

【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7月29日 (2010.7.29)

【公表番号】特表2009-539833(P2009-539833A)

【公表日】平成21年11月19日 (2009.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-046

【出願番号】特願2009-514233(P2009-514233)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 1/10 (2006.01)

A 61 P 25/32 (2006.01)

A 61 P 25/34 (2006.01)

A 61 P 25/36 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

C 07 D 451/02 (2006.01)

A 61 K 31/439 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14 C S P

A 61 P 25/04

A 61 P 25/28

A 61 P 25/18

A 61 P 25/24

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 25/06

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 P 25/00

A 61 P 25/16

A 61 P 25/14

A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 1/10
 A 6 1 P 25/32
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 K 31/454
 C 0 7 D 451/02
 A 6 1 K 31/439

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月4日(2010.6.4)

【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

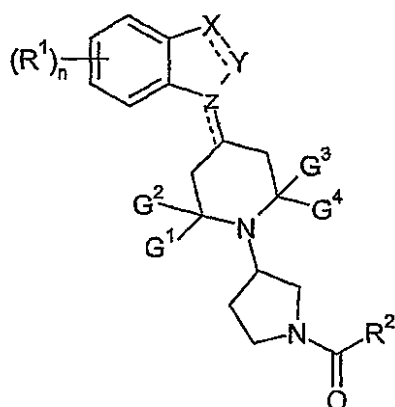
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I A :

【化 1】



IA

の化合物、その医薬上許容しうる塩、ジアステレオマー、鏡像異性体、またはそれらの混合物。

式中、

R¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、- CN、- C(=O) - OR、- C(=O) - NR₂、ヒドロキシ、C₁ - 6 アルコキシ、トリフルオロメチル、FCH₂ -、F₂CH -、CHF₂O -、CF₃O -、C₆ - 10 アリール、および C₂ - 9 ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R² は、水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリ

ールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{2-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール - C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリーール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリーール - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{6-10} アリーール、 C_{6-10} アリーールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{2-9} ヘテロアリーールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリーール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリーール - C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリーール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリーール - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p$ 、 $-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、 H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；

n は、1、2、3 または 4 であり；

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルであり；そして

X 、 Y および Z は、 $C(=O)$ 、 NH 、 $N-CH_3$ 、 N 、 C 、 CH_2 、および CH から独立して選ばれ、ここにおいて X 、 Y および Z の少なくとも 1 つは、 NH 、 $N-CH_3$ および N から選ばれ；ここにおいて X 、 Y および Z の多くとも 1 つが $C(=O)$ であり；そしてここにおいて Z は、 $C(=O)$ ではない。

【請求項 2】

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシは、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシおよび $-CN$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^2 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{4-6} ヘテロアリーールおよびベンジルオキシから選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 は、水素、ハロゲン、メチル、エチル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、 $-CO_2CH_3$ 、 $-CO_2H$ 、ヒドロキシル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CHF_2O- 、および CF_3O- から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

Z は、 N 、 C および CH から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

Y は、N および C (= O) から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

X は、CH₂、NH および N - CH₃ から選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

G¹、G²、G³ および G⁴ は、- H およびメチルから独立して選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

G¹、G²、G³ および G⁴ は、- H である、請求項 1 に記載の化合物。

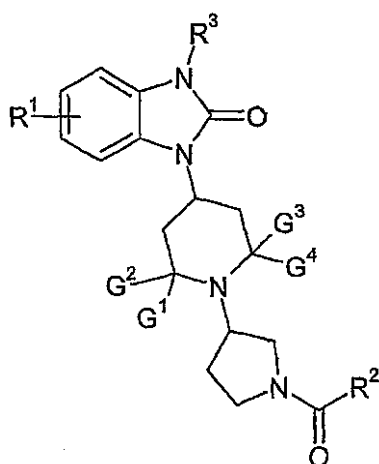
【請求項 10】

G² および G³ は、一緒に連結してエチレンを形成し、そして G¹ および G⁴ は、- H およびメチルから独立して選ばれる、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

