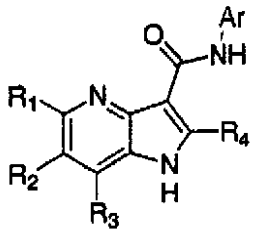
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年1月19日(2006.1.19)

【公表番号】特表2005-516901(P2005-516901A)
【公表日】平成17年6月9日(2005.6.9)
【年通号数】公開・登録公報2005-022
【出願番号】特願2003-545655(P2003-545655)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/437 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/444 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4545 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/497 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/55 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/18 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/22 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 519/00 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０４Ｚ
Ｃ０７Ｄ 471/04 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/437
Ａ６１Ｋ 31/444
Ａ６１Ｋ 31/4545
Ａ６１Ｋ 31/496
Ａ６１Ｋ 31/497
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｋ 31/55
Ａ６１Ｐ 25/18
Ａ６１Ｐ 25/20
Ａ６１Ｐ 25/22
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/28
Ｃ０７Ｄ 519/00 ３１１

【手続補正書】
【提出日】平成17年11月21日(2005.11.21)
【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：



で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩：
式中、
R_1、R_2およびR_3は独立し、下記基であり：
Ａ）水素、ハロゲン、ハロ（C_1－C_6）アルキル、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、アルキル、アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）$NR_{10}R_{11}$、－Ｃ（＝Ｏ）OR_{10}、および－ＯＣ（＝Ｏ）R_{10}、－Ｃ（＝Ｏ）R_{10}（ここでR_{10}およびR_{11}は独立し、水素、C_1－C_6アルキル、フェニル、フェニル（C_1－C_6）アルキル、ピリジル、またはピリジル（C_1－C_6）アルキルである）；
Ｂ）ハロアルコキシ、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシアルキル、－Ｄ－R_{20}、－Ｅ－R_{35}、－C_1－C_4アルキル－Ｄ－R_{20}、－C_1－C_4アルキル－Ｏ－R_{20}、－Ｅ－R_{20}－Ｇ－R_{30}、－Ｅ－Ｌ、－Ｅ－R_{20}－Ｌ、Ｊ、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｌ、または－C_1－C_4アルキル－Ｊ；
［ここで
Ｄは、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NH_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NR_{30}$－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｈ、－$NR_{30}$Ｃ（＝Ｏ）、－$NR_{30}$Ｃ（＝Ｏ）Ｈ、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$－および－$NR_{30}$Ｓ（Ｏ）$_n$－であり；
ＥおよびＧは独立し、－ＮＨ－、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）－、ＳおよびＯであり；
R_{20}およびR_{30}はそれぞれ独立し、（C_1－C_8）アルキル、（C_3－C_8）シクロアルキルまたは（C_3－C_8）シクロアルキル（C_1－C_6）アルキル基であり、このアルキルおよびシクロアルキル基はそれぞれ、０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、およびR_{20}およびR_{30}基中に存在する炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基により置換されていてもよく、ここでＣ）はオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、またはＬであり、ｎは０、１または２であり；
R_{35}はそれぞれ独立し、（C_1－C_8）直鎖状、（C_1－C_8）分枝鎖状、（C_3－C_8）環状アルキルまたは（C_3－C_8）シクロアルキル（C_1－C_6アルキル）基であり、このアルキルおよびシクロアルキル基はそれぞれ、０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、およびR_{35}基中に存在する炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループＣ）から選択される置換基により独立して置換されていてもよく；
ＪおよびＬは独立し、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和および芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素または窒素であり、および残りの環原子は炭素であり、これらの環は未置換であるか、または下記群から独立して選択される１個または２個以上の置換基により置換されていてもよい：

ｉ）ハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ；および

ｉｉ）フェニル、ピリジル、ピリミジルおよびピラジニル（これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１～３個のハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_4アルキル、C_1－C_4アルコキシ、C_1－C_2ハロアルキル、C_1－C_2ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_4）アルキルアミノから独立して選択される）；

ただしＪはフェニルまたはピリジルではない］；

ただしR_1、R_2およびR_3の少なくとも１個は、Ｂ）から選択される；

R_4は水素、ハロゲンまたはヒドロキシルであり；

Ａｒはアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキルまたはヘテロアリール基を表わし、このアリールはそれぞれ、１個または２個の芳香族環を有し、各芳香族環は４～７個の環原子を有し、およびこの環原子の０個、１個または２個は酸素、窒素またはイオウであり、残りの環原子は炭素であり、またこれらの環はそれぞれ、１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよく、ここでR_{40}はそれぞれ独立し、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、XR_{50}、C_1－C_4アルキル－XR_{50}、またはＹであり、

Ｘは、それぞれ存在する場合、結合、－CH_2－、－CHR_{60}－、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（＝Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－ＮＨ－、－NR_{60}－、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－、－Ｃ（＝Ｏ）NR_{60}－、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NR_{60}$－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－、－$NR_{60}$Ｃ（＝Ｏ）－、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$－および－$NR_{60}$Ｓ（Ｏ）$_n$－からなる群から独立して選択され；

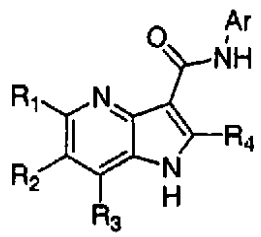
R_{50}およびR_{60}は、それぞれ存在する場合、水素、C_1－C_8アルキル、C_3－C_8シクロアルキルおよび（C_3－C_8）シクロアルキル（C_1－C_6）アルキルから独立して選択され、このアルキルおよびシクロアルキルはそれぞれ、０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、またこのアルキル、シクロアルキルまたはシクロアルキルアルキルの炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびＺにより置換されていてもよく、ここでｎは０、１または２であり；および

