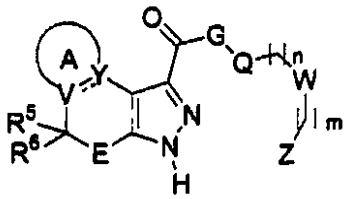
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年4月6日(2006.4.6)

【公表番号】特表2005-525333(P2005-525333A)
【公表日】平成17年8月25日(2005.8.25)
【年通号数】公開・登録公報2005-033
【出願番号】特願2003-566007(P2003-566007)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 401/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/435　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/519　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/20　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/22　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 487/04　(2006.01)
Ｇ０１Ｎ 33/53　(2006.01)
Ｇ０１Ｎ 33/60　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 401/12　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/435
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｋ 31/519
Ａ６１Ｐ 25/20
Ａ６１Ｐ 25/22
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｐ 43/00　１２１
Ｃ０７Ｄ 471/04　１０５Ｐ
Ｃ０７Ｄ 471/04　１０５Ｚ
Ｃ０７Ｄ 487/04　１３６
Ｃ０７Ｄ 487/04　１４１
Ｇ０１Ｎ 33/53　Ｄ
Ｇ０１Ｎ 33/60　Ａ

【手続補正書】
【提出日】平成18年2月16日(2006.2.16)
【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、

【化１】



の化合物、及びその薬剤学的に許容できる塩

［式中、

Ｅは、（ＣＲ^{1} Ｒ^{2}）$_{k}$を表し、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、モノ－及びジ－アルキルアミノ、及びアルコキシから独立に選択され、ｋは０，１，２、又は３であり、

Ｇは、酸素又はＮＨのいずれかであり、

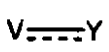
基、

【化２】



は、１～４個の環原子が窒素、酸素及び硫黄から選択され、残りの環原子が炭素である５～７個の環原子を有し、

【化３】



結合が単結合、二重結合、又は芳香族結合である、場合により置換されている飽和、部分不飽和、又は芳香族複素環を表し、

Ｖは、窒素、炭素又はＣＨであり、

Ｙは、炭素又はＣＨであり、

Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、一緒になってカルボニル基を形成してもよく、或いは、

Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、－ＣＯＯＨ、アミノ、Ｒ$_{10}$、－ＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－Ｏ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＳＯ$_{2}$ＮＨＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯＮＨＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯＮ（Ｒ$_{10}$）ＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯＮ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{0-2}$（Ｒ$_{10}$）、場合により置換されているアリール、及び場合により置換されているヘテロアリールから独立に選択され、

Ｒ$_{10}$及びＲ$_{11}$は、直鎖、分岐、及び環状アルキル基、並びに（シクロアルキル）アルキル基から独立に選択され、該直鎖、分岐、及び環状アルキル、並びに（シクロアルキル）アルキル基は、１～８個の炭素原子からなり、且つ、０又は１個又は複数の二重若し

くは三重結合を含み、各アルキル基で１～８個の炭素原子は更に、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、アルコキシ、－ＣＯＯＨ、－SO_2NH_2、－SO_2ＮＨ（アルキル）、－SO_2Ｎ（アルキル）（アルキル）、－ＮＨＣＯ（アルキル）、－Ｎ（アルキル）ＣＯ（アルキル）、－ＮＨCO_2（アルキル）、－Ｎ（アルキル）CO_2（アルキル）、－ＮＨSO_2（アルキル）、－Ｎ（アルキル）SO_2（アルキル）、－SO_2Ｎ（アルキル）ＣＯ（アルキル）、－SO_2ＮＨＣＯ（アルキル）、－ＣＯＮ（アルキル）SO_2（アルキル）、－ＣＯＮＨSO_2（アルキル）、－$CONH_2$、－ＣＯＮＨ（アルキル）、－ＣＯＮ（アルキル）（アルキル）、－CO_2（アルキル）、－ＣＯ（アルキル）、－SO_{0-2}（アルキル）、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクロアルキルから独立に選択される１個又は複数の置換基で場合によって置換されており、

