

【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9月24日 (2009.9.24)

【公表番号】特表2008-543785(P2008-543785A)

【公表日】平成20年12月4日 (2008.12.4)

【年通号数】公開・登録公報2008-048

【出願番号】特願2008-516024(P2008-516024)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (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 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/52 C S P

A 6 1 K 31/426

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/427

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 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/02 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月15日 (2009.5.15)

## 【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

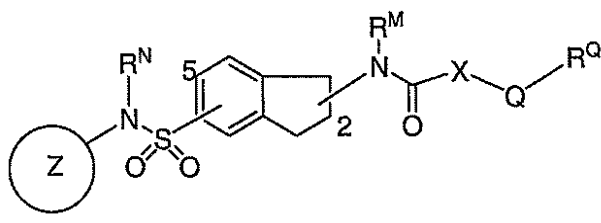
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

化学式 I :

【化 6 4】



の化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって；

ここで、

環 Z は、O、S、N、または NH から選択される少なくとも 1 つの環の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、該環 Z は、 $R^Z$  の z の存在で任意に置換され；

$z$  は 0 - 4 であり；

$R^Z$  は  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、または  $R^5$  から選択され；

X は、結合、O、 $NR^2$ 、または  $C(R^2)_2$  であり；

Q は、結合または C 1 - C 6 直鎖もしくは分枝アルキリデン鎖であり、ここで、2 つまでの隣接しない Q のメチレン単位は、任意にかつ独立して、-CO-、-CS-、-COCO-、-CONR<sup>2</sup>-、-CONR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-CO<sub>2</sub>-、-OCO-、-NR<sup>2</sup>CO<sub>2</sub>-、-O-、-NR<sup>2</sup>CONR<sup>2</sup>-、-OCONR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>-、-NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>CO-、-NR<sup>2</sup>CO-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>2</sup>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>-、NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>-、またはスピロシクロアルキレン部分によって置き換えられ；

$R^Q$  は、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、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 脂肪族基、3 - 8 員の飽和、部分飽和、もしくは完全に不飽和の単環、または 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 員の飽和、部分飽和、もしくは完全に不飽和の二環式系であり；

$R^Q$  は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、または  $R^5$  から選択される 5 個までの置換基で任意に選択され；

$R^M$  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<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、SR<sup>6</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NH<sub>2</sub>、NHR<sup>6</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>、COOH、COOR<sup>6</sup> または OR<sup>6</sup> であり；あるいは

隣接する環原子上の 2 つの  $R^1$  は、一緒になって、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 個までの置換基で任意に置換され；

$R^3$  は、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^4$  または  $R^5$  から独立して選択される 3 個までの置換基で任意に置換された 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 1 0 ヘテロアリール環であり；

R<sup>4</sup> は、OR<sup>5</sup>、OR<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>5</sup>、OC(O)OR<sup>6</sup>、OC(O)OR<sup>5</sup>、OC(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>6</sup>R<sup>5</sup>)、OP(O)(OR<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>6</sup>)(OR<sup>5</sup>)、SR<sup>6</sup>、SR<sup>5</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、S(O)R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>5</sup>、C(O)R<sup>5</sup>、C(O)OR<sup>5</sup>、C(O)R<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、またはP(O)(OR<sup>6</sup>)(OR<sup>5</sup>)であり；

R<sup>5</sup> は、3 個までの R<sup>1</sup> 置換基で任意に置換された C 3 - C 8 脂環式、C 6 - C 1 0 アリール、C 3 - C 8 複素環式、または C 5 - C 1 0 ヘテロアリール環であり；

R<sup>6</sup> は、H または C 1 - C 6 脂肪族であり、ここで、R<sup>6</sup> は、R<sup>7</sup> 置換基で任意に置換されており；

R<sup>7</sup> は C 3 - C 8 脂環式、C 6 - C 1 0 アリール、C 3 - C 8 複素環式、または C 5 - C 1 0 ヘテロアリール環であり、そして各 R<sup>7</sup> は、H、C 1 - C 6 脂肪族、または (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - Z' から独立して選択される 2 個までの置換基で任意に置換され、ここで、m は 0 - 2 であり；

