

【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21年3月5日(2009.3.5)

【公表番号】特表2008-526818(P2008-526818A)

【公表日】平成20年7月24日(2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-029

【出願番号】特願2007-549915(P2007-549915)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/4745	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/22	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/30	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04	1 0 2
C 0 7 D 471/04	C S P
A 6 1 K 31/4745	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/30	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年1月13日(2009.1.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

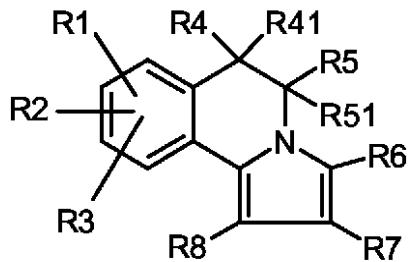
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】



(I)

[式中、

R1は、ハロゲン、ニトロ、アミノ、モノ-もしくはジ- $C_1\sim C_4$ -アルキルアミノ、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルコキシ、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルコキシ、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、

R2は、水素、ハロゲン又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、かつ

R3は、水素又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシであるか、又は

R2及びR3は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、 $C_1\sim C_2$ -アルキレンジオキシ架橋を形成するか、又は

R2及びR3は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1\sim C_2$ -アルキレンジオキシ架橋を形成するか、又はR1及びR2は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、 $C_1\sim C_2$ -アルキレンジオキシ架橋を形成し、かつR3は、水素であるか、又は

R1及びR2は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1\sim C_2$ -アルキレンジオキシ架橋を形成し、かつR3は、水素であり、

R4は、水素、フッ素、塩素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノ、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシカルボニル又は- $CH_2-O-R411$ であり、その際、

R411は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル又は $C_1\sim C_4$ -アルキルカルボニルであり、

R41は、水素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、

R5は、水素、フッ素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、かつ

R51は、水素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R4は、水素、フッ素、塩素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、

R41は、水素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、

R5は、水素、フッ素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、シアノ、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシカルボニル又は- $CH_2-O-R511$ であり、その際、

R511は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル又は $C_1\sim C_4$ -アルキルカルボニルであり、かつ

R51は、水素又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R4及びR5は、一緒になって、 $C_1\sim C_4$ -アルキレン架橋を形成し、かつR41及びR51は、両者とも水素であり、

R6は、 $C_1\sim C_6$ -アルキル、アミノ、ホルミル又はR61によって置換された $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、その際、

R61は、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシカルボニル、カルボキシル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン又は- $N(R611)R612$ であり、その際、

R611は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル又は $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル- $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、かつ

R 6 1 2 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 6 1 1 及び R 6 1 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、基 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、R 6 1 1 及び R 6 1 2 が結合される 1 個の窒素原子と、場合により窒素、酸素及び硫黄からなる群から選択される更なる 1 個のヘテロ原子とを有し、R 6 1 3 によって環窒素原子上で置換されていてよい、5 員ないし 7 員の飽和の複素環式の環基であり、その際、

R 6 1 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、ヒドロキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルキル、アミノ - $C_2 \sim C_4$ - アルキル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ - $C_2 \sim C_4$ - アルキル、ホルミル、ピリジル又はピリミジニルであり、

R 7 は、フェニル、H e t 2 、R 7 1 及び / 又は R 7 2 及び / 又は R 7 3 で置換されたフェニル、R 7 4 及び / 又は R 7 5 で置換されたH e t 2 、ナフチル又は R 7 6 及び / 又は R 7 7 で置換されたナフチルであり、その際、

H e t 2 は、ピロロイソキノリン骨格に環炭素原子を介して結合されており、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、単環式もしくは縮合二環式の 5 員ないし 10 員の部分的にもしくは完全に芳香族の複素環式の環基であり、

R 7 1 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキルメトキシ、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルホニルアミノ、アリールスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルチオ、アリールオキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、アリールオキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、アリールオキシ、アリール - $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、アリール、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、ヒドロキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、アミノ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノカルボニル、カルバモイル、テトラゾリル又は - N (H) S (O) ₂ - N (R 7 1 2) R 7 1 3 であり、その際、

アリールは、フェニル又は R 7 1 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 7 1 1 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、ニトロ又はシアノであり、

R 7 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 7 1 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 7 1 2 及び R 7 1 3 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、基 H e t 3 を形成し、その際、

H e t 3 は、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル又はモルホリン - 4 - イルであり、

R 7 2 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニルであり、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 4 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、シアノ、アミノ、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニル、モルホリノ、カルボキシル、ニトロ、フェニル、フェニルオキシ、フェニル - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、アリールスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルスルホニル又は - S (O) ₂ - N (R 7 1 2) R 7 1 3 であり、

