

【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 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/4745 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/30 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 0 2

C 07 D 471/04 C S P

A 61 K 31/4745

A 61 P 25/00

A 61 P 25/18

A 61 P 25/22

A 61 P 25/16

A 61 P 25/28

A 61 P 25/30

A 61 P 15/00

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 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

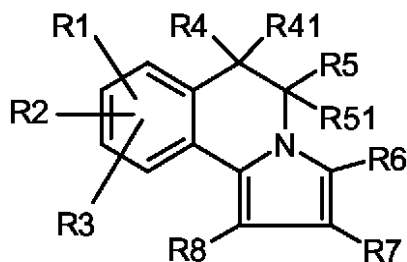
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



(I)

[式中、

R 1 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、

R 2 は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、かつ

R 3 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_2$ - 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 $C_1 \sim C_2$ - 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、 $C_1 \sim C_2$ - 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 $C_1 \sim C_2$ - 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、

R 4 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 $-CH_2-O-R 4 1 1$ であり、その際、

R 4 1 1 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、

R 4 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 5 は、水素、フッ素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、かつ

R 5 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 4 は、水素、フッ素、塩素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 4 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 5 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 $-CH_2-O-R 5 1 1$ であり、その際、

R 5 1 1 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

R 5 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 4 及び R 5 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 R 4 1 及び R 5 1 は、両者とも水素であり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノ、ホルミル又は R 6 1 によって置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、その際、

R 6 1 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 $-N(R 6 1 1)R 6 1 2$ であり、その際、

R 6 1 1 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、アリーロキシ - $C_2 \sim C_4$ - アルコキシ、アリーロキシ - $C_1 \sim C_4$ - アルキル、アリーロキシ、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、フェニロキシ、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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、
 R 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、 $C_1 \sim C_4$ - 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
 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又はハロゲンであり、
 R 8 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - 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、

R 2 は、水素、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、かつ

R 3 は、 $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_2$ -
 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 $C_1 \sim C_2$ - 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、 $C_1 \sim C_2$ -
 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 $C_1 \sim C_2$ - 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 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 4 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 5 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシカルボニルであり

、
 R 5 1 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであるか、又は

R 4 及び R 5 は、一緒になって、 $C_3 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は R 6 1 によって置換された $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、
 その際、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキ
 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、カルボキシル、アリールオキシ、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 - $N(H)S(O)_2 - N(R_{712})R_{713}$ 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 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R_{712} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、かつ

R_{713} は、 $C_1 \sim C_4$ - 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 Het_3 を形成し、その際、

Het_3 は、モルホリン - 4 - イルであり、

R_{72} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R_{73} 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_{74} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、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 - $S(O)_2 - N(R_{712})R_{713}$ 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 Het_4 であり、その際、

Het_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、 $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又はハロゲンであり、
 R_{812} は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - 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 $C_1 \sim C_4$ - 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 $C_1 \sim C_4$ - 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 $C_1 \sim C_4$ - 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 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R_{51} は、水素又は $C_1 \sim C_4$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R_7 は、 Het_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 Het_2 又はナフチルであり、その際、

Het_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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - 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 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、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 7 2 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 7 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又はフェニル - $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 8 は、R 8 1 によって環炭素原子上で置換されており、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 8 1 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ又はハロゲンであり、

R 8 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - 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、

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 $C_1 \sim C_2$ - 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、塩素又はフッ素であり、

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 $C_1 \sim C_2$ - 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 $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

R 5 1 は、水素であり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル又は R 6 1 によって置換された $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、その際、

R 6 1 は、 $C_1 \sim C_2$ - 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、塩素、フッ素、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル、 $C_1 \sim C_2$ - 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 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、塩素、フッ素又は $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

R 7 2 は、塩素、フッ素、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル又は $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 7 3 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル又は $C_1 \sim C_2$ - アルコキシであり、

R 7 4 は、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル又はフェニル - $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ - 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、 $C_1 \sim C_2$ - アルキル、 $C_1 \sim C_2$ - 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、ピロロ [2 , 1 - a] イソキノリン環の 8 位に結合されており、かつ $C_1 \sim C_2$ - 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、塩素又はフッ素であり、

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 $C_1 \sim C_2$ - 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 $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

R 5 1 は、水素であり、

R 6 は、 $C_1 \sim C_4$ - 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、Het 4 であり、その際、

Het 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_3 \sim C_5$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ - 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、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、 $C_1 \sim C_4$ - 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、ピロロ [2 , 1 - a] イソキノリン環の 8 位に結合されており、かつ $C_1 \sim C_2$ - アルコキシ、例えばメトキシであり、

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、かつ塩素又はフッ素であり、

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 $C_1 \sim C_2$ - 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

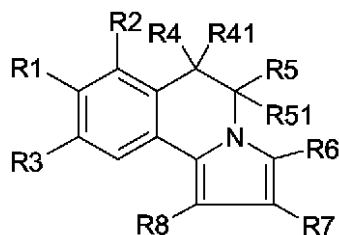
R 5 1 は、水素である

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、

R 1 は、メトキシであり、

R 3 は、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 1 は、水素であり、かつ

以下の R 2、R 5、R 6 及び R 8 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-メチルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
2.)	水素	メチル	メチル	3-シクロプロピルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
3.)	水素	メチル	メチル	3-フェニルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
4.)	水素	水素	メチル	3-メチルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
5.)	水素	水素	メチル	3-シクロプロピルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
6.)	水素	水素	メチル	3-フェニルー[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-メチルー[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-シクロプロピルー[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-フェニルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
10.)	塩素	メチル	メチル	3-メチルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
11.)	塩素	メチル	メチル	3-シクロプロピルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
12.)	塩素	メチル	メチル	3-フェニルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
13.)	フッ素	水素	メチル	3-メチルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
14.)	フッ素	水素	メチル	3-シクロプロピルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
15.)	フッ素	水素	メチル	3-フェニルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
16.)	塩素	水素	メチル	3-メチルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
17.)	塩素	水素	メチル	3-シクロプロピルー[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル
18.)	塩素	水素	メチル	3-フェニルー[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、オルリスタット、シブトラミン、プロモクリプチン、エフェドリン、レプチン、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。