Z' は、ハロ、CN、NO<sub>2</sub>、C(ハロ)<sub>3</sub>、CH(ハロ)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>(ハロ)、-O C(ハロ)<sub>3</sub>、-OCH(ハロ)<sub>2</sub>、-OCH<sub>2</sub>(ハロ)、OH、S-(C 1 - C 6)脂肪族、S(O)-(C 1 - C 6)脂肪族、SO<sub>2</sub>-(C 1 - C 6)脂肪族、NH<sub>2</sub>、NH-(C 1 - C 6)脂肪族、N((C 1 - C 6)脂肪族)<sub>2</sub>、N((C 1 - C 6)脂肪族)R<sup>8</sup>、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；および

R<sup>8</sup> はアセチル、C 6 - C 1 0 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；

以下の条件：

(i) 環 Z が任意に置換されたピリミジン - 2 - イルであり、スルホニル基が 5 位に結合され、N(R<sup>2</sup>)C(O)基が 2 位に結合され、R<sup>2</sup> が H であり、そして X および Q が各々結合である場合、R<sup>Q</sup> は、任意に置換されたフェニルまたは 6 - クロロ - キノリン - 8 - イル、フルオレン - 9 - イルエチル、フルオレン - 9 - イルメチル、インドリン - 1 - イル、シクロヘキシル、(フェニルチオ)メチル、3 - メトキシ - チオフェン - 2 - イル、フラン - 2 - イル、(フェノキシ)メチル、3 - クロロ - チオフェン - 2 - イル、(任意に置換されたフェニル)エチル、もしくはブチルではなく；

(ii) 環 Z が任意に置換されたピリミジン - 2 - イルであり、スルホニル基が 5 位に結合され、そして N(R<sup>2</sup>)C(O)基が 2 位に結合され、R<sup>2</sup> が H であり、そして X および Q が各々結合である場合、R<sup>Q</sup> は 2 - メチル - 5 - クロロ - 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 7 - イルではなく；

(iii) 環 Z が任意に置換されたピリミジン - 2 - イルであり、スルホニル基が 5 位

に結合され、そして  $N(R^2)C(O)$  基が 2 位に結合され、 $R^2$  が H であり、そして X が - O - であり、Q が結合である場合、 $R^Q$  はエチルまたはベンジルではなく；および

(iv) 環 Z が任意に置換されたピリミジン - 2 - イルであり、スルホニル基が 5 位に結合され、そして  $N(R^2)C(O)$  基が 2 位に結合され、 $R^2$  が H であり、そして X が - N(Me) - であり、および Q が結合である場合、 $R^Q$  は 2 - メチルフェニルではない、

である、

化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

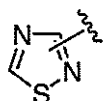
【請求項 2】

Z が

【化 6 6】



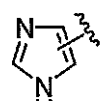
**a-i,**



**a-ii,**



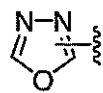
**a-iii,**



**a-iv,**



**a-v,**



**a-vi,**



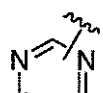
**a-vii,**



**a-viii,**



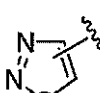
**a-ix,**



**a-x,**



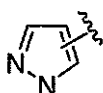
**a-xi,**



**a-xii,**



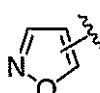
**a-xiii,**



**a-xiv,**

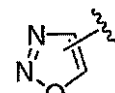


**a-xv,**

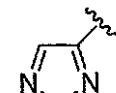


**a-xvi,**

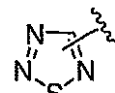
【化 6 7 - 1】



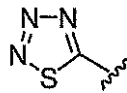
**a-xvii,**



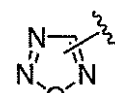
**a-xviii,**



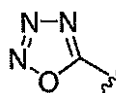
**a-xix,**



**a-xx,**



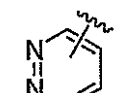
**a-xxi,**



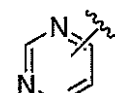
**a-xxii,**



**a-xxiii,**



**a-xxiv,**



または  
**a-xxv.**

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

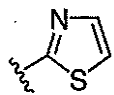
【請求項 3】

z が 0 - 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

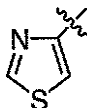
【請求項 4】

z が

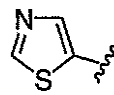
【化 67 - 2】



**a-i-a,**



**a-i-b,**



または **a-i-c.**

から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

R<sup>M</sup> が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R<sup>N</sup> が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

