

【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19年2月15日(2007.2.15)

【公表番号】特表2006-508987(P2006-508987A)

【公表日】平成18年3月16日(2006.3.16)

【年通号数】公開・登録公報2006-011

【出願番号】特願2004-553941(P2004-553941)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 213/89 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4425 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 13/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 21/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/14 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/18 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/24 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**

**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 37/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 407/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 407/14 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 213/89 C S P

A 6 1 K 31/4425

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 35/04  
 A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 407/12  
 C 0 7 D 407/14

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年12月21日(2006.12.21)

## 【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

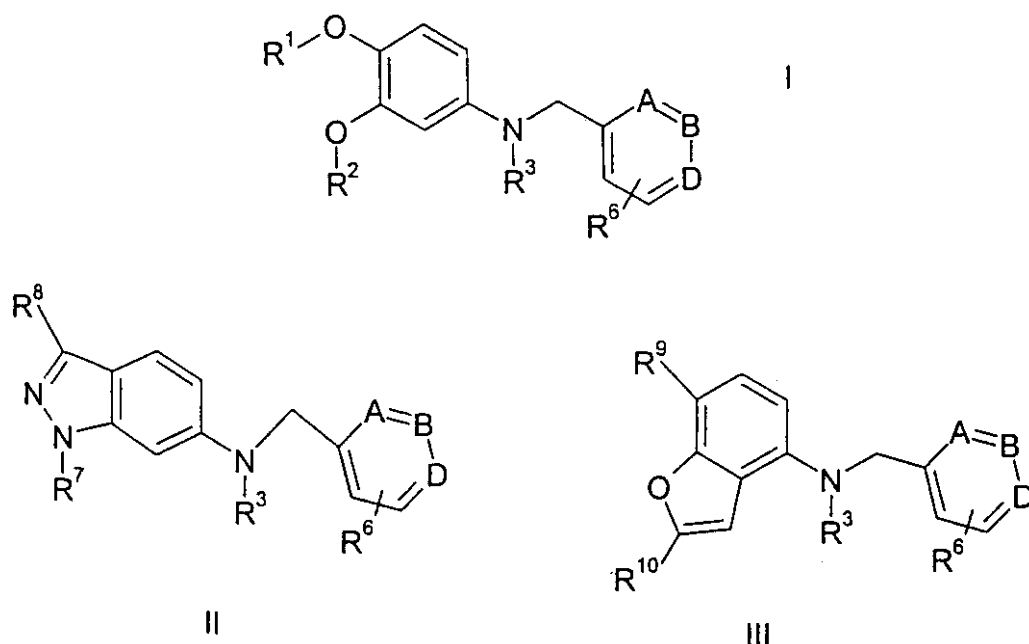
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式I～III:

【化1】



【式中、

A、B、及びDの内の1は、N-Oであり、そして残りは、CR<sup>6</sup>であり；R<sup>1</sup>は、

1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、

1～12個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状

であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置換えられるアルキル、

3 ~ 10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5個の炭素原子を有し、そしてここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

5 ~ 14個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$ は、

Hであり、

3 ~ 10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシク

ロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $OCF_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4$ -L-、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4$ -L-、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

$R^4$ は、

Hであり、

1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7 ~ 19 個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、

又は該アリアル成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ に置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられるアリアルアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1～8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^5-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^5-$ 、 $-\text{NR}^5\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{NR}^5\text{CO}-$ 、 $-\text{CONR}^5-$ 、 $-\text{NHCONH}-$ 、 $-\text{OCONH}$ 、 $-\text{NHCOO}-$ 、 $-\text{SCONH}-$ 、 $-\text{SCSNH}-$ 、又は $-\text{NHCSNH}-$ により置き換えられるラジカルであり；

$\text{R}^5$ は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

6～14個の炭素原子を有するアリアルであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリアルであり、或いは

7～19個の炭素原子を有するアリアルアルキルであって、該アリアル成分が、6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリアルアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリアル成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられるアリアル

ルアルキルであり；

$R^6$ は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

$R^7$ は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^8$ は、

Hであり、又は

1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $C_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ によ

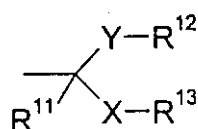
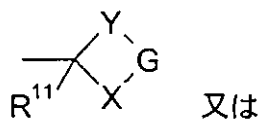
り置き換えられうるアルキルであり；

R<sup>9</sup>は、

各場合において1～4個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

R<sup>10</sup>は、-CO-C<sub>1-4</sub>-アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される-CO-C<sub>1-4</sub>-アルキルであるか、或いは以下の

【化2】



{ 式中、

R<sup>11</sup>は、H 或いは1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

R<sup>12</sup>は、1～6個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

R<sup>13</sup>は、1～6個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y は各々独立してO 又はS であり；そして

G は、2～7個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである} で表される基である]

で表される単離された化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合物を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩。

【請求項2】

B が N-O である、請求項1 に記載の単離された化合物。

【請求項3】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして R<sup>1</sup> がメチル又はジフルオロメチルである、請求項1 に記載の単離された化合物。

【請求項4】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして R<sup>2</sup> がシクロアルキルである、請求項1 に記載の単離された化合物。

【請求項5】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして R<sup>2</sup> がフェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、クロロフェニル、フェネチル、フェンプロピル、フェンブチル、フェニルエチル、フェノキシエチル、フェノキシプロピル、フェノキシブチル、クロロフェニルエチル、メトキシフェニルエチル、クロロフェニルエチル、クロロフェノキシエチル、クロロフェニルプロピル、メトキシフェンプロピル、メトキシフェンブチル、クロロフェンブチル、ニトロフェンブチル、又はクロロフェニルアミノエチルである、請求項1 に記載

の単離された化合物。

【請求項 6】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして  $R^2$  がシクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル、又はインダン-2-イルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 7】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして  $R^2$  がメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、又はメトキシエチルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 8】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして  $R^2$  がテトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピロリル、ピリジルメチル、ピリジリエチル、ピリジルプロピル、ピペラジニルメチル、ピペラジニルエチル、又はメチルピペラジニルエチルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 9】

前記化合物が、式 I の化合物であり、そして  $R^2$  がシクロペンチル、テトラヒドロフラニル、 $CHF_2$ 、メトキシエチル、シクロプロピルメチル、フェネチル、フェンプロピル、フェニルエテニル、フェノキシエチル、フェノキシブチル、フェニルアミノエチル、インダン-2-イル、ピリジリエチル、又はピリジルプロピルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 10】

$R^3$  が、各場合において置換されないか又は一箇所以上置換されるフェニル、ナフチル、ピフェニル、フラニル、ピラジニル、ピリジニル、ピリジル、キノリニル、又はイソキノリニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 11】

$R^3$  が、OH、F、Cl、 $CF_3$ 、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、CN、ビニル、 $CH_2OH$ 、 $CONHOH$ 、 $CONH_2$ 、メチレンジオキシ、COOH、又はそれらの組合せにより置換される、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

$R^3$  が、各場合において置換されるか又は置換されないピリジル又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 13】

$R^3$  が、ハロゲン、COOH、及び/又はCNにより置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 14】

$R^3$  が、 $R^4$ -、 $R^4$ -O-、 $R^4$ -CO-、 $R^4$ -NH-CO-、 $R^4$ -SO<sub>2</sub>-NH-、 $R^4$ -SO<sub>2</sub>-NHCO-、 $R^4$ -SO<sub>2</sub>-NH-アルキレン-O-、NH<sub>2</sub>-アルキル-NH-CO-、 $R^4$ -アルキレン-NH-CO-、アルキル-CO-NH-アルキル-、メチル、エチル、Cl、F、CN、OCH<sub>3</sub>、 $CF_3$ 、アミノ、ニトロ、 $CH_2OH$ 、又はCOOHにより置換されるアリールである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 15】