R 7 5 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又はハロゲンであり、

R 7 6 は、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、カルボキシル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニルであり、

R 7 7 は、 C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、
 R 8 は、 R 8 1 によって置換されていてよく、かつ H e t 4 であり、その際、
 H e t 4 は、ピロロイソキノリン骨格に環炭素原子を介して結合されており、かつオキサジアゾリル基又はオキサゾリル基であり、
 R 8 1 は、 C₁ ~ C₄ - アルキル、 C₃ ~ C₇ - シクロアルキル、 C₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチル、フェニル又は R 8 1 1 及び / 又は R 8 1 2 で置換されたフェニルであり、その際
 、
 R 8 1 1 は、 C₁ ~ C₄ - アルキル、 C₁ ~ C₄ - アルコキシ又はハロゲンであり、
 R 8 1 2 は、 C₁ ~ C₄ - アルキル、 C₁ ~ C₄ - アルコキシ又はハロゲンである] で示される化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項 2】

式 I で示され、その式中、
 R 1 は、 C₁ ~ C₄ - アルコキシ、 C₃ ~ C₇ - シクロアルコキシ、 C₃ ~ C₇ - シクロアルキルメトキシ又は、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、
 R 2 は、水素、ハロゲン又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、かつ
 R 3 は、 C₁ ~ C₄ - アルコキシであるか、又は
 R 2 及び R 3 は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、 C₁ ~ C₂ - アルキレンジオキシ架橋を形成するか、又は
 R 2 及び R 3 は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された C₁ ~ C₂ - アルキレンジオキシ架橋を形成するか、又は
 R 1 及び R 2 は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、 C₁ ~ C₂ - アルキレンジオキシ架橋を形成し、かつ R 3 は、水素であるか、又は
 R 1 及び R 2 は、ベンゾ環部に互いにオルト位で結合されて、一緒になって、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された C₁ ~ C₂ - アルキレンジオキシ架橋を形成し、かつ R 3 は、水素であり、かつ
 R 1 、 R 2 及び R 3 のいずれも、ピロロ [2 , 1 - a] イソキノリン環の 10 位に結合されておらず、
 R 4 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、
 R 4 1 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、
 R 5 は、水素、 C₁ ~ C₄ - アルキル、シアノ又は C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニルであり、
 R 5 1 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであるか、又は
 R 4 及び R 5 は、一緒になって、 C₃ ~ C₄ - アルキレン架橋を形成し、かつ R 4 1 及び R 5 1 は、両者とも水素であり、
 R 6 は、 C₁ ~ C₆ - アルキル又は R 6 1 によって置換された C₁ ~ C₄ - アルキルであり、その際、
 R 6 1 は、 C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル又はカルボキシルであり、
 R 7 は、 H e t 2 、 R 7 1 及び / 又は R 7 2 及び / 又は R 7 3 で置換されたフェニル、 R 7 4 で置換された H e t 2 又はナフチルであり、その際、
 H e t 2 は、
 窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する単環式の 5 員のヘテロアリール基か、又は
 1 又は 2 個の窒素原子を有する単環式の 6 員のヘテロアリール基か、又は
 窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する縮合二環式の 9 員もしくは 10 員のヘテロアリールか、又は
 N - オキシ - ピリジルか
 のいずれかであり、
 R 7 1 は、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、 C₁ ~ C₄ - アルキル、 C₁ ~ C₄ - アルコキシ、アミノ、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、 C₁ ~ C₄ - アルキルスルホ

ニルアミノ、カルボキシル、アリールオキシ、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、カルバモイル、テトラゾリル又は - N (H) S (O)₂ - N (R 712) R 713 であり、その際、

アリールは、フェニル又は R 711 で置換されたフェニルであり、その際、

R 711 は、ハロゲン又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 712 は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、かつ

R 713 は、C₁ ~ C₄ - アルキルであるか、又は

R 712 及び R 713 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、基 H e t 3 を形成し、その際、

H e t 3 は、モルホリン - 4 - イルであり、

R 72 は、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 73 は、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 74 は、C₁ ~ C₄ - アルキル、フェニル - C₁ ~ C₄ - アルキル、アリールスルホニル、C₁ ~ C₄ - アルキルスルホニル又は - S (O)₂ - N (R 712) R 713 であり、

