

【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 07 D 261/20 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 25/22 (2006.01)
A 61 P 21/02 (2006.01)
A 61 P 25/08 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 7/02 (2006.01)
A 61 P 17/02 (2006.01)
A 61 P 25/34 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 31/00 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 25/02 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/32 (2006.01)
A 61 P 31/12 (2006.01)
A 61 P 31/18 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 17/00 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 13/02 (2006.01)
A 61 P 13/10 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 39/02 (2006.01)
A 61 P 25/30 (2006.01)
A 61 P 35/04 (2006.01)
C 07 D 279/16 (2006.01)
A 61 K 31/5415 (2006.01)
A 61 K 31/4985 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
A 61 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

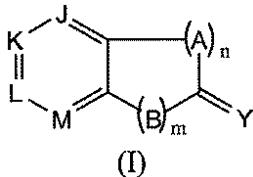
【補正の内容】

【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、NR¹、C=CR¹（EおよびZ異性体）、C=N R¹（EおよびZ異性体）、またはC(R¹R²)、CR¹=CR²-CR¹'R²'（EおよびZ異性体）、またはCR¹=CR²-NR¹'（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；

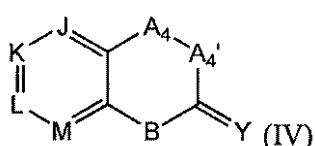
Bは、C、N、O、S、NR³またはC(R³R⁴)であり；J、K、LおよびMは、独立に、NまたはCR⁵であり；Yは、O、S、NR⁶またはC(R⁶R⁷)であり；R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶およびR⁷は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、-CONR⁸R⁹、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキル、ヘテロアルキル、または置換ヘテロアルキルであり；R⁸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60】



[式中、

A₄およびA_{4'}は、独立に、NR¹、C=CR¹（EおよびZ異性体）、C=N R¹（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A_{4'}は、他の原子と共に、任意に置換されていてよい環を形成し；A₄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]

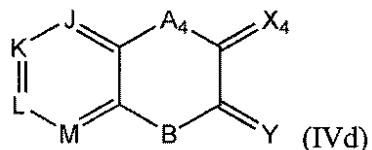
を有する、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導

体。

【請求項3】

構造式(IVd)：

【化61】



[式中、

A₄およびX₄は、独立に、CR¹¹R¹²またはNR¹¹であり；

C=X₄は、EおよびZ異性体であることができ；

R¹¹およびR¹²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-2H-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-4H-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-2H-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-4H-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-[シクロヘキシリル(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-2H-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-2H-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-[シクロヘキシリル(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-2H-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-4H-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-2H-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 - ジメチルピベリジン - 1 - イル) プロピル] アセトアミド
2 6 7 N - { 3 - [ベンジル (プチル) 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
 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 - 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 -
 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 - 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 - { 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
 311 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
 313 (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
 315 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
 317 (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
 319 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
 321 (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
 323 (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

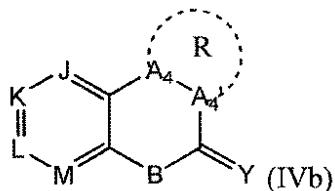
- イミノ - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カルボキサミド
457 (2Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)プロピル] - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 6 - カルボキサミド
459 (3Z) - 3 - ベンジリデン - N - [3 - (2 - エチルピペリジン - 1 - イル)プロピル] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド
461 (3Z) - 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 - 1H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド
463 (3Z) - 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 - 1H - ピリド [3 , 4 - b] [1 , 4] チアジン - 7 - カルボキサミド
465 (2Z) - 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 - 2H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
467 (3Z) - 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 - 1H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド
469 (3Z) - 1 - (シクロヘキシリメチル) - 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 - 1H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド
471 (3Z) - 1 - (シクロヘキシリメチル) - 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 - 1H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - カルボキサミド
473 (2Z) - 4 - (シクロヘキシリメチル) - 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 - 2H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
475 (2Z) - 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 - 2H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 6 - カルボキサミド
477 (3Z) - 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 - 2H - 1 , 4 - ベンゾチアジン - 7 - カルボキサミド
479 (3Z) - 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 - 2H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン 7 - カルボキサミド
481 4 - { [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 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
483 4 - { (Z) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 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
485 4 - { (E) - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 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
487 4 - { [(2Z) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2H - 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。

