

【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25年1月31日(2013.1.31)

【公表番号】特表2012-511054(P2012-511054A)

【公表日】平成24年5月17日(2012.5.17)

【年通号数】公開・登録公報2012-019

【出願番号】特願2011-540836(P2011-540836)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|---------|-----------|
| C 0 7 D | 261/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 45/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 29/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/22 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 21/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 7/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/34 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 37/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/32 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/12 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 19/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 17/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 21/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 13/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 11/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 39/02 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/30 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 279/16 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/5415 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4985 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 471/04 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 413/12 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/496 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 417/12 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/55 | (2006.01) |

【 F I 】

| | | |
|---------|---------|-------|
| C 0 7 D | 261/20 | |
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 2 1 |
| A 6 1 P | 29/00 | |
| A 6 1 P | 25/04 | |
| A 6 1 P | 25/22 | |
| A 6 1 P | 21/02 | |
| A 6 1 P | 25/08 | |
| A 6 1 P | 9/10 | |
| A 6 1 P | 9/10 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 17/06 | |
| A 6 1 P | 7/02 | |
| A 6 1 P | 17/02 | |
| A 6 1 P | 25/34 | |
| A 6 1 P | 37/02 | |
| A 6 1 P | 31/00 | |
| A 6 1 P | 37/06 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 3/10 | |
| A 6 1 P | 25/02 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 25/32 | |
| A 6 1 P | 31/12 | |
| A 6 1 P | 31/18 | |
| A 6 1 P | 19/02 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 17/00 | |
| A 6 1 P | 21/00 | |
| A 6 1 P | 13/02 | |
| A 6 1 P | 13/10 | |
| A 6 1 P | 11/00 | |
| A 6 1 P | 39/02 | |
| A 6 1 P | 25/30 | |
| A 6 1 P | 35/04 | |
| C 0 7 D | 279/16 | C S P |
| A 6 1 K | 31/5415 | |
| A 6 1 K | 31/4985 | |
| C 0 7 D | 471/04 | 1 2 0 |
| C 0 7 D | 413/12 | |
| A 6 1 K | 31/496 | |
| C 0 7 D | 417/12 | |
| A 6 1 K | 31/55 | |

【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成24年12月7日 (2012.12.7)

【 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

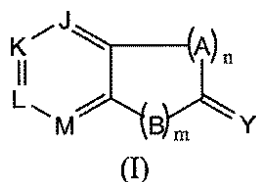
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式 (I) :

【化 5 9】



[式中、

n は、1、2 または 3 であり；

m は、0 または 1 であり；

A は、C、N、O、S、NR¹、C = CR¹ (E および Z 異性体)、C = NR¹ (E および Z 異性体)、または C(R¹R²)、CR¹ = CR² - CR^{1'}R^{2'} (E および Z 異性体)、または CR¹ = CR² - NR^{1'} (E および Z 異性体) であり；

n が 2 または 3 であるとき、任意の 2 個の隣接する A は、他の原子と共に、1 個または 2 個の環を形成し、各環は任意に置換されていてもよく；

B は、C、N、O、S、NR³ または C(R³R⁴) であり；J、K、L および M は、独立に、N または CR⁵ であり；Y は、O、S、NR⁶ または C(R⁶R⁷) であり；

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ および R⁷ は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、-CONR⁸R⁹、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであり；

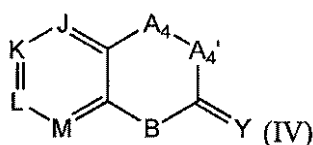
R⁸ および R⁹ は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキルまたは置換ヘテロアルキルであるか、または R⁸ および R⁹ は、それらが結合している窒素原子と共に、4 -、5 -、6 - または 7 - 員シクロヘテロアルキル環を形成し、但し、R⁸ および R⁹ の両方ともが水素でないものとする]

を有する化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 2】

構造式 (IV) :

【化 6 0】



[式中、

A₄ および A₄' は、独立に、NR¹、C = CR¹ (E および Z 異性体)、C = NR¹ (E および Z 異性体) または C(R¹R²) から選択されるか、または A₄ および A₄' は、他の原子と共に、任意に置換されていてもよい環を形成し；

A₄ と A₄' の結合は一重または二重結合であることができる]

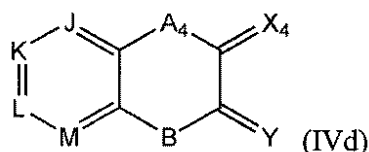
を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導

体。

【請求項 3】

構造式 (IVd) :

【化 6 1】



[式中、

A_4 および X_4 は、独立に、 $CR^{11}R^{12}$ または NR^{11} であり；

$C = X_4$ は、E および Z 異性体であることができ；

R^{11} および R^{12} は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、請求項 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 4】

下記から成る群から選択される、請求項 3 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

203 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

205 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2E) - 2 - (3 - ブロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

207 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [2 - (ジブチルアミノ) エチル] ベンズアミド

209 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

211 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

213 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

215 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

217 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2E) - 2 - (3 - ブロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

219 (2Z) - N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - ベンジリデン - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

221 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [

4 - (2 , 5 - ジメチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 2 3 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 2 5 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } ベンズアミド

2 2 7 (2 Z) - N - [3 - (アゼパン - 1 - イル) プロピル] - 2 - ベンジリデン - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 2 9 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - N - [3 - (3 - メチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 3 1 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 3 3 N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 3 5 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 3 7 (2 Z) - N - { 2 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } - 2 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソエチリデン] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド

2 3 9 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

2 4 1 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [4 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 4 3 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [(1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド

2 4 5 N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (2 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 4 7 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 4 9 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 5 1 N - { 3 - [ベンジル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 5 3 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

- 2 5 5 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
- 2 5 7 N - { 3 - [ベンジル (メチル) アミノ] プロピル } - 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド
- 2 5 9 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
- 2 6 1 N - { 2 - [ブタン - 2 - イル (シクロヘキシル) アミノ] エチル } - 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
- 2 6 3 N - { 2 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] エチル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
- 2 6 5 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
- 2 6 7 N - { 3 - [ベンジル (ブチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
- 2 6 9 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド
- 2 7 1 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
- 2 7 3 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
- 2 7 5 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
- 2 7 7 N - [2 - (ジプロピルアミノ) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
- 2 7 9 (2 Z) - N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - ベンジリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
- 2 8 1 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } ベンズアミド
- 2 8 3 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
- 2 8 5 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
- 2 8 7 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ

ドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル} ベンズアミド
 2 9 1 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 2
 (1 H) - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒ
 ドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 2 9 3 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ
 - 2, 3 - ジヒドロ - 4 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - フル
 オロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル} アセトアミド
 2 9 5 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ
 - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル} - N - [2 - (ピロリジン -
 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 2 9 7 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 2 - [メチル (2 - フェニル
 エチル) アミノ] エチル} アセトアミド
 2 9 9 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ
 - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル} - N - [3 - (3 - メチルピ
 ペリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド
 3 0 1 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペ
 ラジン - 1 - イル] プロピル} - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジ
 ヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 3 0 3 (2 Z) - N - [3 - (アゼパン - 1 - イル) プロピル] - 2 - ベンジリデン -
 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾ
 チアジン - 6 - カルボキサミド
 3 0 5 N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル}
 - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1, 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル} ベンズアミド
 3 0 7 N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル}
 - 4 - { (E) - [4 - (2 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1, 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル} ベンズアミド
 3 0 9 N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル}
 - 4 - { (E) - [4 - (4 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1, 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル} ベンズアミド
 3 1 1 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3 - メチルピペリジン
 - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
 3 1 3 (2 E) - 2 - (4 - エトキシ - 3 - メトキシベンジリデン) - N - { 3 - [4
 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル} - 4 - メチル - 3 - オキ
 ソ - 3, 4 - ジヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 3 1 5 2 - [(2 E) - 2 - (2 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフ
 エニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル} アセトアミド
 3 1 7 (2 Z) - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル]
 プロピル} - 4 - メチル - 2 - (3 - メチルベンジリデン) - 3 - オキソ - 3, 4 - ジヒ
 ドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 3 1 9 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3, 5 - ジメチルピペ
 リジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
 3 2 1 (2 E) - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル]
 プロピル} - 2 - (2 - メトキシベンジリデン) - 4 - メチル - 3 - オキソ - 3, 4 - ジ
 ヒドロ - 2 H - 1, 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 3 2 3 (2 Z) - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル]