式IIA：

【化 2】



IIA

の化合物、その医薬上許容しうる塩、ジアステレオマー、鏡像異性体、またはそれらの混合物。

式中、

R¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、- CN、- C (= O) - OR、- C (= O) - NR₂、ヒドロキシ、C₁ - 6 アルコキシ、トリフルオロメチル、FCH₂-、F₂CH-、CHF₂O-、CF₃O-、C₆ - 10 アリール、および C₂ - 9 ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R² は、水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 9 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキルオキシ、および C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ

、 C_{2-9} ヘテロアリーール - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p$ 、 $-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

R^3 は、 H または C_{1-4} アルキルであり；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、 H およびメチルから独立して選ばれる；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 の 2 つは、一緒になって連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれる；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである。

【請求項 12】

式IIAの R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CF_3O- 、および CHF_2O- から独立して選ばれる、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

式IIAの R^1 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、メトキシおよび C_{1-3} アルキルから選ばれる、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 14】

式IIAの R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシから選ばれる、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリーール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシは、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシおよび $-CN$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項 11 に記載の化合物。

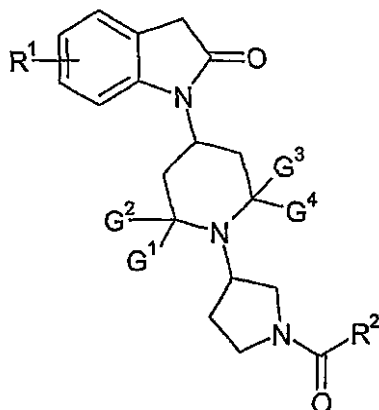
【請求項 15】

式IIAの R^2 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{4-6} ヘテロアリーールおよびベンジルオキシから選ばれる、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 16】

式IIIA：

【化 3】



IIIA

の化合物、その医薬上許容しうる塩、ジアステレオマー、鏡像異性体、またはそれらの混合物。

式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OR$ 、 $-C(=O)-NR_2$ 、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 C_{6-10} アリール、および C_{2-9} ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 の 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである。

【請求項 17】

式 IIIA の R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフル

オロメチル、 FCH_2- 、 $\text{F}_2\text{CH}-$ 、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、および $\text{CHF}_2\text{O}-$ から独立して選ばれる、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

式IIIAの R^1 は、水素、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、メトキシおよび C_{1-3} アルキルから選ばれる、請求項16に記載の化合物。

【請求項19】

式IIIAの R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ- C_{1-6} アルキルアミノ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシは、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシおよび $-\text{CN}$ から選ばれる1つまたはそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項16に記載の化合物。

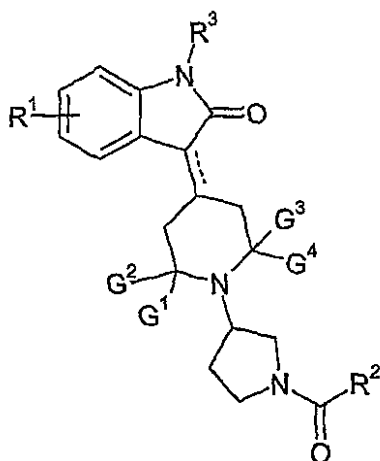
【請求項20】

式IIIAの R^2 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ- C_{1-4} アルキルアミノ、 C_{4-6} ヘテロアリールおよびベンジルオキシから選ばれる、請求項16に記載の化合物。

【請求項21】

式IVA：

【化4】



IVA

の化合物、その医薬上許容しうる塩、ジアステレオマー、鏡像異性体、またはそれらの混合物。

式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{OR}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{NR}_2$ 、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 $\text{F}_2\text{CH}-$ 、 $\text{CHF}_2\text{O}-$ 、 $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 C_{6-10} アリール、および C_{2-9} ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_3 。

C_9 シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ、および $C_3 - C_6$ シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 $C_6 - C_{10}$ アリール、 $C_6 - C_{10}$ アリールオキシ、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリール、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリールオキシ、 $C_3 - C_5$ ヘテロシクロアルキルオキシ、 $C_3 - C_9$ ヘテロシクロアルキル、 $C_6 - C_{10}$ アリール - C_{1-3} アルコキシ、 $C_6 - C_{10}$ アリール - C_{1-3} アルキル、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリール - C_{1-3} アルコキシ、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリール - C_{1-3} アルキル、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 $C_3 - C_9$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ、および $C_3 - C_6$ シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p$ 、 $-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

