

【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

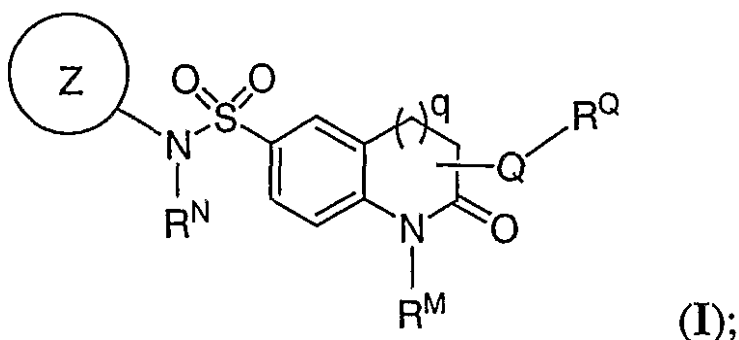
【補正の内容】

【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り；

ここで Z は、環 A の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 $C_1 - C_6$ 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、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-COCO-$ 、 $-CONR^2-$ 、 $-CONR^2NR^2-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OCO-$ 、 $-NR^2CO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-NR^2CONR^2-$ 、 $-OCONR^2-$ 、 $-NR^2NR^2-$ 、 $-NR^2NR^2CO-$ 、 $-NR^2CO-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-SO_2NR^2-$ 、 $-NR^2SO_2-$ 、 $-NR^2SO_2NR^2-$ 、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、 $C_1 - C_6$ 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、または完全不飽和単環式環、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、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、または R^5 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、 R^2 であり；

R^1 は、オキソ、 $=NN(R^6)_2$ 、 $=NN(R^7)_2$ 、 $=NN(R^6R^7)$ 、 R^6 、または $(CH_2)_n - Y$ であり；

n は、0、1、または 2 であり；

Y は、ハロ、CN、 NO_2 、 CF_3 、 OCF_3 、OH、 SR^6 、 $S(O)R^6$ 、 SO_2R^6 、 NH_2 、 NHR^6 、 $N(R^6)_2$ 、 NR^6R^8 、 $COOH$ 、 $COOR^6$ 、または OR^6 であり；あるいは

隣接する環原子上の 2 個の R^1 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 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 $OC(O)N(R^6)_2$ 、 $OC(O)N(R^5)_2$ 、 $OC(O)N(R^6)R^5$ 、 $OP(O)(OR^6)_2$ 、 $OP(O)(OR^5)_2$ 、 $OP(O)(OR^6)(OR^5)$ 、 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 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)R^6$ 、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)N(R^5R^6)$ 、 $C(O)N(OR^6)R^6$ 、 $C(O)N(OR^5)R^6$ 、 $C(O)N(OR^6)R^5$ 、 $C(O)N(OR^5)R^5$ 、 $C(NOR^6)R^6$ 、 $C(NOR^6)R^5$ 、 $C(NOR^5)R^6$ 、 $C(NOR^5)R^5$ 、 $N(R^6)_2$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $N(R^5R^6)$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^5$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NR^5C(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^6SO_2R^6$ 、 $NR^6SO_2R^5$ 、 $NR^5SO_2R^5$ 、 $NR^6SO_2N(R^6)_2$ 、 $NR^6SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^6SO_2N(R^5)_2$ 、 $NR^5SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^5SO_2N(R^5)_2$ 、 $N(OR^6)R^6$ 、 $N(OR^6)R^5$ 、 $N(OR^5)R^5$ 、 $N(OR^5)R^6$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5R^6)$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5R^6)$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)_2$ 、または $P(O)(OR^6)(OR^5)$ 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、ハロ、 CN 、 NO_2 、 C （ハロ） $_3$ 、 CH （ハロ） $_2$ 、 CH_2 （ハロ）、 $-OC$ （ハロ） $_3$ 、 $-OCH$ （ハロ） $_2$ 、 $-OCH_2$ （ハロ）、 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、 $N((C_1 - C_6) 脂肪族)_2$ 、 $N((C_1 - C_6) 脂肪族)R^8$ 、 $COOH$ 、 $C(O)O - (C_1 - C_6)$ 脂肪族、または $O - (C_1 - C_6)$ 脂肪族から選択され；