$R^3$  が、 $R^4$ -SO<sub>2</sub>-NH-により置換されるフェニルであり、かつ  $R^4$  がメチル、エチル、プロピル、又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 16】

$R^3$  が、 $R^4$ -SO<sub>2</sub>-NH-アルキレン-O-により置換されるフェニルであり、 $R^4$  がメチル、エチル、プロピル、又はフェニルであり、そしてアルキレンが-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、又は-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 17】

$R^3$  が、 $R^4$ -L-により置換されるフェニルであり、 $R^4$  が、フェニル、テトラゾリル、オキサジニル、ピペラジニル、メチルピペラジニル、ピリジル、メチルピリジル、ピロリニル、メチルピロリニル、ピペラジニル、又はメチルピペラジニルであり、かつ L が、単結合、-O-、-CO-、-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-O-、-CH<sub>2</sub>



$\text{C H}_2\text{-O-}$ 、 $\text{-C H}_2\text{C H}_2\text{C H}_2\text{-O-}$ 、 $\text{-C H}_2\text{-NH-C H}_2\text{C H}_2\text{-O-}$ 、 $\text{-CO-NH-}$ 、 $\text{-NH-CO-}$ 、又は $\text{-CONHSO}_2\text{-}$ である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 18】

$\text{R}^6$  が、H 又は F である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 19】

$\text{R}^6$  が H である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 20】

前記化合物が式 I I の化合物であり、そして  $\text{R}^7$  が、2 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、場合によりハロゲンにより置換されるアルキルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 21】

前記化合物が式 I I の化合物であり、そして  $\text{R}^7$  がシクロペンチル又はシクロヘキシルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 22】

前記化合物が式 I I の化合物であり、そして  $\text{R}^8$  が H 又は  $\text{C}_2\text{H}_5$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 23】

前記化合物が式 I I I の化合物であり、そして  $\text{R}^9$  が  $\text{C H}_3$  又は  $\text{C}_2\text{H}_5$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 24】

前記化合物が式 I I I の化合物であり、そして  $\text{R}^{10}$  が  $\text{-CO-C}_{1-4}\text{-}$  アルキルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 25】

前記化合物が式 I I I の化合物であり、そして  $\text{R}^{11}$  が  $\text{-C H}_3$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 26】

前記化合物が式 I I I の化合物であり、そして  $\text{R}^{12}$  及び  $\text{R}^{13}$  が各々独立して  $\text{-C H}_3$  又は  $\text{-C H}_2\text{C H}_3$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 27】

X 及び Y が各々 O である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 28】

前記化合物が式 I I I の化合物であり、そして G が  $\text{-C H}_2\text{C H}_2\text{-}$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 29】

$\text{R}^3$  が H である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 30】

D が N-O である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 31】

各アリール基は、独立してフェニル、ナフチル、又はピフェニル基であって、場合によりハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、シアノ、アシル、アルコキシカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はフェノキシにより一箇所以上置換される基であり；

各ヘテロアリール基は、独立してフリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ジチアリル、オキサチアリル、イソキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾリル、オキサチアゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、オキサジニル、イソキサジニル、オキサチアジニル、オキサジアジニル、ベンゾフラニル、イソベンゾフラニル、チオナフテニル、イソチオナ

フテニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズイソチアゾリル、プリニル、ベンゾピラニル、キノリニル、イソキノリニル、シノリニル、キナゾリニル、ナフチリジニル、又はベンズオキサジニル基であって、場合によりハロゲン、アリール、アルキル、アルコキシ、カルボキシ、メチレン、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、又はジアルキルアミノにより一箇所以上置換される基であり；そして

