c]
] ピロール 4 (5 H) オン、又は

[3 8] ((R , S) 5 , 6) 2 ベンジル 5 (4 クロロフェニル) 6
フェニル (3 a , 6 a シス) 1 , 2 , 3 , 3 a ヘキサヒドロシクロペンタ [c]
] ピロール 4 (5 H) オン。

【請求項 21】

一般式 (II) で表される置換ピロリン化合物を反応させることにより一般式 (I) で表
される置換二環式テトラヒドロピロール化合物を調製する方法であって、一般式 (II) で
表される置換ピロリン化合物が一般式 (III) で表される化合物と反応して、一般式 (I
a) で表される化合物を得る置換二環式テトラヒドロピロール化合物を調製する方法；

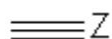
【化 4】



一般式 (II)

一般式 (II) 中、R¹ は請求項 1 に記載の意味を有し、

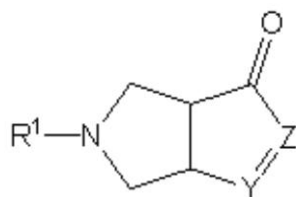
【化 5】



一般式 (III)

一般式 (III) 中、Z は CH R⁶ 基；CH CHR⁷ R^{7a} 基；CH (C=O)
R⁸ 基；CH CH₂ (SO₂) R⁹ 基；CH CH₂ (SO₂) NR¹⁰ R^{10a}
基；もしくは CH (C=O) NR¹⁰ R^{10a} 基を表し；

【化 6】



一般式 (I a)

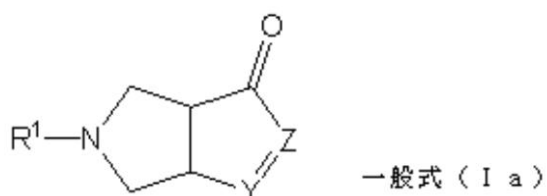
一般式 (I a) 中、Y と Z との結合は、不飽和 (Y = Z) であり、Y は CH 基を表し、
Z は請求項 1 に記載の意味を有する。

【請求項 22】

一般式 (I a) で表される置換ピロリン化合物を反応させることにより一般式 (I b)
で表される化合物を得る、一般式 (I) で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合

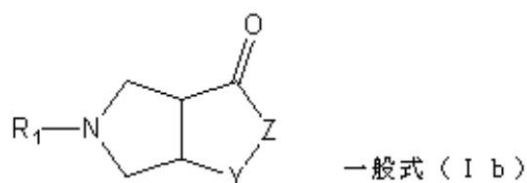
物を調製する方法；

【化 7】



一般式 (I a) 中、 R^1 は請求項 1 に記載の意味を有し、 Z は $CH(R^6)$ 基； $CH_2C(H)R^7R^{7a}$ 基； $CH(C=O)R^8$ 基； $CH_2CH_2(SO_2)R^9$ 基； $CH_2(SO_2)NR^{10}R^{10a}$ 基；もしくは $CH(C=O)NR^{10}R^{10a}$ 基を表し、 Y は CH 基を表し、

【化 8】



一般式 (I b) 中、 R^1 は請求項 1 に記載の意味を有し、 Y と Z が飽和結合 ($Y-Z$) を形成し、 Y は CH_2 基； $C(R^{11})R^{12}$ 基； $CH(C=O)R^{16}$ 基； $CH(SO_2)R^{17}$ 基； $CH(SO_2)NR^{18}R^{18a}$ 基；又は $CH(C=O)NR^{18}R^{18a}$ 基を表す。

【請求項 23】

請求項 1 から 18 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの一般式 (I) で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合物を含む薬剤又はそのプロドラッグ。

【請求項 24】

一般式 (I) で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合物は、立体異性体の 1 つの形態、ラセミ化合物、もしくは、任意の混合比率の少なくとも 2 つの立体異性体の混合物の形態、その塩、又はその溶媒化合物である請求項 23 に記載の薬剤。

【請求項 25】

請求項 1 から 18 のいずれかに記載の一般式 (I) で表される置換二環式テトラヒドロピロール化合物を含むことを特徴とするシグマ受容体を介する疾患もしくは病気の治療又は予防用薬剤。