【請求項 5】

構造式 (IVb) :

【化 6 2】



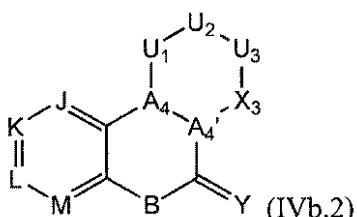
[式中、R環は、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリール環である]

を有する、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 (IVb . 2) :

【化 6 3】



[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($R^{2\ 0}$)、C($R^{2\ 0}$)、またはC($R^{2\ 0} R^{2\ 1}$)であり；

A_4 および A_4' は、独立に、N、C、またはCR^{2 2}であり；

$R^{2\ 0}$ 、 $R^{2\ 1}$ 、および $R^{2\ 2}$ は、独立に、水素、ハロゲン、アシリル、置換アシリル、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：

I D I U P A C 名

5 1 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 - 4 b , 5 , 6 , 7 , 8 , 8 a , 9 , 1 0 - オクタヒドロフェナントレン - 2 - カルボキサミド

5 1 7 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 , 1 0 - ヘキサヒドロ -

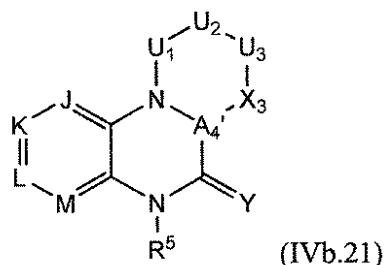
5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド
 5 1 9 5 - ベンジル - 6 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル)
 プロピル] - 5 , 6 , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキ
 サミド

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 (IV 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 , 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

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 , 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 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 , 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

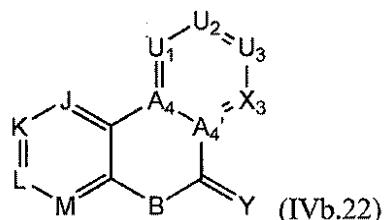
5 5 5 N - ({ 2 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] シクロプロピル } メチル) - 6 - オキソ - 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

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。

【請求項 10】

構造式 (IV b . 2 2) :

【化65】



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11】

下記から成る群から選択される、請求項10に記載の化合物：

ID IUPAC名

525 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

527 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

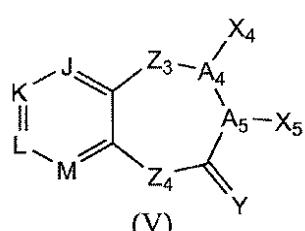
529 6 - ベンジル - 5 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 - ジヒドロベンゾ [c] [2 , 6] ナフチリジン - 8 - カルボキサミド

531 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12】

構造式(V)：

【化66】



[式中、

A₄ - X₄、A₅ - X₅は、独立に、N R¹、C = C R¹ (EおよびZ異性体)、C = N R¹、またはC (R¹R²)であり；

Z₃およびZ₄は、独立に、O、S、N R³、またはC (R³R⁴)であるか；または、Z₃ - A₄ - X₄、またはX₄ - A₄ - A₅ - X₅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13】

下記から成る群から選択される、請求項12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

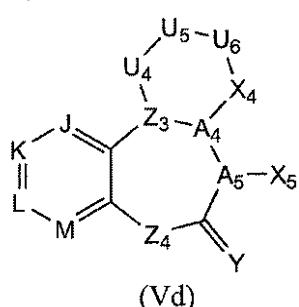
807 4 - { [(2E) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] アミノ } - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

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。

【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($R^{1,9}$)、C($R^{1,9}$)、C($R^{1,9}R^{2,0}$) であり；

Z_3 および A_4 は、独立に、N、C、または $CR^{2,1}$ であり；

$R^{1,9}$ 、 $R^{2,0}$ 、および $R^{2,1}$ は、独立に、水素、ハロゲン、アシリル、置換アシリル、アルコキカルボニル、置換アルコキカルボニル、アリールオキカルボニル、置換アリールオキカルボニル、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：