プロピル } - 4 - メチル - 2 - (2 - メチルベンジリデン) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 4 2 1 4 - { (Z) - [4 - (4 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド
 4 2 3 4 - { (Z) - [4 - (4 - クロロベンジル) - 3 - チオキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [4 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド
 4 2 5 N - メチル - 4 - [(Z) - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) メチル] ベンズアミド
 4 2 7 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) - 2 - フェニルエチル] ベンズアミド
 4 2 9 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) - 3 - フェニルプロピル] ベンズアミド
 4 3 1 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロキノキサリン - 2 (1 H) - イリデン) - 3 - フェニルプロピル] ベンズアミド
 4 3 3 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロキノキサリン - 2 (1 H) - イリデン) - 2 - フェニルエチル] ベンズアミド
 4 3 5 4 - { (Z) - [4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 3 7 4 - { (Z) - [4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [3 , 4 - b] ピラジン - 2 (1 H) - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 3 9 4 - { (Z) - [1 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - チオキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 3 - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 4 1 4 - { [(2 Z) - 1 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 4 3 4 - { [(2 Z) - 1 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 5 - ナフチリジン - 4 - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 4 5 4 - { [(3 E) - 4 - ベンジル - 3 - エチリデン - 2 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 4 7 4 - { [(3 E) - 4 - ベンジル - 3 - エチリデン - 2 - チオキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 4 9 4 - { [(3 E) - 4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - 2 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 4 5 1 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - 3 - オキソ - N - [3 - (2 - プロピルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 4 5 3 4 - ベンジル - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - イミノ - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 4 5 5 4 - ベンジル - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2

- イミノ - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カルボキサミド

4 5 7 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カルボキサミド

4 5 9 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 1 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 3 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] チアジン - 7 - カルボキサミド

4 6 5 (2 Z) - 4 - ベンジル - 2 - エチリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

4 6 7 (3 Z) - 1 - ベンジル - 3 - エチリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 9 (3 Z) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 7 1 (3 Z) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - N - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - チオキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 7 3 (2 Z) - 4 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - エチリデン - 3 - イミノ - N - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

4 7 5 (2 Z) - 4 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - イミノ - N - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

4 7 7 (3 Z) - 3 - エチリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 - オキソ - N - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 7 - カルボキサミド

4 7 9 (3 Z) - 3 - エチリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - N - [3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - チオキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 7 - カルボキサミド

4 8 1 4 - { [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イル] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

4 8 3 4 - { (Z) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド

4 8 5 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド

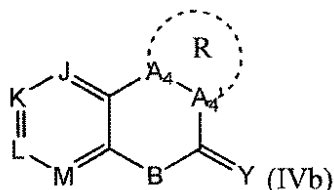
4 8 7 4 - { [(2 Z) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] アミノ } - N - メチルベンズアミド

489 4 - { [(2 E) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] アミノ } - N - メチルベンズアミド。

【請求項5】

構造式 (IV b) :

【化62】



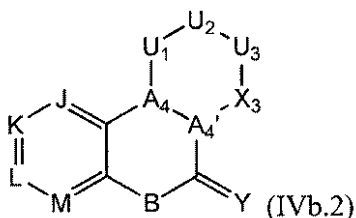
[式中、R 環は、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリール環である]

を有する、請求項2に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項6】

構造式 (IV b . 2) :

【化63】



[式中、

$A_4 - U_1$ 、 $U_1 - U_2$ 、 $U_2 - U_3$ 、 $U_3 - X_3$ 、 $A_4' - X_3$ 、 $A_4 - A_4'$ は、独立に、一重または二重結合であり；

U_1 、 U_2 、 U_3 、および X_3 は、独立に、S、O、N、 $N(R^{20})$ 、 $C(R^{20})$ 、または $C(R^{20}R^{21})$ であり；

A_4 および A_4' は、独立に、N、C、または CR^{22} であり；

R^{20} 、 R^{21} 、および R^{22} は、独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、請求項5に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項7】

下記から成る群から選択される、請求項6に記載の化合物：

ID IUPAC 名

515 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 9 - オキソ - 4 b , 5 , 6 , 7 , 8 , 8 a , 9 , 10 - オクタヒドロフェナントレン - 2 - カルボキサミド

517 5 - ベンジル - N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ -

5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

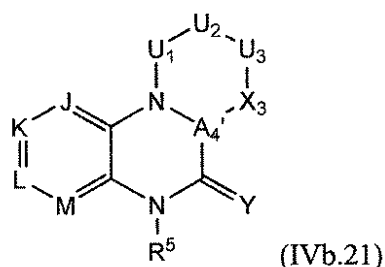
5 1 9 5 - ベンジル - 6 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

5 2 1 5 - (2 - フルオロベンジル) - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 6 - チオキソ - 6 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド。

【請求項 8】

構造式 (I V b . 2 1) :

【化 6 4】



を有する、請求項 6 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 9】

下記から成る群から選択される、請求項 8 に記載の化合物：

I D I U P A C 名

2 0 1 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

2 8 9 N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

5 5 1 N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 8 , 9 , 1 0 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

5 5 3 N - (3 - { 4 - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピペラジン - 1 - イル } プロピル) - 5 - メチル - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

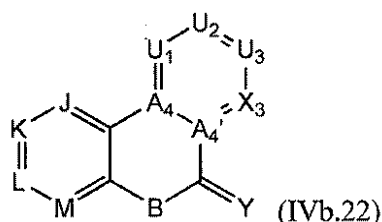
5 5 5 N - ({ 2 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] シクロプロピル } メチル) - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

5 5 7 N - { 3 - [4 - (1 , 3 - ベンゾジオキソル - 5 - イル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド。

【請求項 1 0】

構造式 (I V b . 2 2) :

【化 6 5】



を有する、請求項 6 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 1 1】

下記から成る群から選択される、請求項 1 0 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

5 2 5 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 9 - オキソ - 9 , 1 0 - ジヒドロフェナントレン - 2 - カルボキサミド

5 2 7 5 - (2 - フルオロベンジル) - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 6 - チオキソ - 5 , 6 - ジヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

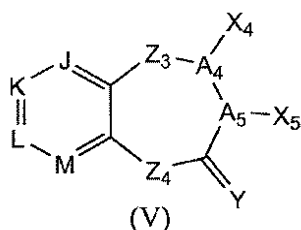
5 2 9 6 - ベンジル - 5 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 - ジヒドロベンゾ [c] [2 , 6] ナフチリジン - 8 - カルボキサミド

5 3 1 5 - ベンジル - N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 5 , 6 - ジヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド。

【請求項 1 2】

構造式 (V) :