各複素環基は、独立して、ヘテロアリール基又はテトラヒドロフラニル、ピペリジニル、又はピロリジニル基であって、場合によりハロゲン、アリール、アルキル、アルコキシ、カルボキシ、メチレン、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、又はジアルキルアミノにより一箇所以上置換される基である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 2】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり； $R^2$  が、各場合において置換されるか又は置換されないアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリールアルキル、複素環-アルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、又は複素環であり；そして  $R^3$  が各場合において置換されるか又は置換されないアリール又はヘテロアリールである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 3】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり；そして  $R^2$  がシクロペンチル、 $CHF_2$ 、シクロプロピルメチル、ピリジリエチル、又はテトラヒドロフラニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 4】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり； $R^2$  がシクロペンチル、 $CHF_2$ 、シクロプロピルメチル、ピリジリエチル、又はテトラヒドロフラニルであり；そして  $R^3$  が、各場合において置換されるか又は置換されないアリール又はヘテロアリールである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 5】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり； $R^2$  がシクロペンチルであり；そして  $R^3$  が置換されるか又は置換されないアリール又はヘテロアリールである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 6】

$R^1$  がメチルであり； $R^2$  がシクロペンチルであり；そして  $R^3$  が置換されるか又は置換されないフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 7】

$R^1$  がメチルであり； $R^2$  がシクロペンチルであり；そして  $R^3$  がフェニル又は 1 ~ 3 個の置換基で置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 8】

$R^1$  がメチルであり； $R^2$  がシクロペンチルであり；そして  $R^3$  が、各場合において置換されるか又は置換されないフェニル、ナフチル、ピフェニル、ピリジル、ピリミジニル、チアゾリル、ピラジニル、キノリニル、又はイソキノリニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 3 9】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 4 0】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり、そして B が N-O である、請求項 1 に記載の単離された化合物。

【請求項 4 1】

$R^1$  がメチル又は  $CHF_2$  であり、そして  $R^2$  がシクロペンチル、 $CHF_2$ 、シクロプロピルメチル、ピリジリエチル、又はテトラヒドロフラニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 2】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、そしてR<sup>2</sup>がシクロペンチル、CHF<sub>2</sub>、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 3】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、そしてR<sup>3</sup>が、各場合において置換されるか又は置換されない3-ピリジル又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 4】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、そしてR<sup>3</sup>が、各場合において置換されるか又は置換されない3-ピリジル又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 5】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、R<sup>2</sup>がシクロペンチル、CHF<sub>2</sub>、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そしてR<sup>3</sup>が、各場合において置換されるか又は置換されない3-ピリジル又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 6】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、R<sup>2</sup>がシクロペンチル、CHF<sub>2</sub>、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そしてR<sup>3</sup>が、各場合において置換されるか又は置換されない3-ピリジル又はフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 7】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、そしてR<sup>3</sup>が、3又は4位で置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 8】

R<sup>1</sup>が、メチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、そしてR<sup>3</sup>が、3又は4位で置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 4 9】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、R<sup>2</sup>がシクロペンチル、CHF<sub>2</sub>、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そしてR<sup>3</sup>が、3又は4位で置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 5 0】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、R<sup>2</sup>がシクロペンチル、CHF<sub>2</sub>、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そしてR<sup>3</sup>が3又は4位で置換されるフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 5 1】

R<sup>1</sup>がメチル又はCHF<sub>2</sub>であり、そしてR<sup>3</sup>が3-ピリジル、3-COOH-フェニル、3-Cl-フェニル、3-シアノ-フェニル、3-エチルスルホンアミド-フェニル、3-テトラゾール-5-イル-フェニル、3-ヒドロキシメチル-フェニル、4-ピリジル、4-COOH-フェニル、4-シアノ-フェニル、4-エチルスルホンアミド-フェニル、4-テトラゾール-5-イル-フェニル、又は4-ヒドロキシメチルフェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 5 2】

R<sup>1</sup>が、メチル又はCHF<sub>2</sub>であり、BがN-Oであり、そしてR<sup>3</sup>が3-ピリジル、3-COOH-フェニル、3-Cl-フェニル、3-シアノ-フェニル、3-エチルスルホンアミド-フェニル、3-テトラゾール-5-イル-フェニル、3-ヒドロキシメチル-フェニル、4-ピリジル、4-COOH-フェニル、4-シアノ-フェニル、4-エチルスルホンアミド-フェニル、4-テトラゾール-5-イル-フェニル、又は4-ヒドロキシメチル-フェニルである、請求項 1 に記載の単離された化合物。

