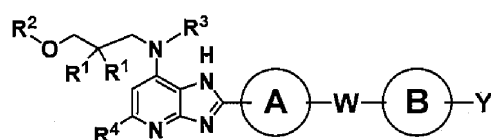


請求の範囲

[請求項1] 次の式 [1] :

[化1]

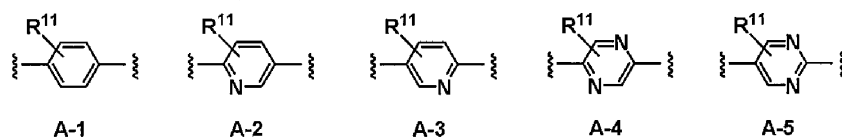


[1]

[式中、R¹は、水素原子、若しくはアルキルであるか、又は2つのR¹が隣接する炭素原子と一緒にあって、3～7員のシクロアルキル、若しくは酸素を含有する非芳香族複素環を形成してもよく、
R²は水素原子、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルが置換したアルキル、又はアルコキシアルキルであり、
R³は水素原子、アルキル、又はアルコキシアルキルであり、
R⁴はアルキル、トリハロアルキル、アルコキシ、シアノ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1個若しくは2個の基で置換されていてもよいピリジル、又はトリハロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1個～3個の基で置換されていてもよいフェニルであり、

Aは、以下のA-1、A-2、A-3、A-4、又はA-5 :

[化2]

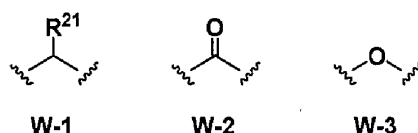


(各基の左側の結合手は式 [1] のアザベンゾイミダゾールの2位に結合し、右側の結合手は式 [1] のWに結合し、R¹¹は水素原子、

ハロゲン、アルキル、アルコキシ、及びニトロから選択される基である。) で表される基であり、

Wは、結合手、又は以下のW-1、W-2、若しくはW-3：

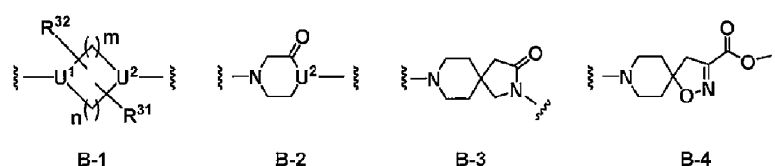
[化3]



(R^{21} は水素原子、又はアルキルである。) で表される基であり、

Bは、以下のB-1、B-2、B-3、又はB-4：

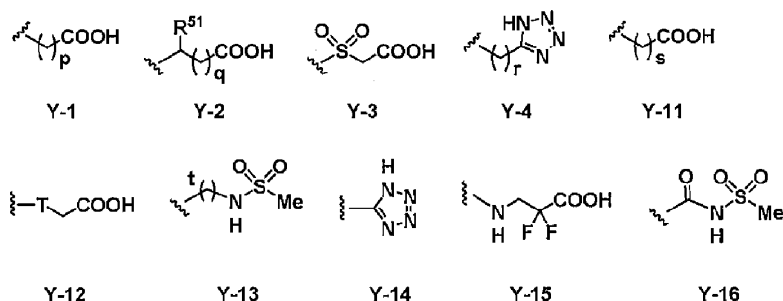
[化4]



(各基の左側の結合手は式[1]のWに結合し、右側の結合手は式[1]のYに結合し、 U^1 は窒素原子、又は CR^{41} であり、 U^2 は窒素原子、又は CR^{42} であり、 R^{41} 及び R^{42} はそれぞれ独立して水素原子、アルキル、ハロゲン、又は水酸基であり、m、及びnはそれぞれ1、2又は3であり、 R^{31} 及び R^{32} は、それぞれ独立して水素原子、アルキル、ハロゲン、若しくはアルコキシアルキルであるか、又は R^{31} と R^{32} は、隣接する炭素原子と一緒に、アルキレン架橋を形成してもよく(R^{31} 及び R^{32} は、 U^1 、及び U^2 以外の置換可能な任意の位置に置換する。)、

