

【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 0 7 D 401/14	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 37/08	(2006.01)
A 6 1 P 31/12	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/32	(2006.01)
A 6 1 P 25/34	(2006.01)
A 6 1 P 25/36	(2006.01)
A 6 1 K 31/454	(2006.01)
C 0 7 D 451/02	(2006.01)
A 6 1 K 31/439	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14	C S P
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 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

【手續補正書】

【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

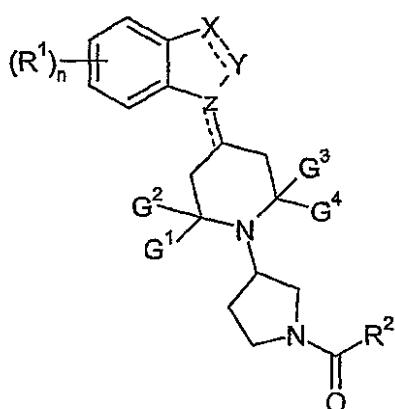
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I A :



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、FC₂H₂ - 、F₂CH - 、CH₂F₂O - 、CF₃O - 、C₆ - 1₀ アリール、およびC₂。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} アルキル、 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、-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；

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-CH₃、N、C、CH₂、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-CH₃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-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)-NH₂、-CO₂CH₃、-CO₂H、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、FC₂H₂-、F₂CH-、CH₂F₂O-、およびCF₃O-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。

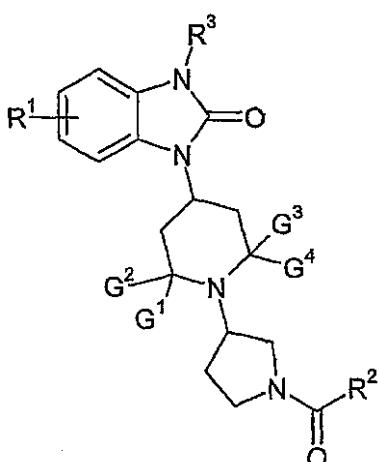
【請求項 10】

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、FC₂H₂-、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

、 $C_{2\sim 9}$ ヘテロアリール - $C_{1\sim 3}$ アルキル、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ アルコキシ、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ アルキル、 $C_{3\sim 9}$ シクロアルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルオキシ、 および $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ アルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ アルコキシは、 - CN、 - SR、 - OR、 - O(CH_2)_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；

R³ は、 H または $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

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 2 つは、 一緒になって連結して $C_{1\sim 4}$ 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、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニルまたはハロゲン化 $C_{1\sim 6}$ アルキルである。

【請求項 1 2】

式IIIA の R¹ は、 水素、 ハロゲン、 $C_{1\sim 3}$ アルキル、 - CN、 - C(=O) - OH、 - C(=O) - NH₂、 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、 FCH₂-、 F₂CH-、 CF₃O-、 および CHF₂O- から独立して選ばれる、 請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

式IIIA の R¹ は、 水素、 ハロゲン、 - CN、 メトキシおよび $C_{1\sim 3}$ アルキルから選ばれる、 請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

式IIIA の R² は、 水素、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{1\sim 6}$ アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ アルキルアミノ、 ジ - $C_{1\sim 6}$ アルキルアミノ、 $C_{2\sim 9}$ ヘテロアリール、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ 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 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{1\sim 6}$ アルコキシ、 $C_{1\sim 6}$ アルキルアミノ、 ジ - $C_{1\sim 6}$ アルキルアミノ、 $C_{2\sim 9}$ ヘテロアリール、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ 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、 $C_{1\sim 6}$ 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 1 に記載の化合物。

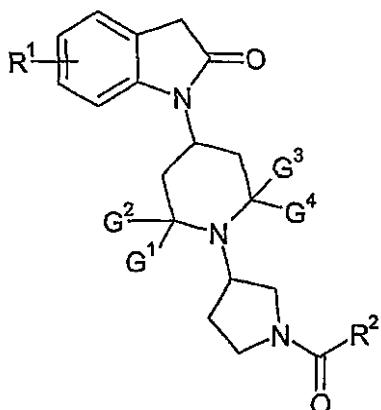
【請求項 1 5】

式IIIA の R² は、 水素、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル - $C_{1\sim 3}$ アルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $C_{3\sim 6}$ ヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルキルアミノ、 ジ - $C_{1\sim 4}$ アルキルアミノ、 $C_{4\sim 6}$ 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 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

式IIIA :