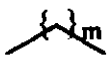
Ｑは、場合により置換されているアリール又は場合により置換されているヘテロアリール基であり、

Ｗは、水素、酸素、NR^7、硫黄、又はCR^7R^8であり、R^7及びR^8は、同一又は異なって、水素、直鎖若しくは分岐鎖アルキルを表し、或いは、CR^7R^8は３～７個の炭素原子をもつシクロアルキル基を表し、

Ｚは、存在しないか、水素、ヒドロキシ、直鎖若しくは分岐鎖アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキル（アルコキシ）、アミノ、モノ－若しくはジ－アルキルアミノ、又は$NR_{12}COR_{13}$であり、R_{12}及びR_{13}は、同一又は異なって、水素又は直鎖若しくは分岐鎖アルキルを表し、或いは、R_{12}及びR_{13}が連結してヘテロシクロアルキル環を形成してもよく、或いは、

Ｚは、場合により置換されている炭素環基又は場合により置換されている複素環基であり、

【化４】



及び

【化５】



は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、モノ－若しくはジ－アルキルアミノ、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、直鎖若しくは分岐鎖アルキル、又はシクロアルキルで置換されていてもよいメチレン基を表し、

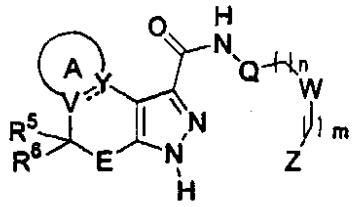
ｍは、０、１、２、又は３であり、且つ、

ｎは、０、１、２、又は３である（但し、Ｗが水素の場合は、ｍが０で、Ｚは存在しない）］。

【請求項２】

式

【化６】



で示される、請求項１に記載の化合物、及びその薬剤学的に許容できる塩

［式中、

Ｅは、（ＣＲ^{1}Ｒ^{2}）$_{k}$を表し、Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルケニル、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルキニル、ハロ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、ハロ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、モノ－及びジ－アルキル（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アミノ、及び（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシから独立に選択され、

ｋは０、１、２、又は３であり、

基

【化７】



は、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピラジニル、ピリジジニル、ピペリジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、対称及び非対称トリアゾリル、ピロリル、フラニル、ジアゼニル、トリアゼニル、１，２，４－トリアゾロン、４，５－ジヒドロイミダゾリル、及び１，４，５，６－テトラヒドロピリミジニルから選択される、飽和、部分不飽和、又は芳香族複素環を表す次式、

【化８】



の基であって、そのそれぞれの複素環は、結合を形成できる任意の利用可能な窒素においてＲ^{A}で場合によって置換されており、及び任意の利用可能な炭素においてＲ^{3}、Ｒ$^{3'}$及びＲ^{4}で場合によって置換されており、