R 8 は、R 81 によって環炭素原子上で置換されていてよく、かつ H e t 4 であり、その際、

H e t 4 は、ピロロイソキノリン骨格に環炭素原子を介して結合されており、かつ [1, 2, 4] オキサジアゾリル基又はオキサゾリル基であり、

R 81 は、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキルメチル、フェニル又は R 811 及び / 又は R 812 で置換されたフェニルであり、その際、

R 811 は、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ又はハロゲンであり、

R 812 は、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ又はハロゲンである、請求項 1 記載の化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項 3】

式 I で示され、その式中、

R 1 は、ピロロ [2, 1 - a] イソキノリン環の 8 位に結合されており、かつ C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 2 は、ピロロ [2, 1 - a] イソキノリン環の 7 位に結合されており、かつ水素、ハロゲン又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 3 は、ピロロ [2, 1 - a] イソキノリン環の 9 位に結合されており、かつ C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 4 は、水素であり、

R 41 は、水素であり、

R 5 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 51 は、水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであるか、又は

R 4 及び R 5 は、一緒になって、テトラメチレン架橋を形成し、かつ R 41 及び R 51 は、両者とも水素であり、

R 6 は、C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 7 は、H e t 2、R 71 及び / 又は R 72 及び / 又は R 73 で置換されたフェニル、R 74 で置換された H e t 2 又はナフチルであり、その際、

H e t 2 は、

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する単環式の 5 員のヘテロアリール基か、又は

1 又は 2 個の窒素原子を有する単環式の 6 員のヘテロアリール基か、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する縮合二環式の 9 員もしくは 10 員のヘテロアリールか、又は

N - オキシ - ピリジルか

のいずれかであり、

R 71 は、ヒドロキシル、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ又はア

リールオキシであり、その際、

アリールは、フェニル又はR₇11で置換されたフェニルであり、その際、

R₇11は、ハロゲン又はC₁～C₄-アルキルであり、

R₇2は、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル又はC₁～C₄-アルコキシであり、

R₇3は、C₁～C₄-アルキル又はC₁～C₄-アルコキシであり、

R₇4は、C₁～C₄-アルキル又はフェニル-C₁～C₄-アルキルであり、

R₈は、R₈1によって環炭素原子上で置換されており、かつH_{et}4であり、その際、

H_{et}4は、ピロロイソキノリン骨格に環炭素原子を介して結合されており、かつ[1,

2,4]オキサジアゾリル基又はオキサゾリル基であり、

R₈1は、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₅-シクロアルキル、C₃～C₅-シクロアルキルメチル、フェニル又はR₈11及び/又はR₈12で置換されたフェニルであり、その際、

R₈11は、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ又はハロゲンであり、

R₈12は、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ又はハロゲンである、請求項1記載の化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項4】

式Iで示され、その式中、

R₁は、ピロロ[2,1-a]イソキノリン環の8位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシであり、

R₂は、ピロロ[2,1-a]イソキノリン環の7位に結合されており、かつ水素、塩素又はフッ素であり、

R₃は、ピロロ[2,1-a]イソキノリン環の9位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシであり、

R₄は、水素であり、

R₄1は、水素であり、

R₅は、水素又はC₁～C₂-アルキルであり、

R₅1は、水素であり、

R₆は、C₁～C₂-アルキル又はR₆1によって置換されたC₁～C₂-アルキルであり、その際、

R₆1は、C₁～C₂-アルコキシカルボニル又はカルボキシルであり、

R₇は、H_{et}2、R₇1及び/又はR₇2及び/又はR₇3で置換されたフェニル、R₇4で置換されたH_{et}2又はナフチルであり、その際、

H_{et}2は、

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1～4個のヘテロ原子を有する単環式の5員のヘテロアリール基か、又は

1又は2個の窒素原子を有する単環式の6員のヘテロアリール基か、又は

窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1～3個のヘテロ原子を有する縮合二環式の9員もしくは10員のヘテロアリールか、又は

N-オキシ-ピリジルか

のいずれかであり、

R₇1は、ヒドロキシル、塩素、フッ素、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-アルコキシ、カルボキシル又はアリールオキシであり、その際、

アリールは、フェニル又はR₇11で置換されたフェニルであり、その際、

R₇11は、塩素、フッ素又はC₁～C₂-アルキルであり、

R₇2は、塩素、フッ素、C₁～C₂-アルキル又はC₁～C₂-アルコキシであり、

R₇3は、C₁～C₂-アルキル又はC₁～C₂-アルコキシであり、

R₇4は、C₁～C₂-アルキル又はフェニル-C₁～C₂-アルキルであり、

R₈は、H_{et}4であり、その際、

H_{et}4は、3-(R₈1)-[1,2,4]オキサジアゾール-5-イル又は5-(R₈1)-オキサゾール-2-イルであり、

R 8 1 は、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₅-シクロアルキル、C₃～C₅-シクロアルキルメチル、フェニル又はR 8 1 1で置換されたフェニルであり、その際、