X が、結合、CH<sub>2</sub>、または O から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

Q が結合または C 1 - C 6 直鎖もしくは分枝アルキリデン鎖から選択され、ここで、該アルキリデンの 2 個までのメチレン単位が O、S、OCO、NH、N(R<sup>2</sup>)、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 9】

Q が -X<sub>2</sub>-(X<sub>1</sub>)<sub>p</sub>- であり、

ここで、

X<sub>2</sub> が結合または、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、もしくは R<sup>5</sup> から独立して選択される 2 個までの置換基で任意に置換された C 1 - C 6 脂肪族であり；

p は 0 または 1 であり；および

X<sub>1</sub> は O、S、または NR<sup>2</sup> である、

請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

X<sub>2</sub> 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、該アルキルまたはアルキリデンが、独立してかつ任意に R<sup>1</sup> または R<sup>4</sup> で置換される、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

X<sub>2</sub> が、結合、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-C(Me)<sub>2</sub>-、-CH(Me)-、-C(Me)=CH-、-CH=CH-、-CH(Ph)-、-CH<sub>2</sub>-CH(Me)-、-CH(Et)-、または -CH(i-Pr)- から選択される、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

X<sub>1</sub> が NH または -N(C 1 - C 6 アルキル)- である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 13】

R<sup>Q</sup> が、ハロ、シアノ、トリフルオロメチル、OH、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル、C<sub>2</sub>-<sub>4</sub> アルケニル、C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルコキシ、トリフルオロメトキシ、C(O)NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル)、N(C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル)<sub>2</sub>、NHC(O)C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキル、または C(O)C<sub>1</sub>-<sub>4</sub> アルキルから選択される 4 個までの置換基で任意に置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

R<sup>Q</sup> が、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、任意に置換された 3 - 8 員の飽和、部分飽和、または芳香族の単環である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

R<sup>Q</sup> が任意に置換されたフェニルである、請求項 14 に記載の化合物。

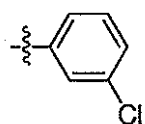
## 【請求項 16】

前記フェニルが、ハロ、シアノ、トリフルオロメチル、OH、C<sub>1</sub>-4 アルキル、C<sub>2</sub>-4 アルケニル、C<sub>1</sub>-4 アルコキシ、トリフルオロメトキシ、C(O)NH<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、NH(C<sub>1</sub>-4 アルキル)、N(C<sub>1</sub>-4 アルキル)<sub>2</sub>、NHC(O)C<sub>1</sub>-4 アルキル、または C(O)C<sub>1</sub>-4 アルキルから選択される 3 個までの置換基で任意に置換されている、請求項 15 に記載の化合物。