【化９】



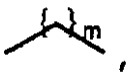
及び

【化１０】



の結合は、単結合、二重結合、又は芳香族結合であってもよく、
Ｕは、窒素、ＮＲ^{A}、Ｓ、又はＯであり、
Ｖは、窒素、炭素又はＣＨであり、
Ｙは、炭素又はＣＨであり、
Ｒ^{A}は、水素、（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、場合により置換されているアリール、及び場合により置換されているヘテロアリール基から選ばれ、該ヘテロアリール基が１～３個の環、各環に５～７個の還原子、及び該環の少なくとも１個中にＮ、Ｏ、及びＳから選択される１～約３個のヘテロ原子を有し、
Ｒ^{3}、Ｒ$^{3'}$、及びＲ^{4}は、各存在毎に独立に選択され、Ｒ^{5}及びＲ^{6}と同一の定義を有し、
Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、一緒になってカルボニル基を形成してもよく、或いは、
Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、－ＣＯＯＨ、アミノ、Ｒ$_{10}$、－ＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－Ｏ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＮＨＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＳＯ$_{2}$ＮＨＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｒ$_{10}$）ＣＯ（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯＮＨＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯＮ（Ｒ$_{10}$）ＳＯ$_{2}$（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮＨ（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯＮ（Ｒ$_{10}$）（Ｒ$_{11}$）、－ＣＯ$_{2}$（Ｒ$_{10}$）、－ＣＯ（Ｒ$_{10}$）、－ＳＯ$_{0-2}$（Ｒ$_{10}$）、場合により置換されているアリール基、及び場合により置換されているヘテロアリール基から独立に選択され、
Ｒ$_{10}$及びＲ$_{11}$は、直鎖、分岐、及び環状アルキル基、並びに（シクロアルキル）アルキル基から独立に選択され、該直鎖、分岐、及び環状アルキル、並びに（シクロアルキル）アルキル基は、１～８個の炭素原子からなり、且つ、０又は１個又は複数の二重若しくは三重結合を含み、各アルキル基で１～８個の炭素原子は更に、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、アルコキシ、－ＣＯＯＨ、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）ＣＯ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＮＨＣＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）ＣＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＮＨＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）ＣＯ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＳＯ$_{2}$ＮＨＣＯ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯＮ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）ＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯＮＨＳＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯＮＨ$_{2}$、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯＮ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯ$_{2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＣＯ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、－ＳＯ$_{0-2}$（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルキル）、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル、チエニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、及びモルホリニル基から独立に選択される１個又は複数の置換基で置換されていてもよく、
Ｑは、フェニル、ナフチル、キノリニル、チエニル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、対称若しくは非対称オキサジアゾリル、対称若しくは非対称チアジアゾリル、対称若しくは非対称トリアゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、フラニル、ジアゼニル、トリアゼニル、又はトリアゾロピラジニル基を表し、そのそれぞれは、非置換でも、或いはｉ）及びｉｉ）から独立に選択される最大３個までの置換基で置換されていてもよく、
ｉ）は、ヒドロキシ、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、モノ－若しくはジ－（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルアミノ、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルケニル、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルキニル、（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、トリフルオロメチル、又はトリフルオロメトキシを表し、
ｉｉ）は、ヘテロ原子を含んでいてもよく、且つ１個又は複数の炭素環又は複素環基で

場合により置換されている直鎖又は分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、
Ｗは、水素、酸素、ＮＲ^{7}、硫黄、又はＣＲ^{7}Ｒ^{8}であり、Ｒ^{7}及びＲ^{8}は、同一又は異なって、水素、直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、或いは、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}はＣ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル基を表し、
Ｚは、存在しないか、水素、ヒドロキシ、直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、（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$_{3}$）アルコキシ、アミノ、モノ若しくはジ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルアミノ、非芳香族炭素環、非芳香族複素環基、又はＮＲ$_{12}$ＣＯＲ$_{13}$であり、Ｒ$_{12}$及びＲ$_{13}$は、同一又は異なって、水素又は直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、或いはＲ$_{12}$及びＲ$_{13}$は連結して３～８員環ヘテロシクロアルキル環を形成してもよく、或いは、
Ｚは、フェニル、ナフチル、キノリニル、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピラジニル、ピリジジニル、ピペリジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、対称若しくは非対称チアジアゾリル、対称若しくは非対称トリアゾリル、対称若しくは非対称オキサジアゾリル、ピロリル、フラニル、ピリミジニル、ジアゼニル、トリアゼニル、１，２，４－トリアゾロン、４，５－ジヒドロイミダゾリル、又は１，４，５，６－テトラヒドロピリミジニル基であり、
【化１１】