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り；そして

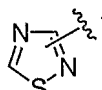
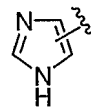
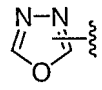
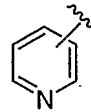
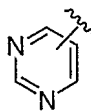
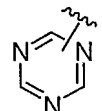
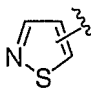
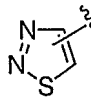
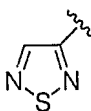
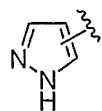
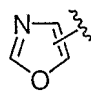
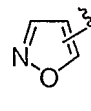
前記化合物が N - [4 - シアノ - 5 - (メチルチオ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 1, 2 - ジヒドロ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - (トリフロロメチル) - 6 - キノリンスルホンアミドでないという条件である）

の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

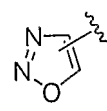
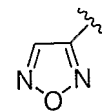
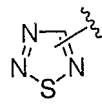
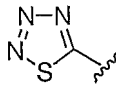
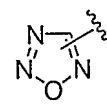
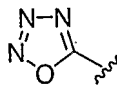
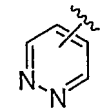
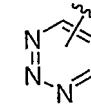
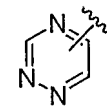
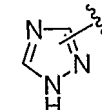
【請求項 2】

Z が：

【化 2】

**a-i,****a-ii,****a-iii,****a-iv,****a-v,****a-vi,****a-vii,****a-viii,****a-ix,****a-x,****a-xi,****a-xii,****a-xiii,****a-xiv,****a-xv,****a-xvi,**

【化 3】

**a-xvii,****a-xviii,****a-xix,****a-xx,****a-xxi,****a-xxii,****a-xxiii,****a-xxiv,****a-xxv,**または **a-xxvi.**

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^2 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^2 が、水素、ハロ、 OR^6 、 $C_1 - C_6$ 脂肪族、あるいは $C_3 - C_8$ 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、 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、 $O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ 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、 $C_1 - C_6$ 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 、 $N(C_1 - C_4 \text{ アルキル})$ 、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 $-X_2 - (X_1)_p -$ であり、

式中：

X_2 は、結合または 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た $C_1 - C_6$ 脂肪族であり；

p は、0 または 1 であり；そして

X_1 は、 O 、 S 、または NR^2 である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

X_2 が結合、 $C_1 - C_6$ アルキル、または $C_2 - C_6$ 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 R^1 または R^4 によって独立して場合により置換される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

X_2 が、結合、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-C(Me)_2-$ 、 $-CH(Me)-$ 、 $-C(Me)=CH-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-CH(Ph)-$ 、 $-CH_2-CH(Me)-$ 、 $-CH(Et)-$ 、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。

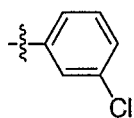
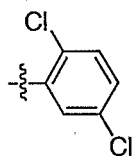
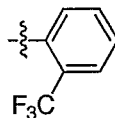
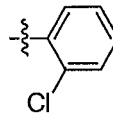
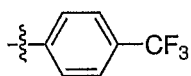
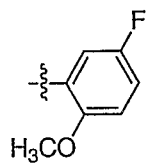
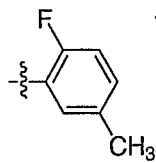
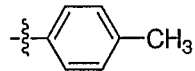
【請求項 15】

R^Q が、ハロ、シアノ、トリフルオロメチル、 OH 、 $C_1 - 4$ アルキル、 $C_2 - 4$ アルケニル、 $C_1 - 4$ アルコキシ、トリフルオロメトキシ、 $C(O)NH_2$ 、 NH_2 、 $NH(C_1 - 4 \text{ アルキル})$ 、 $N(C_1 - 4 \text{ アルキル})_2$ 、 $NHC(O)C_1 - 4 \text{ アルキル}$ 、または $C(O)C_1 - 4 \text{ アルキル}$ 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。