ＹおよびＺは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和または芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、残りの環原子は炭素であり、またＹおよびＺは未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい：および

ｎはそれぞれ独立し、０、１または２である。

【請求項２】

式：



で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩：
式中、
R_1、R_2およびR_3は独立し、下記基から選択され：
A）水素、ハロゲン、ハロ（C_1－C_6）アルキル、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、アルキル、アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルキル、－C（＝O）$NR_{10}R_{11}$、－C（＝O）OR_{10}、および－OC（＝O）R_{10}、－C（＝O）R_{10}（ここでR_{10}およびR_{11}は独立し、水素、C_1－C_6アルキル、フェニル、フェニル（C_1－C_6）アルキル、ピリジル、およびピリジル（C_1－C_6）アルキルから独立して選択される）；
B）ハロアルコキシ、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシアルキル、－D－R_{20}、－E－R_{35}、－C_1－C_4アルキル－DpR$_{20}$、－C_1－C_4アルキル－O－R_{20}、－E－R_{20}－G－R_{30}、－E－L、－E－R_{20}－L、J、－C（＝O）－L、および－C_1－C_4アルキル－J；
［ここで
Dは、－S（O）$_n$－、－S（O）$_n$NH－、－S（O）$_n$$NH_2$－、－S（O）$_n$$NR_{30}$－、－NHC（＝O）－、－NHC（＝O）H、－$NR_{30}$C（＝O）－、－$NR_{30}$C（＝O）H、－NHS（O）$_n$－および－$NR_{30}$S（O）$_n$－であり；
EおよびGは独立し、NH、N－C_1－C_6アルキル、SおよびOであり；
R_{20}、R_{30}およびR_{35}は、それぞれ存在する場合、直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、またR_{20}およびR_{35}基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループC）から独立して選択される置換基により置換されていてもよく、およびR_{35}において、１～８個の炭素原子の少なくとも１個は１個または２個以上のグループC）から独立して選択される置換基によりさらに置換されており；
ここでグループC）はオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－NH（C_1－C_6アルキル）、－N（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－NHC（＝O）（C_1－C_6アルキル）、－N（C_1－C_6アルキル）C（＝O）（C_1－C_6アルキル）、－NHS（O）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－S（O）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－S（O）$_n$NH（C_1－C_6アルキル）、－S（O）$_n$N（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびLからなり；
JおよびLは独立し、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和および芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、および残りの環原子は炭素であり、これらの環は未置換であるか、または下記群から独立し選択される１個または２個以上の置換基により置換されていてもよい：ｉ）ハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ；およびｉｉ）フェニル、ピリジル、ピリミジルおよびピラジニル（これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１～３個のハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_4アルキル、C_1－C_4アルコキシ、C_1－C_2ハロアルキル、C_1－C_2ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_4）アルキルアミノから独立して選択される置換により置換されていてもよい）］；
R_4は水素、ハロゲンまたはヒドロキシルであり；
Arはヘテロアリールまたはヘテロアリール（C_1－C_6）アルキルを表わし、このヘテロアリールは、キノリニル、ベンゾチエニル、インドリル、ピリダジニル、ピアジニル、イソインドリル、イソキノリル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、イミダゾリル、イソキサゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チエニル、チアゾリル、インドリ

ジニル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾイソオキソリル、ジヒドロ－ベンゾジオキシニル、フラニル、ピロリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾロピリジニル、イミダゾピリジニル、イソチアゾリル、ナフチリジニル、シンノリニル、カルバゾリル、ベーターカルボリニル、イソクロマニル、クロマノニル、クロマニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソインドリニル、イソベンゾテトラヒドロフラニル、イソベンゾテトラヒドロチエニル、イソベンゾチエニル、ベンゾキサゾリル、ピリドピリジニル、ベンゾテトラヒドロフラニル、ベンゾテトラヒドロチエニル、プリニル、ベンゾジオキソリル、トリアジニル、フェノキサジニル、フェノチアジニル、プテリジニル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリジニル、イミダゾチアゾリル、ジヒドロベンズイソキサジニル、ベンズイソキサジニル、ベンゾキサジニル、ジヒドロベンズイソチアジニル、ベンゾピラニル、ベンゾチオピラニル、クマリニル、イソクマリニル、クロマニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、ジヒドロキノリノニル、ジヒドロイソキノリノニル、ジヒドロクマリニル、ジヒドロイソクマリニル、イソインドリノニル、ベンゾジオキサニル、ベンゾキサゾリノニル、ピロリル Ｎ－オキシド、ピリミジニル Ｎ－オキシド、ピリダジニル Ｎ－オキシド、ピラジニル Ｎ－オキシド、キノリニル Ｎ－オキシド、インドリル Ｎ－オキシド、インドリニル Ｎ－オキシド、イソキノリル Ｎ－オキシド、キナゾリニル Ｎ－オキシド、キノキサリニル Ｎ－オキシド、フタラジニル Ｎ－オキシド、イミダゾリル Ｎ－オキシド、イソキサゾリル Ｎ－オキシド、オキサゾリル Ｎ－オキシド、チアゾリル Ｎ－オキシド、インドリジニル Ｎ－オキシド、インダゾリル Ｎ－オキシド、ベンゾチアゾリル Ｎ－オキシド、ベンズイミダゾリル Ｎ－オキシド、ピロリル Ｎ－オキシド、オキサジアゾリル Ｎ－オキシド、チアジアゾリル Ｎ－オキシド、トリアゾリル Ｎ－オキシド、テトラゾリル Ｎ－オキシド、ベンゾチオピラニル Ｓ－オキシドおよびベンゾチオピラニル Ｓ，Ｓ－ジオキシドから選択され、Ａｒはまた、１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよく；