【化 6 6】



[式中、

$A_4 - X_4$ 、 $A_5 - X_5$ は、独立に、 NR^1 、 $C = CR^1$ (E および Z 異性体)、 $C = NR^1$ 、または $C(R^1R^2)$ であり；

Z_3 および Z_4 は、独立に、O、S、 NR^3 、または $C(R^3R^4)$ であるか；または、 $Z_3 - A_4 - X_4$ 、または $X_4 - A_4 - A_5 - X_5$ は、他の原子と共に、任意に置換されていてもよい 6 - または 7 - 員環を形成する]

を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 1 3】

下記から成る群から選択される、請求項 1 2 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

8 0 1 4 - { (Z) - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3 H) - イリデン] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

803 4 - { (E) - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3 H) - イリデン] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

805 4 - { [(2 Z) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3 H) - イリデン] アミノ } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

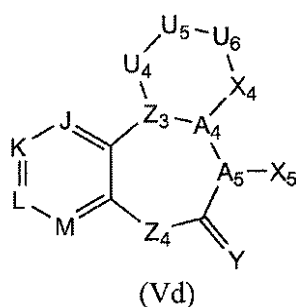
807 4 - { [(2 E) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3 H) - イリデン] アミノ } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

809 4 - { 2 - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] エチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド。

【請求項 14】

構造式 (Vd) :

【化 67】



[式中、

$Z_3 - U_4$ 、 $U_4 - U_5$ 、 $U_5 - U_6$ 、 $U_6 - X_4$ 、 $A_4 - X_4$ 、 $Z_3 - A_4$ は、独立に、一重または二重結合であり；

U_4 、 U_5 、 U_6 、および X_4 は、独立に、S、O、N、 $N(R^{19})$ 、 $C(R^{19})$ 、 $C(R^{19}R^{20})$ であり；

Z_3 および A_4 は、独立に、N、C、または CR^{21} であり；

R^{19} 、 R^{20} 、および R^{21} は、独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、請求項 12 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 15】

下記から成る群から選択される、請求項 14 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

1131 (7aS, 11aS) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 6 - オキソ - 6 , 7 , 7a , 8 , 9 , 10 , 11 , 11a - オクタヒドロ - 5H - ジベンゾ [b , d] アゼピン - 3 - カルボキサミド

1133 (12aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - (3 - フルオロベンジル) - 6 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 9 , 10 , 11 , 12 , 12a - オクタヒドロピリド [1 , 2 - d] [1 , 4] ベンゾジアゼピン - 3 - カルボキサミド

1135 (4aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 7

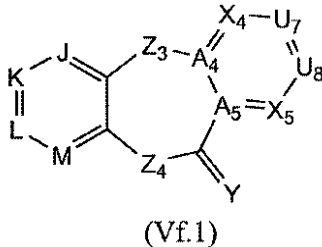
- (2 - クロロベンジル) - 6 - オキソ - 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 7 - ヘキサヒドロチオ
ピラノ [4 , 3 - d] [1] ベンズアゼピン - 9 - カルボキサミド

1 1 3 7 (7 a R) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5
- メチル - 6 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 7 a , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 - オクタヒドロピリド [1 , 2 - a] [1 , 5] ベンゾジアゼピン - 3 - カルボキサミド。

【請求項 1 6】

構造式 (V f . 1) :

【化 6 8】



[式中、

X_4 、 U_7 、 U_8 、および X_5 は、独立に、N または $CR^{2,5}$ である]

を有する、請求項 1 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 1 7】

下記から成る群から択される、請求項 1 6 に記載の化合物 :

ID IUPAC 名

1 2 3 5 1 0 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 1 1 - オキソ - N - [2 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) エチル] - 1 0 , 1 1 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4] チアゼピン - 8 - カルボキサミド

1 2 3 7 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 6 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - オキソ - 5 , 6 - ジヒドロピリド [2 , 3 - b] [1 , 5] ベンゾキサゼピン - 8 - カルボキサミド

1 2 3 9 N - { 2 - [4 - (シクロペンタ - 1 , 3 - ジエン - 1 - イル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } - 5 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 6 - オキソ - 6 , 1 1 - ジヒドロ - 5 H - ジピリド [3 , 2 - b : 2 ' , 3 ' - e] [1 , 4] ジアゼピン - 3 - カルボキサミド

1 2 4 1 N - [2 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) エチル] - 6 - メチル - 5 , 1 1 - ジオキソ - 6 , 1 1 - ジヒドロ - 5 H - ピリド [4 , 3 - c] [1] ベンズアゼピン - 8 - カルボキサミド

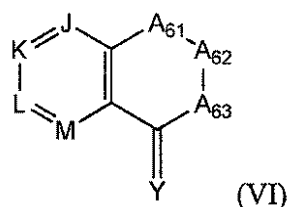
1 2 4 3 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 1 0 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 1 1 - オキソ - 1 0 , 1 1 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4] チアゼピン - 8 - カルボキサミド

1 2 4 5 1 0 - (3 - クロロベンジル) - 1 1 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 1 0 , 1 1 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4] チアゼピン - 8 - カルボキサミド。

【請求項 1 8】

構造式 (V I) :

【化 6 9】



[式中、

A_{61} 、 A_{62} および A_{63} は、独立に、C、N、O、S、 NR^1 、 $C=CR^1$ (E および Z 異性体)、 $C=NR^1$ (E および Z 異性体)、または $C(R^1R^2)$ であり；

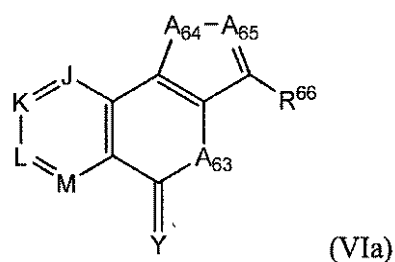
$A_{61}-A_{62}$ および $A_{62}-A_{63}$ は、独立に、一重または二重結合である]

を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 19】

構造式 (VIa)：

【化 7 0】



[式中、

A_{64} は、O または S であり；

A_{65} は、N または CR^1 であり；

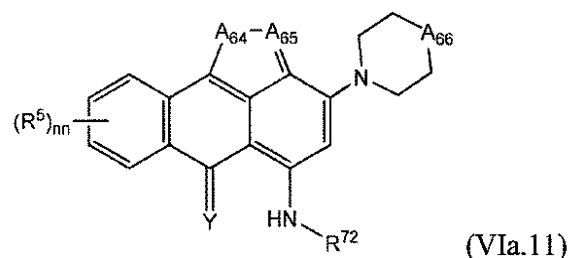
R^{66} は、水素、アルキル、または置換アルキルである]

を有する、請求項 18 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 20】

構造式 (VIa.11)：

【化 7 1】



[式中、

nn は、0 ~ 4 の整数であり；

A_{66} は、 NR^{73} または $CR^{73}R^{74}$ であり；

R^{72} 、 R^{73} 、および R^{74} は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、置換アミノ、スルホニル、置換スルホニル、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、 $-CONR^{75}R^{76}$ 、 $S(O)_2NR^{75}R^{76}$ 、アルキル、置換アルキル、アリ

ール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであり；

R^{75} および R^{76} は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであるか、または R^{75} および R^{76} は、それらが結合している窒素原子と共に、4 -、5 -、6 - または 7 - 員シクロヘテロアルキル環を形成する]

を有する、請求項 19 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

【請求項 21】

下記から成る群から選択される、請求項 20 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

11 5 - [(フラン - 2 - イルメチル)アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - フロ[4', 3', 2' : 5, 10]アントラ[2, 3 - d][1, 3]ジオキサソル - 6 - オン