R^3 は、 H または C_{1-4} アルキルであり；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、 H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 の 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは、 H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである。

【請求項 22】

式 IVA の R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OH$ 、 $-C(=O)-NH_2$ 、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CF_3O- 、および CHF_2O- から独立して選ばれる、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

式 IVA の R^1 は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、メトキシおよび C_{1-3} アルキルから選ばれる、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 24】

式 IVA の R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリール、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルアミノ、ジ - C_{1-6} アルキルアミノ、 $C_2 - C_9$ ヘテロアリール、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキルおよびベンジルオキシは、アミノ、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシおよび $-CN$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基によって場合により置換されている、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 25】

式 IVA の R^2 は、水素、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ ヘテロシクロアルキル、 C_{1-4} アルキルアミノ、ジ - C_{1-4} アルキルアミノ、 $C_4 - C_6$ ヘテロアリールおよびベンジルオキシから選ばれる、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 26】

エチル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート；

エチル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート；

エチル 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート；

ベンジル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1

- イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- t - ブチル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- イソプロピル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- 1 - [1 - (1 - ブチリルピロリジン - 3 - イル) ピペリジン - 4 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- N、N - ジメチル - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキサミド ;
- 1 - { 1 - [1 - (3 - メチルブタノイル) ピロリジン - 3 - イル] ピペリジン - 4 - イル} - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- エチル 3 - [4 - (3 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- エチル 3 - [4 - (1 H - 1, 2, 3 - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- エチル 3 - [4 - (2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロ - 3 H - インドール - 3 - イリデン) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- エチル 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 3 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- tert - ブチル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- エチル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- エチル (3 R) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- メチル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- イソ - プロピル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;
- 1 - { 1 - [(3 S) - 1 - (シクロペンチルカルボニル) ピロリジン - 3 - イル] ピペリジン - 4 - イル} - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- 1 - (1 - { (3 S) - 1 - [(2 S) - テトラヒドロフラン - 2 - イルカルボニル] ピロリジン - 3 - イル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- 1 - (1 - { (3 S) - 1 - [(1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - イル) カルボニル] ピロリジン - 3 - イル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- 1 - (1 - { (3 S) - 1 - [4 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) ブタノイル] ピロリジン - 3 - イル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- 1 - (1 - { (3 S) - 1 - [3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) プロパノイル] ピロリジン - 3 - イル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- 1 - メチル - 3 - (1 - { (3 S) - 1 - [3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) プロパノイル] ピロリジン - 3 - イル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾイミダゾール - 2 - オン ;
- (3 S) - N - エチル - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキサミド ;
- エチル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 R) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

メチル (3 S) - 3 - [4 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

1 - (1 - { (3 S) - 1 - [3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) プロパノイル] ピロリジン - 3 - イル } ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - インドール - 2 - オン ;

エチル 3 - [3 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) - 8 - アザピシクロ [3.2.1] オクタ - 8 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル 3 - [4 - (7 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル 3 - [4 - (5 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル 3 - [4 - (4 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル 3 - [4 - (6 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 S) エチル 3 - [4 - (6 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 R) エチル 3 - [4 - (6 - フルオロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 S) エチル 3 - [4 - (6 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 R) エチル 3 - [4 - (6 - メチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 S) エチル 3 - [4 - (6 - メトキシ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

(3 R) エチル 3 - [4 - (6 - メトキシ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 S) - 3 - [4 - (6 - シアノ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 S) - 3 - [4 - (6 - クロロ - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 S) - 3 - [4 - (6 - トリフルオロメチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 S) - 3 - [4 - (5 - トリフルオロメチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキシレート ;

エチル (3 S) - 3 - [4 - (6 - tert - ブチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ベンゾイミダゾール - 1 - イル) ピペリジン - 1 - イル] ピロリジン - 1 - カルボキ

シレート；

エチル(3S)-3-[4-(5-tert-ブチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾール-1-イル)ピペリジン-1-イル]ピロリジン-1-カルボキシレート；