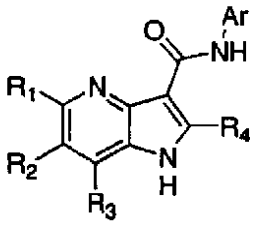
ここでR_{40}は、それぞれ存在する場合、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、XR_{50}、C_1－C_4アルキル－XR_{50}およびＹから独立して選択され；

Ｘは、それぞれ存在する場合、結合、－CH_2－、－CHR_{60}－、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（＝Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－ＮＨ－、－NR_{60}－、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－、－Ｃ（＝Ｏ）NR_{60}－、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NR_{60}$－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－、－$NR_{60}$Ｃ（＝Ｏ）－、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$－および－$NR_{60}$Ｓ（Ｏ）$_n$－からなる群から独立して選択され；

R_{50}およびR_{60}は、それぞれ存在する場合、水素、および直鎖状、分枝鎖状および環状アルキル基、ならびに（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状および環状アルキル基、ならびに（シクロアルキル）アルキル基は炭素原子１～８個を含有し、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、これらの基はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびＺから独立して選択される置換基により置換されていてもよく；

ＹおよびＺは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和および芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、残りの環原子は炭素であり、またＹおよびＺは未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい］：および

ｎは、それぞれ存在する場合、０、１および２から独立して選択される。
【請求項３】
式：



で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩：
式中、
R_1、R_2およびR_3は独立し、下記基から選択され：
Ａ）水素、ハロゲン、ハロ（C_1－C_6）アルキル、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、アルキル、アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルキル、－Ｃ（＝Ｏ）$NR_{10}R_{11}$、－Ｃ（＝Ｏ）OR_{10}、および－ＯＣ（＝Ｏ）R_{10}、－Ｃ（＝Ｏ）R_{10}（ここでR_{10}およびR_{11}は独立し、水素、C_1－C_6アルキル、フェニル、フェニル（C_1－C_6）アルキル、ピリジル、またはピリジル（C_1－C_6）アルキルから選択される）；
Ｂ）ハロアルコキシ、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシアルキル、－Ｄ－R_{20}、－Ｅ－R_{35}、－C_1－C_4アルキル－Ｄ－R_{20}、－C_1－C_4アルキル－Ｏ－R_{20}、－Ｅ－R_{20}－Ｇ－R_{30}、－Ｅ－Ｌ、－Ｅ－R_{20}－Ｌ、Ｊ、－Ｃ（＝Ｏ）－Ｌ、および－C_1－C_4アルキル－Ｊ；
［ここで
Ｄは、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NH_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_n$$NR_{30}$－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）Ｈ、－$NR_{30}$Ｃ（＝Ｏ）－、－$NR_{30}$Ｃ（＝Ｏ）Ｈ、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$－および－$NR_{30}$Ｓ（Ｏ）$_n$－であり；
ＥおよびＧは独立し、－ＮＨ－、－Ｎ－C_1－C_6アルキル－、ＳおよびＯであり；
R_{20}、R_{30}およびR_{35}は、それぞれ存在する場合、直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、またR_{20}およびR_{35}基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基により置換されていてもよく、およびR_{35}において、１～８個の炭素原子の少なくとも１個は１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基によりさらに置換されていてもよく；
ここでグループＣ）はオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびＬからなり；
ＪおよびＬは独立し、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和および芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、および残りの環原子は炭素であり、これらの環は未置換であるか、または下記群から独立し選択される１個または２個以上の置換基により置換されていてもよい：ｉ）ハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアル

キル、C_1-C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ；およびｉｉ）フェニル、ピリジル、ピリミジルおよびピラジニル（これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１～３個のハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1-C_4アルキル、C_1-C_4アルコキシ、C_1-C_2ハロアルキル、C_1-C_2ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_4）アルキルアミノにより置換されていてもよい）］；

R_4は水素、ハロゲンまたはヒドロキシルであり；

Ａｒはフェニル、ピリジルまたはピリミジニルを表わし、Ａｒは１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよく、ここでR_{40}は、それぞれ存在する場合、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、C_1-C_6アルカノイル、C_3-C_7シクロアルキル、C_3-C_7シクロアルキル（C_1-C_4）アルキル、C_3-C_7シクロアルキル－Ｏ－、C_3-C_7シクロアルキル（C_1-C_4）アルコキシ－、C_2-C_6アルケニル、C_1-C_6アルキルチオ－、ハロ（C_1-C_6）アルキル、およびハロ（C_1-C_6）アルコキシから独立して選択され、またＡｒは少なくとも１個の$-E-R_{50}-G-R_{60}$、$-E-R_{50}-G-Y$、C_1-C_4アルキル$-XR_{50}$、$-NH-R_{60}-Y$、$-(NR_{50})R_{60}-Y$およびＹにより置換されており；