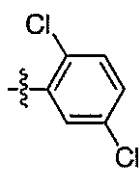
## 【請求項 17】

R<sup>Q</sup> が

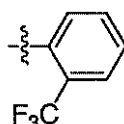
## 【化 71】



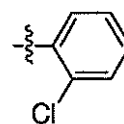
xlix,



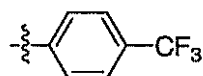
I,



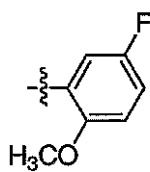
li,



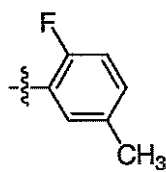
lii,



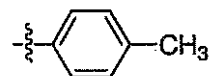
liii,



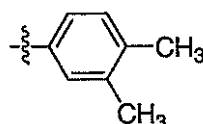
liv,



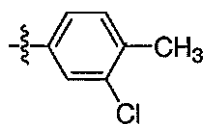
lv,



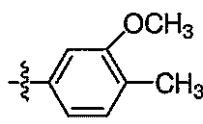
lvi,



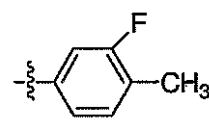
lvii,



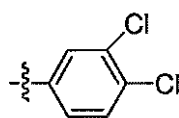
lviii,



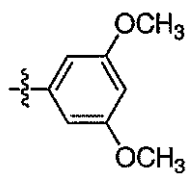
lvix,



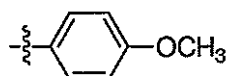
lx,



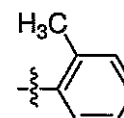
lxi,



lxii,

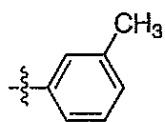


lxiii,

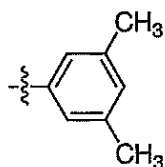


lxiv,

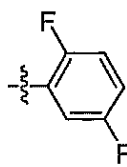
【化 7 2】



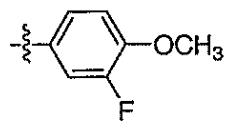
lxxv,



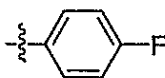
lxxvi,



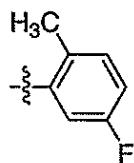
lxxvii,



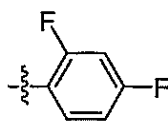
lxxviii,



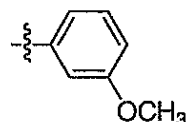
lxxix,



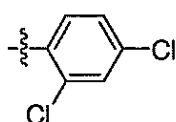
lxxx,



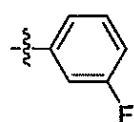
lxxxi,



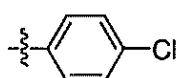
lxxxii,



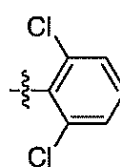
lxxxiii



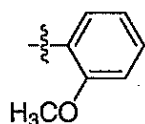
lxxxiv,



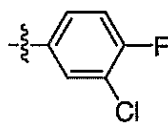
lxxxv,



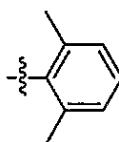
lxxxvi,



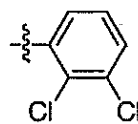
lxxxvii,



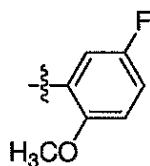
lxxxviii,



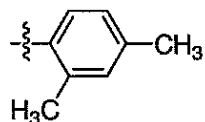
lxxxix,



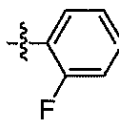
lxxx,



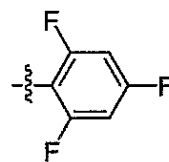
lxxxxi,



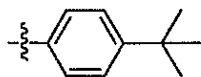
lxxxii,



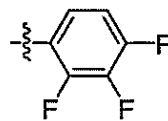
lxxxiii



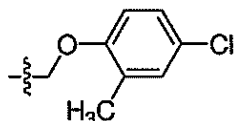
lxxxiv,



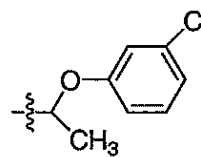
lxxxv



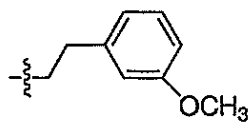
lxxxvi,



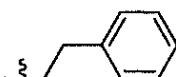
lxxxvii,



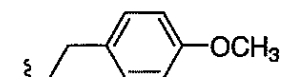
lxxxviii,



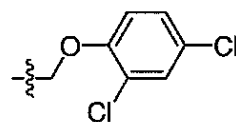
lxxxix,



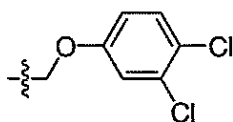
xc,



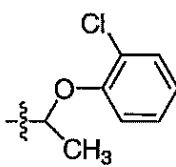
xci,



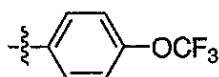
xcii,



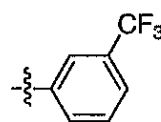
xciii,



xciv,



xcv,



または xcvi.