【請求項 26】

シグマ受容体を介する疾患もしくは病気がアルツハイマー病である請求項 25 に記載のシグマ受容体を介する疾患もしくは病気の治療又は予防用薬剤。

【請求項 27】

シグマ受容体を介する疾患もしくは病気が、下痢、リポタンパク質異常 (lipoprotein disorders)、片頭痛、肥満症、関節炎、高血圧、不整脈、潰瘍、学習障害、記憶障害、注意欠陥、認知障害、神経変性疾患、脱髄疾患；コカイン、アンフェタミン、エタノール及びニコチン等の薬物及び化学物質中毒；遅発性ジスキネジア、虚血性脳梗塞、てんかん、発作、ストレス、癌、又は精神障害状態、特に、うつ病、不安神経症、精神病、統合失調症；炎症、又は自己免疫疾患である請求項 25 に記載のシグマ受容体を介する疾患もしくは病気の治療又は予防用薬剤。

【請求項 28】

シグマ受容体を介する疾患もしくは病気が、トリグリセリド値上昇、カイロミクロン血症、異常リポタンパク血症、高リポタンパク血症、高脂血症、混合型高脂血症、高コレステロール血症、リポタンパク質異常、高トリグリセリド血症、散発性高トリグリセリド血症、遺伝性高トリグリセリド血症、及び / 又は異常リポタンパク血症からなる群より

選択される疾患である請求項 25 に記載のシグマ受容体を介する疾患もしくは病気の治療又は予防用薬剤。

【請求項 29】

シグマ受容体を介する疾患もしくは病気が、痛みである請求項 25 に記載のシグマ受容体を介する疾患もしくは病気の治療又は予防用薬剤。

【請求項 30】

薬理学的ツールとしての請求項 1 から 18 のいずれかに記載される一般式 (I) で表される化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0048

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0048】

更に、本発明の非常に好適な実施形態は、上記一般式 (I) で表される化合物であり、式中、 R^1 は、アルキル及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換され、及びアリール基が他の任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよいアルキル アリール基; C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるベンズヒドリル基を表し;

Y と Z との結合は、飽和 (Y-Z) であり;

Y は CH_2 ; $C-R^{11}R^{12}$ を表し、及び Z は $CH-R^6$ を表し;

R^6 は F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH 及び NH_2 からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換される分岐もしくは非分岐状 C_{1-6} アルキル基; C_{1-4} アルキル基、任意で少なくとも一置換されたフェニル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , $N(C=O)OR'$, NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアリール基; アルキル及び / 又はアリール基が C_{1-4} アルキル基、直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルコキシ基、F, Cl, I, Br, CF_3 , CH_2F , CHF_2 , CN, OH, SH, NH_2 , $(C=O)R'$, SR' , SOR' , SO_2R' , NHR' 及び $NR'R''$ (各置換基の R' 及び任意で R'' は、それぞれ独立して直鎖もしくは分岐状 C_{1-6} アルキル基を表す。) からなる群より独立して選択される 1 つ以上の置換基により任意で置換されるアルキルアリール基を表し; 並びに

R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なり、直鎖もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された脂肪族基; 非分岐もしくは分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルコキシ基 (alkoxy radical); 飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換された任意で少なくとも 1 つのヘテロ原子を環員として含むシクロアルキル基、シクロアルキル基は任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい; 任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアリール基; 任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたアルキル アリール基; 任意で少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で

縮合されてもよい任意で少なくとも一置換されたヘテロアリール基；ヘテロシクリル基が他の少なくとも一置換された単環式もしくは多環式環系で任意に縮合される分岐もしくは非分岐状、飽和もしくは不飽和、任意で少なくとも一置換されたアルキルヘテロシクリル基を表し；ただし、 R^{11} 及び R^{12} は同時にフェニル基を表さない、又は同時に水素原子を表さない；

任意で、立体異性体、好ましくは鏡像異性体もしくはジアステレオ異性体、の1つの形態、ラセミ化合物、もしくは、任意の混合比率の少なくとも2つの立体異性体、好ましくは鏡像異性体及び/又はジアステレオ異性体、の混合物の形態、その塩、又はその溶媒化合物である。