

【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】令和4年9月21日(2022.9.21)

【国際公開番号】WO2020/065597

【公表番号】特表2022-502366(P2022-502366A)

【公表日】令和4年1月11日(2022.1.11)

【出願番号】特願2021-516369(P2021-516369)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 3 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 H

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7 5

A 6 1 K 4 5 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 0 4

A 6 1 P 2 5 / 1 8

A 6 1 P 2 5 / 2 4

A 6 1 P 2 5 / 2 8

A 6 1 P 2 5 / 3 0

30

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 0 0 1 0 1

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 3

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 3 7

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4

【手続補正書】

【提出日】令和4年9月12日(2022.9.12)

40

【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】

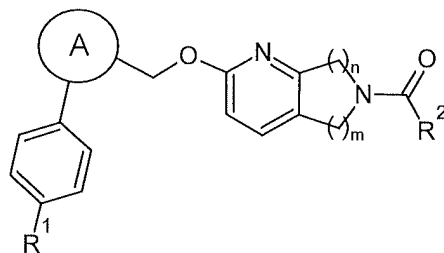
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

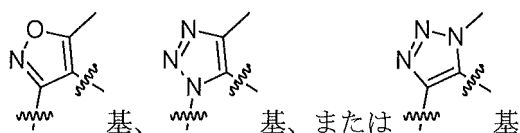
50

【化 1】



[式中、
A は、
【化 2】

10



によって表され、

R^1 は、水素またはハロゲンであり、

n および m は、それぞれ独立して、1 または 2 であり、

20

R^2 は、水素；1 つ以上のハロゲン、 C_{1-4} アルコキシ、 $-S(O)_2-C_{1-4}$ アルキルもしくは R^3 で、場合により独立して置換されていてもよい C_{1-4} アルキル； $NR^4 R^5$ または R^6 であり、

R^4 および R^5 は、それぞれ独立して、水素、 C_{1-4} アルキルまたは R^7 であるか；あるいは R^4 および R^5 は、それらが結合する N と一緒になって、ヘテロ環を形成し、

R^3 、 R^6 および R^7 は、場合により置換されていてもよい、炭素環、ヘテロ環またはヘテロアリアルである]、

および / またはその塩、および / またはその幾何異性体、および / またはその立体異性体、および / またはそのエナンチオマー、および / またはそのラセミ体、および / またはそのジアステレオマー、および / またはその生物学的に活性な代謝物、および / またはそのプロドラッグ、および / またはその溶媒和物、および / またはその水和物、および / またはその多形体。

30

【請求項 2】

R^1 が、ハロゲンであり、

n および m が、それぞれ独立して 1 または 2 であり、

R^2 が、 C_{1-4} アルコキシ、 $-S(O)_2-C_{1-4}$ アルキルで、場合により独立して置換されていてもよい C_{1-4} アルキル； $NR^4 R^5$ または R^6 であり、

R^4 および R^5 が、それぞれ独立して、水素、 C_{1-4} アルキルまたは R^7 であるか；あるいは R^4 および R^5 が、それらが結合する N と一緒になって、単環式ヘテロ環を形成し、

40

R^3 、 R^6 および R^7 が、場合により置換されていてもよい、 C_{3-10} シクロアルキル、 C_{3-10} シクロアルケニル、 C_{6-10} アリアル、N、O および S から独立して選択される 1、2、3 もしくは 4 個の環ヘテロ原子を含む C_{3-10} ヘテロ環、または N、O および S から独立して選択される 1、2、3 もしくは 4 個のヘテロ原子を含む C_{5-10} ヘテロアリアルである、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^1 が、フッ素、臭素または塩素であり、

R^2 が、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルキル - $S(O)_2-C_{1-3}$ アルキル、 $NR^4 R^5$ または R^6 であり、

