

【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21年7月2日(2009.7.2)

【公表番号】特表2008-540661(P2008-540661A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-512394(P2008-512394)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12	(2006.01)
C 0 7 D 417/12	(2006.01)
A 6 1 K 31/4709	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 13/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 417/12	C S P
A 6 1 K 31/4709	
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/14	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 13/00	
A 6 1 P 9/00	

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月1日(2009.5.1)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

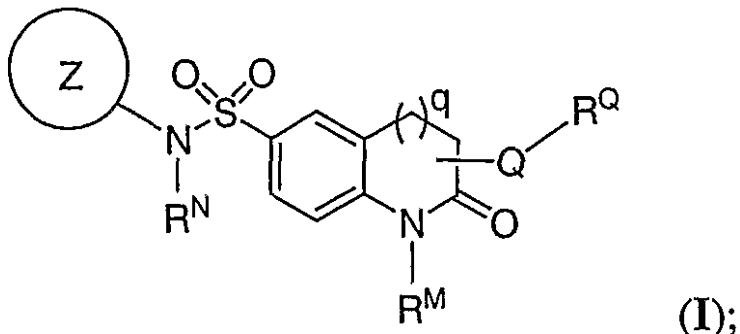
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)：

【化 1】



(式中：

環 Z は、O、S、N、またはNHから選択される少なくとも1個の環ヘテロ原子を有する、5～7員不飽和または芳香族環である；

ここで Z は、環 A に場合により縮合され；ここで A は、場合により置換された5～7員不飽和または芳香族環であり；そして

ここで Z または前記縮合環 A とひとまとめにされた Z は、R^Z の z 回までの出現によって置換され；

z は、0～4 であり；

各 R^Z は、R¹、R²、R³、R⁴、またはR⁵ から独立して選択され；

q は、0～2 であり；

Q は、結合あるいはC₁～C₆直鎖または分岐アルキリジン鎖であり、ここで Q の 2 個までの非隣接メチレン単位は、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR²-、-CONR²NR²-、-CO₂-、-OCO-、-NR²CO₂-、-O-、-NR²C_{ONR²}-、-OCONR²-、-NR²NR²-、-NR²NR²CO-、-NR²CO-、-S-、-SO-、-SO₂-、-NR²-、-SO₂NR²-、NR²SO₂-、-NR²SO₂NR²-、またはスピロシクロアルキレン部分によって場合により独立して置換され；

R^Q は、C₁～₆脂肪族基、O、S、N、またはNHから独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員飽和、部分不飽和、または完全不飽和單環式環、あるいはO、S、N、またはNHから独立して選択される0～5個のヘテロ原子を有する8～12員飽和、部分不飽和、または完全不飽和2環式環系であり；

ここで R^Q は、R¹、R²、R³、R⁴、またはR⁵ から独立して選択される4個までの置換基によって場合により置換され；

R^M および R^N は独立して、R² であり；

R¹ は、オキソ、=NN(R⁶)₂、=NN(R⁷)₂、=NN(R⁶R⁷)、R⁶、または(C_nH₂)_n-Y であり；

n は、0、1、または2 であり；

Y は、ハロ、CN、NO₂、CF₃、OCF₃、OH、SR⁶、S(O)R⁶、SO₂R⁶、NH₂、NHR⁶、N(R⁶)₂、NR⁶R⁸、COOH、COOR⁶、またはOR⁶ であり；あるいは