## 【請求項 5 3】

$R^1$ がメチル又は $CHF_2$ であり、 $R^2$ がシクロペンチル、 $CHF_2$ 、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そして $R^3$ が3-ピリジル、3-COOH-フェニル、3-Cl-フェニル、3-シアノ-フェニル、3-エチルスルホンアミド-フェニル、3-テトラゾール-5-イル-フェニル、3-ヒドロキシメチル-フェニル、4-ピリジル、4-COOH-フェニル、4-シアノ-フェニル、4-エチルスルホンアミド-フェニル、4-テトラゾール-5-イル-フェニル、又は4-ヒドロキシメチル-フェニルである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項54】

$R^1$ がメチル又は $CHF_2$ であり、BがN-Oであり、 $R^2$ がシクロペンチル、 $CHF_2$ 、シクロプロピルメチル、ピリジルエチル、又はテトラヒドロフラニルであり、そして $R^3$ が3-ピリジル、3-COOH-フェニル、3-Cl-フェニル、3-シアノ-フェニル、3-エチルスルホンアミド-フェニル、3-テトラゾール-5-イル-フェニル、3-ヒドロキシメチル-フェニル、3-ニトロ-フェニル、4-ピリジル、4-COOH-フェニル、4-シアノ-フェニル、4-エチルスルホンアミド-フェニル、4-テトラゾール-5-イル-フェニル、又は4-ヒドロキシメチル-フェニルである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項55】

$R^3$ がHであり、又は各場合において置換されるか又は置換されないアリール若しくはヘテロアリールである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項56】

前記化合物が、式IIの化合物であり、 $R^7$ がシクロアルキルであり、そして $R^8$ がH又は $C_2H_5$ である、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項57】

前記化合物が、式IIの化合物であり、 $R^7$ がシクロアルキルであり； $R^8$ がH又は $C_2H_5$ であり；そして $R^3$ がHであり、又は各場合において置換されるか又は置換されないアリール若しくはヘテロアリールである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項58】

前記化合物が、式IIの化合物であり、 $R^7$ がシクロペンチルであり； $R^8$ がH又は $C_2H_5$ であり；そして $R^3$ がHであり、又は各場合において置換されるか若しくは置換されないアリール若しくはヘテロアリールである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項59】

前記化合物が、式IIの化合物であり、 $R^7$ がシクロペンチルであり； $R^8$ がH又は $C_2H_5$ であり；そして $R^3$ が置換されるか又は置換されないフェニルである、請求項1に記載の単離された化合物。

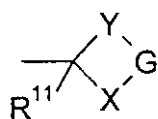
【請求項60】

$R^3$ がHであり、又は各場合において置換されるか又は置換されないアリール若しくはヘテロアリールである、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項61】

前記化合物が、式IIIの化合物であり、 $R^9$ が1～4個の炭素原子を有するアルコキシであり； $R^{10}$ が $COCH_3$ 又は以下の

【化3】



{ 式中、

$R^{11}$ が $-CH_3$ であり；

X 及び Y が両方とも O 又は S であり ; そして

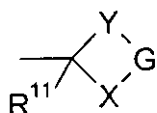
G が  $-CH_2CH_2-$  である }

で表される基である、請求項 1 に記載の 単離された化合物。

【請求項 6 2】

前記化合物が、式 I I I の化合物であり、 $R^3$  が H であり、又は各場合において置換されるか若しくは置換されないアリール若しくはヘテロアリールであり ;  $R^9$  が 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシであり ;  $R^{10}$  が  $COCH_3$  又は以下の

【化 4】



{ 式中、

$R^{11}$  が  $-CH_3$  であり ;

X 及び Y が両方とも O 又は S であり ; そして

G が  $-CH_2CH_2-$  である }

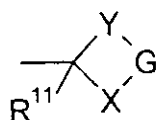
で表される基である、請求項 1 に記載の 単離された化合物。

【請求項 6 3】

前記化合物が、式 I I I の化合物であり、そして  $R^3$  が置換されるか又は置換されないフェニルであり ;  $R^9$  が 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシであり ;