13 2 - [(4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル)メチル] - 5 - [(フラン - 2 - イルメチル)アミノ] - 6 H - アントラ[9, 1 - bc]フラン - 6 - オン

15 4 - {[3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 2 - メチル - 6 - オキソ - 6 H - フロ[4', 3', 2' : 5, 10]アントラ[2, 3 - d][1, 3]ジオキサソル - 5 - イル]アミノ}安息香酸

17 5 - [(3 - エトキシプロピル)アミノ] - 2 - {[4 - (フラン - 2 - イルカルボニル)ピペラジン - 1 - イル]メチル} - 6 H - アントラ[9, 1 - bc]フラン - 6 - オン

41 5 - [(フラン - 2 - イルメチル)アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - [1, 3]ジオキサゾロ[6, 7]アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

43 4 - {[3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - [1, 3]ジオキサゾロ[6, 7]アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 5 - イル]アミノ}安息香酸

1001 5 - [(1, 4 - ジオキサン - 2 - イルメチル)アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1003 5 - (ベンジルアミノ) - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1005 5 - [(シクロペンタ - 1, 3 - ジエン - 1 - イルメチル)アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1007 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(1 H - ピロル - 2 - イルメチル)アミノ] - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1009 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(ピラジン - 2 - イルメチル)アミノ] - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1011 5 - [(ヒドロキシメチル)アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1013 N - [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 5 - イル]グリシン

1015 5 - [2 - (フラン - 2 - イル)エチル] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1017 5 - [2 - (1, 4 - ジオキサン - 2 - イル)エチル] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ[1, 9 - cd]イソキサゾル - 6 - オン

1019 5 - [2 - (1, 4 - ジオキシン - 2 - イル)エチル] - 3 - (4 - メチルピ

ペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 1 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H
 - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } 安息香酸
 7 0 3 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(フラン - 2 - イル
 メチル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 5 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン -
 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 7 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - [4 - (2 - ヒドロキシエチ
 ル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 9 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(3 - エトキシプロ
 ピル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 1 5 - (ブチルアミノ) - 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 3 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1
 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 5 5 - (シクロヘキシルアミノ) - 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イ
 ル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 7 3 - [4 - (1 , 3 - ベンゾジオキソル - 5 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イ
 ル] - 5 - [4 - (フラン - 2 - イルカルボニル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 H - アン
 トラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 2 1 メチル 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキ
 ソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 3 メチル 4 - { [3 - (モルホリン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - アントラ
 [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 5 メチル 4 - { [6 - オキソ - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 7 エチル 4 - { [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H
 - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 9 5 - [(4 - エトキシフェニル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン -
 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 3 1 5 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イルアミノ) - 3
 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾ
 ル - 6 - オン
 1 0 3 3 4 - ({ 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メトキシベンジル) ピペラジン - 1 -
 イル] - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル } アミノ
) 安息香酸
 1 0 3 5 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ブタン酸
 1 0 3 7 N - (3 - { 4 - [3 - (4 - クロロフェニル) プロピル] ピペラジン - 1 -
 イル } - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル) グリシ
 ン
 1 0 3 9 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - { [4 - (1 H - テ
 トラゾル - 5 - イル) フェニル] アミノ } - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾ
 ル - 6 - オン
 1 0 4 1 N - [(4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オ
 キソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } フェニル) ス
 ルホニル] アセトアミド
 1 0 4 3 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - { [4 - (1 , 1 ,
 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - 2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) フェニル] アミ
 ノ } - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン

1045 4 - ({ 3 - [4 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル } アミノ) 安息香酸。

【請求項 22】

治療有効量の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体；および、少なくとも 1 つの薬学的に許容されるビヒクルを含んで成る医薬組成物であって、前記化合物が請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物である医薬組成物。

【請求項 23】

患者における不整 T r k A 活性に関連した疾患、障害、症候または状態を処置するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体を含んで成る組成物。

【請求項 24】

経口用量、または注射、または経皮パッチ、またはデポー配合物の埋め込みに組み込まれる、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

下記を含んで成る医薬組成物：(a) 請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体、および (b) 下記から成る群から選択される少なくとも 1 つの付加的活性剤：タンパク質キナーゼ A (P K A) の阻害薬、c A M P シグナル伝達の阻害薬、非ステロイド性抗炎症薬、プロスタグランジン合成阻害薬、局所麻酔薬、抗痙攣薬、抗うつ薬、オピオイド受容体作動薬、神経弛緩薬、G A B A_A 受容体の作動薬、T r k A 拮抗薬と異なるメカニズムによって作用する鎮痛剤または抗癌剤、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、神経ステロイド、および吸入麻酔薬、麻酔薬、抗癌薬、m G l u R 5 受容体の調節因子、およびそれらの組合せ。

【請求項 26】

患者における不整 T r k A 活性に関連した疾患、障害、症候または状態を処置するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体を含んで成り、該組成物は、治療有効量の下記から成る群から選択される少なくとも 1 つの付加的活性剤：タンパク質キナーゼ A (P K A) の阻害薬、c A M P シグナル伝達の阻害薬、非ステロイド性抗炎症薬、プロスタグランジン合成阻害薬、局所麻酔薬、抗痙攣薬、抗うつ薬、オピオイド受容体作動薬、神経弛緩薬、G A B A_A 受容体の作動薬、T r k A 拮抗薬と異なるメカニズムによって作用する鎮痛剤または抗癌剤、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、神経ステロイド、および吸入麻酔薬、麻酔薬、抗癌薬、m G l u R 5 受容体の調節因子、およびそれらの組合せ

と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 27】

疾患、障害、症候または状態が、下記から成る群から選択される、請求項 23 または 26 に記載の組成物：

急性疼痛、慢性疼痛、炎症性疼痛、神経障害性疼痛、緊張性疼痛、持続性疼痛、術後疼痛、化学誘発疼痛、化学療法誘発疼痛、癌疼痛、薬剤誘発疼痛、骨疼痛、アルコール誘発通覚過敏に関連した疼痛、全身性疼痛障害、不安、骨格筋痙攣、痙攣発作、癲癇、再狭窄、アテローム性動脈硬化症、乾癬、血栓症、熱傷、心的外傷後ストレス障害、心臓障害、喫煙、炎症および免疫媒介障害（微生物感染および器官移植を包含する）、癌（乳癌、頭頸部癌、前立腺癌および肺癌を包含する）、髄鞘発育不全または髄鞘脱落に関連した疾患、障害または損傷、およびそれらの組合せ。

【請求項 28】

疾患、障害または症候または状態が、下記によるかまたは関連している、請求項 23 または 26 に記載の組成物：

カウザルギー、糖尿病、膠原血管病、三叉神経痛、脊髄損傷、脳幹損傷、視床痛症候群、複合性局所疼痛症候群 I 型 / 反射性交感神経性ジストロフィー、ファブリー症候群、小径

線維ニューロパシー、癌、癌化学療法、慢性アルコール中毒、脳卒中、膿瘍、脱髄疾患、ウイルス感染、抗ウイルス療法、AIDS、AIDS療法、熱傷、日焼け、関節炎、大腸炎、心臓炎、皮膚炎、筋炎、神経炎、粘膜炎、尿道炎、膀胱炎、胃炎、肺炎、膠原血管病、外傷、手術、切断術、毒素、不適応物質使用、物質依存、アルコール使用または乱用、物質使用または乱用、薬物使用または乱用、薬剤関連作用、転移、線維筋痛症、過敏性腸症候群、側頭下顎障害、炎症、免疫異常、およびそれらの組合せ。