Yは水素原子、又は以下のY-1～Y-4、若しくはY-11～Y-16：

[化5]



(R^{51} はアルキルであり、 p は1、2、又は3であり、 q は0、1、又は2であり、 r は1、2、又は3であり、 T はO、S、 SO_2 、又は NR^{61} であり、ここで R^{61} は水素原子、アルキルであり、 s は0、1、2、又は3であり、 t は0、又は1である。)で表される基であり、以下の(a)～(d)のいずれかの場合から選択される。

(a) Wが結合手である場合

- ・ BがB-1又はB-2であって、 U^2 が窒素原子であるとき、
YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4であり、
- ・ BがB-1、B-2であって、 U^2 が CR^{42} であるとき (R^{42} は前記と同義である)、
 U^1 は窒素原子であり、
YはY-11、Y-12、Y-13、Y-14、Y-15、又はY-16であり、

- ・ BがB-3、又はB-4であるとき、
Yは水素原子であり、

(b) WがW-1である場合

- ・ BがB-1であり、
 U^1 が窒素原子であり、
 U^2 が窒素原子のとき、YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4であり、

- ・ B が B - 1 であり、
U¹ が窒素原子であり、
・ U² が C R^{4.2} のとき (R^{4.2} は前記と同義である)、
Y は Y - 1 1、Y - 1 2、Y - 1 3、Y - 1 4、Y - 1 5、又は Y - 1 6 であり、
(c) W が W - 2 である場合
・ B が B - 1 又は B - 2 であり、
U¹ が窒素原子であり、
U² が窒素原子のとき、Y は Y - 1、Y - 2、Y - 3、又は Y - 4 であり、
・ B が B - 1 又は B - 2 であり、
U¹ が窒素原子であり、
U² が C R^{4.2} のとき (R^{4.2} は前記と同義である)、
Y は Y - 1 1、Y - 1 2、Y - 1 3、Y - 1 4、Y - 1 5、又は Y - 1 6 であり、
・ B が B - 3 又は B - 4 のとき、Y は水素原子であり、
(d) W が W - 3 である場合、
・ B は B - 1 であり、
U¹ は C R^{4.1} であり (R^{4.1} は前記と同義である)、
U² が窒素原子のとき、
Y は Y - 1、Y - 2、Y - 3、又は Y - 4 である。)]

で表されるアザベンゾイミダゾール化合物若しくはその医薬上許容される塩、又はその溶媒和物を有効成分として含有する、機能性消化管障害の治療剤又は予防剤。

[請求項2] W が結合手である、請求項 1 に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項3] 以下の (1)、(2)、又は (3) の場合である；

(1) B が B - 1 又は B - 2 であり、

U² が窒素原子であり、

YがY-1、Y-2、又はY-3であるか、

(2) Bが、B-1又はB-2であり、

U²がC R^{4.2}であり、

YがY-11、Y-12、又はY-15であるか、

(3) Bが、B-4であり、Yが水素原子である、請求項1または請求項2に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項4] R⁴がアルキル、トリハロアルキル、アルコキシ、シアノ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1つの基、並びにトリハロアルキルで置換されたピリジルである、請求項3に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項5] AがA-4である、請求項4に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項6] アザベンゾイミダゾール化合物が次の(1)～(15)のいずれかに記載の化合物である、請求項1～請求項5のいずれかに記載の治療剤又は予防剤。

(1) [4-(5-{5-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-7-[{ [1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペラジン-1-イル]酢酸、

(2) 4-フルオロ-1-(5-{5-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-7-[{ [1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(3) 1-(5-{5-[6-エトキシ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{ [1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(4) 1 - (5 - {5 - [2 - エトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] - 7 - [{ [1 - (メトキシメチル) シクロブチル] メチル} (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル} ピラジン - 2 - イル) ピペリジン - 4 - カルボン酸、