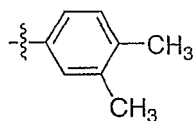
【請求項 16】

R^Q が：

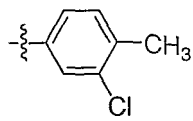
【化 4】

**xlix,****I,****II,****III,****liii,****liv,****Iv,****lvi,**

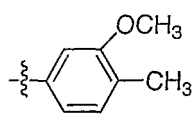
【化 5】



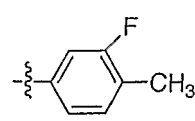
lvii,



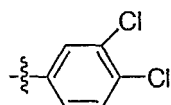
lviii,



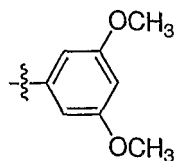
lvix,



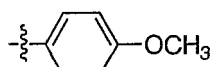
lx,



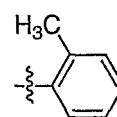
lxi,



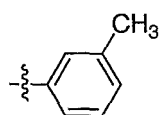
lxii,



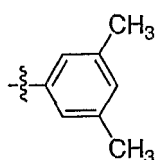
lxiii,



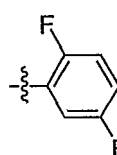
lxiv,



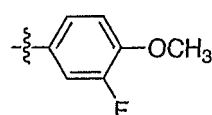
lxv,



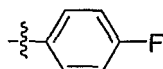
lxvi,



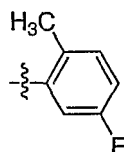
lxvii,



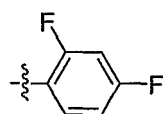
lxviii,



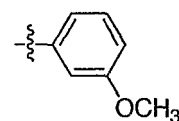
lxix,



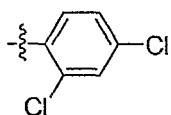
lxx,



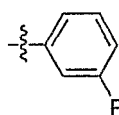
lxxi,



lxxii,



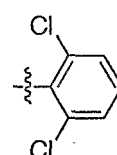
lxxiii,



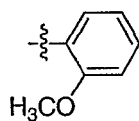
lxxiv,



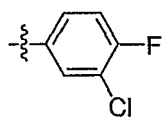
lxxv,



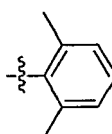
lxxvi,



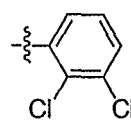
lxxvii,



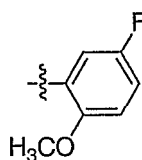
lxxviii,



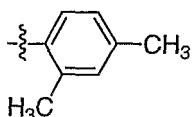
lxxix,



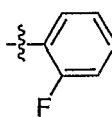
lxxx,



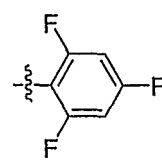
lxxxi,



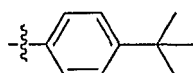
lxxxii,



lxxxiii,



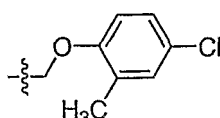
lxxxiv,



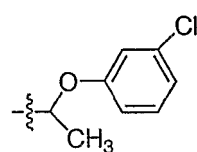
lxxxv,



lxxxvi,

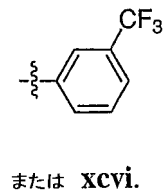
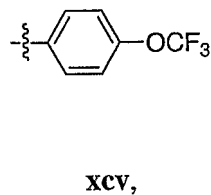
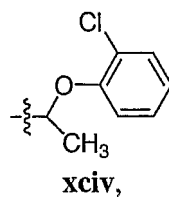
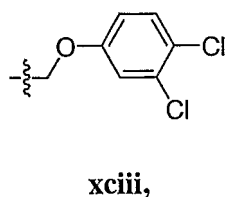
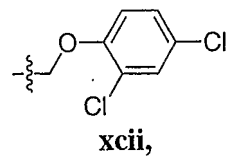
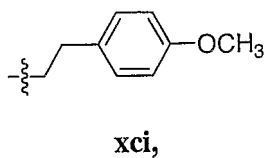
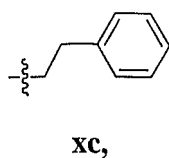
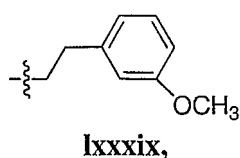


lxxxvii,



lxxxviii,

【化 6】



から選択される、請求項 15 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。

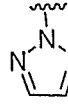
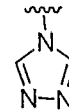
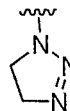
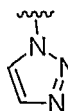
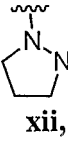
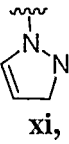
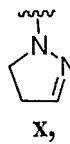
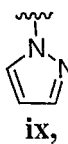
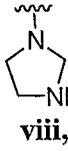
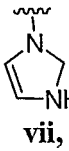
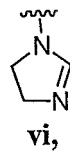
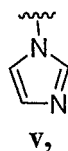
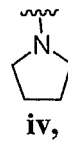
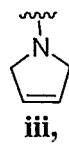
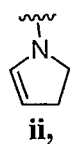
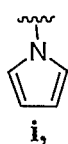
【請求項 19】

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 員単環式、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】