【請求項 29】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 つに記載の化合物、または請求項 22、24 または 25 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物を含んで成るキット。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

3. 発明の概要

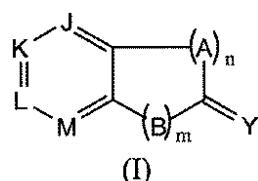
本発明の目的は、TrkA の阻害に関連した疾患（疼痛、癌、再狭窄、アテローム性動脈硬化症、乾癬、血栓症、または髄鞘發育不全もしくは髄鞘脱落に関連した疾患、障害もしくは損傷を包含する）の処置および / または予防用薬剤の製造のための、NGF 受容体 TrkA 阻害薬および / 拮抗薬としての合成小分子の使用である。

本発明は、例えば、以下を提供する：

（項目 1）

構造式（I）：

【化 59】



[式中、

n は、1、2 または 3 であり；

m は、0 または 1 であり；

A は、C、N、O、S、 NR^1 、 $\text{C}=\text{CR}^1$ （E および Z 異性体）、 $\text{C}=\text{NR}^1$ （E および Z 異性体）、または $\text{C}(\text{R}^1\text{R}^2)$ 、 $\text{CR}^1=\text{CR}^2-\text{CR}^1$ 、 R^2 、（E および Z 異性体）、または $\text{CR}^1=\text{CR}^2-\text{NR}^1$ 、（E および Z 異性体）であり；

n が 2 または 3 であるとき、任意の 2 個の隣接する A は、他の原子と共に、1 個または 2 個の環を形成し、各環は任意に置換されていてもよく；

B は、C、N、O、S、 NR^3 または $\text{C}(\text{R}^3\text{R}^4)$ であり；

J、K、L および M は、独立に、N または CR^5 であり；

Y は、O、S、 NR^6 または $\text{C}(\text{R}^6\text{R}^7)$ であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、 $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ 、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであり；

R^8 および R^9 は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキルまたは置換ヘテロア

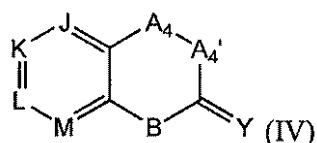
ルキルであるか、または R^8 および R^9 は、それらが結合している窒素原子と共に、4 -、5 -、6 - または 7 - 員シクロヘテロアルキル環を形成し、但し、 R^8 および R^9 の両方ともが水素でないものとする]

を有する化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 2)

構造式 (IV) :

【化 6 0】



[式中、

A_4 および A_4' は、独立に、 NR^1 、 $C=CR^1$ (E および Z 異性体)、 $C=NR^1$ (E および Z 異性体) または $C(R^1R^2)$ から選択されるか、または A_4 および A_4' は、他の原子と共に、任意に置換されていてもよい環を形成し；

A_4 と A_4' の結合は一重または二重結合であることができる]

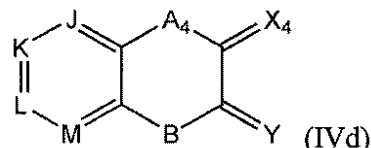
を有する、項目 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体

。

(項目 3)

構造式 (IVd) :

【化 6 1】



[式中、

A_4 および X_4 は、独立に、 $CR^{11}R^{12}$ または NR^{11} であり；

$C=X_4$ は、E および Z 異性体であることができ；

R^{11} および R^{12} は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、項目 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体

。

(項目 4)

下記から成る群から選択される、項目 3 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

203 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

205 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

207 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [2 - (ジブチルアミノ) エチル] ベンズアミド

209 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

211 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

213 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

215 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

217 N - [3 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

219 (2 Z) - N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - ベンジリデン - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

221 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (2 , 5 - ジメチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

223 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

225 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } ベンズアミド

227 (2 Z) - N - [3 - (アゼパン - 1 - イル) プロピル] - 2 - ベンジリデン - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

229 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - N - [3 - (3 - メチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

231 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

233 N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

235 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

237 (2 Z) - N - { 2 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] エチル } - 2 - [2 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - オキソエチリデン] - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリン - 6 - カルボキサミド

239 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

241 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [4 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4

- ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 4 3 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [(1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル] ベンズアミド

2 4 5 N - { 3 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (2 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 4 7 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 4 9 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

2 5 1 N - { 3 - [ベンジル (メチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 5 3 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

2 5 5 2 - [(2 E) - 2 - (3 - ブロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

2 5 7 N - { 3 - [ベンジル (メチル) アミノ] プロピル } - 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

2 5 9 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

2 6 1 N - { 2 - [ブタン - 2 - イル (シクロヘキシル) アミノ] エチル } - 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 6 3 N - { 2 - [シクロヘキシル (メチル) アミノ] エチル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 6 5 2 - [(2 E) - 2 - (3 - ブロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド

2 6 7 N - { 3 - [ベンジル (ブチル) アミノ] プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

2 6 9 N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - [(2 E) - 2 - (3 - ブロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] アセトアミド

2 7 1 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

2 7 3 2 - [(2 E) - 2 - (3 - ブロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド

2 7 5 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル]

プロピル} - 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジ
 ヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
 277 N - [2 - (ジプロピルアミノ) エチル] - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチル
 ベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリ
 デン] メチル } ベンズアミド
 279 (2 Z) - N - [2 - (アゼパン - 1 - イル) エチル] - 2 - ベンジリデン - 4
 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチ
 アジン - 6 - カルボキサミド
 281 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ
 - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - { 3 - [4 - (2 - フ
 ルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } ベンズアミド
 283 2 - [(2 Z) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェ
 ニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
 285 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (2 - エチルピペリジン
 - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
 287 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル]
 プロピル } - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ
 ドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
 291 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2
 (1 H) - イル) プロピル] - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ
 ドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 293 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモ - 4 - メトキシベンジリデン) - 3 - オキソ
 - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4
 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド
 295 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ
 - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [2 - (ピロリジン -
 1 - イル) エチル] ベンズアミド
 297 2 - [(2 E) - 2 - (3 - プロモベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒ
 ドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 2 - [メチル (2 - フェニル
 エチル) アミノ] エチル } アセトアミド
 299 4 - { (E) - [4 - (3 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ
 - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [3 - (3 - メチルピ
 ペリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド
 301 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペ
 ラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジ
 ヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
 303 (2 Z) - N - [3 - (アゼパン - 1 - イル) プロピル] - 2 - ベンジリデン -
 4 - (4 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾ
 チアジン - 6 - カルボキサミド
 305 N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル }
 - 4 - { (E) - [4 - (3 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
 307 N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル }
 - 4 - { (E) - [4 - (2 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド
 309 N - { 3 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル }
 - 4 - { (E) - [4 - (4 - メチルベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H
 - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イリデン] メチル } ベンズアミド

3 1 1 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3 - メチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド

3 1 3 (2 E) - 2 - (4 - エトキシ - 3 - メトキシベンジリデン) - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

3 1 5 2 - [(2 E) - 2 - (2 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } アセトアミド

3 1 7 (2 Z) - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - メチル - 2 - (3 - メチルベンジリデン) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

3 1 9 2 - [(2 E) - 2 - (3 - クロロベンジリデン) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 4 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 4 - イル] - N - [3 - (3 , 5 - ジメチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド

3 2 1 (2 E) - N - { 3 - [4 - (2 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 2 - (2 - メトキシベンジリデン) - 4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

3 2 3 (2 Z) - N - { 3 - [4 - (4 - フルオロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 4 - メチル - 2 - (2 - メチルベンジリデン) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド

4 2 1 4 - { (Z) - [4 - (4 - クロロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド

4 2 3 4 - { (Z) - [4 - (4 - クロロベンジル) - 3 - チオキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [4 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミド

4 2 5 N - メチル - 4 - [(Z) - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) メチル] ベンズアミド

4 2 7 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) - 2 - フェニルエチル] ベンズアミド

4 2 9 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン) - 3 - フェニルプロピル] ベンズアミド

4 3 1 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロキノキサリン - 2 (1 H) - イリデン) - 3 - フェニルプロピル] ベンズアミド

4 3 3 N - メチル - 4 - [(1 Z) - 1 - (4 - メチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロキノキサリン - 2 (1 H) - イリデン) - 2 - フェニルエチル] ベンズアミド

4 3 5 4 - { (Z) - [4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 3 7 4 - { (Z) - [4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [3 , 4 - b] ピラジン - 2 (1 H) - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 3 9 4 - { (Z) - [1 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - チオキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 3 - イリデン] メチル } - N - [2 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 4 1 4 - { [(2 Z) - 1 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 4 - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 4 3 4 - { [(2 Z) - 1 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 ,
4 - テトラヒドロ - 1 , 5 - ナフチリジン - 4 - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジ
ン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 4 5 4 - { [(3 E) - 4 - ベンジル - 3 - エチリデン - 2 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ
ドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン -
1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 4 7 4 - { [(3 E) - 4 - ベンジル - 3 - エチリデン - 2 - チオキソ - 3 , 4 - ジ
ヒドロ - 1 , 6 - ナフチリジン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン
- 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 4 9 4 - { [(3 E) - 4 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - 2 - オキ
ソ - 3 , 4 - ジヒドロキノリン - 1 (2 H) - イル] メチル } - N - [2 - (ピペリジン
- 1 - イル) エチル] ベンズアミド

4 5 1 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - 3 - オキソ - N - [3 - (2 - プロピルピペリジ
ン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カ
ルボキサミド

4 5 3 4 - ベンジル - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2
- イミノ - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボ
キサミド

4 5 5 4 - ベンジル - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2
- イミノ - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カルボ
キサミド

4 5 7 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)
プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カル
ボキサミド

4 5 9 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)
プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オ
キサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 1 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)
プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] オ
キサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 3 (3 Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)
プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] チ
アジン - 7 - カルボキサミド

4 6 5 (2 Z) - 4 - ベンジル - 2 - エチリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン
- 1 - イル) プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジ
ン - 6 - カルボキサミド

4 6 7 (3 Z) - 1 - ベンジル - 3 - エチリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン
- 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b]
[1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 6 9 (3 Z) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - N - [3 - (2 -
エチルピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリ
ド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 7 1 (3 Z) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 3 - エチリデン - N - [3 - (ピペ
リジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - チオキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 ,
3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド

4 7 3 (2 Z) - 4 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - エチリデン - 3 - イミノ - N -
[3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾ
チアジン - 6 - カルボキサミド

4 7 5 (2 Z) - 4 - ベンジル - 2 - エチリデン - 3 - イミノ - N - [3 - (ピペリジ
ン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カ

ルボキサミド

4 7 7 (3 Z) - 3 - エチリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - 2 - オキソ - N -
[3 - (ピペリジン - 1 - イル) プロピル] - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾ
チアジン - 7 - カルボキサミド

4 7 9 (3 Z) - 3 - エチリデン - 4 - (4 - フルオロベンジル) - N - [3 - (ピペ
リジン - 1 - イル) プロピル] - 2 - チオキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベン
ゾオキサジン 7 - カルボキサミド

4 8 1 4 - { [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H
- 1 , 4 - ベンゾチアジン - 2 - イル] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル)
プロピル] ベンズアミド

4 8 3 4 - { (Z) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒド
ロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミ
ド

4 8 5 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒド
ロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] メチル } - N - メチルベンズアミ
ド

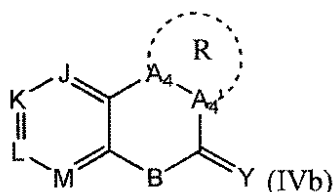
4 8 7 4 - { [(2 Z) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ
ドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] アミノ } - N - メチルベンズア
ミド

4 8 9 4 - { [(2 E) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒ
ドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] アミノ } - N - メチルベンズア
ミド

(項目 5)

構造式 (I V b) :

【化 6 2】



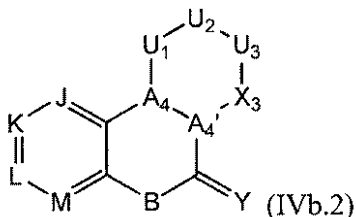
[式中、R 環は、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シク
ロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリー
ル環である]

を有する、項目 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体
。

(項目 6)

構造式 (I V b . 2) :

【化 6 3】



[式中、

A₄ - U₁、U₁ - U₂、U₂ - U₃、U₃ - X₃、A₄' - X₃、A₄ - A₄' は、独
立に、一重または二重結合であり；

U_1 、 U_2 、 U_3 、および X_3 は、独立に、S、O、N、 $N(R^{20})$ 、 $C(R^{20})$ 、または $C(R^{20}R^{21})$ であり；

A_4 および A_4' は、独立に、N、C、または CR^{22} であり；

R^{20} 、 R^{21} 、および R^{22} は、独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリーラルキル、置換アリーラルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリーラルキル、置換ヘテロアリーラルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、項目 5 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 7)

下記から成る群から選択される、項目 6 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

515 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 9 - オキソ - 4b, 5, 6, 7, 8, 8a, 9, 10 - オクタヒドロフェナントレン - 2 - カルボキサミド

517 5 - ベンジル - N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6, 6a, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロ - 5H - ピリド [1, 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

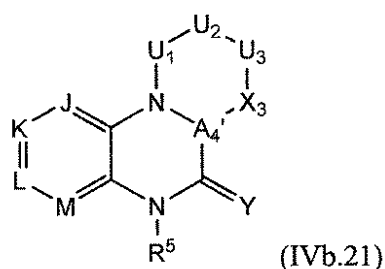
519 5 - ベンジル - 6 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5, 6, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

521 5 - (2 - フルオロベンジル) - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 6 - チオキソ - 6, 8 - ジヒドロ - 5H - ピリド [1, 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

(項目 8)

構造式 (IVb.21)：

【化 64】



を有する、項目 6 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 9)

下記から成る群から選択される、項目 8 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

201 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6, 6a, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロ - 5H - ピリド [1, 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

289 N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6, 6a, 7, 8, 9, 10 - ヘキサヒドロ - 5H - ピリド [1, 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

551 N - { 3 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } -

6 - オキソ - 6 , 8 , 9 , 10 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

5 5 3 N - (3 - { 4 - [5 - クロロ - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピペラジン - 1 - イル } プロピル) - 5 - メチル - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

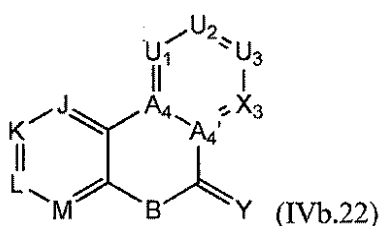
5 5 5 N - ({ 2 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] シクロプロピル } メチル) - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

5 5 7 N - { 3 - [4 - (1 , 3 - ベンゾジオキソル - 5 - イル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

(項目 1 0)

構造式 (I V b . 2 2) :

【化 6 5】



を有する、項目 6 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体

(項目 1 1)

下記から成る群から選択される、項目 1 0 に記載の化合物 :