【化3】

III A

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、FC₂H₂-、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 アルキル、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、ここでにおいて該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。

【請求項17】

式III A の R¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - 3 アルキル、-CN、-C(=O)-OH、-C(=O)-NH₂、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16に記載の化合物。

【請求項 18】

式III A の R¹ は、水素、ハロゲン、-CN、メトキシおよびC₁ -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、C₂~₉ヘテロアリール、C₃~₆ヘテロシクロアルキル-C₁~₃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、C₂~₉ヘテロアリール、C₃~₆ヘテロシクロアルキル-C₁~₃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、C₁~₆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16に記載の化合物。

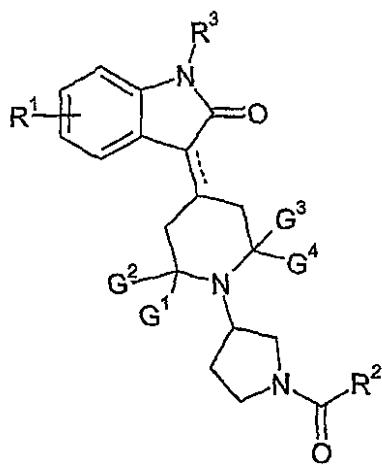
【請求項 20】

式III A の R² は、水素、C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル、C₁ - 4 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 4 アルキルアミノ、C₄ - 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 1 6 に記載の化合物。

【請求項 21】

式IV A :

【化 4】



IV

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)-NR₂、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FC_2H_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；

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；

R³ は、HまたはC₁ - 4 アルキルであり；

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。

【請求項22】

式IVAのR¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - 3 アルキル、- CN、- C(=O) - OH、- C(=O) - NH₂、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、FC₂H₂ - 、F₂CH - 、CF₃O - 、およびCHF₂O - 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R¹ は、水素、ハロゲン、- CN、メトキシおよびC₁ - 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、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 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、C₂ - 9 ヘテロアリール、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 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、C₁ - 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R² は、水素、C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル - C₁ - 3 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₃ - 6 ヘテロシクロアルキル、C₁ - 4 アルキルアミノ、ジ - C₁ - 4 アルキルアミノ、C₄ - 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 - 1H - 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 - 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3 - [4 - (5 - クロロ - 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；

ベンジル3 - [4 - (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 ;
 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 ;
 イソプロビル 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
 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
 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
 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 - アザビシクロ [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 ;
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。

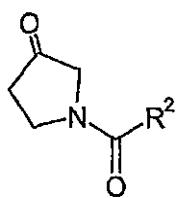
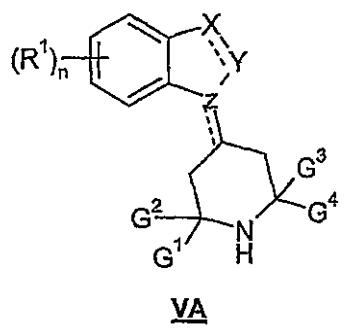
【請求項 30】

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 3 1】

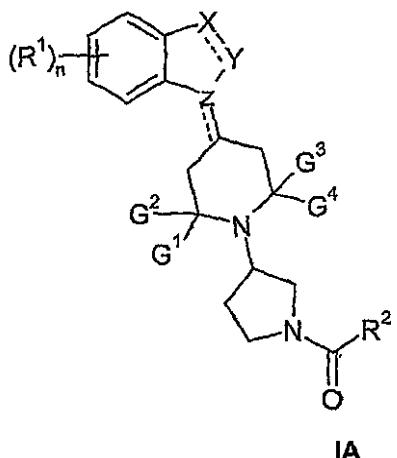
式VAの化合物を式VIの化合物と反応させる：

【化 5】



ことを含む、式 I A :

【化6】



[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、FC₂H₂-、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アルキル、C₂~9ヘテロアリール-C₁~3アルコキシ、C₆~10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(C₂H₂)_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；

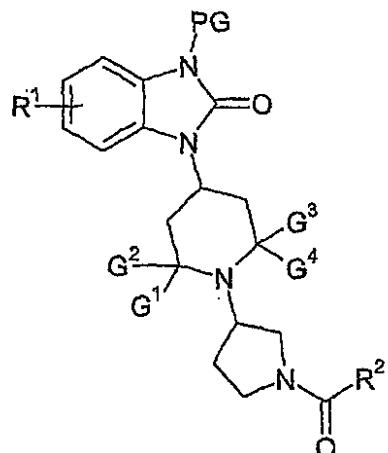
G¹、G²、G³およびG⁴は、Hおよびメチルから独立して選ばれ；またはG¹、G²、G³およびG⁴のうちの2つは、一緒に連結してC₁~4アルキレンを形成し、そして他の2つはHおよびメチルから独立して選ばれ；そして