Ｘは、それぞれ存在する場合、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（＝Ｏ）－、$-S(O)_n-$、－ＮＨ－、$-NR_{60}-$、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－、－Ｃ（＝Ｏ）$NR_{60}-$、$-S(O)_nNH-$、$-S(O)_nNR_{60}-$、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－、$-NR_{60}C$（＝Ｏ）－、$-NHS(O)_n-$および$-NR_{60}S(O)_n-$からなる群から独立して選択され；

ここでR_{50}およびR_{60}は、それぞれ存在する場合、水素、および直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、ならびに（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、これらの基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルコキシ、$-NH(C_1-C_6$アルキル）、$-N(C_1-C_6$アルキル）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、$-N(C_1-C_6$アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、$-NHS(O)_n(C_1-C_6$アルキル）、$-S(O)_n(C_1-C_6$アルキル）、$-S(O)_nNH(C_1-C_6$アルキル）、$-S(O)_nN(C_1-C_6$アルキル）（C_1-C_6アルキル）、およびＺから独立して選択される置換基によりさらに置換されていてもよく；

ＹおよびＺは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和または芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、残りの環原子は炭素であり、またＹおよびＺは未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、C_1-C_6アルコキシ（C_1-C_6アルキル）、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい］：および

ｎは、それぞれ存在する場合、０、１または２から独立して選択される。

【請求項４】

Ａｒがアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルを表わし、このアリールおよびヘテロアリールは、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、［１，３，４］チアジアゾリル、トリアゾリル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾジオキソリル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾイソキソリル、およびジヒドロ－ベンゾジオキシニルから選択され、および１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよい、請求項１に記載の化合物または塩。

【請求項５】

R_4が水素である、請求項４に記載の化合物または塩。

【請求項６】

R_1がＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項７】
R_1がＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、CF_3、CHF_2、OCF_3、ヒドロキシ、シアノ、C_1－C_2アルキル、C_1－C_2アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_2）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項８】
R_1がＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；
R_4が水素である；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項９】
R_{40}が、それぞれ存在する場合、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、XR_{50}、（C_1－C_4）アルキル－XR_{50}、およびＹから独立して選択され；
Ｘは、それぞれ存在する場合、結合、－CH_2－、－CHR_{60}－、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－ＮＨ－、および－NR_{60}－から独立して選択され；
R_{50}およびR_{60}は、それぞれ存在する場合、水素、ならびに直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、これらの基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびＺから独立して選択される置換基によりさらに置換されていてもよく；
ＹおよびＺは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和または芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、残りの環原子は炭素であり、またＹおよびＺは未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい：および
ｎが、それぞれ存在する場合、０、１または２から独立して選択される；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項１０】
R_1がＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項９に記載の化合物または塩。
【請求項１１】
R_1がＢ）から選択され；

R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；
R_4が水素であり；および
R_{40}が、それぞれ存在する場合、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、ハロゲン、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ（C_1-C_6）アルコキシ、（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルキル、および（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルコキシから独立して選択される；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項１２】
R_1がＢ）から選択され；
Ｂ）が、－Ｅ－R_{35}、－C_1-C_4アルキル－Ｏ－R_{20}、－Ｅ－R_{20}－Ｇ－R_{30}、－Ｅ－Ｌ、－Ｅ－R_{20}－Ｌ、Ｊ、または－C_1-C_4アルキル－Ｊであり；
ＥおよびＧは独立し、－ＮＨ－、－Ｎ－C_1-C_6アルキル－、またはＯであり；
R_{20}、R_{30}およびR_{35}は、それぞれ存在する場合、直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、またR_{20}およびR_{35}基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基により置換されていてもよく、およびR_{35}において、１～８個の炭素原子の少なくとも１個は１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基によりさらに置換されており；
ここでグループＣ）はオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1-C_6アルキル）（C_1-C_6アルキル）、およびＬからなり；
ＪおよびＬは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和ヘテロ環から独立して選択され、これらの環において、環原子の１個または２個は窒素であり、および残りの環原子は炭素であり、これらの環は未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、C_1-C_6アルコキシ（C_1-C_6アルキル）、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい：ただしＪはフェニルまたはピリジルではなく；
R_2およびR_3が独立し、水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから選択され；
R_4が水素であり；および
R_{40}は、それぞれ存在する場合、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、ハロゲン、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ（C_1-C_6）アルコキシ、（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルキル、および（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルコキシから独立して選択される；
請求項４に記載の化合物または塩。
【請求項１３】
Ａｒがアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキル基を表わし、このアリールおよびヘテロアリールは、ピペラジニル、ピロリル、イミダゾリル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、［１，３，４］チアジアゾリル、トリアゾリル、インドリル、キノリニル、イソキノリニル、ベンゾジオキソリル、ベンゾフラニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾイソキソリル、およびジヒドロ－ベンゾジオキシニルから選択され、および１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよい；
請求項２に記載の化合物または塩。
【請求項１４】