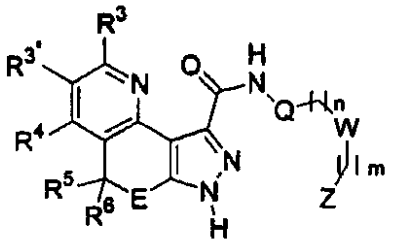


及び
【化１２】



は、非置換、又はハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、モノ－若しくはジ－（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルアミノ、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルケニル、（Ｃ$_{2}$～Ｃ$_{6}$）アルキニル、（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキル、又は（Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$）シクロアルキルで置換されていてもよいメチレン基を表し、
ｍは、０、１、２、又は３であり、且つ、
ｎは、０、１、２、又は３である（但し、Ｗが水素である場合には、ｍは０であり、Ｚは存在しない）］。
【請求項３】
Ｒ^{3}、Ｒ$^{3'}$、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、及びＲ^{6}が、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、－ＣＯＯＨ、（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$）アルキル、ハロ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{2}$）アルキル、ハロ（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{2}$）アルコキシ、モノ－及びジ－（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{4}$）アルキルアミノ、及びＣ$_{1}$～Ｃ$_{4}$アルコキシから独立に選択される、請求項２に記載の化合物又は塩。
【請求項４】
式

【化１３】



で表される、請求項２に記載の化合物又は塩。

【請求項５】

Ｅが（ＣＲ^{1} Ｒ^{2}）$_{2}$を表し、Ｒ^{1}及びＲ^{2}が独立に水素又はメチルである、請求項４に記載の化合物又は塩。

【請求項６】

Ｒ^{1}及びＲ^{2}が水素である、請求項５に記載の化合物又は塩。

【請求項７】

Ｒ^{3}、Ｒ$^{3'}$、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、及びＲ^{6}が、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、及びエトキシから独立に選択される、請求項５に記載の化合物又は塩。

【請求項８】

Ｒ^{3}、Ｒ$^{3'}$、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、及びＲ^{6}が水素である、請求項４に記載の化合物又は塩。

【請求項９】

Ｑが、フェニル、ピリジル、ピリミジニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、及びイミダゾリルから選択される、請求項６に記載の化合物又は塩。

【請求項１０】

Ｗが、酸素、ＮＨ、又はＣＨ$_{2}$である、請求項９に記載の化合物又は塩。

【請求項１１】

Ｚが、水素、ヒドロキシ、直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、（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$_{3}$）アルコキシ、アミノ、モノ若しくはジ－（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルアミノ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、アゼチジニル、ピロリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、又はピペリジニル、又はＮＲ$_{12}$ＣＯＲ$_{13}$であり、Ｒ$_{12}$及びＲ$_{13}$が、同一又は異なって、水素又は直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルを表し、又はＲ$_{12}$及びＲ$_{13}$が連結して３～８員環ヘテロシクロアルキル環を形成してもよく、或いは、

Ｚが、フェニル、チエニル、チアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジジニル、オキサゾリル、イソキサゾリル、対称若しくは非対称チアジアゾリル、対称若しくは非対称トリアゾリル、対称若しくは非対称オキサジアゾリル、ピロリル、フラニル、ピリミジニル、ジアゼニル、トリアゼニル基である、請求項９に記載の化合物又は塩。

【請求項１２】

Ｚが、水素、ヒドロキシ、直鎖若しくは分岐鎖（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルコキシ、（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$_{3}$）アルコキシ、アミノ、モノ若しくはジ－（Ｃ$_{1}$～Ｃ$_{6}$）アルキルアミノ、Ｃ$_{3}$～Ｃ$_{7}$シクロアルキル、アゼチジニル、ピロリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、又はピペリジニルである、請求項９に記載の化合物又は塩。

【請求項１３】

Ｅが、ＣＲ^{1} Ｒ^{2}を表し、Ｒ^{1}及びＲ^{2}が独立に水素又はメチルである、請求項４に記載の化合物又は塩。

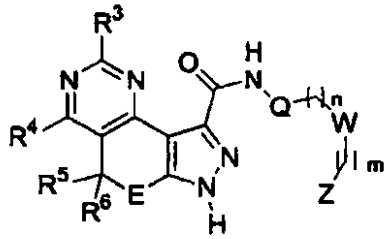
【請求項１４】

R^1及びR^2が水素であり、且つ、R^3、$R^{3'}$、及びR^4が、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、及びエトキシから独立に選択される、請求項１３に記載の化合物又は塩。