50

R⁴ および R⁵ が、それぞれ独立して、水素、C₁₋₄アルキルまたは R⁷ であり、
 R⁶ および R⁷ が、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、ハロC₁₋₄アルキル、ハロC₁₋₄アルコキシ、ヒドロキシルもしくはオキソで場合により置換されていてもよい、C₃₋₆シクロアルキル、C₆₋₁₀アリール、N、O および S から独立して選択される 1 もしくは 2 個の環ヘテロ原子を含む C₄₋₆ヘテロ環、または N および O から独立して選択される 1 もしくは 2 個の環ヘテロ原子を含む C₅₋₆ヘテロアリールである、

請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ が、フッ素または塩素であり、

R² が、C₁₋₄アルコキシ C₁₋₃アルキル、メチルスルホニルメタン、エチルスルホニルメタン、NR⁴R⁵ または R⁶ であり、

R⁴ および R⁵ が、それぞれ独立して、水素、C₁₋₃アルキルまたは R⁷ であり、

R⁶ および R⁷ が、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、ハロゲン、ハロC₁₋₄アルキル、ハロC₁₋₄アルコキシ、ヒドロキシルもしくはオキソで場合により置換されていてもよい、シクロプロピル、シクロブチル、シクロヘキサン、フェニル、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、チアン、ピロリジン、ピペリジン、ピリジン、イソキサゾール、ピロールおよびモルホリンである、

請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

下記からなる群：

1 - [2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 (5 H) - イル] エタノン、

2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (オキサラン - 3 - カルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (1 , 2 - オキサゾール - 5 - カルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

6 - シクロブタンカルボニル - 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

6 - シクロプロパンカルボニル - 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

4 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 ラムダ 6 - チアン - 1 , 1 - ジオン、

2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (オキサラン - 2 - カルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

1 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - イル) - 2 - メタンスルホニルエタン - 1 - オン、

2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (オキサン - 4 - カルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン、

2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - カルボニル) - 5 , 6 ,

10

20

30

40

50

- 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 6 - (1 - メチル - 1 H - ピロール - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) エタン - 1 - オン、
- 4 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - メチルピロリジン - 2 - オン、 10
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) エタン - 1 - オン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - (オキサラン - 2 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - (オキサラン - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - [(3 R) - オキサラン - 3 - カルボニル] - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、 20
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - [(3 S) - オキサラン - 3 - カルボニル] - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 6 - シクロプロパンカルボニル - 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - (1, 2 - オキサゾール - 5 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、 30
- 4 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - メチルピロリジン - 2 - オン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) - 2 - メチルプロパン - 1 - オン、
- 4 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 ラムダ 6 - チアン - 1, 1 - ジオン、 40
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) プロパン - 1 - オン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - (ピリジン - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 6 - (ピリジン - 2 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 6 - (3 - クロロベンゾイル) - 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 50

- 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (オキサ - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (オキサラン - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (オキサ - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (3 - メチルオキサラン - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (オキサ - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (ピリジン - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 7 - ナフチリジン - 7 - イル) エタン - 1 - オン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (4 - メトキシシクロヘキサ - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) エタン - 1 - オン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - カルボニル] - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - [(3 S) - オキサラン - 3 - カルボニル] - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (ピリジン - 3 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
- (5 S) - 5 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - メチルピロリジン - 2 - オン、
- (5 R) - 5 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - メチルピロリジン - 2 - オン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - イル) - 2 - メトキシエタン - 1 - オン、
- 1 - エチル - 4 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) ピロリジン - 2 - オン、

10

20

30

40

50

- 4 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - (プロパン - 2 - イル) ピロリジン - 2 - オン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタン - 1 - オン、
- 5 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - カルボニル) - 1 - メチルピペリジン - 2 - オン、
- シクロプロピル (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) メタノン、 10
- 1 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - イル) - 3 - メタンスルホニルプロパン - 1 - オン、
- 1 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 2 - メタンスルホニルエタン - 1 - オン、
- 1 - (2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、 20
- 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) プロパン - 1 - オン、
- 2 , 2 - ジフルオロ - 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、 30
- 2 - フルオロ - 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、
- 1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキサソール - 4 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3 - メチルブタン - 1 - オン、
- 5 - [({ 6 - シクロブタンカルボニル - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル } オキシ) メチル] - 1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、 40
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 2 - メチルプロパン - 1 - オン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 2 , 2 - ジメチルプロパン - 1 - オン、
- 1 - (2 - { [1 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン 50