R_4が水素である、請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項１５】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項１６】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、CF_3、CHF_2、OCF_3、ヒドロキシ、シアノ、C_1-C_2アルキル、C_1-C_2アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_2）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項１７】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
Ｂ）は－Ｅ－R_{35}、－C_1-C_4アルキル－Ｏ－R_{20}、－Ｅ－R_{20}－Ｇ－R_{30}、－Ｅ－Ｌ、－Ｅ－R_{20}－Ｌ、Ｊ、または－C_1-C_4アルキル－Ｊであり；
ＥおよびＧは独立し、－ＮＨ－、－Ｎ－C_1-C_6アルキル、またはＯであり；
R_2およびR_3が独立し、水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから選択され；
R_4が水素である；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項１８】
R_{40}が、それぞれ存在する場合、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、XR_{50}、－（C_1-C_4）アルキル－XR_{50}、およびＹから独立して選択され；
Ｘは、それぞれ存在する場合、結合、－CH_2－、－CHR_{60}－、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－ＮＨ－、および－NR_{60}－からなる群から独立して選択され；
R_{50}およびR_{60}は、それぞれ存在する場合、水素、ならびに直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、これらの基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1-C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1-C_6アルキル）（C_1-C_6アルキル）、およびＺから独立して選択される置換基によりさらに置換されていてもよく；
ＹおよびＺは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和、部分的不飽和または芳香族環から選択され、これらの環において、環原子の０個、１個または２個は酸素および窒素から選択され、残りの環原子は炭素であり、およびＹおよびＺは未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、C_1-C_6アルコキシ（C_1-C_6アルキル）、C_1-

C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから独立して選択される置換基により置換されていてもよい：および
nは、それぞれ存在する場合、０、１または２から独立して選択される；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項１９】
R_1が水素，ハロゲン、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項１８に記載の化合物または塩。
【請求項２０】
R_1が水素，ハロゲン、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；
R_4が水素であり；および
R_{40}は、それぞれ存在する場合、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、ハロゲン、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、（C_1－C_6）アルコキシ（C_1－C_6）アルキル、および（C_1－C_6）アルコキシ（C_1－C_6）アルコキシから独立して選択される；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項２１】
R_1が水素，ハロゲン、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
Ｂ）が－Ｅ－R_{35}、－C_1－C_4アルキル－Ｏ－R_{20}、－Ｅ－R_{20}－Ｇ－R_{30}、－Ｅ－Ｌ、－Ｅ－R_{20}－Ｌ、Ｊ、または－C_1－C_4アルキル－Ｊであり；
ＥおよびＧは独立し、－ＮＨ－、－Ｎ－C_1－C_6アルキル、またはＯであり；
R_{20}、R_{30}およびR_{35}は、それぞれ存在する場合、直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、またR_{20}およびR_{35}基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基により置換されていてもよく、およびR_{35}において、１～８個の炭素原子の少なくとも１個は１個または２個以上のグループＣ）から独立して選択される置換基によりさらに置換されており；
ここでグループＣ）はオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－Ｎ（C_1－C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1－C_6アルキル）、－ＮＨＳ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$ＮＨ（C_1－C_6アルキル）、－Ｓ（Ｏ）$_n$Ｎ（C_1－C_6アルキル）（C_1－C_6アルキル）、およびＬからなり；
ＪおよびＬは、それぞれ存在する場合、環原子４～７個を有する飽和ヘテロ環状環から独立して選択され、これらの環において、環原子の１個または２個は窒素であって、残りの環原子は炭素であり、これらの環は未置換であるか、または１個または２個以上のハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、アミノ、シアノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、C_1－C_6アルコキシ（C_1－C_6アルキル）、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノにより置換されていてもよい：ただしＪはフェニルまたはピリジルではなく；

R_2およびR_3が独立し、水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから選択され；
R_4が水素であり；および
R_{40}が、それぞれ存在する場合、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、ハロゲン、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ、モノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノ（C_1-C_6）アルコキシ、（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルキル、および（C_1-C_6）アルコキシ（C_1-C_6）アルコキシから独立して選択される；
請求項１３に記載の化合物または塩。
【請求項２２】
R_4が水素である、請求項３に記載の化合物または塩。
【請求項２３】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項３に記載の化合物または塩。
【請求項２４】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_6）アルキルアミノから選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、CF_3、CHF_2、OCF_3、ヒドロキシ、シアノ、C_1-C_2アルキル、C_1-C_2アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1-C_2）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項３に記載の化合物または塩。
【請求項２５】
Ａｒは１個または２個以上のR_{40}により置換されていてもよく；
R_{40}が、それぞれ存在する場合、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、ハロ（C_1-C_6）アルキル、およびハロ（C_1-C_6）アルコキシから独立して選択され；
Ａｒが少なくとも１個の－Ｅ－R_{50}－Ｇ－R_{60}－、－Ｅ－R_{50}－Ｇ－Ｙ、C_1-C_4アルキル－ＸR_{50}、－ＮＨ－R_{60}－Ｙ、－（ＮR_{50}）R_{60}－Ｙ、およびＹにより置換されており：
Ｘが、それぞれ存在する場合、－Ｏ－、－Ｃ（＝Ｏ）－、－Ｃ（＝Ｏ）Ｏ－、－ＯＣ（＝Ｏ）－、－Ｓ（Ｏ）$_n$－、－ＮＨ－、－ＮR_{60}－、－Ｃ（＝Ｏ）ＮＨ－、－Ｃ（＝Ｏ）ＮR_{60}－、－ＮＨＣ（＝Ｏ）－および－ＮR_{60}Ｃ（＝Ｏ）から独立して選択され；
R_{50}およびR_{60}が、それぞれ存在する場合、水素、および直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、ならびに（シクロアルキル）アルキル基から独立して選択され、この直鎖状、分枝鎖状、および環状アルキル基、および（シクロアルキル）アルキル基はそれぞれ、炭素原子１～８個からなり、また０個、１個または２個以上の二重結合または三重結合を含有しており、これらの基中に存在する１～８個の炭素原子はそれぞれ、１個または２個以上のオキソ、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、アミノ、C_1-C_6アルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）（C_1-C_6アルキル）、－ＮＨＣ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、－Ｎ（C_1-C_6アルキル）Ｃ（＝Ｏ）（C_1-C_6アルキル）、およびＺから独立して選択される置換基によりさらに置換されていてもよい；
請求項３に記載の化合物または塩。
【請求項２６】
R_1が水素，ハロゲン、C_1-C_6ハロアルキル、C_1-C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ

、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノから選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、CF_3、CHF_2、OCF_3、ヒドロキシ、シアノ、C_1－C_2アルキル、C_1－C_2アルコキシ、およびモノ－またはジ－（C_1－C_2）アルキルアミノから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項２５に記載の化合物または塩。
【請求項２７】
R_1が水素，ハロゲン、C_1－C_6ハロアルキル、C_1－C_6ハロアルコキシ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C_1－C_6アルキル、C_1－C_6アルコキシ、モノ－またはジ－（C_1－C_6）アルキルアミノおよびＢ）から選択され；
R_2およびR_3が水素、ハロゲン、メチルおよびエチルから独立して選択され；および
R_4が水素である；
請求項２５に記載の化合物または塩。
【請求項２８】
下記群から選択される、請求項１に記載の化合物または塩：
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（２－フルオロ－フェニル）－アミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
７－クロロ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（２－フルオロ－フェニル）－アミド；
６－メチル－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４－メトキシ－フェニル）－アミド；
６－メチル－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－プロポキシ－ピリジン－２－イル）－アミド；
６－メチル－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－３－イルアミド；
５－メトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（２－フルオロ－フェニル）－アミド；
５－メトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－メトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４－メトキシ－フェニル）－アミド；
５－エチルアミノ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４－メトキシ－フェニル）－アミド；
５－エチルアミノ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（２－フルオロ－フェニル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（２－フルオロ－フェニル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４－メトキシ－フェニル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－クロロ－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－ブロモ－ピリジン－３－イル）－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－フ

ルオロ－フェニル）－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－フルオロ－４－メトキシ－フェニル）－アミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸キノリン－８－イルアミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［４－（３－メタンスルホニルアミノ－プロポキシ）－フェニル］－アミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－プロピル－［１，２，４］チアジアゾール－５－イル）－アミド；
１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
６－メチル－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
６－メチル－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピラジン－２－イルアミド；
５－メトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［６－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－ピリジン－３－イル］－アミド；
５－メトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（ピリジン－２－イルメチル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［６－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－ピリジン－３－イル］－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［４－（２－エトキシ－エトキシ）－フェニル］－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［６－（テトラヒドロ－フラン－３－イルオキシ）－ピリジン－３－イル］－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソチアゾール－５－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソオキサゾール－５－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－エチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［４－（２－ヒドロキシ－エチル）－フェニル］－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［４－（２－ジエチルアミノ－エチル）－フェニル］－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－ヒドロキシメチル－フェニル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－ピロリジン－１－イルメチル－フェニル）－アミド；
５－エトキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸［４－（２－ピロリジン－１－イル－エチル）－フェニル］－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソチアゾール－５－イル）－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソオキサゾール－５－イル）－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；

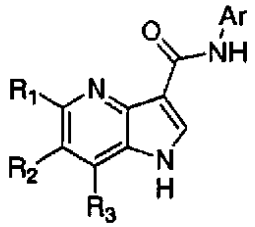
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－イソプロポキシ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－エチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－メトキシ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－メトキシ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソオキサゾール－５－イル）－アミド；
５－（２－メトキシ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソチアゾール－５－イル）－アミド；
５－（２－メトキシ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－メトキシ－ピラジン－２－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピペリジン－４－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－４－イルアミド；
５－（２－ジエチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－ジエチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（２－ジエチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－ピロリジン－１－イル－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－ピロリジン－１－イル－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（２－ピロリジン－１－イル－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピロリジン－３－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－ピロリジン－３－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（１－メチル－ピロリジン－３－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－ジメチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－イソオキサゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－ジメチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（２－ジメチルアミノ－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（１－メチル－アゼチジン－３－イルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－２，２－ジメチル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド

；
５－（３－ジメチルアミノ－２，２－ジメチル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－メトキシ－ピリジン－３－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－フルオロ－フェニル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソチアゾール－５－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリミジン－２－イルアミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（５－メチル－［１，３，４］チアジアゾール－２－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－メチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４，６－ジメチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソオキサゾール－５－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－エチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジメチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－ブチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－エチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－メチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ジエチルアミノ－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－オキソ－４，５－ジヒドロ－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（４－ジメチルアミノ－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ピペリジン－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ピペリジン－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－アゼチジン－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－アゼチジン－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［２－（１－メチル－ピロリジン－２－イル）－エトキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，