隣接する環原子上の2個のR¹ はひとまとめにされて、1,2-メチレンジオキシまたは1,2-エチレンジオキシを形成し；

R² は、水素またはC₁～C₆脂肪族であり、ここで各 R² は、R¹、R⁴、またはR⁵ から独立して選択される2個までの置換基によって場合により置換され；

R³ は、R¹、R²、R⁴、またはR⁵ から独立して選択される3個までの置換基によ

って場合により置換された、C₃ - C₈ 脂環式、C₆ - C₁₀ アリール、C₃ - C₈ 複素環式、またはC₅ - C₁₀ ヘテロアリール環であり；

R⁴ は、OR⁵、OR⁶、OC(O)R⁶、OC(O)R⁵、OC(O)OR⁶、OC(O)OR⁵、OC(O)N(R⁶)₂、OC(O)N(R⁵)₂、OC(O)N(R⁶)R⁵、OP(O)(OR⁶)₂、OP(O)(OR⁵)₂、OP(O)(OR⁶)(OR⁵)、SR⁶、SR⁵、S(O)R⁶、S(O)R⁵、SO₂R⁶、SO₂R⁵、SO₂N(R⁶)₂、SO₂N(R⁵)₂、SO₂NR⁵R⁶、SO₃R⁶、SO₃R⁵、C(O)R⁵、C(O)OR⁵、C(O)R⁶、C(O)OR⁶、C(O)N(R⁶)₂、C(O)N(R⁵)₂、C(O)N(R⁵R⁶)、C(O)N(OR⁶)R⁶、C(O)N(OR⁵)R⁶、C(O)N(OR⁵)R⁵、C(NOR⁶)R⁶、C(NOR⁶)R⁵、C(NOR⁵)R⁶、C(NOR⁵)R⁵、N(R⁶)₂、N(R⁵)₂、N(R⁵R⁶)、NR⁵C(O)R⁵、NR⁶C(O)R⁶、NR⁶C(O)R⁵、NR⁵C(O)OR⁵、NR⁵C(O)OR⁶、NR⁶C(O)OR⁶、NR⁶C(O)OR⁵、NR⁵C(O)OR⁵、NR⁶C(O)N(R⁶)₂、NR⁶C(O)N(R⁵)₂、NR⁵C(O)NR⁵R⁶、NR⁵C(O)N(R⁵)₂、NR⁵C(O)N(R⁶)₂、NR⁵C(O)NR⁵R⁶、NR⁶SO₂R⁶、NR⁶SO₂R⁵、NR⁵SO₂R⁵、NR⁶SO₂N(R⁶)₂、NR⁶SO₂NR⁵R⁶、NR⁶SO₂N(R⁵)₂、NR⁵SO₂NR⁵R⁶、NR⁵SO₂N(R⁵)₂、NR⁵SO₂N(R⁶)₂、P(O)(OR⁶)N(R⁶)₂、P(O)(OR⁶)N(R⁵R⁶)、P(O)(OR⁶)N(R⁵)₂、P(O)(OR⁵)N(R⁶)、P(O)(OR⁵)N(R⁶)₂、P(O)(OR⁵)N(R⁵)₂、P(O)(OR⁶)₂、P(O)(OR⁵)₂、またはP(O)(OR⁶)(OR⁵) であり；

R⁵ は、3個までのR¹置換基によって場合により置換された、C₃ - C₈ 脂環式、C₆ - C₁₀ アリール、C₃ - C₈ 複素環式、またはC₅ - C₁₀ ヘテロアリール環であり；

R⁶ は、H または C₁ - C₆ 脂肪族であり、ここで R⁶ は、R⁷ 置換基によって場合により置換され；

R⁷ は、H、C₁ - C₆ 脂肪族、または(C₂H₅)_m - Z' (ここでmは0 ~ 2である)から独立して選択される2個までの置換基によって場合により置換された、C₃ - C₈ 脂環式、C₆ - C₁₀ アリール、C₃ - C₈ 複素環式、またはC₅ - C₁₀ ヘテロアリール環であり；

Z' は、ハロ、CN、NO₂、C(ハロ)₃、CH(ハロ)₂、CH₂(ハロ)、-O-C(ハロ)₃、-OCH(ハロ)₂、-OCH₂(ハロ)、OH、S-(C₁ - C₆) 脂肪族、S(O)- (C₁ - C₆) 脂肪族、SO₂- (C₁ - C₆) 脂肪族、NH₂、NH- (C₁ - C₆) 脂肪族、N((C₁ - C₆) 脂肪族)₂、N((C₁ - C₆) 脂肪族)R⁸、COOH、C(O)O(- (C₁ - C₆) 脂肪族)、またはO- (C₁ - C₆) 脂肪族から選択され；

R⁸ は、アセチル、C₆ - C₁₀ アリールスルホニル、またはC₁ - C₆ アルキルスルホニルであり；そして

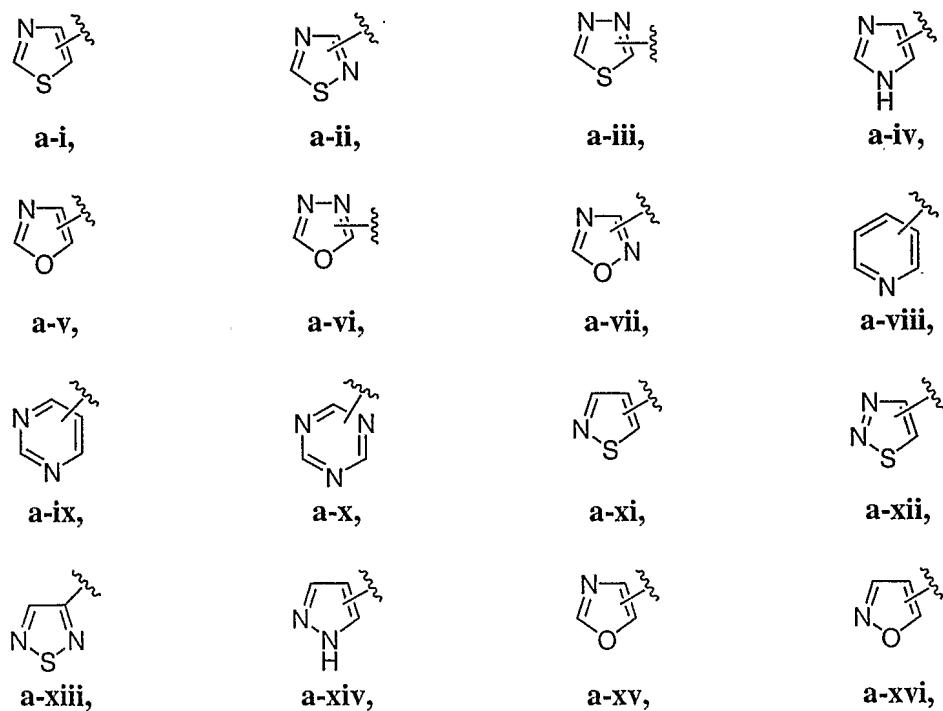
前記化合物がN-[4-シアノ-5-(メチルチオ)-1H-ピラゾール-3-イル]-1,2-ジヒドロ-1-メチル-2-オキソ-4-(トリフロオロメチル)-6-キノリンスルホンアミドでないという条件である)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