$R^{10}$  が  $COCH_3$  又は以下の

【化 5】



{ 式中、

$R^{11}$  が  $-CH_3$  であり ;

X 及び Y が両方とも O 又は S であり ; そして

G が  $-CH_2CH_2-$  である }

で表される基である、請求項 1 に記載の 単離された化合物。

【請求項 6 4】

B が N-O であり ;

$R^1$  がメチル又はジフルオロメチルであり ;

$R^2$  がフェニル、メチルフェニル、メトキシフェニル、クロロフェニル、フェネチル、フェンプロピル、フェンブチル、フェニルエチニル、フェノキシエチル、フェノキシプロピル、フェノキシブチル、クロロフェニルエチル、メトキシフェニルエチル、クロロフェニルエチニル、クロロフェノキシエチル、クロロフェニルプロピル、メトキシフェンプロピル、メトキシフェンブチル、クロロフェンブチル、ニトロフェンブチル、クロロフェニルアミノエチル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル、インダン-2-イル-メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシエチル、テトラヒドロフランニル、ピロリジニル、ピロリル、ピリジルメチル、ピリジルエチル、ピリジルプロピル、ピペラジニルメチル、ピペラジニルエチル、メチルピペラジニルエチル、シクロペンチル、CHF

2、メトキシエチル、シクロプロピルメチル、又はフェニルアミノエチルであり；

$R^3$  が、各場合において置換されないか又は置換されるフェニル又はピリジルであり；

$R^6$  が、H又はFであり；

$R^7$  が、シクロペンチル、シクロヘキシル、又は2～4個の炭素原子を有するアルキルであって、場合によりハロゲンにより置換されるアルキルであり、

$R^8$  が、H又は $C_2H_5$ であり；

$R^9$  が、 $CH_3$ 又は $C_2H_5$ であり；

$R^{10}$  が、 $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであり；

$R^{11}$  が、 $-CH_3$ であり；

$R^{12}$  及び  $R^{13}$  が、各々独立して $-CH_3$ 又は $-CH_2CH_3$ であり；

X及びYが、各々Oであり；そして

Gが $-CH_2CH_2-$ である、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項65】

A、B、及びDの内の1が、N-Oであり、そして残りが、CHであり；

$R^1$  が、

1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

$R^2$  が、

1～12を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置換えられるアルキル、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつアルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

5～14個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニ

トロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5～10個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1～5個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は複素環成分において、ハロゲン、 $\text{OCF}_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられ、及び1以上の $-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により、 $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$\text{R}^3$ が、

Hであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $\text{OCF}_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4-\text{L}-$ 、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、或いは

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5～10個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4-\text{L}-$ 、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、

$\text{R}^4$ が、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1～8個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1～5個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1～4個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオ

キシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、又はアルキルスルホニルにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7 ~ 19 個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が 6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、又はジアルキルアミノにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチルにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも 1 の環原子が、N、O、又は S 原子である 5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも 1 の環原子が、N、O、又は S 原子である 5 ~ 10 個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

L が、

単結合又は 1 ~ 8 個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1 以上の  $-CH_2-$  基は、各々場合により  $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^5-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-NH SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-NR^5CO-$ 、 $-CONR^5-$ 、 $-NHCONH-$ 、 $-OCONH-$ 、 $-NHCOO-$ 、 $-SCONH-$ 、 $-SCSNH-$ 、又は  $-NHCSNH-$  により置き換えられるラジカルであり；

$R^5$  が、

H であり、

1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^7$  が、

H であり、

1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個炭素を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも 1 の環原子が N、O、又は S 原子である 5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル



、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、

$R^8$  が、

Hであり、又は

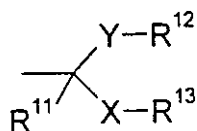
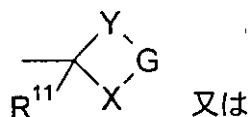
1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $C_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられうるアルキルであり；