I D I U P A C 名

5 2 5 N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 9 - オキソ - 9 , 10 - ジヒドロフェナントレン - 2 - カルボキサミド

5 2 7 5 - (2 - フルオロベンジル) - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 6 - チオキソ - 5 , 6 - ジヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

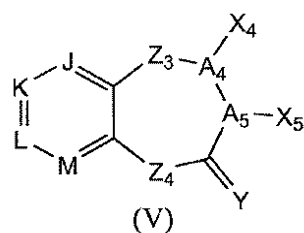
5 2 9 6 - ベンジル - 5 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 - ジヒドロベンゾ [c] [2 , 6] ナフチリジン - 8 - カルボキサミド

5 3 1 5 - ベンジル - N - { 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロピル } - 6 - オキソ - 5 , 6 - ジヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

(項目 1 2)

構造式 (V) :

【化 6 6】



[式中、

$A_4 - X_4$ 、 $A_5 - X_5$ は、独立に、 NR^1 、 $C = CR^1$ (E および Z 異性体)、 $C = NR^1$ 、または $C(R^1R^2)$ であり；

Z_3 および Z_4 は、独立に、O、S、 NR^3 、または $C(R^3R^4)$ であるか；または、 $Z_3 - A_4 - X_4$ 、または $X_4 - A_4 - A_5 - X_5$ は、他の原子と共に、任意に置換されていてもよい 6 - または 7 - 員環を形成する]

を有する、項目 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 1 3)

下記から成る群から選択される、項目 1 2 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

801 4 - { (Z) - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

803 4 - { (E) - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] メチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

805 4 - { [(2Z) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] アミノ } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

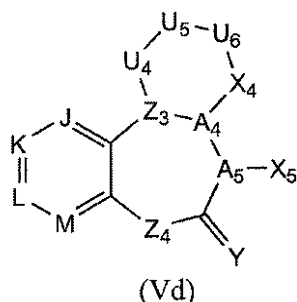
807 4 - { [(2E) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] アミノ } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

809 4 - { 2 - [5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1, 5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] エチル } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

(項目 1 4)

構造式 (Vd)：

【化 6 7】



[式中、

$Z_3 - U_4$ 、 $U_4 - U_5$ 、 $U_5 - U_6$ 、 $U_6 - X_4$ 、 $A_4 - X_4$ 、 $Z_3 - A_4$ は、独立に、一重または二重結合であり；

U_4 、 U_5 、 U_6 、および X_4 は、独立に、S、O、N、 $N(R^{19})$ 、 $C(R^{19})$ 、 $C(R^{19}R^{20})$ であり；

Z_3 および A_4 は、独立に、N、C、または CR^{21} であり；

R^{19} 、 R^{20} 、および R^{21} は、独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリアルコキシカルボニル、置換アリアルコキシカルボニル、アルキル、置換アルキル、アリアル、置換アリアル、アリアルアルキル、置換アリアルアルキル、ヘテロアリアル、置換ヘテロアリアル、ヘテロアリアルアルキル、置換ヘテロアリアルアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルである]

を有する、項目 1 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導

体。

(項目 15)

下記から成る群から選択される、項目 14 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

1131 (7aS, 11aS) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 6 - オキソ - 6, 7, 7a, 8, 9, 10, 11, 11a - オクタヒドロ - 5H - ジベンゾ [b, d] アゼピン - 3 - カルボキサミド

1133 (12aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - (3 - フルオロベンジル) - 6 - オキソ - 5, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 12a - オクタヒドロピリド [1, 2 - d] [1, 4] ベンゾジアゼピン - 3 - カルボキサミド

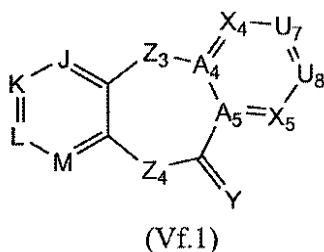
1135 (4aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 7 - (2 - クロロベンジル) - 6 - オキソ - 3, 4, 4a, 5, 6, 7 - ヘキサヒドロチオピラノ [4, 3 - d] [1] ベンズアゼピン - 9 - カルボキサミド

1137 (7aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - メチル - 6 - オキソ - 5, 6, 7, 7a, 8, 9, 10, 11 - オクタヒドロピリド [1, 2 - a] [1, 5] ベンゾジアゼピン - 3 - カルボキサミド

(項目 16)

構造式 (Vf.1)：

【化 68】



[式中、

X_4 、 U_7 、 U_8 、および X_5 は、独立に、N または $CR^{2,5}$ である]

を有する、項目 12 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 17)

下記から成る群から択される、項目 16 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

1235 10 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル) - 11 - オキソ - N - [2 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) エチル] - 10, 11 - ジヒドロジベンゾ [b, f] [1, 4] チアゼピン - 8 - カルボキサミド

1237 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 6 - (3 - フルオロベンジル) - 5 - オキソ - 5, 6 - ジヒドロピリド [2, 3 - b] [1, 5] ベンゾキサゼピン - 8 - カルボキサミド

1239 N - {2 - [4 - (シクロペンタ - 1, 3 - ジエン - 1 - イル) ピペラジン - 1 - イル] エチル} - 5 - (5 - フルオロ - 2 - メチルベンジル) - 6 - オキソ - 6, 11 - ジヒドロ - 5H - ジピリド [3, 2 - b : 2', 3' - e] [1, 4] ジアゼピン - 3 - カルボキサミド

1241 N - [2 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) エチル] - 6 - メチル - 5, 11 - ジオキソ - 6, 11 - ジヒドロ - 5H - ピリド [4, 3 - c] [1] ベンズアゼピン - 8 - カルボキサミド

1243 N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 10 - (2 - ク

1 2 4 5 1 0 - (3 - クロロベンジル) - 1 1 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピ
ペラジン - 1 - イル) プロピル] - 1 0 , 1 1 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4]
チアゼピン - 8 - カルボキサミド

【化 6 9】

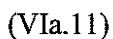


を有する、項目 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体

【化 7 0】



【化 7 1】



[式中、

n は、0 ~ 4 の整数であり；

A_{66} は、 NR^{73} または $CR^{73}R^{74}$ であり；

R^{72} 、 R^{73} 、および R^{74} は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、置換アミノ、スルホニル、置換スルホニル、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、 $-CONR^{75}R^{76}$ 、 $S(O)_2NR^{75}R^{76}$ 、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであり；

R^{75} および R^{76} は、独立に、水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであるか、または R^{75} および R^{76} は、それらが結合している窒素原子と共に、4 -、5 -、6 - または 7 - 員シクロヘテロアルキル環を形成する]

を有する、項目 19 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

(項目 21)

下記から成る群から選択される、項目 20 に記載の化合物：

ID IUPAC 名

11 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - フロ [4' , 3' , 2' : 5 , 10] アントラ [2 , 3 - d] [1 , 3] ジオキソル - 6 - オン

13 2 - [(4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) メチル] - 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 6 H - アントラ [9 , 1 - bc] フラン - 6 - オン

15 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 2 - メチル - 6 - オキソ - 6 H - フロ [4' , 3' , 2' : 5 , 10] アントラ [2 , 3 - d] [1 , 3] ジオキソル - 5 - イル] アミノ } 安息香酸

17 5 - [(3 - エトキシプロピル) アミノ] - 2 - { [4 - (フラン - 2 - イルカルボニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル } - 6 H - アントラ [9 , 1 - bc] フラン - 6 - オン

41 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - [1 , 3] ジオキソロ [6 , 7] アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

43 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - [1 , 3] ジオキソロ [6 , 7] アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 5 - イル] アミノ } 安息香酸