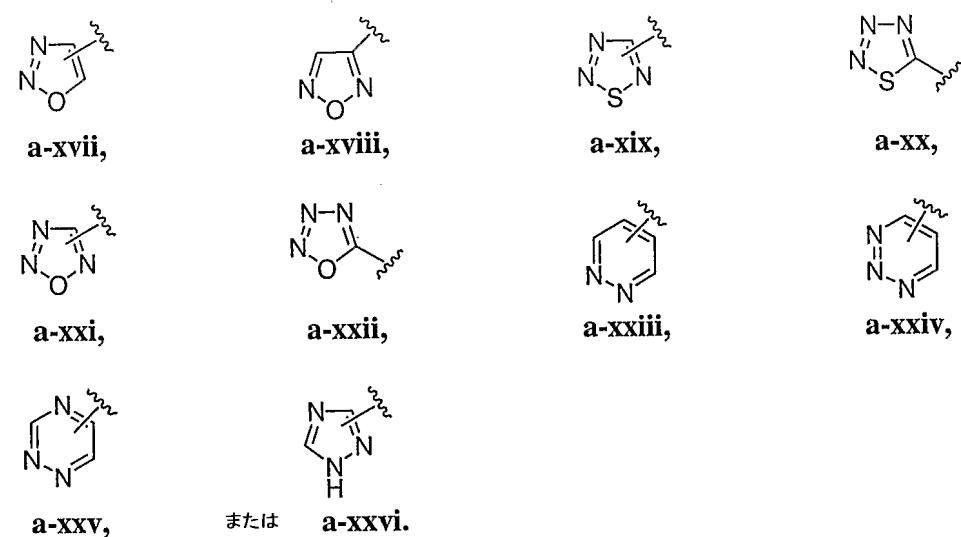
【請求項 2】

Z が：

【化2】



【化3】



から選択される場合により置換された環である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Aがフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

z が0～2である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

各 R^z が R^1 、 R^2 、または R^5 から独立して選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

各 R^z が、水素、ハロ、OR⁶、C₁-C₆脂肪族、あるいはC₃-C₈脂環式、C₆-C₁₀アリール、C₃-C₈複素環式、またはC₅-C₁₀ヘテロアリール環から独立して選択される場合により置換された基から独立して選択され；前記脂環式、前記アリール、前記複素環式、または前記ヘテロアリールが、R¹、R²、R⁴、またはR⁵から独立して選択される3個までの置換基によって場合により置換される、請求項1に記載の化合

物。

【請求項 7】

各 R^Z が、水素、ハロ、O(C₁ - C₆ アルキル)、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、またはフェニルから独立して選択される、請求項 6 に記載の化合物

【請求項 8】

R^M が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^N が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

Q が、結合、C₁ - C₆ 直鎖または分岐アルキリデン鎖から選択され、前記アルキリデンの 2 個までのメチレン単位が O、S、OCO、NH、N(C₁ - C₄ アルキル)、またはスピロシクロアルキレン基によって独立して置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

Q が -X₂- (X₁)_p- であり、

式中：

X₂ は、結合または R¹、R⁴、または R⁵ から独立して選択される 2 個までの置換基によって場合により置換された C₁ - C₆ 脂肪族であり；

p は、0 または 1 であり；そして

X₁ は、O、S、または NR² である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

X₂ が結合、C₁ - C₆ アルキル、または C₂ - C₆ アルキリデンであり、前記アルキルおよびアルキリデンが R¹ または R⁴ によって独立して場合により置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

X₂ が、結合、-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-(CH₂)₃-、-C(Me)₂-、-CH(Me)-、-C(Me)=CH-、-CH=CH-、-CH(Ph)-、-CH₂-CH(Me)-、-CH(Et)-、または -CH(i-Pr)- から選択される、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