I D I U P A C 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

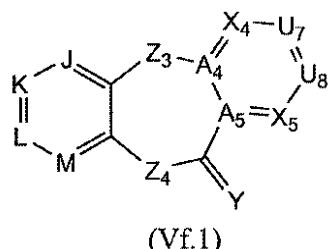
1135 (4aR) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 7

- (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。

【請求項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CR²⁻⁵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17】

下記から成る群から択される、請求項16に記載の化合物：

I D 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-6,1,1-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-シクロヘキシリピペラジン-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

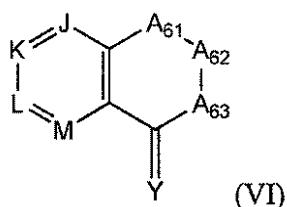
1243 N-[2-(4-ベンジルピペリジン-1-イル)エチル]-10-(2-クロロ-5-フルオロベンジル)-11-オキソ-10,11-ジヒドロジベンゾ[b,f][1,4]チアゼピン-8-カルボキサミド

1245 10-(3-クロロベンジル)-11-オキソ-N-[3-(4-フェニルピペラジン-1-イル)プロピル]-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。

【請求項18】

構造式(VI)：

【化69】



[式中、

A_{61} 、 A_{62} および A_{63} は、独立に、C、N、O、S、NR¹、C=CR¹（E および Z 異性体）、C=N R¹（E および Z 異性体）、またはC(R¹R²)であり；

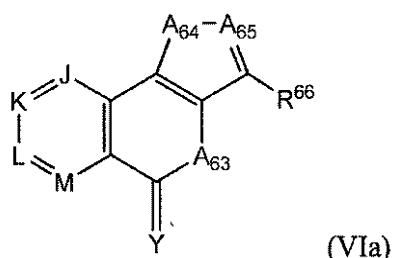
A_{61} - A_{62} および A_{62} - A_{63} は、独立に、一重または二重結合である]

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70】



[式中、

A_{64} は、O または S であり；

A_{65} は、N または CR¹ であり；

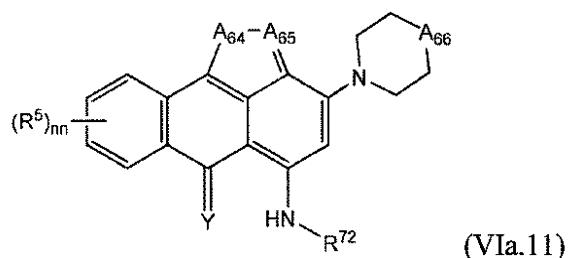
R^{66} は、水素、アルキル、または置換アルキルである]

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71】



[式中、

n は、0 ~ 4 の整数であり；

A_{66} は、NR⁷³ または CR⁷³R⁷⁴ 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、アルコキカルボニル、置換アルコキカルボニル、アリールオキカルボニル、置換アリールオキカルボニル、-CONR⁷⁵R⁷⁶、S(O)₂NR⁷⁵R⁷⁶、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；

R⁷⁻⁵ および R⁷⁻⁶ 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 R⁷⁻⁵ および R⁷⁻⁶ 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

- 1 1 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
- 1 3 2 - [(4 - シクロヘキシリルピペラジン - 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 - b c] フラン - 6 - オン
- 1 5 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシリルピペラジン - 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
- 1 7 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 - b c] フラン - 6 - オン
- 4 1 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 4 3 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシリルピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - [1 , 3] ジオキソロ [6 , 7] アントラ [1 , 9 - c d] イソキサゾル - 5 - イル] アミノ } 安息香酸
- 1 0 0 1 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 1 0 0 3 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 1 0 0 5 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 1 0 0 7 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 1 0 0 9 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン
- 1 0 1 1 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 - c d] イソキサゾル - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - (シクロヘキシリアミノ) - 3 - (4 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 1 - イル) - 5 - { [4 - (1 H - テ
 トライル - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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。

【請求項 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、前記化合物が請求項 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。