から選択される、請求項 1 5 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

R<sup>Q</sup> が、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、任意に置換された8 - 12員の飽和、部分飽和、または完全不飽和の二環式環系である、請求項1に記載の化合物。

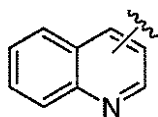
## 【請求項 19】

R<sup>Q</sup> が、任意に置換された8 - 10員二環式芳香族複素環である、請求項18に記載の化合物。

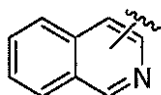
## 【請求項 20】

R<sup>Q</sup> が、以下：

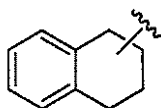
## 【化 74 - 2】



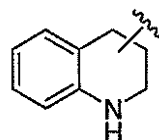
xxv,



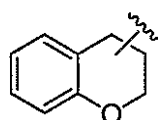
xxvi,



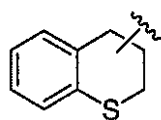
xxvii,



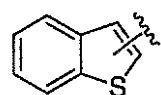
xxviii,



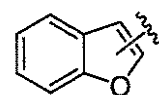
xxix,



xxx,

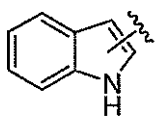


xxxi,

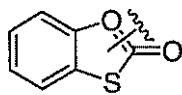


xxxii,

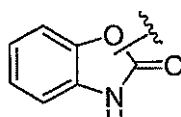
## 【化 75 - 1】



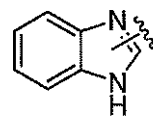
xxxiii,



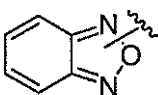
xxxiv,



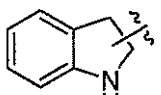
xxxv,



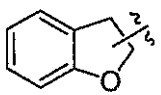
xxxvi,



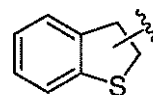
xxxvii,



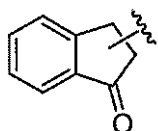
xxxviii,



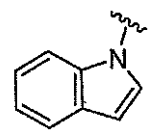
xxxix,



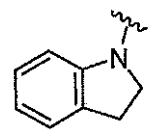
xl,



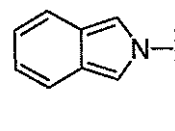
xli,



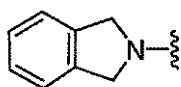
xlii,



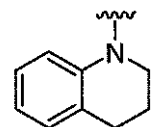
xliii,



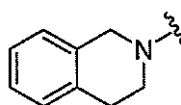
xliv,



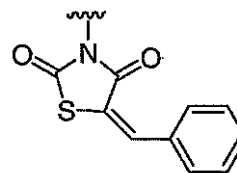
xlv,



xlvi,



xlvii,



または, xlviii.

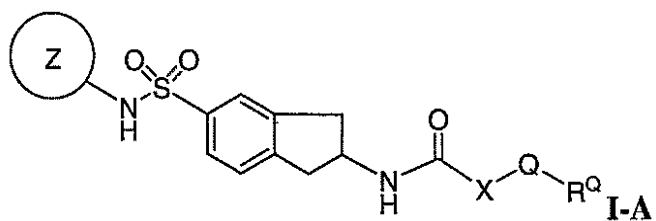
から選択される、任意に置換された環である、請求項18に記載の化合物。

## 【請求項 21】

化学式 I - A :



【化 7 5 - 2】

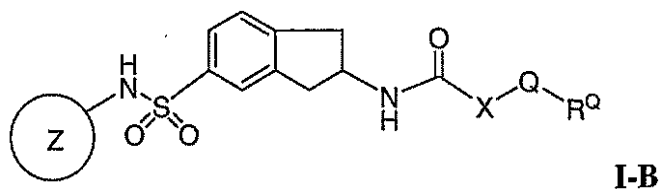


を有し、ここで、環 Z、X、Q、および  $R^Q$  は上記に定義される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

化学式 I - B :