R^Q が場合により置換されたフェニルまたはナフチルである、請求項 1 に記載の化合物。

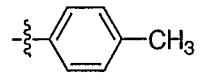
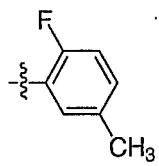
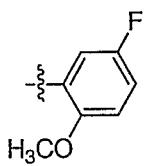
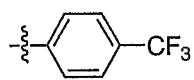
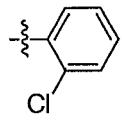
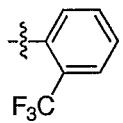
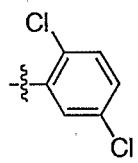
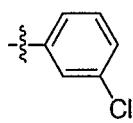
【請求項 15】

R^Q が、ハロ、シアノ、トリフルオロメチル、OH、C₁ - C₄ アルキル、C₂ - C₄ アルケニル、C₁ - C₄ アルコキシ、トリフルオロメトキシ、C(O)NH₂、NH₂、NH(C₁ - C₄ アルキル)、N(C₁ - C₄ アルキル)₂、NHCO(C₁ - C₄ アルキル)、または C(O)C₁ - C₄ アルキルから選択される 3 個までの置換基によって場合により置換される、請求項 14 に記載の化合物。

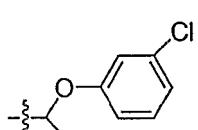
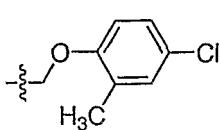
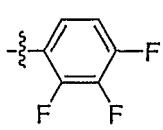
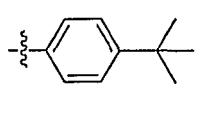
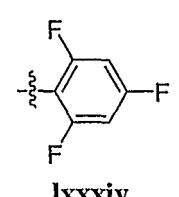
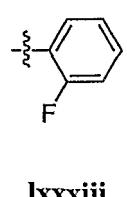
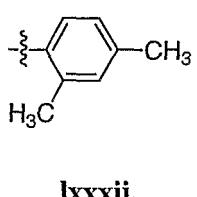
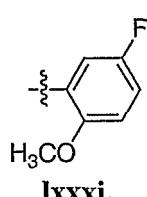
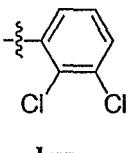
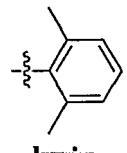
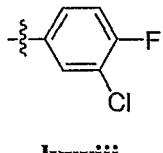
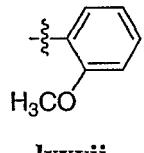
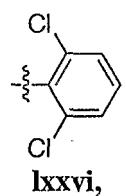
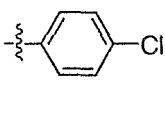
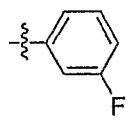
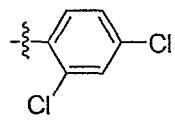
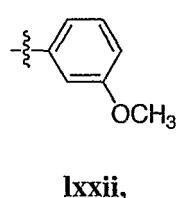
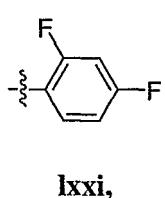
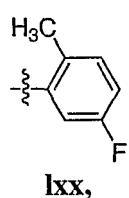
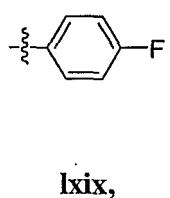
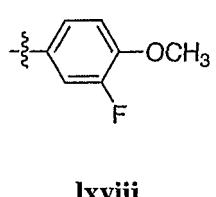
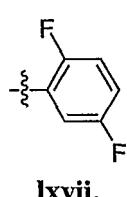
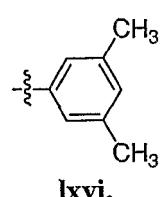
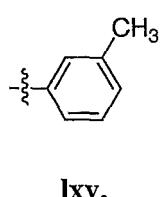
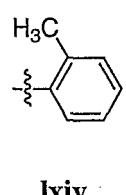
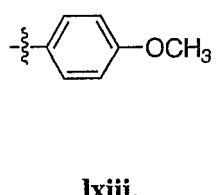
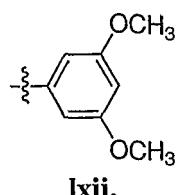
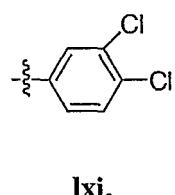
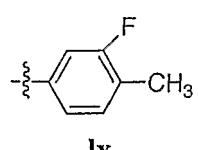
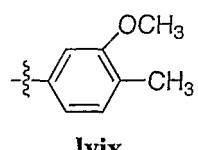
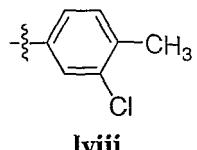
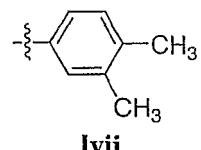
【請求項 16】