【請求項 2 3】

患者における不整 TrkA 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 ~ 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含んで成る組成物。

【請求項 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、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

下記を含んで成る医薬組成物：(a) 請求項 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、cAMP 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、GABA_A 受容体の作動薬、TrkA 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、mGluR5 受容体の調節因子、およびそれらの組合せ。

【請求項 2 6】

患者における不整 TrkA 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 ~ 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、cAMP 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、GABA_A 受容体の作動薬、TrkA 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、mGluR5 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 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、請求項 2 3 または 2 6 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）、髓鞘発育不全または髓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 2 8】

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 2 3 または 2 6 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、脱髓疾患、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、側頭下頸障害、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

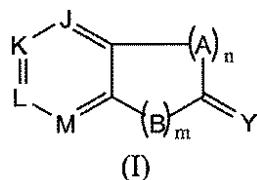
本発明の目的は、TrkA の阻害に関連した疾患（疼痛、癌、再狭窄、アテローム性動脈硬化症、乾癬、血栓症、または髄鞘発育不全もしくは髄鞘脱落に関連した疾患、障害もしくは損傷を包含する）の処置および／または予防用薬剤の製造のための、NGF 受容体 TrkA 阻害薬および／拮抗薬としての合成小分子の使用である。

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、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-CR¹、R² (E および Z 異性体)、または CR¹=CR²-NR¹ (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、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、-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

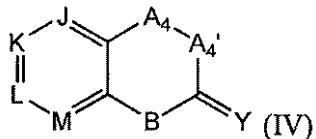
ルキルであるか、またはR⁸およびR⁹は、それらが結合している窒素原子と共に、4-、5-、6-または7-員シクロヘテロアルキル環を形成し、但し、R⁸およびR⁹の両方ともが水素でないものとする】

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。

(項目2)

構造式(IV) :

【化60】



[式中、

A₄およびA_{4'}は、独立に、N R¹、C = C R¹ (EおよびZ異性体)、C = N R¹ (EおよびZ異性体)またはC (R¹ R²)から選択されるか、またはA₄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；

A₄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】

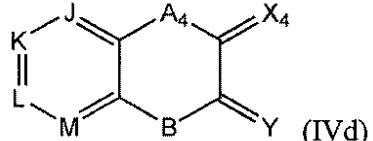
を有する、項目1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物または生理学的機能性誘導体。

。

(項目3)

構造式(IVd) :

【化61】



[式中、

A₄およびX₄は、独立に、C R¹ R²またはN R¹であり；

C = X₄は、EおよびZ異性体であることができ；

R¹ R²およびR¹ R²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：

I D I U P A C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-2H-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-4H-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-2H-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

2 0 9 N - [3 - (4 - ベンジルペリジン - 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

2 1 1 (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

2 1 3 (2 Z) - 2 - ベンジリデン - N - [3 - (4 - ベンジルペリジン - 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 1 5 (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

2 1 7 N - [3 - (4 - ベンジルペリジン - 1 - イル) プロピル] - 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] アセトアミド

2 1 9 (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

2 2 1 N - [2 - (4 - ベンジルペリジン - 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 - [シクロヘキシリ (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 (シクロヘキシリ) 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 - [シクロヘキシリ (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 - 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
 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 - 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 -
 (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 - 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 - { 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
 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

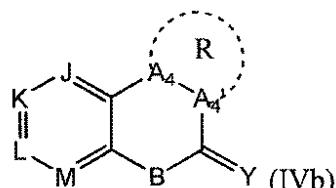
4 8 7 4 - { [(2 Z) - 4 - (2 - フルオロベンジル) - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジン - 2 - イリデン] アミノ } - N - メチルベンズアミド

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 (IVb) :

【化 6 2】



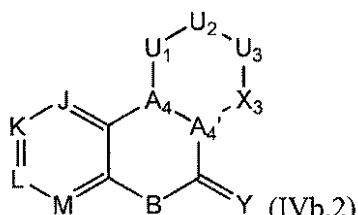
[式中、R 環は、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリール環である]

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 (IVb . 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；