1001 5 - [(1 , 4 - ジオキサン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1003 5 - (ベンジルアミノ) - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1005 5 - [(シクロペンタ - 1 , 3 - ジエン - 1 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1007 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(1 H - ピロル - 2 - イルメチル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1009 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(ピラジン - 2 - イルメチル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1011 5 - [(ヒドロキシメチル) アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - cd] イソキサゾール - 6 - オン

1 0 1 3 N - [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - アント
 ラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] グリシン
 1 0 1 5 5 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1
 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 1 7 5 - [2 - (1 , 4 - ジオキサン - 2 - イル) エチル] - 3 - (4 - メチルピ
 ペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 1 9 5 - [2 - (1 , 4 - ジオキシン - 2 - イル) エチル] - 3 - (4 - メチルピ
 ペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 1 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H
 - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } 安息香酸
 7 0 3 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(フラン - 2 - イル
 メチル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 5 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン -
 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 7 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - [4 - (2 - ヒドロキシエチ
 ル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 0 9 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - [(3 - エトキシプロ
 ピル) アミノ] - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 1 5 - (ブチルアミノ) - 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 3 5 - [(フラン - 2 - イルメチル) アミノ] - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1
 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 5 5 - (シクロヘキシルアミノ) - 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イ
 ル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 7 1 7 3 - [4 - (1 , 3 - ベンゾジオキソル - 5 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イ
 ル] - 5 - [4 - (フラン - 2 - イルカルボニル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 H - アン
 トラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 2 1 メチル 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキ
 ソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 3 メチル 4 - { [3 - (モルホリン - 4 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - アントラ
 [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 5 メチル 4 - { [6 - オキソ - 3 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 7 エチル 4 - { [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H
 - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ベンゾエート
 1 0 2 9 5 - [(4 - エトキシフェニル) アミノ] - 3 - (4 - プロピルピペラジン -
 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
 1 0 3 1 5 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イルアミノ) - 3
 - (4 - プロピルピペラジン - 1 - イル) - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾ
 ル - 6 - オン
 1 0 3 3 4 - ({ 3 - [4 - (5 - クロロ - 2 - メトキシベンジル) ピペラジン - 1 -
 イル] - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル } アミノ
) 安息香酸
 1 0 3 5 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6
 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } ブタン酸
 1 0 3 7 N - (3 - { 4 - [3 - (4 - クロロフェニル) プロピル] ピペラジン - 1 -
 イル } - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル) グリシ
 ン
 1 0 3 9 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - { [4 - (1 H - テ
 トラゾル - 5 - イル) フェニル] アミノ } - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾ

ル - 6 - オン

1 0 4 1 N - [(4 - { [3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } フェニル) スルホニル] アセトアミド

1 0 4 3 3 - (4 - シクロヘキシルピペラジン - 1 - イル) - 5 - { [4 - (1 , 1 , 1 , 3 , 3 , 3 - ヘキサフルオロ - 2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) フェニル] アミノ } - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 6 - オン

1 0 4 5 4 - ({ 3 - [4 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) ピペラジン - 1 - イル] - 6 - オキソ - 6 H - アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル } アミノ)

安息香酸(項目 2 2)

治療有効量の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体；および、少なくとも 1 つの薬学的に許容されるビヒクルを含んで成る医薬組成物であって、前記化合物が項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載の化合物である医薬組成物。

(項目 2 3)

患者における不整 T r k A 活性に関連した疾患、障害、症候または状態を処置する方法であって、治療有効量の項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体を患者に投与することを含んで成る方法。

(項目 2 4)

経口用量、または注射、または経皮パッチ、またはデポー配合物の埋め込みに組み込まれる、項目 2 2 に記載の医薬組成物。

(項目 2 5)

下記を含んで成る医薬組成物：(a) 項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体、および (b) 下記から成る群から選択される少なくとも 1 つの付加的活性剤：タンパク質キナーゼ A (P K A) の阻害薬、c A M P シグナル伝達の阻害薬、非ステロイド性抗炎症薬、プロスタグランジン合成阻害薬、局所麻酔薬、抗痙攣薬、抗うつ薬、オピオイド受容体作動薬、神経弛緩薬、G A B A_A 受容体の作動薬、T r k A 拮抗薬と異なるメカニズムによって作用する鎮痛剤または抗癌剤、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、神経ステロイド、および吸入麻酔薬、麻酔薬、抗癌薬、m G l u R 5 受容体の調節因子、およびそれらの組合せ。

(項目 2 6)

患者における不整 T r k A 活性に関連した疾患、障害、症候または状態を処置する方法であって、治療有効量の下記物質を患者に共投与することを含んで成る方法：

(a) 項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体；それと組み合わせた

(b) 下記から成る群から選択される少なくとも 1 つの付加的活性剤：タンパク質キナーゼ A (P K A) の阻害薬、c A M P シグナル伝達の阻害薬、非ステロイド性抗炎症薬、プロスタグランジン合成阻害薬、局所麻酔薬、抗痙攣薬、抗うつ薬、オピオイド受容体作動薬、神経弛緩薬、G A B A_A 受容体の作動薬、T r k A 拮抗薬と異なるメカニズムによって作用する鎮痛剤または抗癌剤、ベンゾジアゼピン、バルビツレート、神経ステロイド、および吸入麻酔薬、麻酔薬、抗癌薬、m G l u R 5 受容体の調節因子、およびそれらの組合せ。

(項目 2 7)

疾患、障害、症候または状態が、下記から成る群から選択される、項目 2 3 または 2 6 に記載の方法：

急性疼痛、慢性疼痛、炎症性疼痛、神経障害性疼痛、緊張性疼痛、持続性疼痛、術後疼痛、化学誘発疼痛、化学療法誘発疼痛、癌疼痛、薬剤誘発疼痛、骨疼痛、アルコール誘発通覚過敏に関連した疼痛、全身性疼痛障害、不安、骨格筋痙攣、痙攣発作、癲癇、再狭窄、アテローム性動脈硬化症、乾癬、血栓症、熱傷、心的外傷後ストレス障害、心臓障害、喫煙、炎症および免疫媒介障害（微生物感染および器官移植を包含する）、癌（乳癌、頭頸

部癌、前立腺癌および肺癌を包含する)、髄鞘発育不全または髄鞘脱落に関連した疾患、障害または損傷、およびそれらの組合せ。

(項目28)

疾患、障害または症候または状態が、下記によるかまたは関連している、項目23または26に記載の方法：

カウザルギー、糖尿病、膠原血管病、三叉神経痛、脊髄損傷、脳幹損傷、視床痛症候群、複合性局所疼痛症候群Ⅰ型／反射性交感神経性ジストロフィー、ファブリー症候群、小径線維ニューロパシー、癌、癌化学療法、慢性アルコール中毒、脳卒中、膿瘍、脱髄疾患、ウイルス感染、抗ウイルス療法、AIDS、AIDS療法、熱傷、日焼け、関節炎、大腸炎、心臓炎、皮膚炎、筋炎、神経炎、粘膜炎、尿道炎、膀胱炎、胃炎、肺炎、膠原血管病、外傷、手術、切断術、毒素、不適応物質使用、物質依存、アルコール使用または乱用、物質使用または乱用、薬物使用または乱用、薬剤関連作用、転移、線維筋痛症、過敏性腸症候群、側頭下顎障害、炎症、免疫異常、およびそれらの組合せ。

(項目29)

項目1～21のいずれか1つに記載の化合物、または項目22、24または25のいずれか1つに記載の医薬組成物を含んで成るキット。