R^Q が：

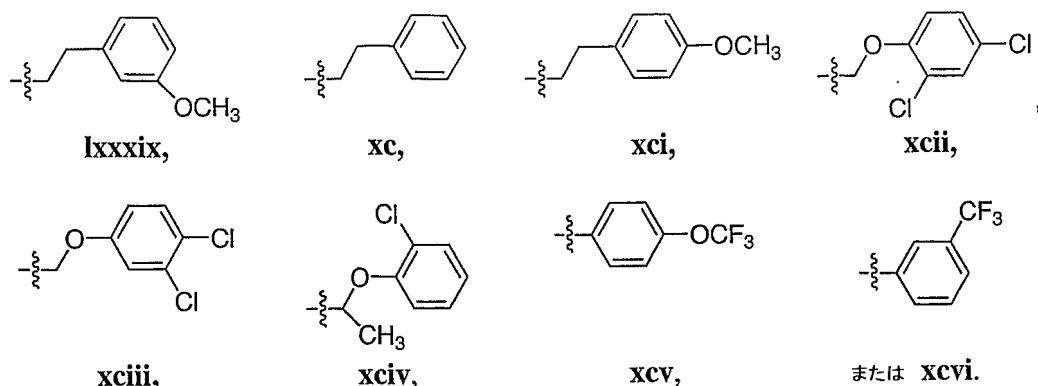
【化4】



【化5】



【化6】



から選択される、請求項1～5に記載の化合物。

【請求項17】

R^Qが場合により置換された3～8員脂環式環である、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

R^Qが、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルから選択される場合により置換された環である、請求項17に記載の化合物。

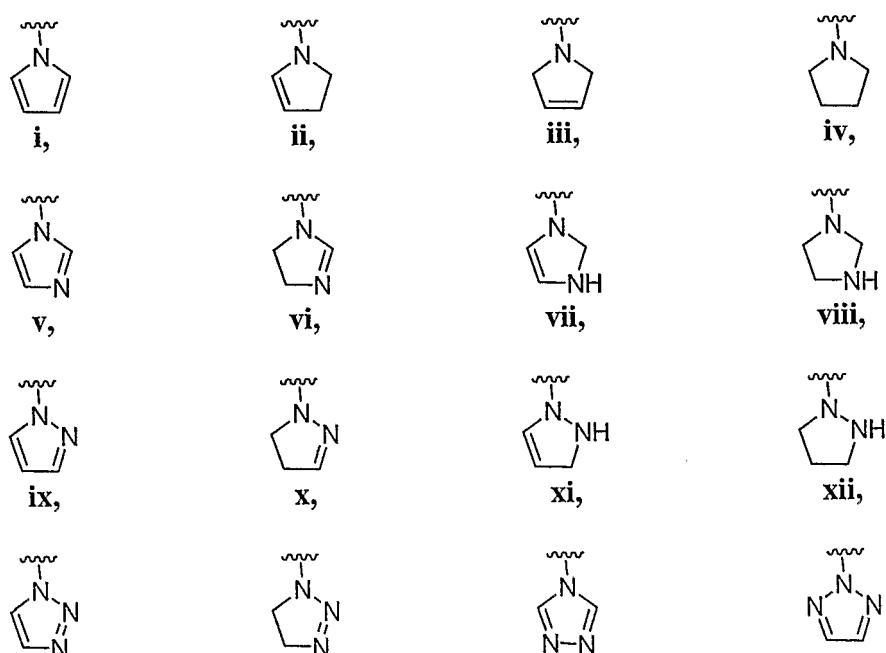
【請求項19】

R^Qが、O、S、N、またはNHから独立して選択される3個までのヘテロ原子を含有する、場合により置換された5～6員单環式、不飽和、部分飽和、または芳香族環である、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

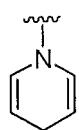
R^Qが：

【化7】

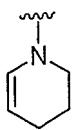


【化 8】

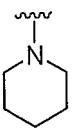
xiii,



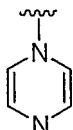
xiv,



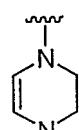
xv,



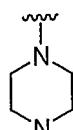
xvi,



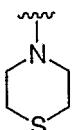
xvii,



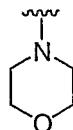
xviii,



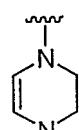
xix,



xx,



xxi,



xxii,

xxiii, または xxiv.