【請求項１５】

式

【化１４】



で表される、請求項２に記載の化合物又は塩。

【請求項１６】

EがCR^1 R^2であり、R^1及びR^2が独立に水素又はメチルである、請求項１５に記載の化合物。

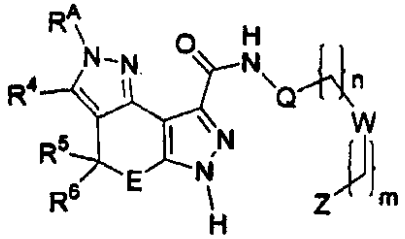
【請求項１７】

EがCH_2であり、R^3、$R^{3'}$、R^4、R^5、及びR^6が、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、及びエトキシから独立に選択される、請求項１５に記載の化合物。

【請求項１８】

式

【化１５】



で表される、請求項２に記載の化合物又は塩。

【請求項１９】

EがCR^1 R^2であり、R^1及びR^2が独立に水素又はメチルである、請求項１８に記載の化合物。

【請求項２０】

Eが、CH_2であり、

R^Aが、（C_1～C_6）アルキル、フェニル、チエニル、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、又はイミダゾリルであり、且つ、

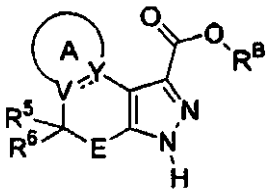
R^4、R^5、及びR^6が、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、及びエトキシから独立に選択される、請求項１８に記載の化合物。

【請求項２１】

Eが、CH_2であり、

R^4、R^5、及びR^6が、独立に水素であり、且つ、

R^Aが、メチル、エチル、又はピリジルである、請求項１８に記載の化合物又は塩。
【請求項２２】
式
【化１６】



の化合物
［式中、
Ｅは、（CR^1R^2）$_k$を表し、R^1及びR^2は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、モノ若しくはジアルキルアミノ、及びアルコキシから独立に選択され、ｋは０，１，２、又は３であり、
基、
【化１７】



は、１～４個の環原子が窒素、酸素及び硫黄から選択され、残りの環原子が炭素である５～７個の環原子を有し、
【化１８】



結合が単結合、二重結合、又は芳香族結合である、場合により置換されている飽和、部分不飽和、又は芳香族複素環を表し、
Ｖは、窒素、炭素又はＣＨであり、
Ｙは、炭素又はＣＨであり、
R^5及びR^6は、一緒になってカルボニル基を形成してもよく、或いは、
R^5及びR^6は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、－ＣＯＯＨ、アミノ、R_{10}、－ＮＨ（R_{10}）、－Ｎ（R_{10}）（R_{11}）、－Ｏ（R_{10}）、－SO_2NH_2、－SO_2NH（R_{10}）、－SO_2N（R_{10}）（R_{11}）、－ＮＨＣＯ（R_{10}）、－Ｎ（R_{10}）ＣＯ（R_{11}）、－$NHCO_2$（R_{10}）、－Ｎ（R_{10}）CO_2（R_{11}）、－$NHSO_2$（R_{10}）、－Ｎ（R_{10}）SO_2（R_{11}）、－SO_2NHCO（R_{10}）、－SO_2N（R_{10}）ＣＯ（R_{11}）、－ＣＯＮＨSO_2（R_{10}）、－ＣＯＮ（R_{10}）SO_2（R_{11}）、－$CONH_2$、－ＣＯＮＨ（R_{10}）、－ＣＯＮ（R_{10}）（R_{11}）、－CO_2（R_{10}）、－ＣＯ（R_{10}）、－SO_{0-2}（R_{10}）、場合により置換されているアリール、及び場合により置換されているヘテロアリールから独立に選択され、
R_{10}及びR_{11}は、直鎖、分岐、及び環状アルキル基、並びに（シクロアルキル）アルキル基から独立に選択され、該直鎖、分岐、及び環状アルキル、並びに（シクロアルキ