エチル(3S)-3-[4-(6-トリフルオロメトキシ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾール-1-イル)ピペリジン-1-イル]ピロリジン-1-カルボキシレート；

エチル(3S)-3-[4-(5-トリフルオロメトキシ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾール-1-イル)ピペリジン-1-イル]ピロリジン-1-カルボキシレート；

エチル(3S)-3-[4-(5-フルオロ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾール-1-イル)ピペリジン-1-イル]ピロリジン-1-カルボキシレート；

およびそれらの医薬上許容しうる塩から選ばれる化合物。

【請求項27】

疼痛を治療する薬剤の製造における、請求項1～26のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項28】

アルツハイマー病を治療する薬剤の製造における、請求項1～26のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項29】

統合失調症を治療する薬剤の製造における、請求項1～26のいずれか1項に記載の化合物の使用。

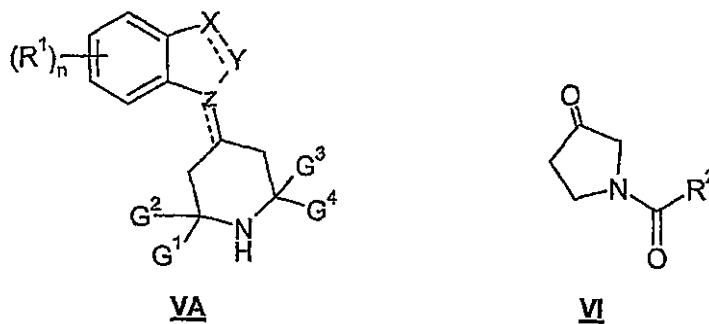
【請求項30】

請求項1～26のいずれか1項に記載の化合物および医薬上許容しうる担体を含む医薬組成物。

【請求項31】

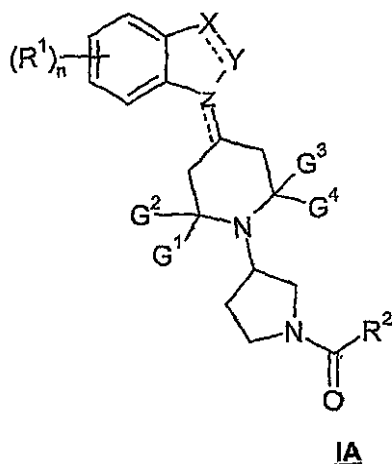
式VAの化合物を式VIの化合物と反応させる；

【化5】



ことを含む、式IA：

【化 6】



[式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OR$ 、 $-C(=O)-NR_2$ 、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 C_{6-10} アリール、および C_{2-9} ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

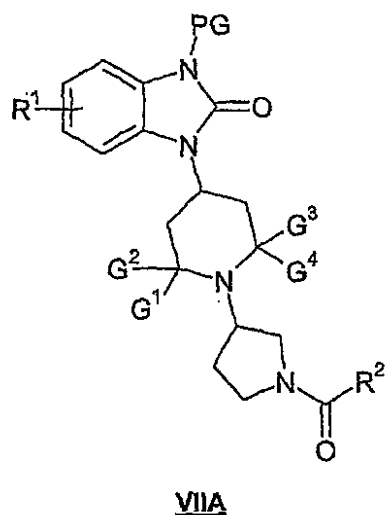
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである] の化合物の製造方法。

【請求項 32】

式 VIIA：

【化 7】



[式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OR$ 、 $-C(=O)-NR_2$ 、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 C_{6-10} アリール、および C_{2-9} ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；

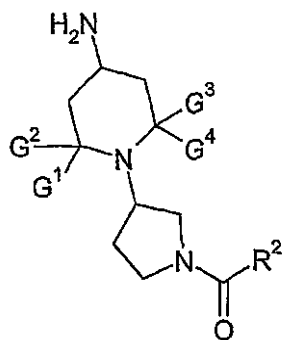
それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルであり；そして