から選択される場合により置換された環である、請求項 1 9 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

R^Q が場合により置換されたフェニル環に場合により縮合される、請求項 2 0 に記載の化合物。

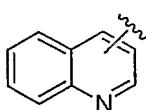
【請求項 2 2】

R^Q が場合により置換された 8 ~ 10 員 2 環式、複素環式、または複素芳香族環である、請求項 1 に記載の化合物。

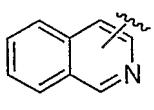
【請求項 2 3】

R^Q が :

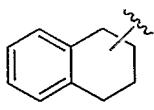
【化 9】



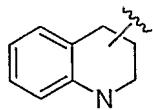
xxv,



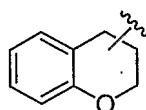
xxvi,



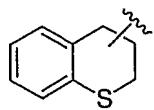
xxvii,



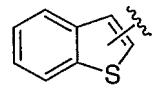
xxviii,



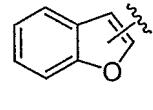
xxix,



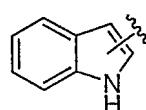
xxx,



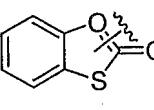
xxxi,



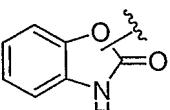
xxxii,



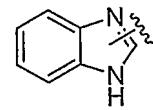
xxxiii,



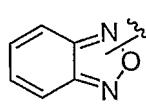
xxxiv,



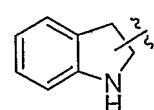
xxxv,



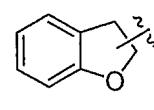
xxxvi,



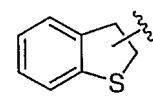
xxxvii,



xxxviii,

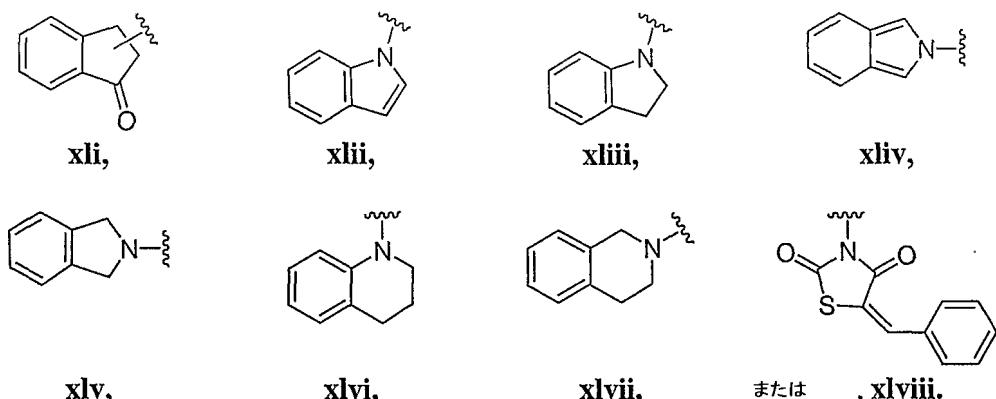


xxxix,



xl,

【化10】



から選択される場合により置換された環である、請求項22に記載の化合物。

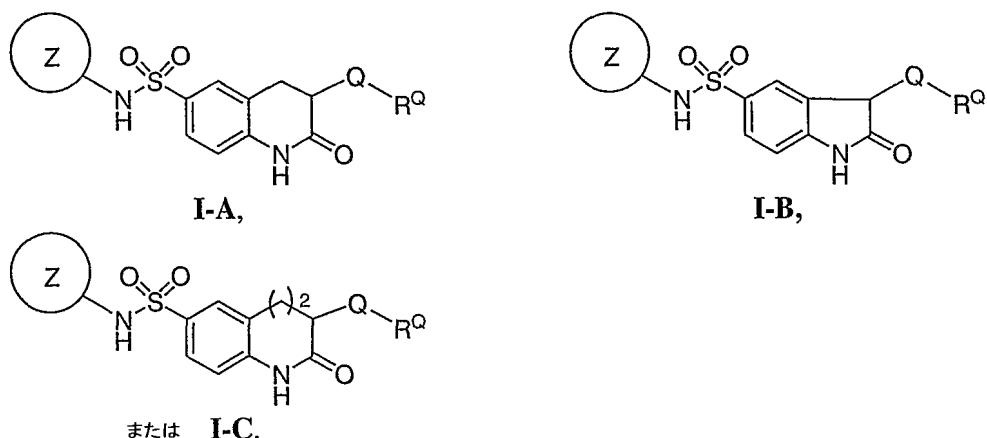
【請求項24】

R^Q が、ピロリジン-1-イル、3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、3-メチル-ピペリジン-1-イル、4-メチル-ピペリジン-1-イル、4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル、4,5-ジメチル-4-モルホリン-1-イル、2,6-ジメチル-モルホリン-4-イル、インドール-1-イル、4-フルオロ-インドール-1-イル、5-クロロ-インドール-1-イル、7-クロロ-インドール-1-イル、テトラヒドロキノリン-1-イル、7-トリフルオロメチル-テトラヒドロキノリン-1-イル、6-メチル-テトラヒドロキノリン-1-イル、6-クロロ-テトラヒドロキノリン-1-イル、テトラヒドロ-イソキノリン-2-イル、7-クロロ-テトラヒドロ-イソキノリン-2-イル、7-フルオロ-テトラヒドロ-イソキノリン-2-イル、8-トリフルオロメチル-キノリン-4-イル、ピリジン-3-イル、またはピリジン-4-イルから選択される、請求項19または請求項22に記載の化合物。