【化 7 6 - 1】

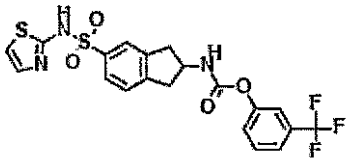
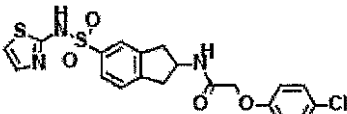
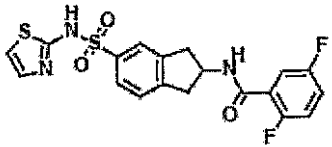
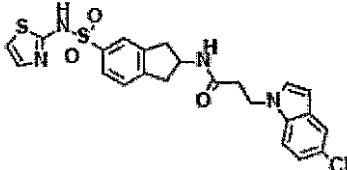
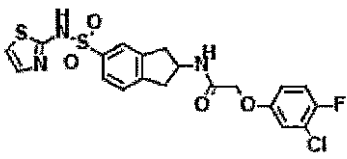
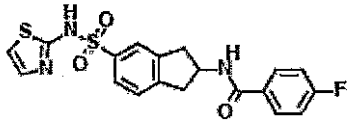
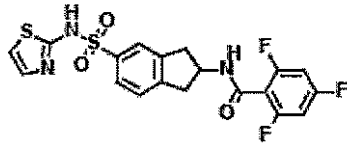
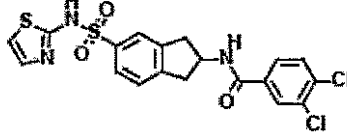
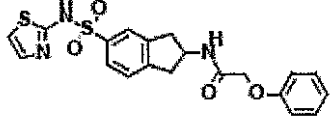
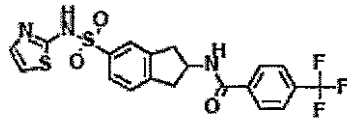
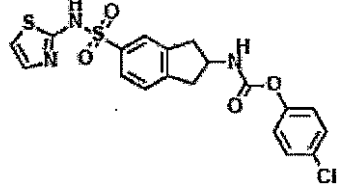
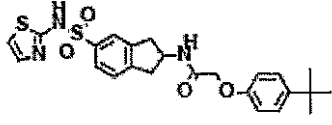