(5) { [1 - (5 - {5 - [2 - シクロプロピル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] - 7 - [{ [1 - (メトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル} ピラジン - 2 - イル) ピペリジン - 4 - イル] オキシ} 酢酸、

(6) 1 - (4 - {5 - [6 - エトキシ - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] - 7 - [{ [1 - (メトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル} - 3 - フルオロフェニル) ピペリジン - 4 - カルボン酸、

(7) 1 - (5 - {5 - [2 - エトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] - 7 - [(3 - メトキシ - 2, 2 - ジメチルプロピル) (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル} ピラジン - 2 - イル) ピペリジン - 4 - カルボン酸、

(8) 1 - (5 - {5 - [6 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] - 7 - [{ [1 - (エトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル} ピラジン - 2 - イル) ピペリジン - 4 - カルボン酸、

(9) 1 - (5 - {5 - [2 - エトキシ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] - 7 - [{ [1 - (メトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] - 1 H - イミダゾ [4, 5 -

b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペリジン-4-カルボン酸、

(10) 3-[4-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロヘキシル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペラジン-1-イル] プロパン酸、

(11) [4-(4-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロペンチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} -3-フルオロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] 酢酸、

(12) 3-[(2S)-4-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロヘキシル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル)-2-(メトキシメチル)ピペラジン-1-イル] プロパン酸、

(13) 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(エトキシメチル)シクロペンチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル] プロパン酸、

(14) 3-[(3R)-4-(5-{5-[2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロヘキシル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル] プロパン酸、

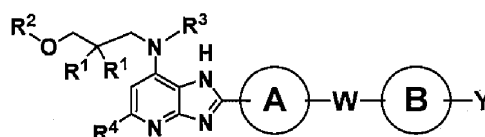
(15) 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロペンチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル]プロパン酸。

[請求項7] 前記機能性消化管障害が過敏性腸症候群（IBS）である、請求項1～請求項6のいずれかに記載の治療剤又は予防剤。

[請求項8] 前記機能性消化管障害が機能性便秘である、請求項1～請求項6のいずれかに記載の治療剤又は予防剤。

[請求項9] 次の式〔1〕

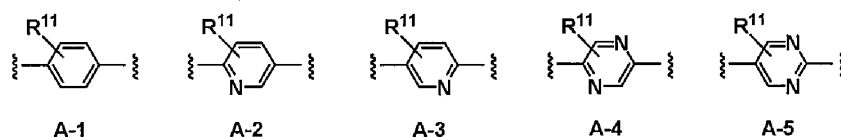
[化6]



〔1〕

[式中、R¹は、水素原子、若しくはアルキルであるか、又は2つのR¹が隣接する炭素原子と一緒にあって、3～7員のシクロアルキル、若しくは酸素を含有する非芳香族複素環を形成してもよく、
R²は水素原子、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルが置換したアルキル、又はアルコキシアルキルであり、
R³は水素原子、アルキル、又はアルコキシアルキルであり、
R⁴はアルキル、トリハロアルキル、アルコキシ、シアノ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1個若しくは2個の基で置換されていてもよいピリジル、又はトリハロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1個～3個の基で置換されていてもよいフェニルであり、
Aは、以下のA-1、A-2、A-3、A-4、又はA-5：

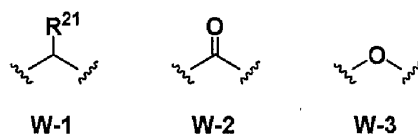
[化7]



(各基の左側の結合手は式 [1] のアザベンゾイミダゾールの 2 位に結合し、右側の結合手は式 [1] の W に結合し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、及びニトロから選択される基である。) で表される基であり、

W は、結合手、又は以下の W-1、W-2、若しくは W-3 :