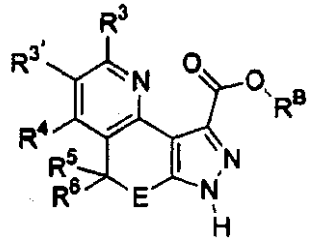
ル）アルキル基は、１～８個の炭素原子からなり、０又は１個又は複数の二重若しくは三重結合を含み、各アルキル基で１～８個の炭素原子は更に、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、モノ若しくはジアルキルアミノ、シアノ、ニトロ、アルコキシ、－ＣＯＯＨ、－SO_2NH_2、－SO_2ＮＨ（アルキル）、－SO_2Ｎ（アルキル）（アルキル）、－ＮＨＣＯ（アルキル）、－Ｎ（アルキル）ＣＯ（アルキル）、－$NHCO_2$（アルキル）、－Ｎ（アルキル）CO_2（アルキル）、－ＮＨSO_2（アルキル）、－Ｎ（アルキル）SO_2（アルキル）、－SO_2Ｎ（アルキル）ＣＯ（アルキル）、－SO_2ＮＨＣＯ（アルキル）、－ＣＯＮ（アルキル）SO_2（アルキル）、－ＣＯＮＨSO_2（アルキル）、－$CONH_2$、－ＣＯＮＨ（アルキル）、－ＣＯＮ（アルキル）（アルキル）、－CO_2（アルキル）、－ＣＯ（アルキル）、－SO_{0-2}（アルキル）、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、及びヘテロシクロアルキルから独立に選択される１個又は複数の置換基で置換されていてもよく、

R^Bは、水素、メチル、エチル及びベンジルから選択される］。

【請求項２３】

式

【化１９】

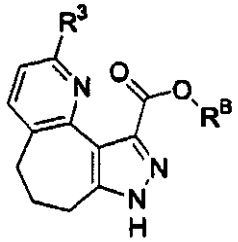


で表される、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２４】

式

【化２０】



［式中、R^3は、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシ、及びエトキシから選択される］。

で表される、請求項２２に記載の化合物。

【請求項２５】

３，４，５，６－テトラヒドロ－２，３，１０－トリアザ－ベンゾ［ｅ］アズレン－１－カルボン酸フェニルアミド、

３，４，５，６－テトラヒドロ－２，３，１０－トリアザ－ベンゾ［ｅ］アズレン－１－カルボン酸［１－（３－アゼチジン－１－イル－プロピル）－１Ｈ－ピラゾル－３－イル］－アミド、

４－オキソ－４，５，６，７－テトラヒドロ－１Ｈ－インダゾール－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、