を有し、ここで、環 Z、X、Q、および  $R^Q$  は上記に定義される、請求項 1 に記載の化合物。

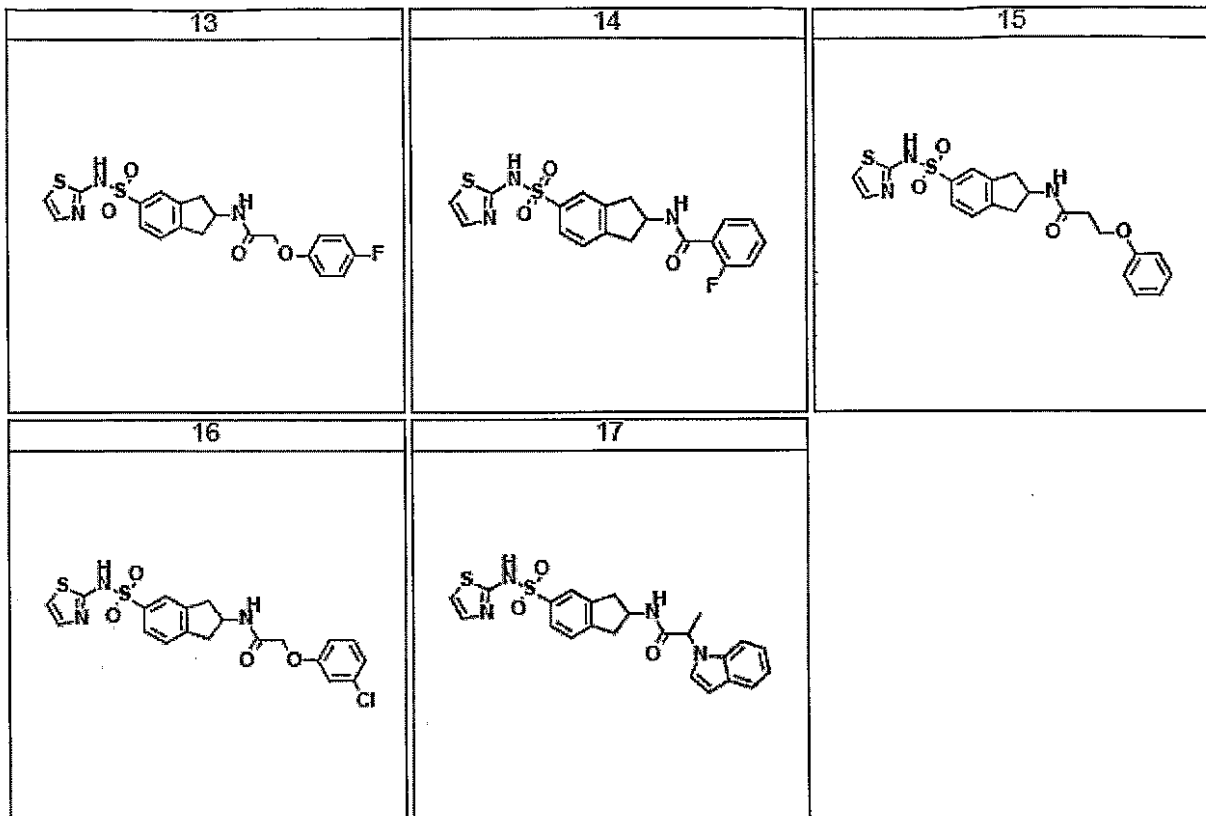
【請求項 2 3】

以下：

## 【化 3 6】

<p>1</p> 	<p>2</p> 	<p>3</p> 
<p>4</p> 	<p>5</p> 	<p>6</p> 
<p>7</p> 	<p>8</p> 	<p>9</p> 
<p>10</p> 	<p>11</p> 	<p>12</p> 

## 【化 3 7】



から選択される化合物。

## 【請求項 2 4】

請求項 1 - 2 3 のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

## 【請求項 2 5】

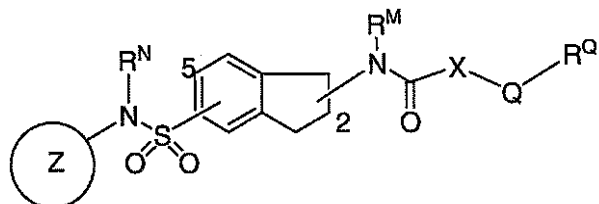
(a) 患者；または

(b) 生物学的試料における、

NaV1.1、NaV1.2、NaV1.3、NaV1.4、NaV1.5、NaV1.6、NaV1.7、NaV1.8、NaV1.9、またはCaV2.2の1つ以上の活性を阻害するための組成物であって、

該組成物は、化学式 I：

## 【化 7 6 - 2】



(I)

の化合物またはその薬学的に受容可能な塩を含み、  
ここで、

Zは、O、S、N、またはNHから選択される、少なくとも1個の環の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、該環ZはR<sup>Z</sup>のzの存在で任意に置換され；

zは0 - 4であり；

R<sup>Z</sup>はR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、またはR<sup>5</sup>から選択され；

Xは結合、O、NR<sup>2</sup>、またはC(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>であり；

Qは、結合またはC 1 - C 6 直鎖または分枝アルキリデン鎖であり、ここで、2 個までの隣接しないQのメチレン単位が、- CO -、- CS -、- COCO -、- CONR<sup>2</sup> -、- CONR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup> -、- CO<sub>2</sub> -、- OCO -、- NR<sup>2</sup>CO<sub>2</sub> -、- O -、- NR<sup>2</sup>CONR<sup>2</sup> -、- OCONR<sup>2</sup> -、- NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup> -、- NR<sup>2</sup>NR<sup>2</sup>CO -、- NR<sup>2</sup>CO -、- S -、- SO、- SO<sub>2</sub> -、- NR<sup>2</sup> -、- SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup> -、NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub> -、- NR<sup>2</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup> -、またはスピロシクロアルキレン部分によって任意にかつ独立して置き換えられ；

R<sup>Q</sup>は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 脂肪族基、O、S、N、もしくは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、部分飽和、もしくは完全不飽和単環、またはO、S、N、もしくは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、部分飽和、もしくは完全不飽和二環系であり；

ここで、R<sup>Q</sup>はR<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、またはR<sup>5</sup>から選択される4 個までの置換基で任意に置換され；

R<sup>M</sup>およびR<sup>N</sup>は独立してR<sup>2</sup>であり；

R<sup>1</sup>はオキソ、= NN(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、= NN(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、= NN(R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)、R<sup>6</sup>または(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - Yであり；

nは0、1または2であり；

Yはハロ、CN、NO<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、OH、SR<sup>6</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NH<sub>2</sub>、NHR<sup>6</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>、COOH、COOR<sup>6</sup>またはOR<sup>6</sup>であり；あるいは

隣接する環原子上の2 個のR<sup>1</sup>は、一緒になって、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<sup>2</sup>は水素またはC 1 - C 6 脂肪族であり、ここで、各R<sup>2</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>4</sup>、またはR<sup>5</sup>から独立して選択される2 個までの置換基で任意に置換され；