U₁、U₂、U₃、およびX₃は、独立に、S、O、N、N(R²⁰)、C(R²⁰)、またはC(R²⁰R²¹)であり；

A₄およびA₄'は、独立に、N、C、またはCR²²であり；

R²⁰、R²¹、およびR²²は、独立に、水素、ハロゲン、アシル、置換アシル、アルコキカルボニル、置換アルコキカルボニル、アリールオキカルボニル、置換アリールオキカルボニル、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、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 - 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

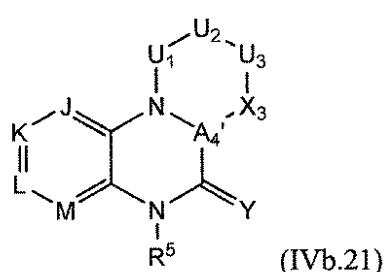
519 5 - ベンジル - 6 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロフェナントリジン - 3 - カルボキサミド

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 - 5 H - 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 , 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

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 , 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

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

553 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 , 6a , 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

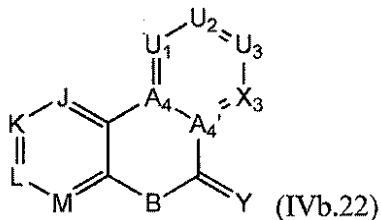
555 N - ({ 2 - [4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] シクロプロピル } メチル) - 6 - オキソ - 6 , 6a , 7 , 8 , 9 , 10 - ヘキサヒドロ - 5 H - ピリド [1 , 2 - a] キノキサリン - 3 - カルボキサミド

557 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 , 6a , 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 10)

構造式 (IVb . 22) :

【 化 65 】



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 11)

下記から成る群から選択される、項目 10 に記載の化合物：

I D I U P A C 名

525 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

527 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

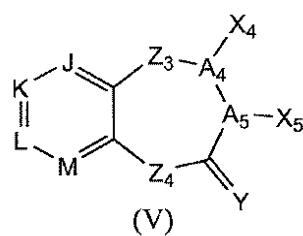
529 6 - ベンジル - 5 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルピペラジン - 1 - イル) プロピル] - 5 , 6 - ジヒドロベンゾ [c] [2 , 6] ナフチリジン - 8 - カルボキサミド

531 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 12)

構造式 (V) :

【 化 66 】



[式中、

A₄-X₄、A₅-X₅は、独立に、N R¹、C=C R¹ (EおよびZ異性体)、C=N R¹、またはC(R¹R²)であり；

Z₃およびZ₄は、独立に、O、S、N R³、またはC(R³R⁴)であるか；または、Z₃-A₄-X₄、またはX₄-A₄-A₅-X₅は、他の原子と共に、任意に置換されてもよい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13)

下記から成る群から選択される、項目12に記載の化合物：

I D I U P A C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

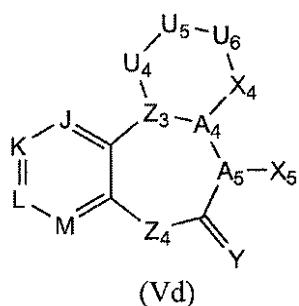
807 4 - { [(2E) - 5 - (2 - フルオロベンジル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 5 - ベンゾチアゼピン - 2 (3H) - イリデン] アミノ} - N - [3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド

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14)

構造式(Vd)：

【化67】



[式中、

Z₃-U₄ U₄-U₅、U₅-U₆、U₆-X₄、A₄-X₄、Z₃-A₄は、独立に、一重または二重結合であり；

U₄、U₅、U₆、およびX₄は、独立に、S、O、N、N(R¹⁹)、C(R¹⁹)、C(R¹⁹R²⁰)であり；

Z₃およびA₄は、独立に、N、C、またはCR²¹であり；

R¹⁹、R²⁰、およびR²¹は、独立に、水素、ハロゲン、アシリル、置換アシリル、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、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。

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：

I D I U P A C 名

1 1 3 1 (7 a S , 1 1 a S) - 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 , 7 a , 8 , 9 , 1 0 , 1 1 , 1 1 a - オクタヒドロ - 5 H - ジベンゾ [b , d] アゼピン - 3 - カルボキサミド