PG は、 $-C(=O)=O-t-Bu$ および $-C(=O)-OBn$ から選ばれる] の化合物。

【請求項 33】

式VIII：

【化 8】

VIII

[式中、

R² は、水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 9 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキルオキシ、および C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 9 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキルオキシ、および C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシは、- CN、- SR、- OR、- O(CH₂)_p - OR、R、- C(=O) - R、- CO₂R、- SO₂R、- SO₂NR₂、ハロゲン、- NO₂、- NR₂、- (CH₂)_pNR₂、および - C(=O) - NR₂ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

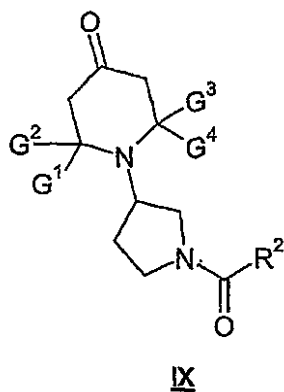
G¹、G²、G³ および G⁴ は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G¹、G²、G³ および G⁴ のうちの 2 つは、一緒に連結して C₁ - 4 アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニルまたはハロゲン化 C₁ - 6 アルキルである] の化合物。

【請求項 34】

式 IX：

【化 9】



[式中、

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシは、-CN、-SR、-OR、-O(CH₂)_p-OR、R、-C(=O)-R、-CO₂R、-SO₂R、-SO₂NR₂、ハロゲン、-NO₂、-NR₂、-(CH₂)_pNR₂、および -C(=O)-NR₂ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

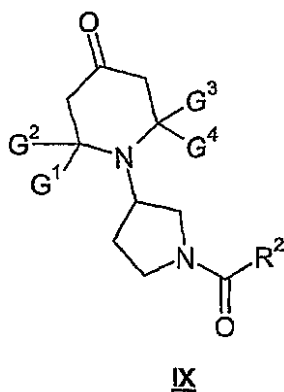
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである] の化合物。

【請求項 35】

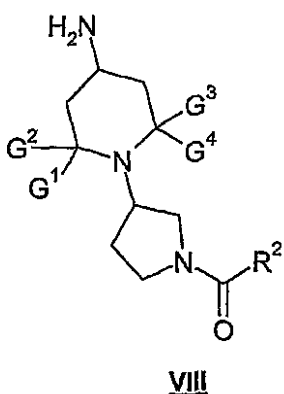
式 IX：

【化 10】



の化合物の還元的アミノ化を含む、式VIII：

【化 11】



[式中、

R² は、水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 9 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキルオキシ、および C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3 アルキル、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルコキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 9 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキルオキシ、および C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 3 アルコキシは、- CN、- SR、- OR、- O (CH₂)_p - OR、R、- C (= O) - R、- CO₂ R、- SO₂ R、- SO₂ NR₂、ハロゲン、- NO₂、- NR₂、- (CH₂)_p NR₂、および - C (= O) - NR₂ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

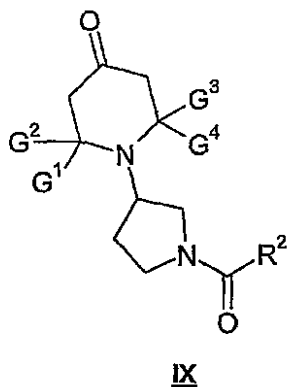
G¹、G²、G³ および G⁴ は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G¹、G²、G³ および G⁴ のうちの 2 つは、一緒に連結して C₁ - 4 アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニルまたはハロゲン化 C₁ - 6 アルキルである] の化合物の製造方法。

【請求項 36】

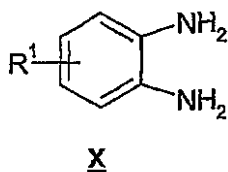
式 IX :

【化 12】



の化合物を、還元剤の存在下で式 X :