- 6 - イル) エタノン、
 1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキシラン - 2 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキシラン - 3 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキサン - 3 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 4 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - カルボニル) ピリジン、
 3 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - カルボニル) ピリジン、
 2 - (2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - カルボニル) ピリジン、
 1 - (2 - { [4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、
 1 - (2 - { [4 - (4 - クロロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、
 1 - (2 - { [4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) プロパン - 1 - オン、
 2 - フルオロ - 1 - (2 - { [4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) エタノン、
 4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキシラン - 3 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 1 - (2 - { [4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 2 - メチルプロパン - 1 - オン、
 4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキシラン - 2 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 4 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル - 5 - ({ [6 - (オキサン - 3 - カルボニル) - 5 H , 6 H , 7 H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン - 2 - イル] オキシ } メチル) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール、
 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - N - (1 - メチル - 5 - オキソピロリジン - 3 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 5 - イル] メトキシ } - N , N - ジメチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール

- 5 - イル]メトキシ} - 6 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - N - (オキソラン - 3 - イル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 N - (2 - クロロフェニル) - 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 6 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
 N - (4 - クロロフェニル) - 2 - { [1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - メチル - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 5 - イル]メトキシ} - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル]メトキシ} - 6 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル]メトキシ} - N, N - ジメチル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、
 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル]メトキシ} - 6 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル]メトキシ} - 6 - (ピペリジン - 1 - カルボニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン、
 2 - { [3 - (4 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル]メトキシ} - N - (オキソラン - 3 - イル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 6 - ナフチリジン - 6 - カルボキサミド、および
それらの薬学的に許容される塩
 から選択される、請求項 4 に記載の化合物。
 【請求項 6】
神経変性障害、神経認知障害、統合失調症、気分障害、疼痛性障害、物質関連障害および嗜癮性障害、ならびに他の疾患からなる群から選択される G A B A_A 5 受容体に関する疾患の治療もしくは予防のための、または認知増強剤としての、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。
 【請求項 7】
1 種以上の他の活性成分と組み合わせられる、請求項 6 に記載の化合物。
 【請求項 8】
 前記 G A B A_A 5 受容体に関する疾患が、アルツハイマー病 (A D)、認知欠陥障害、記憶欠損、加齢に関連する記憶障害または認知機能低下、認知症、軽度認知機能障害 (M C I)、血管性認知機能障害 (V C I)、脳卒中後に起こる C N S の状態、脳がんに関連する認知機能障害、ダウン症 (D S) における認知機能低下、大うつ病性障害 (M D D) における認知機能不全、および統合失調症からなる群から選択される、請求項 6 または 7 に記載の化合物。
 【請求項 9】
 活性成分として、少なくとも 1 つの請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物、および少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。
 【請求項 10】
 前記組成物が、1 種以上の他の活性成分をさらに含む、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

神経変性障害、神経認知障害、統合失調症、気分障害、疼痛性障害、物質関連障害および嗜癮性障害、ならびに他の疾患からなる群から選択される G A B A A₅ 受容体に関する疾患の治療もしくは予防のための、または認知増強剤としての、請求項 9 または 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記 G A B A A₅ 受容体に関する疾患が、アルツハイマー病 (A D)、認知欠陥障害、記憶欠損、加齢に関連する記憶障害または認知機能低下、認知症、軽度認知機能障害 (M C I)、血管性認知機能障害 (V C I)、脳卒中後に起こる C N S の状態、脳がんに関連する認知機能障害、ダウン症 (D S) における認知機能低下、大うつ病性障害 (M D D) における認知機能不全、および統合失調症からなる群から選択される、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50