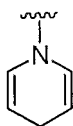
R^Q が：

【化 7】

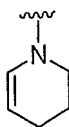


【化 8】

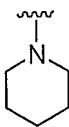
xiii,



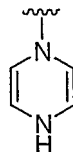
xiv,



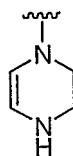
xv,



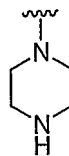
xvi,



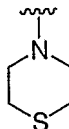
xvii,



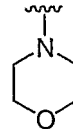
xviii,



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 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

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 20 に記載の化合物。

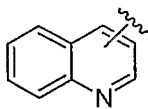
【請求項 22】

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。

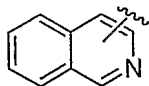
【請求項 23】

R^Q が：

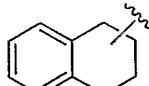
【化 9】



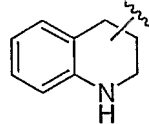
xxv,



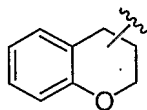
xxvi,



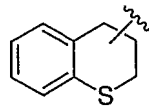
xxvii,



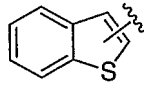
xxviii,



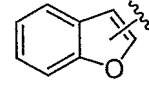
xxix,



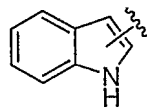
xxx,



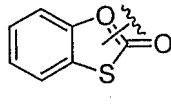
xxxi,



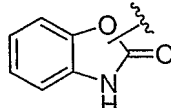
xxxii,



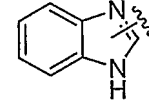
xxxiii,



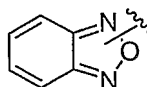
xxxiv,



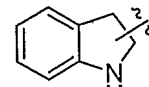
xxxv,



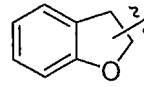
xxxvi,



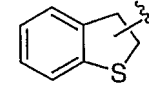
xxxvii,



xxxviii,

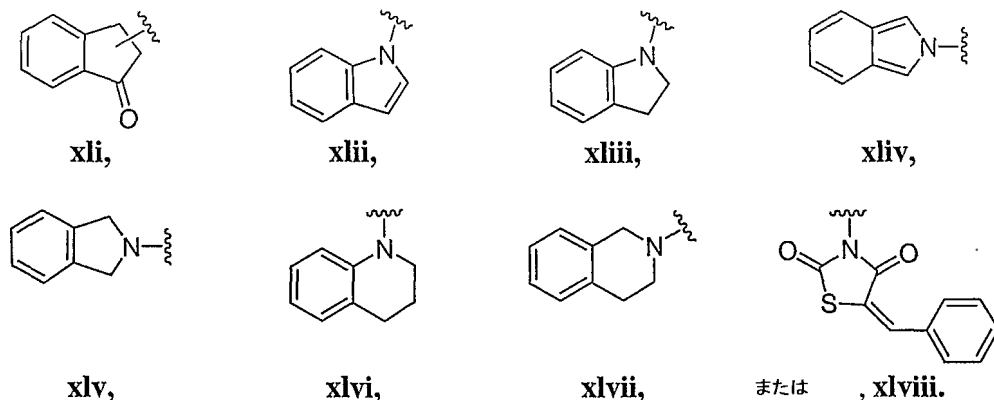


xxxix,



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。

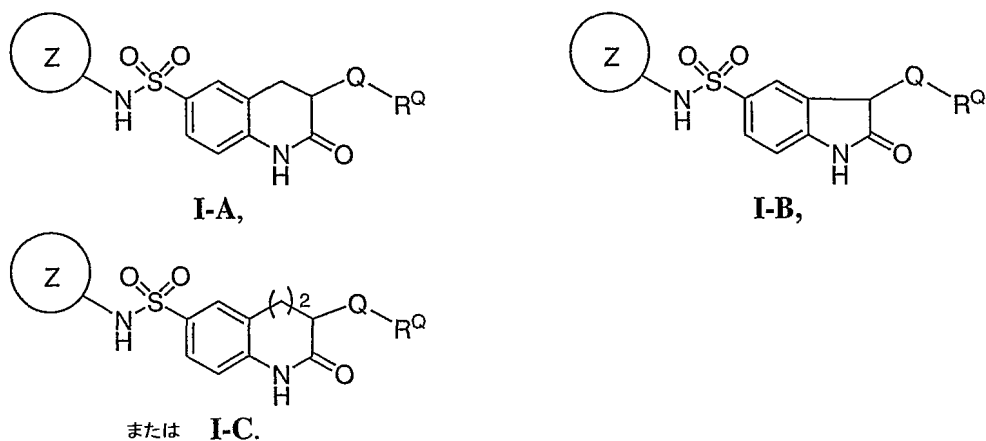
【請求項 24】

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 - トリフルオロメチル - 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、6 - メチル - 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】