【請求項25】

前記化合物が式I-A、式I-B、または式I-C：

【化11】



から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項26】

表2から選択される化合物。

【請求項27】

請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体、アジュバント、またはビヒクルとを含む薬学組成物。

【請求項28】

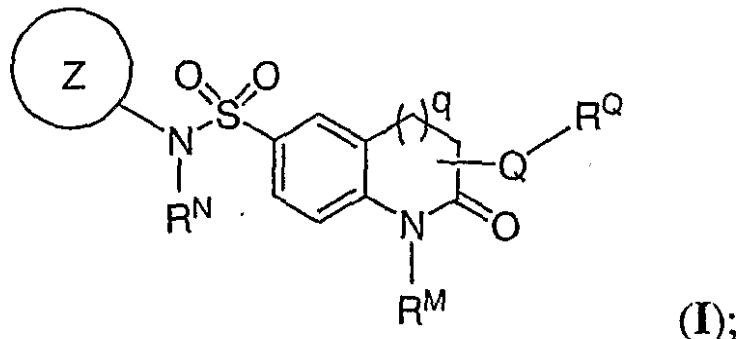
(a) 患者；または

(b) 生体サンプル；

における NAV1.1、NAV1.2、NAV1.3、NAV1.4、NAV1.5、NAV1.6、NAV1.7、NAV1.8、NAV1.9、または CaV2.2 活性の 1 つ以上を阻害するための組成物であって：

式 I :

【化 12】



(式中：

環 Z は、O、S、N、または NH から選択される少なくとも 1 個の環ヘテロ原子を有する、5 ~ 7 員不飽和または芳香族環であり；

ここで Z は、環 A に場合により縮合され；ここで A は、場合により置換された 5 ~ 7 員不飽和または芳香族環であり；そして

ここで Z または前記縮合環 A とひとまとめにされた Z は、R^Z の z 回までの出現によって置換され；

z は、0 ~ 4 であり；

各 R^Z は、R^1、R^2、R^3、R^4、または R^5 から独立して選択され；

q は、0 ~ 2 であり；

Q は、結合あるいは C₁ - C₆ 直鎖または分岐アルキリジン鎖であり、ここで Q の 2 個までの非隣接メチレン単位は、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR²-、-CONR²NR²-、-CO₂-、-OCO-、-NR²CO₂-、-O-、-NR²C_{ONR²}-、-OCONR²-、-NR²NR²-、-NR²NR²CO-、-NR²CO-、-S-、-SO-、-SO₂-、-NR²-、-SO₂NR²-、NR²SO₂-、-NR²SO₂NR²-、またはスピロシクロアルキレン部分によって場合により独立して置換され；

R^Q は、C₁ - C₆ 脂肪族基、O、S、N、または NH から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員飽和、部分不飽和、または完全不飽和單環式環、あるいは O、S、N、または NH から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 12 員飽和、部分不飽和、または完全不飽和 2 環式環系であり；

ここで R^Q は、R¹、R²、R³、R⁴、または R⁵ から独立して選択される 4 個までの置換基によって場合により置換され；

R^M および R^N は独立して、R² であり；

R¹ は、オキソ、=NN(R⁶)₂、=NN(R⁷)₂、=NN(R⁶R⁷)、R⁶、または (CH₂)_n-Y であり；

n は、0、1、または 2 であり；

Y は、ハロ、CN、NO₂、CF₃、OCF₃、OH、SR⁶、S(O)R⁶、SO₂R⁶、NH₂、NHR⁶、N(R⁶)₂、NR⁶R⁸、COOH、COOR⁶、または OR⁶ であり；あるいは

隣接する環原子上の 2 個の R¹ はひとまとめにされて、1,2-メチレンジオキシまたは 1,2-エチレンジオキシを形成し；

R^2 は、水素または $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、ここで各 R^2 は、 R^1 、 R^4 、または R^5 から独立して選択される 2 個までの置換基によって場合により置換され；

R^3 は、 R^1 、 R^2 、 R^4 、または R^5 から独立して選択される 3 個までの置換基によって場合により置換された、 $C_3 - C_8$ 脂環式、 $C_6 - C_{10}$ アリール、 $C_3 - C_8$ 複素環式、または $C_5 - C_{10}$ ヘテロアリール環であり；