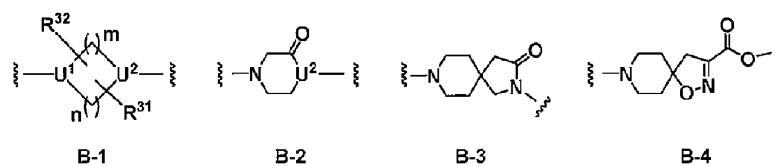
[化8]



(R^{21} は水素原子、又はアルキルである。) で表される基であり、

B は、以下の B-1、B-2、B-3、又は B-4 :

[化9]

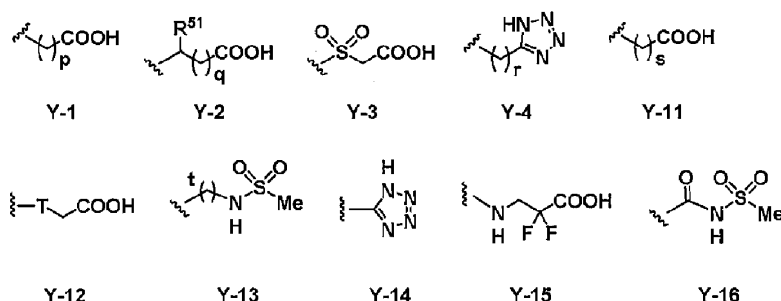


(各基の左側の結合手は式 [1] の W に結合し、右側の結合手は式 [1] の Y に結合し、 U^1 は窒素原子、又は CR^{41} であり、 U^2 は窒素原子、又は CR^{42} であり、 R^{41} 及び R^{42} はそれぞれ独立して水素原子、アルキル、ハロゲン、又は水酸基であり、m、及び n はそれぞれ

1、2又は3であり、 R^{31} 及び R^{32} は、それぞれ独立して水素原子、アルキル、ハロゲン、若しくはアルコキシアルキルであるか、又は R^{31} と R^{32} は、隣接する炭素原子と一緒に、アルキレン架橋を形成してもよく（ R^{31} 及び R^{32} は、 U^1 、及び U^2 以外の置換可能な任意の位置に置換する。）、

Yは水素原子、又は以下のY-1～Y-4、若しくはY-11～Y-16：

[化10]



（ R^{51} はアルキルであり、pは1、2、又は3であり、qは0、1、又は2であり、rは1、2、又は3であり、TはO、S、 SO_2 、又は NR^{61} であり、ここで R^{61} は水素原子、アルキルであり、sは0、1、2、又は3であり、tは0、又は1である。）で表される基であり、以下の（a）～（d）のいずれかの場合から選択される。

（a）Wが結合手である場合

- ・ BがB-1又はB-2であって、 U^2 が窒素原子であるとき、YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4であり、
- ・ BがB-1、B-2であって、 U^2 が CR^{42} であるとき（ R^{42} は前記と同義である）、 U^1 は窒素原子であり、YはY-11、Y-12、Y-13、Y-14、Y-15、又はY-16であり、

・ BがB-3、又はB-4であるとき、

Yは水素原子であり、

(b) WがW-1である場合

・ BがB-1であり、

U¹が窒素原子であり、

U²が窒素原子のとき、YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4であり、

・ BがB-1であり、

U¹が窒素原子であり、

・ U²がC R^{4.2}のとき (R^{4.2}は前記と同義である)、

YはY-11、Y-12、Y-13、Y-14、Y-15、又はY-16であり、

(c) WがW-2である場合

・ BがB-1又はB-2であり、

U¹が窒素原子であり、

U²が窒素原子のとき、YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4であり、

・ BがB-1又はB-2であり、

U¹が窒素原子であり、

U²がC R^{4.2}のとき (R^{4.2}は前記と同義である)、

YはY-11、Y-12、Y-13、Y-14、Y-15、又はY-16であり、

・ BがB-3又はB-4のとき、Yは水素原子であり、

(d) WがW-3である場合、

・ BはB-1であり、

U¹はC R^{4.1}であり (R^{4.1}は前記と同義である)、

U²が窒素原子のとき、

YはY-1、Y-2、Y-3、又はY-4である。)]