1 1 3 3 (1 2 a R) - 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 , 1 0 , 1 1 , 1 2 , 1 2 a - 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

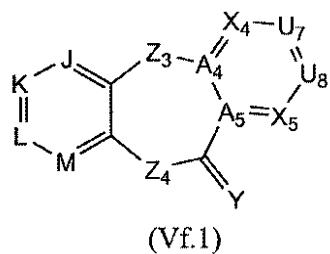
1 1 3 5 (4 a R) - N - [2 - (4 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) エチル] - 7 - (2 - クロロベンジル) - 6 - オキソ - 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 7 - ヘキサヒドロチオピラノ [4 , 3 - d] [1] ベンズアゼピン - 9 - カルボキサミド

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

(項目16)

構造式 (Vf.1) :

【化68】



[式中、

X₄、U₇、U₈、およびX₅は、独立に、NまたはCR²⁻⁵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選択される、項目16に記載の化合物：

I D I U P A C 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 - (シクロヘキシルピペラジン - 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

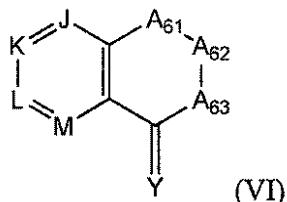
□□ - 5 - フルオロベンジル) - 11 - オキソ - 10 , 11 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4] チアゼピン - 8 - カルボキサミド

1 2 4 5 1 0 - (3 - クロロベンジル) - 11 - オキソ - N - [3 - (4 - フェニルビペラジン - 1 - イル) プロピル] - 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

(項目 18)

構造式 (VI) :

【 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；

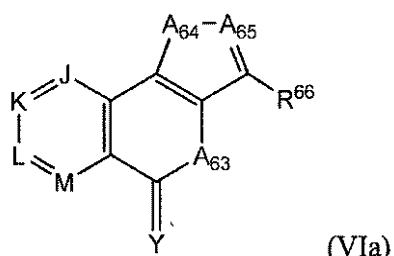
$A_{61} - A_{62}$ および $A_{62} - A_{63}$ は、独立に、一重または二重結合である]

を有する、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 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；

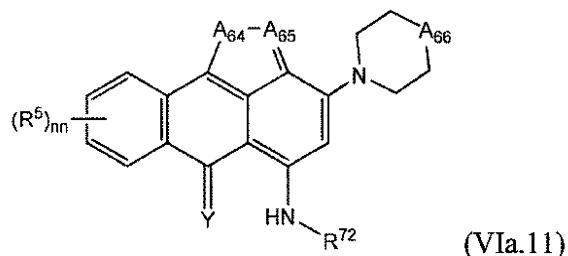
R^{66} は、水素、アルキル、または置換アルキルである]

を有する、項目 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。

(項目 20)

構造式 (VIa . 11) :

【 化 7 1 】



[式中、

n_1 は、0 ~ 4 の整数であり；

$A_{6,6}$ は、 $NR^{7,3}$ または $CR^{7,3}R^{7,4}$ であり；

$R^{7,2}$ 、 $R^{7,3}$ 、および $R^{7,4}$ 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、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、 $-CONR^{7,5}R^{7,6}$ 、 $S(O)_2NR^{7,5}R^{7,6}$ 、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；

$R^{7,5}$ および $R^{7,6}$ 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 $R^{7,5}$ および $R^{7,6}$ 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：

I D I U P A C 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - b c] フラン - 6 - オン

15 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - b c] 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 - c d] イソキサゾル - 6 - オン

43 4 - { [3 - (4 - シクロヘキシリピペラジン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 6 H - [1 , 3] ジオキソロ [6 , 7] アントラ [1 , 9 - c d] 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 - c d] 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 - c d] 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 - c d] 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 - c d] 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 - c d] 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 - c d] イソキサゾル - 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 - ベンゾジオキソール - 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

ル - 6 - オン

1 0 4 1 N - [(4 - { [3 - (4 - シクロヘキシリピペラジン - 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 - シクロヘキシリピペラジン - 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 TrkA 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、TrkA 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 TrkA 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、TrkA 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、側頭下頸障害、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。