R^4 は、 OR^5 、 OR^6 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 $OC(O)N(R^6)_2$ 、 $OC(O)N(R^5)_2$ 、 $OC(O)N(R^6)$ 、 $OP(O)(OR^6)_2$ 、 $OP(O)(OR^5)_2$ 、 $OP(O)(OR^6)(O)R^5$ 、 SR^6 、 SR^5 、 $S(O)R^6$ 、 $S(O)R^5$ 、 SO_2R^6 、 SO_2R^5 、 $SO_2N(R^6)_2$ 、 $SO_2N(R^5)_2$ 、 $SO_2NR^5R^6$ 、 SO_3R^6 、 SO_3R^5 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)R^6$ 、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)N(R^5R^6)$ 、 $C(O)N(OR^6)R^6$ 、 $C(O)N(OR^5)R^6$ 、 $C(NOR^6)R^6$ 、 $C(NOR^6)R^5$ 、 $C(NOR^5)R^6$ 、 $C(NOR^5)R^5$ 、 $N(R^6)_2$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $N(R^5R^6)$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NR^5C(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^6SO_2R^6$ 、 $NR^6SO_2R^5$ 、 $NR^5SO_2R^5$ 、 $NR^6SO_2N(R^6)_2$ 、 $NR^6SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^6SO_2N(R^5)_2$ 、 $NR^5SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^5SO_2N(R^5)_2$ 、 $N(OR^6)R^6$ 、 $N(OR^6)R^5$ 、 $N(OR^5)R^5$ 、 $N(OR^5)R^6$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5R^6)$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5R^6)$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^6)(OR^5)$ であり；

R^5 は、3 個までの R^1 置換基によって場合により置換された、 $C_3 - C_8$ 脂環式、 $C_6 - C_{10}$ アリール、 $C_3 - C_8$ 複素環式、または $C_5 - C_{10}$ ヘテロアリール環であり；

R^6 は、H または $C_1 - C_6$ 脂肪族であり、ここで R^6 は、 R^7 置換基によって場合により置換され；

R^7 は、H、 $C_1 - C_6$ 脂肪族、または $(CH_2)_m - Z'$ （ここで m は 0 ~ 2 である）から独立して選択される 2 個までの置換基によって場合により置換された、 $C_3 - C_8$ 脂環式、 $C_6 - C_{10}$ アリール、 $C_3 - C_8$ 複素環式、または $C_5 - C_{10}$ ヘテロアリール環であり；

Z' は、八口、 CN 、 NO_2 、 $C(\text{八口})_3$ 、 $CH(\text{八口})_2$ 、 $CH_2(\text{八口})$ 、 $-O$ 、 $C(\text{八口})_3$ 、 $-OCH(\text{八口})_2$ 、 $-OCH_2(\text{八口})$ 、 OH 、 $S - (C_1 - C_6)$ 脂肪族、 $S(O) - (C_1 - C_6)$ 脂肪族、 $SO_2 - (C_1 - C_6)$ 脂肪族、 NH_2 、 $NH - (C_1 - C_6)$ 脂肪族、 $N((C_1 - C_6) \text{ 脂肪族})_2$ 、 $N((C_1 - C_6) \text{ 脂肪族})R^8$ 、 $COOH$ 、 $C(O)O(- (C_1 - C_6) \text{ 脂肪族})$ 、または $O - (C_1 - C_6)$ 脂肪族から選択され；そして

R^8 は、アセチル、 $C_6 - C_{10}$ アリールスルホニル、または $C_1 - C_6$ アルキルスルホニルである）

の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、組成物。

【請求項 29】

前記化合物が式 I、式 I - A、式 I - B、または式 I - C を含む、請求項 28 に記載の組成物。

【請求項 30】

式 I、式 I - A、式 I - B、式 I - C による化合物を含む組成物、または請求項 27 に記載の組成物であって、急性、慢性、神経障害性、または炎症性疼痛、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、ヘルペス神経痛、全身神経痛、てんかんまたはてんかん状態、神

経変性障害、精神障害、たとえば不安およびうつ病、ミオトニー、不整脈、運動障害、神経内分泌障害、運動失調、多発性硬化症、過敏性腸症候群、失禁、内臓痛、変形性関節症痛、ヘルペス後神経痛、糖尿病性ニューロパシー、根性痛、座骨神経痛、背痛、頭または頸部痛、激痛または難治性疼痛、侵害受容疼痛、突出痛、術後痛、脳卒中、双極性障害、または癌性疼痛から選択される疾患、障害、または状態の重症度を処置または軽減するための組成物。

【請求項 3 1】

前記化合物が請求項 1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載されている、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

疾患、状態、または障害が電位型ナトリウムチャネルの活性化または機能亢進で示唆される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

疾患、状態、または障害が根性痛、座骨神経痛、背痛、頭痛、頸部痛、またはニューロパシーである、請求項 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

疾患、状態、または障害が激痛または難治性疼痛、急性疼痛、術後痛、背痛、あるいは癌性疼痛である、請求項 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

疾患、状態、または障害が電位型カルシウムチャネルの活性化または機能亢進で示唆される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

疾患、状態、または障害が急性、慢性、神経障害性、または炎症性疼痛、あるいは炎症性突出痛である、請求項 3 5 に記載の組成物。