R<sup>3</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>から独立して選択される3 個までの置換基で任意に置換されたC 3 - C 8 脂環式、C 6 - C 10 アリール、C 3 - C 8 複素環、またはC 5 - C 10 ヘテロアリール環であり；

R<sup>4</sup>は、OR<sup>5</sup>、OR<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>6</sup>、OC(O)R<sup>5</sup>、OC(O)OR<sup>6</sup>、OC(O)OR<sup>5</sup>、OC(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OC(O)N(R<sup>6</sup>R<sup>5</sup>)、OP(O)(OR<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、OP(O)(OR<sup>6</sup>)(OR<sup>5</sup>)、SR<sup>6</sup>、SR<sup>5</sup>、S(O)R<sup>6</sup>、S(O)R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>3</sub>R<sup>5</sup>、C(O)R<sup>5</sup>、C(O)OR<sup>5</sup>、C(O)R<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、C(O)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(O)N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(O)N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、C(NOR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、NR<sup>5</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)OR<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>C(O)NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>C(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、N(OR<sup>6</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>5</sup>、N(OR<sup>5</sup>)R<sup>6</sup>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、P(O)(OR<sup>6</sup>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>5</sup>R<sup>6</sup>)、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、P(O)(OR<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、またはP(O)(OR<sup>6</sup>)(OR<sup>5</sup>)であり；

R<sup>5</sup>は、3 個までのR<sup>1</sup>置換基で任意に置換された、C 3 - C 8 脂環式、C 6 - C 10 アリール、C 3 - C 8 複素環、またはC 5 - C 10 ヘテロアリール環であり；

R<sup>6</sup>は、HまたはC 1 - C 6 脂肪族であり、ここで、R<sup>6</sup>はR<sup>7</sup>置換基で任意に置換さ

れており；

$R^7$  は、 $C_3 - C_8$  脂環式、 $C_6 - C_{10}$  アリール、 $C_3 - C_8$  複素環、または  $C_5 - C_{10}$  ヘテロアリール環であり、各  $R^7$  は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$  脂肪族、または  $(CH_2)_m - Z'$  から独立して選択される 2 個までの置換基で任意に置換され、ここで、 $m$  は 0 - 2 であり；

$Z'$  は、ハロ、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $C$  (ハロ) $_3$ 、 $CH$  (ハロ) $_2$ 、 $CH_2$  (ハロ)、 $-O$   $C$  (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；ならびに

$R^8$  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、組成物。

【請求項 26】

前記化合物が請求項 1 に記載の化学式 I、請求項 21 に記載の化学式 I - A、または請求項 22 に記載の化学式 I - B を有する、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 27】

急性、慢性、神経障害性、または炎症性の痛み、関節炎、片頭痛、群発性頭痛、三叉神経痛、ヘルペス性神経痛、一般神経痛、てんかん、またはてんかん状態、神経変性障害、精神障害、例えば、不安およびうつ病、筋緊張症、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、失調症、内臓痛、変形性関節症の痛み、ヘルペス後神経痛、糖尿病性神経障害、根性痛、坐骨神経痛、背痛、頭頸部痛、重篤または難治性疼痛、侵害受容性疼痛、突出痛、術後疼痛、脳卒中、双極性障害、または癌の痛みから選択される疾患、障害、または状態の重篤度を治療または軽減するための組成物であって、請求項 1 に記載の化学式 I、請求項 21 に記載の化学式 I - A、または請求項 22 に記載の化学式 I - B に従う化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項 28】

前記化合物が請求項 1 - 23 のいずれか一項に記載されている、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記疾患、状態、または障害が電位依存性ナトリウムチャネルの活性化または機能亢進に関与する、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記疾患、状態、または障害が、根性痛、坐骨神経痛、背痛、頭部痛、頸部痛、または神経障害である、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 31】

前記疾患、状態、または障害が、重篤または難治性疼痛、急性痛、術後疼痛、背痛、または癌の痛みである、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 32】

前記疾患、状態、または障害が電位依存性カルシウムチャネルの活性化または機能亢進に関与する、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 33】

前記疾患、状態、または障害が、急性痛、慢性痛、神経障害性の痛み、または炎症性の痛み、炎症性突出痛である、請求項 32 に記載の組成物。