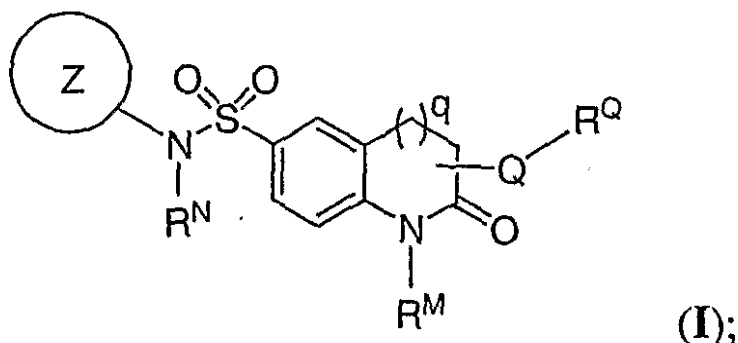
(a) 患者；または

(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 $C_1 - C_6$ 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-、-NR²CONR²-、-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、 $C_1 - C_6$ 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、または完全不飽和単環式環、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、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、または R^5 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、 R^2 であり；

R^1 は、オキソ、=NN(R^6)₂、=NN(R^7)₂、=NN(R^6R^7)、 R^6 、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(R^6)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 R^1 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 、 $OC(O)R^6$ 、 $OC(O)R^5$ 、 $OC(O)OR^6$ 、 $OC(O)OR^5$ 、 $OC(O)N(R^6)_2$ 、 $OC(O)N(R^5)_2$ 、 $OC(O)N(R^6)R^5$ 、 $OP(O)(OR^6)_2$ 、 $OP(O)(OR^5)_2$ 、 $OP(O)(OR^6)(OR^5)$ 、 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 、 $C(O)R^5$ 、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)R^6$ 、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)N(R^6)_2$ 、 $C(O)N(R^5)_2$ 、 $C(O)N(R^5)R^6$ 、 $C(O)N(OR^6)R^6$ 、 $C(O)N(OR^5)R^6$ 、 $C(O)N(OR^6)R^5$ 、 $C(O)N(OR^5)R^5$ 、 $C(NOR^6)R^6$ 、 $C(NOR^6)R^5$ 、 $C(NOR^5)R^6$ 、 $C(NOR^5)R^5$ 、 $N(R^6)_2$ 、 $N(R^5)_2$ 、 $N(R^5)R^6$ 、 $NR^5C(O)R^5$ 、 $NR^6C(O)R^6$ 、 $NR^6C(O)R^5$ 、 $NR^6C(O)OR^6$ 、 $NR^5C(O)OR^6$ 、 $NR^6C(O)OR^5$ 、 $NR^5C(O)OR^5$ 、 $NR^6C(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^6C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^6C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^5C(O)N(R^6)_2$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)N(R^5)_2$ 、 $NR^6SO_2R^6$ 、 $NR^6SO_2R^5$ 、 $NR^5SO_2R^5$ 、 $NR^6SO_2N(R^6)_2$ 、 $NR^6SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^6SO_2N(R^5)_2$ 、 $NR^5SO_2NR^5R^6$ 、 $NR^5SO_2N(R^5)_2$ 、 $N(OR^6)R^6$ 、 $N(OR^6)R^5$ 、 $N(OR^5)R^5$ 、 $N(OR^5)R^6$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5)R^6$ 、 $P(O)(OR^6)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5)R^6$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)N(R^5)_2$ 、 $P(O)(OR^6)_2$ 、 $P(O)(OR^5)_2$ 、または $P(O)(OR^6)(OR^5)$ 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、ハロ、CN、 NO_2 、 C （ハロ） $_3$ 、 CH （ハロ） $_2$ 、 CH_2 （ハロ）、 $-OC$ （ハロ） $_3$ 、 $-OCH$ （ハロ） $_2$ 、 $-OCH_2$ （ハロ）、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、 $N((C_1 - C_6) \text{ 脂肪族})_2$ 、 $N((C_1 - C_6) \text{ 脂肪族})R^8$ 、 $COOH$ 、 $C(O)O - (C_1 - C_6)$ 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。