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]の化合物の製造方法。

【請求項32】

式VIIA：

【化7】



VIIA

[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、FC₂H₂-、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(C₂H₂)_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；

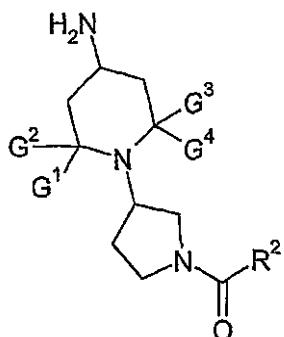
G¹、G²、G³およびG⁴は、Hおよびメチルから独立して選ばれ；またはG¹、G²、G³およびG⁴のうちの2つは、一緒に連結してC₁~4アルキレンを形成し、そして他の2つはHおよびメチルから独立して選ばれ；

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、

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_{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} アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール- 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} アルキル、 C_{3-6} 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、-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；

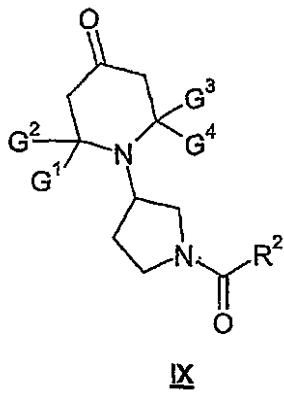
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、Hおよびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの2つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の2つはHおよびメチルから独立して選ばれ；そして

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} 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} 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 、- $O(CH_2)_pOR$ 、 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；

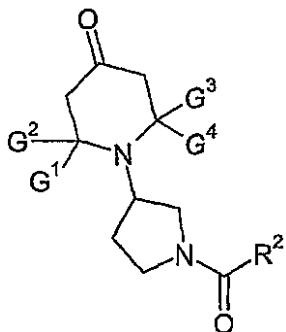
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、 H およびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの2つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の2つは H およびメチルから独立して選ばれ；そして

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。

【請求項35】

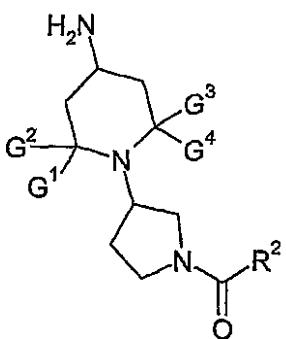
式IX：

【化10】

IX

の化合物の還元的アミノ化を含む、式VIII：

【化11】

VIII

[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、-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；

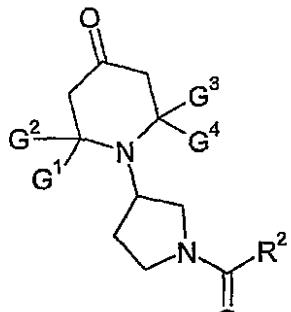
G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 は、Hおよびメチルから独立して選ばれ；または G^1 、 G^2 、 G^3 および G^4 のうちの2つは、一緒に連結して C_{1-4} アルキレンを形成し、そして他の2つはHおよびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれの R は、独立して水素、C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニルまたはハロゲン化 C₁ - C₆ アルキルである] の化合物の製造方法。

【請求項 3 6】

式IX：

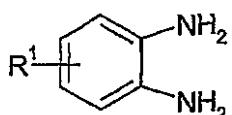
【化 1 2】



IX

の化合物を、還元剤の存在下で式 X :

【化 1 3】

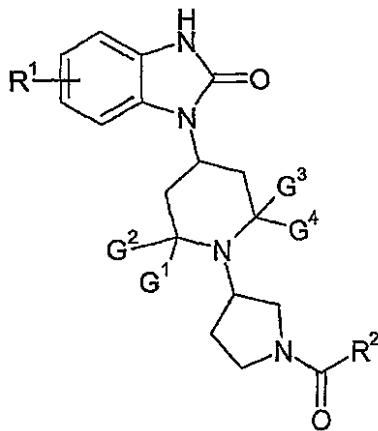


X

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 1 4】



IIA

[式中、

R¹ は、水素、ハロゲン、C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、-C N、-C(=O)-OR、-C(=O)-NR₂、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルコキシ、トリフルオロメチル、FC₂H₂-、F₂CH-、CHF₂O-、CF₃O-、C₆ - C₁₀ アリール、およびC₂ - C₉ ヘテロアリールから独立して選ばれ；