２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－［２－（１－メチル－ピロリジン－２－イル）－エトキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ピロール－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ピロール－１－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－［３－（３－メチル－ピペリジン－１－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［３－（３－メチル－ピペリジン－１－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ヒドロキシ－３－メチル－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（４，６－ジメチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ヒドロキシ－３－メチル－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（６－メチル－ピリジン－２－イル）－アミド；
５－（３－ヒドロキシ－３－メチル－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（４－ヒドロキシ－４－メチル－ペンチルオキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［３－（６－アザ－ビシクロ［３．２．２］ノン－６－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－［３－（６－アザ－ビシクロ［３．２．２］ノン－６－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（４－ジエチルアミノ－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（３－メチル－イソオキサゾール－５－イル）－アミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－エチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－ブチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－プロピル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－ピリジン－２－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（４－ヒドロキシ－ブトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［３－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［３－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－プロポキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（３－モルホリン－４－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（３－モルホリン－４－イル－プロポキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジ

ン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－エトキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－［２－（４－メチル－ピペラジン－１－イル）－エトキシ］－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；
５－（２－モルホリン－４－イル－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸ピリジン－２－イルアミド；
５－（２－モルホリン－４－イル－エトキシ）－１Ｈ－ピロロ［３，２－ｂ］ピリジン－３－カルボン酸（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）－アミド；および
その医薬として許容される塩。
レセプター結合性化合物は１マイクロモルまたはそれ以下のＫｉを示す。
【請求項２９】
ＧＡＢＡ$_A$レセプター結合性分析において、化合物は１００ナノモルまたはそれ以下のＫｉを示す、請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩。
【請求項３０】
ＧＡＢＡ$_A$レセプター結合性分析において、化合物は１０ナノモルまたはそれ以下のＫｉを示す、請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩。
【請求項３１】
請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩を、医薬上で許容される担体または賦形剤とともに含有する医薬組成物。
【請求項３２】
医薬組成物が注射用液体、エアゾル、クリーム、ゲル、ピル、カプセル、シロップまたは経皮貼布剤として製剤化される、請求項３１に記載の医薬組成物。
【請求項３３】
不安症、うつ症、睡眠障害、注意力欠損障害またはアルツハイマー病性痴呆の処置のための医薬組成物であって、請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩を有効成分として含有する、上記医薬組成物。
【請求項３４】
ＣＮＳ剤の治療効果を強化するための医薬組成物であって、ＣＮＳ剤および請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩を有効成分として含有する、上記医薬組成物。
【請求項３５】
患者における短期間記憶の改善するための医薬組成物であって、請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩を有効成分として含有する、上記医薬組成物。
【請求項３６】
試料中のＧＡＢＡ$_A$レセプターの存在または不存在を測定する方法であって、
（ａ）試料と請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩とを、当該化合物がＧＡＢＡ$_A$レセプターに結合することができる条件下に接触させ；
（ｂ）ＧＡＢＡ$_A$レセプターに結合していない化合物または塩を分離し；次いで
（ｃ）ＧＡＢＡ$_A$レセプターに結合した化合物または塩のレベルを測定し、これにより試料中のＧＡＢＡ$_A$レセプターの存在または不存在を検出する；
工程を包含する、上記方法。
【請求項３７】
結合した化合物の存在または不存在を、オートラジオグラフィを用いて検出する、請求項３６に記載の方法。
【請求項３８】
ＧＡＢＡ$_A$レセプターのシグナル伝達活性を変更する方法であって、上記方法がＧＡＢＡ$_A$レセプターを発現する細胞を、当該細胞に電気生理学的に検出可能な変更を生じさせるのに充分な濃度の請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩を含有する溶液と接触させ、これによりＧＡＢＡ$_A$レセプターシグナル伝達活性を変更させることを包含する

、上記方法。
【請求項３９】
ＧＡＢＡ$_A$レセプターのシグナル伝達活性を変更する方法であって、上記方法がＧＡＢＡ$_A$レセプターを発現する細胞を、ヒトＧＡＢＡ$_A$レセプターを発現する細胞に対するインビトロＲＯ１５－１７８８結合を抑制するのに充分な濃度の請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩に曝すことを包含する、上記方法。
【請求項４０】
細胞の電気生理学的に検出可能な変更が、細胞のクロライドイオン伝導率における変化である、請求項３８に記載の方法。
【請求項４１】
細胞が異種ＧＡＢＡ$_A$レセプターを組換えにより発現するものであり、および細胞の電気生理学的変更を細胞内記録法またはパッチクランプ記録法により検出する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４２】
不安症、うつ症、睡眠障害、注意力欠損障害またはアルツハイマー病性痴呆または短期間記憶喪失に被患している患者を処置するための組成物に用いられる容器または構造物中に、請求項３１の医薬組成物を含有する包装された医薬製剤。
【請求項４３】
不安症、うつ症、睡眠障害、注意力欠損障害またはアルツハイマー病性痴呆または短期間記憶喪失を処置するための医薬の製造における請求項１～３のいずれかに記載の化合物または塩の使用。
【請求項４４】
式：



で表わされる化合物またはその医薬として許容される塩：
式中、
R_1は、アミノ（C_1－C_6）アルコキシ、モノ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ジ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_6）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_6）アルコキシ、（C_1－C_4）アルコキシ（C_1－C_6）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_6）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_6）アルキルにより置換されていてもよい）、モルホリニル（C_1－C_6）アルコキシ、またはチオモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシであり；
R_2およびR_3は、Ｈ、（C_1－C_6）アルキル、ハロゲンまたは（C_1－C_6）アルコキシから独立して選択され；
Ａｒは、ピリジル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、またはピリダジニルであり、これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１個、２個または３個の独立した（C_1－C_6）アルキル、（C_1－C_6）アルコキシ、ハロゲン、ＯＣＦ$_3$またはＣＦ$_3$である基により置換されていてもよい。
【請求項４５】
R_1が、アミノ（C_1－C_4）アルコキシ、モノ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ジ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_4）ア

ルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1-C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1-C_6）アルコキシである、請求項４４に記載の化合物。
【請求項４６】
R_2およびR_3が、H、（C_1-C_4）アルキル、ハロゲンまたは（C_1-C_4）アルコキシから独立して選択され、ただしR_2およびR_3の少なくとも一方はHであり；および
Ａｒが、ピリジル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、ピラゾリル、ピリミジル、またはピリダジニルであり、これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１個、２個または３個の独立したアルキル、アルコキシ、ハロゲン、ＯＣＦ$_3$またはＣＦ$_3$である基により置換されていてもよい；
請求項４５に記載の化合物。
【請求項４７】
R_1が、アミノ（C_1-C_4）アルコキシ、モノ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_1-C_4）アルコキシ、ジ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_1-C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1-C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1-C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1-C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1-C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1-C_6）アルコキシであり；
R_2およびR_3が、H、（C_1-C_4）アルキルまたは（C_1-C_4）アルコキシから独立して選択され、ただしR_2およびR_3の少なくとも一方はHであり；および
Ａｒが、ピリジル、イソオキサゾリル、オキサゾール－５－イル、ピラゾリル、ピリミジル、またはピリダジニルであり、これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１個、２個または３個の独立した（C_1-C_4）アルキル、（C_1-C_4）アルコキシ、ハロゲン、ＯＣＦ$_3$またはＣＦ$_3$である基により置換されていてもよい；
請求項４６に記載の化合物。
【請求項４８】
R_1が、アミノ（C_1-C_4）アルコキシ、モノ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_1-C_4）アルコキシ、ジ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_1-C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1-C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1-C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1-C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1-C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1-C_4）アルコキシであり；
R_2およびR_3が、H、および（C_1-C_4）アルキルから独立して選択され、ただしR_2およびR_3の少なくとも一方はHであり；および
Ａｒが、ピリド－２－イル、イソオキサゾール－５－イル、オキサゾール－５－イル、ピラゾール－３－イル、ピリミド－２－イル、またはピリダジン－３－イルであり、これらの基はそれぞれ、未置換であるか、または１個または２個の独立した（C_1-C_4）アルキル、（C_1-C_4）アルコキシまたはハロゲンである基により置換されていてもよい；
請求項４７に記載の化合物。
【請求項４９】
R_1が、アミノ（C_2-C_4）アルコキシ、モノ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_2-C_4）アルコキシ、ジ（C_1-C_4）アルキルアミノ（C_2-C_4）アルコキシ、ピリジル（C_2-C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_2-C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_2-C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1-C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_2-C_4）アルコキシであり；
R_2が、Hまたはメチルであり；および
R_3が、Hである；
請求項４４に記載の化合物。
【請求項５０】
R_1が、アミノ（C_1-C_6）アルコキシ、モノ（C_1-C_3）アルキルアミノ（C_1-C_6）アルコキシ、ジ（C_1-C_3）アルキルアミノ（C_1-C_6）アルコキシ、ピリジル（C_1-C_6）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1-C_6）アルコキシ、（C_1-C_4）アルコキシ（C_1-C_6）アルコキシ、ピペラジニル（C_1-C_6）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は

（C_1－C_6）アルキルにより置換されていてもよい）、モルホリニル（C_1－C_6）アルコキシまたはチオモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシであり；

R_2およびR_3が、H、（C_1－C_6）アルキル、ハロゲンまたは（C_1－C_6）アルコキシ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５１】

R_1が、アミノ（C_1－C_4）アルコキシ、モノ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ジ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシである；

請求項５０に記載の化合物。

【請求項５２】

R_1が、アミノ（C_1－C_6）アルコキシ、モノ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ジ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_6）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_6）アルコキシ、（C_1－C_4）アルコキシ（C_1－C_6）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_6）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_6）アルキルにより置換されていてもよい）、モルホリニル（C_1－C_6）アルコキシ、またはチオモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシであり；

R_2およびR_3が、H、（C_1－C_6）アルキル、ハロゲンまたは（C_1－C_6）アルコキシから独立して選択される；

請求項２に記載の化合物。

【請求項５３】

R_1が、アミノ（C_1－C_4）アルコキシ、モノ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ジ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシである；

請求項５２に記載の化合物。

【請求項５４】

R_1が、アミノ（C_1－C_6）アルコキシ、モノ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ジ（C_1－C_3）アルキルアミノ（C_1－C_6）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_6）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_6）アルコキシ、（C_1－C_4）アルコキシ（C_1－C_6）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_6）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_6）アルキルにより置換されていてもよい）、モルホリニル（C_1－C_6）アルコキシ、またはチオモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシであり；

R_2およびR_3が、H、（C_1－C_6）アルキル、ハロゲンまたは（C_1－C_6）アルコキシから独立して選択される；

請求項３に記載の化合物。

【請求項５５】

R_1が、アミノ（C_1－C_4）アルコキシ、モノ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ジ（C_1－C_4）アルキルアミノ（C_1－C_4）アルコキシ、ピリジル（C_1－C_4）アルコキシ、ヒドロキシ（C_1－C_4）アルコキシ、ピペラジニル（C_1－C_4）アルコキシ（ここで、ピペラジニル基は（C_1－C_4）アルキルにより置換されていてもよい）、またはモルホリニル（C_1－C_6）アルコキシである；

請求項５４に記載の化合物。