R 8 1 1 は、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-アルコキシ、塩素又はフッ素である、請求項1記載の化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項5】

式Iで示され、その式中、

R 1 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の8位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシであり、

R 2 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の7位に結合されており、かつ水素、塩素又はフッ素であり、

R 3 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の9位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシであり、

R 4 は、水素であり、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、水素又はC₁～C₂-アルキルであり、

R 5 1 は、水素であり、

R 6 は、C₁～C₄-アルキルであり、

R 7 は、ナフチル又は、4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチルフェニル、4-メトキシ-3, 5-ジメチルフェニル、2-メチル-4-ヒドロキシ-フェニル又は2-フルオロ-3, 4-ジメトキシ-フェニル、ピリジル又はキノリニル、又は2-メチル-ピリジン-4-イル又は3-メチル-ピリジン-4-イルであり、

R 8 は、H e t 4 であり、その際、

H e t 4 は、3-(R 8 1)-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル又は5-(R 8 1)-オキサゾール-2-イルであり、

R 8 1 は、C₁～C₄-アルキル、C₃～C₅-シクロアルキル、C₃～C₅-シクロアルキルメチル、フェニル又はR 8 1 1で置換されたフェニルであり、その際、

R 8 1 1 は、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ又はハロゲンである、請求項1記載の化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項6】

請求項1から5までのいずれか1項記載の式Iの化合物であって、以下の

R 1 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の8位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシ、例えばメトキシであり、

R 2 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の7位に結合されており、かつ塩素又はフッ素であり、

R 3 は、ピロ口[2, 1-a]イソキノリン環の9位に結合されており、かつC₁～C₂-アルコキシ、例えばメトキシであり、

R 4 は、水素であり、

R 4 1 は、水素であり、

R 5 は、メチルであり、かつ

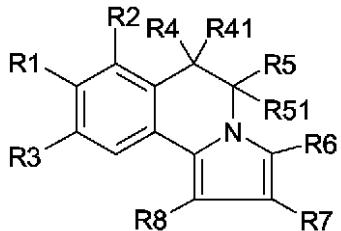
R 5 1 は、水素である

の1つ以上を含む化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項7】

請求項1から5までのいずれか1項記載の化合物であって、式I a

【化2】



(Ia)

[式中、

R1は、メトキシであり、

R3は、メトキシであり、

R4は、水素であり、

R41は、水素であり、

R51は、水素であり、かつ

以下のR2、R5、R6及びR8についての置換基の意味：

【表1】

	R2	R5	R6	R8
1.)	水素	メチル	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
2.)	水素	メチル	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
3.)	水素	メチル	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
4.)	水素	水素	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
5.)	水素	水素	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
6.)	水素	水素	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
7.)	フッ素	メチル	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
8.)	フッ素	メチル	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
9.)	フッ素	メチル	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
10.)	塩素	メチル	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
11.)	塩素	メチル	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
12.)	塩素	メチル	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
13.)	フッ素	水素	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
14.)	フッ素	水素	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
15.)	フッ素	水素	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
16.)	塩素	水素	メチル	3-メチル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
17.)	塩素	水素	メチル	3-シクロプロピル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
18.)	塩素	水素	メチル	3-フェニル-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル

のいずれかが当てはまる] 化合物及び立体異性体並びにこれらの化合物及び立体異性体の塩。

【請求項8】

請求項1から7までのいずれか1項記載の化合物を、神経学的及び/又は精神医学的な疾患、例えば精神疾患、不安障害、機嫌障害又は気分発作、薬物依存、運動疾患、認知不全疾患、強迫障害又は神経変性疾患の治療のための医薬組成物の製造において用いる使用。

【請求項 9】

有効成分として、請求項 1 から 7 までのいずれか 1 項記載の化合物少なくとも 1 種の有効量と一緒に、好適な医薬品助剤及び / 又は賦形剤を含有する、神経学的もしくは精神医学的な疾患の治療のための、又は受精率の制御のための、又は糖尿病の治療のための、又は体脂肪もしくは体重を低下させるための、又は非インスリン依存性糖尿病、メタボリックシンドロームもしくは糖不耐症を治療するための医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 9 記載の医薬組成物において、更にリモナバント、オルリストット、シプロトラミン、プロモクリプチン、エフェドリン、レプチニン、シュードエフェドリン、ペプチド YY₃₋₃₆ 及びそれらの類似体から選択される抗肥満薬を投与することを含む医薬組成物。