R² は、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₁ - C₆ アルコキシ、C₁ - C₆ アルキルアミノ、ジ-C₁ - C₆ アルキルアミノ、C₆ - C₁₀ アリール、C₆ - C₁₀ アリールオキシ、C₂ - C₉ ヘテロアリール、C₂ - C₉ ヘテロアリールオキシ、C₃ - C₅ ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - C₉ ヘテロシクロアルキル、C₆ - C₁₀ アリール-C₁ - C₃

アルコキシ、C₆ - C₁₀アリール - C₁ - C₃アルキル、C₂ - C₉ヘテロアリール - C₁ - C₃アルコキシ、C₂ - C₉ヘテロアリール - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆ヘテロシクロアルキル - C₁ - C₃アルコキシ、C₃ - C₆ヘテロシクロアルキル - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆シクロアルキルオキシ、およびC₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₃アルコキシから選ばれ、ここにおいて該C₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニル、C₁ - C₆アルコキシ、C₁ - C₆アルキルアミノ、ジ - C₁ - C₆アルキルアミノ、C₆ - C₁₀アリール、C₆ - C₁₀アリールオキシ、C₂ - C₉ヘテロアリール、C₂ - C₉ヘテロアリールオキシ、C₃ - C₅ヘテロシクロアルキルオキシ、C₃ - C₉ヘテロシクロアルキル、C₆ - C₁₀アリール - C₁ - C₃アルキル、C₂ - C₉ヘテロアリール - C₁ - C₃アルコキシ、C₂ - C₉ヘテロアリール - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆ヘテロシクロアルキル - C₁ - C₃アルコキシ、C₃ - C₆ヘテロシクロアルキル - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆シクロアルキルオキシ、およびC₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₃アルキル、C₃ - C₆シクロアルキル - C₁ - C₃アルコキシは、-CN、-SR、-OR、-O(CH₂)_pOR、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；

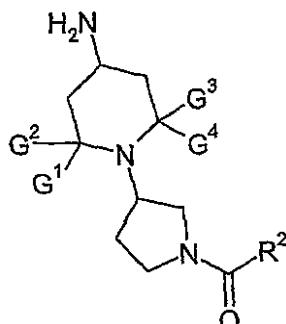
G¹、G²、G³およびG⁴は、Hおよびメチルから独立して選ばれ；またはG¹、G²、G³およびG⁴のうちの2つは、一緒に連結してC₁ - C₄アルキレンを形成し、そして他の2つはHおよびメチルから独立して選ばれ；そして

それぞれのRは、独立して水素、C₁ - C₆アルキル、C₂ - C₆アルケニルまたはハロゲン化C₁ - C₆アルキルである]の化合物の製造方法。

【請求項37】

式VIII：

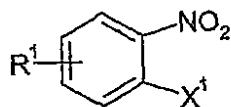
【化15】



VIII

の化合物を還元剤の存在下で、式XI：

【化16】



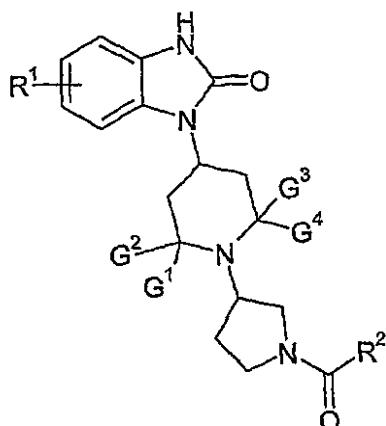
XI

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】



III A

[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)-NR₂、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルコキシ、トリフルオロメチル、 FC_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-C₁₋₃ アルコキシ、 C_{6-10} アリール-C₁₋₃ アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール-C₁₋₃ アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロアリール-C₁₋₃ アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル-C₁₋₃ 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-C₁₋₃ アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル-C₁₋₃ アルコキシから選ばれ、ここでにおいて該 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-C₁₋₃ アルコキシ、 C_{6-10} アリール-C₁₋₃ アルキル、 C_{2-9} ヘテロアリール-C₁₋₃ アルキル、 C_{3-6} ヘテロシクロアルキル-C₁₋₃ アルコキシ、 C_{2-9} ヘテロシクロアルキル-C₁₋₃ 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-C₁₋₃ アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル-C₁₋₃ アルコキシは、-CN、-SR、-OR、-O(CH_2)_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；

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。