５，７－ジヒドロ－６Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｈ］キノリン－９－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、
５，７－ジヒドロ－６Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｈ］キナゾリン－９－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、
２－メチル－５，７－ジヒドロ－６Ｈ－ピラゾロ［３，４－ｈ］キナゾリン－９－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、
２，４，５，６－テトラヒドロ－１，２，６，７－テトラアザ－ａｓ－インダセン－８－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、
又はそれらの薬剤学的に許容できる塩である、請求項１に記載の化合物。
【請求項２６】
少なくとも１種の薬剤学的に許容できる担体又は賦形剤と組み一緒になって、請求項１に記載の化合物又は塩を含む医薬組成物。
【請求項２７】
医薬組成物が、注射可能流体、エアゾール、クリーム、ゲル、ピル、カプセル、シロップ、又は経皮パッチとして製剤化される、請求項２６に記載の医薬組成物。
【請求項２８】
ａ）該化合物が$GABA_A$受容体に結合できる条件下で、サンプルを請求項１に記載の化合物又は塩と接触させること、及び
ｂ）$GABA_A$受容体に結合した化合物の濃度を検出すること、及びそれによってサンプル中における$GABA_A$受容体の存在又は不在を判定すること、を含む、サンプル中における$GABA_A$受容体の存在又は不在を判定するための方法。
【請求項２９】
前記化合物を放射能標識化し、且つ、前記検出段階が
（ｉ）非結合化合物を結合化合物から分離すること、及び
（ｉｉ）サンプル中における結合化合物の存在又は不在を検出すること
を含む、請求項２８に記載の方法。
【請求項３０】
前記サンプルが組織切片である、請求項２９に記載の方法。
【請求項３１】
前記標識化合物又は塩が、放射能標識又は直接若しくは間接発光標識である、請求項３０に記載の方法。
【請求項３２】
前記サンプルが組織切片であり、且つ、前記標識化合物又は塩をオートラジオグラフィーで検出し、少なくとも１つのサンプルのそれぞれに対するオートラジオグラムを作成する、請求項２９に記載の方法。
【請求項３３】
前記サンプル中の標識化合物又は塩の量の各測定が、オートラジオグラムを調べることによって実施され、比較がオートラジオグラムの露光密度を比較することである、請求項２９に記載の方法。
【請求項３４】
$GABA_A$受容体を発現する細胞を、該細胞の電気生理学を検出可能な程度変化させ、それによって$GABA_A$受容体のシグナル伝達活性を変化させるに十分な量の請求項１に記載の化合物又は塩を含有する溶液とｉｎ　ｖｉｔｒｏで接触させることを含む、$GABA_A$受容体のシグナル伝達活性をｉｎ　ｖｉｔｒｏで変化させるための方法。
【請求項３５】
前記溶液が、$GABA_A$受容体を発現する細胞のｉｎ　ｖｉｔｒｏでの塩素伝導度を検出可能な程度に変化させるに十分な濃度で請求項１に記載の化合物又は塩を含む、請求項３４に記載の方法。
【請求項３６】

前記細胞が、組換えにより異種ＧＡＢＡ$_A$受容体を発現しており、且つ、該細胞の電気生理学に関する変化を細胞内記録又はパッチクランプ記録によって検出する、請求項３５に記載の方法。

【請求項３７】

前記細胞が動物内でｉｎ　ｖｉｖｏで接触している神経細胞であり、前記溶液が体液であり、且つ、該細胞の電気生理学における変化を動物の反応の再現可能な変化として検出する、請求項３４に記載の方法。

【請求項３８】

前記動物がヒトであり、前記細胞が脳細胞であり、且つ、前記体液が脳脊髄液である、請求項３７に記載の方法。

【請求項３９】

ＧＡＢＡ$_A$受容体を発現する細胞を、ＲＯ１５－１７８８がヒトＧＡＢＡ$_A$受容体を発現する細胞にｉｎ　ｖｉｔｒｏで結合するのを抑制するに十分な量で請求項１に記載の化合物又は塩を含有する溶液と接触させることを含む、ＧＡＢＡ$_A$受容体のシグナル伝達活性をｉｎ　ｖｉｔｒｏで変化させるための方法。

【請求項４０】

容器内に請求項２６の医薬組成物を含み、且つ、更に、

該組成物を不安障害に罹患した患者の治療に使用するための使用説明書、

該組成物を抑うつ症に罹患した患者の治療に使用するための使用説明書、

該組成物を睡眠障害に罹患した患者の治療に使用するための使用説明書、

該組成物を注意欠陥過活動性障害に罹患した患者の治療に使用するための使用説明書

の少なくとも１種を含む詰合せ物。

【請求項４１】

容器内に請求項２６の医薬組成物を含み、且つ、更に、該組成物をアルツハイマー痴呆に罹患した患者の治療に使用するための使用説明書、又は該組成物を患者の記憶強化に使用するための使用説明書の少なくとも１種を含む特徴を具備する詰合せ物。

【請求項４２】

医薬を製造するための、請求項１に記載の化合物又は塩の使用。

【請求項４３】

不安、抑うつ、睡眠障害、又は注意欠陥過活動性障害を治療するための、請求項１に記載の化合物又は塩の使用。

【請求項４４】

記憶を強化するための、請求項１に記載の化合物又は塩の使用。