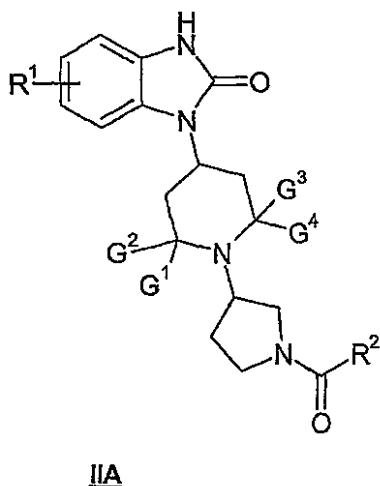
【化 13】



の化合物と反応させて第 1 の生成物を形成させる第 1 の工程 ; および

該第 1 の生成物をホスゲンタイプの試薬と反応させて式 IIA の化合物を形成させることを含む、式 IIA :

【化 14】



[式中、

R¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、- CN、- C (= O) - OR、- C (= O) - NR₂、ヒドロキシ、C₁ - 6 アルコキシ、トリフルオロメチル、FCH₂ -、F₂CH -、CHF₂O -、CF₃O -、C₆ - 10 アリール、および C₂ - 9 ヘテロアリールから独立して選ばれ ;

R² は、水素、C₁ - 6 アルキル、C₂ - 6 アルケニル、C₁ - 6 アルコキシ、C₁ - 6 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 6 アルキルアミノ、C₆ - 10 アリール、C₆ - 10 アリールオキシ、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₂ - 9 ヘテロアリールオキシ、C₃ - 5 ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - 9 ヘテロシクロアルキル、C₆ - 10 アリール - C₁ - 3

アルコキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール - C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール - C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p$ 、 $-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

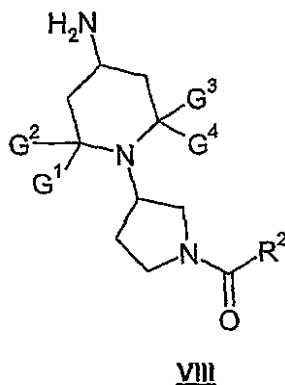
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである] の化合物の製造方法。

【請求項 37】

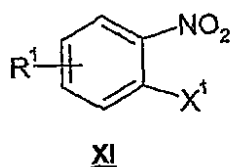
式VIII：

【化 15】



の化合物を還元剤の存在下で、式XI：

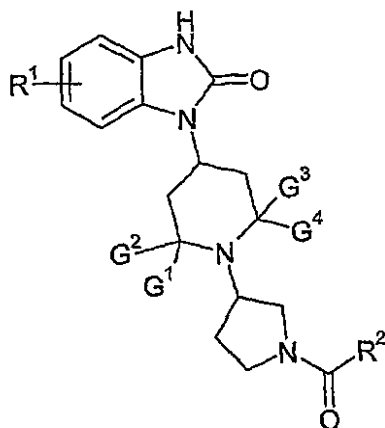
【化 16】



の化合物と反応させてニトロ基を含む第 1 の生成物を形成させる第 1 の工程；および
該第 1 の生成物のニトロ基をアミノ基に還元して第 2 の生成物を形成させ；

該第 2 の生成物をホスゲンタイプの試薬と反応させて式IIA の化合物を形成させることを含む、式IIA：

【化 17】



IIA

[式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 $-CN$ 、 $-C(=O)-OR$ 、 $-C(=O)-NR_2$ 、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FCH_2- 、 F_2CH- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 C_{6-10} アリール、および C_{2-9} ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R^2 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシから選ばれ、ここにおいて該 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{1-6} アルコキシ、 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} アリールオキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール、 C_{2-9} ヘテロアリールオキシ、 C_{3-5} ヘテロシクロアルキルオキシ、 C_{3-9} ヘテロシクロアルキル、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{6-10} アリール- C_{1-3} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルコキシ、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-9} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキルオキシ、および C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-3} アルコキシは、 $-CN$ 、 $-SR$ 、 $-OR$ 、 $-O(CH_2)_p-OR$ 、 R 、 $-C(=O)-R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SO_2NR_2$ 、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-NR_2$ 、 $-(CH_2)_pNR_2$ 、および $-C(=O)-NR_2$ から選ばれる 1 つまたはそれ以上の基で場合により置換されており；

G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの 2 つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の 2 つは H およびメチルから独立して選ばれ；

X^1 は、ハロゲンであり；そして

それぞれの R は、独立して水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニルまたはハロゲン化 C_{1-6} アルキルである] の化合物の製造方法。