で表されるアザベンゾイミダゾール化合物若しくはその医薬上許容される塩、又はその溶媒和物を有効成分として含有する、口腔乾燥症の治療剤又は予防剤。

[請求項10] Wが結合手である、請求項9に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項11] 以下の(1)、(2)、又は(3)の場合である；

(1) BがB-1又はB-2であり、

U²が窒素原子であり、

YがY-1、Y-2、又はY-3であるか、

(2) Bが、B-1又はB-2であり、

U²がC R^{4.2}であり、

YがY-11、Y-12、又はY-15であるか、

(3) Bが、B-4であり、Yが水素原子である、請求項9または請求項10に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項12] R⁴がアルキル、トリハロアルキル、アルコキシ、シアノ、及びシクロアルキルからなる群から選択される1つの基、並びにトリハロアルキルで置換されたピリジルである、請求項11に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項13] AがA-4である、請求項12に記載の治療剤又は予防剤。

[請求項14] アザベンゾイミダゾール化合物が次の(1)～(15)のいずれかに記載の化合物である、請求項9～請求項13のいずれかに記載の治療剤又は予防剤。

(1) [4-(5-{5-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペラジン-1-イル]酢酸、

(2) 4-フルオロ-1-(5-{5-[3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5

ーb] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペリジン-4-カルボン酸、

(3) 1-(5-{5-[6-エトキシ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(4) 1-(5-{5-[2-エトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロブチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(5) {[1-(5-{5-[2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロペンチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-イル]オキシ}酢酸、

(6) 1-(4-{5-[6-エトキシ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-7-[{[1-(メトキシメチル)シクロペンチル]メチル}(メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}-3-フルオロフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(7) 1-(5-{5-[2-エトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-7-[3-メトキシ-2,2-ジメチルプロピル](メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)ピペリジン-4-カルボン酸、

(8) 1-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロ

メチル) ピリジン-3-イル] -7- [{ [1- (エトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] -1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペリジン-4-カルボン酸、

(9) 1- (5- {5- [2-エトキシ-6- (トリフルオロメチル) ピリジン-4-イル] -7- [{ [1- (メトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] -1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペリジン-4-カルボン酸、

(10) 3- [4- (5- {5- [6-シクロプロピル-5- (トリフルオロメチル) ピリジン-3-イル] -7- [{ [1- (メトキシメチル) シクロヘキシル] メチル} (メチル) アミノ] -1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) ピペラジン-1-イル] プロパン酸、

(11) [4- (4- {5- [6-シクロプロピル-5- (トリフルオロメチル) ピリジン-3-イル] -7- [{ [1- (メトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] -1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} -3-フルオロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] 酢酸、

(12) 3- [(2S) -4- (5- {5- [6-シクロプロピル-5- (トリフルオロメチル) ピリジン-3-イル] -7- [{ [1- (メトキシメチル) シクロヘキシル] メチル} (メチル) アミノ] -1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-2-イル} ピラジン-2-イル) -2- (メトキシメチル) ピペラジン-1-イル] プロパン酸、

(13) 3- [(3R) -4- (5- {5- [6-シクロプロピル-5- (トリフルオロメチル) ピリジン-3-イル] -7- [{ [1- (エトキシメチル) シクロペンチル] メチル} (メチル) アミノ] -

1H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル]プロパン酸、

(14) 3-[(3R)-4-(5-{5-[2-シクロプロピル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]}-7-[{ [1-(メトキシメチル)シクロヘキシル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル]プロパン酸、

(15) 3-[(3R)-4-(5-{5-[6-シクロプロピル-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]}-7-[{ [1-(メトキシメチル)シクロペンチル]メチル} (メチル)アミノ]-1H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル}ピラジン-2-イル)-3-メチルピペラジン-1-イル]プロパン酸。