$R^9$  が、

各場合において1～4個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$R^{10}$  が、 $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化6】



{ 式中、

$R^{11}$  が、H 或いは1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{12}$  が、1～6個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{13}$  が、1～6個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y が、各々独立してO 又は S であり；そして

G が、2～7個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである} で表される基である、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項66】

前記化合物が、以下：

3'-クロロ-3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3'-クロロ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-(3-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

3'-シアノ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-(3-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

3,4-ビス(ジフルオロメトキシ)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

3'-シアノ-4-ジフルオロメトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

3'-クロロ-4-ジフルオロメトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)ジフェニルアミン、

4'-tert-ブチルジメチルシリルオキシ-3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4-アミノ安息香酸、

N-(3-シクロペンチルオキシ-4-ジフルオロメトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[4-メトキシ-3-(3-テトラヒドロフリルオキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-3,4-ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[4-メトキシ-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-(3-シクロプロピルメトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4-アミノ安息香酸、

N-(3-シクロプロピルメトキシ-4-ジフルオロメトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[3-(4-クロロフェニル)プロピ-1-イルオキシ-4-メトキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-(3-シクロプロピルメトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[3-(2-インダニルオキシ)-4-メトキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[4-メトキシ-3-(3-テトラヒドロフリルオキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[4-メトキシ-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

N-[3-(2-メトキシエトキシ)-4-メトキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-アミノ安息香酸、

3-シクロプロピルメチルオキシ-4-ジフルオロメトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4'-(2H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4'-(2H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3'-(2H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-((3R)-テトラヒドロフリルオキシ)-4'-(2H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

3-シクロプロピルメチルオキシ-4-メトキシ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4'-(2H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3 -[(3 R)-テトラヒドロフリルオキシ]-4' -(2 H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4' -(2 H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

3 -シクロプロピルメチルオキシ-4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3' -(2 H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

ビス-3,4 -ジフルオロメトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4' -(2 H-テトラゾール-5-イル)ジフェニルアミン、

N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(3-ピリジル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アミン、

N-(3-シクロペンチルオキシ-4-ジフルオロメトキシフェニル)-N-(3-ピリジル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アミン、

N-(3-シクロプロピルメトキシ-4-ジフルオロメトキシフェニル)-N-(3-ピリジル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アミン、

N-(4-ジフルオロメトキシ-3-(3 R)-テトラヒドロフリルオキシフェニル)-N-(3-ピリジル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アミン、

3 -シクロペンチルオキシ-3' -エタンスルホニルアミノ-4-メトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-3' -(1-プロパンスルホニルアミノ)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4' -エタンスルホニルアミノ-4-メトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-4' -(1-プロパンスルホニルアミノ)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3 -シクロプロピルメトキシ-3' -エタンスルホニルアミノ-4-メトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

4 -ジフルオロメトキシ-3' -エタンスルホニルアミノ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3 -[(3 R)-テトラヒドロフリルオキシ]ジフェニルアミン、

4-メトキシ-3 -[2-(2-ピリジル)エトキシ]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

4-メトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3 -[(3 R)-テトラヒドロフリルオキシ]ジフェニルアミン、

3' -クロロ-4-メトキシ-3 -[2-(2-ピリジル)エトキシ]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3' -クロロ-4-メトキシ -N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3 -[(3 R)-テトラヒドロフリルオキシ]ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-4' -[2-(5-オキソピロリジニル)メトキシ]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)ジフェニルアミン、

3 -シクロペンチルオキシ-4-メトキシ -N-(3-アミノカルボニルフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

3,4 -ビスジフルオロメトキシ -N-(3-カルボキシ-4-クロロフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

3,4 -ビスジフルオロメトキシ -N-(4-(1-ピロール-1-イル)フェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-メトキシ-3-(R)-テトラヒドロフリルオキシ -N-(3-カルボキシ-4-クロロフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-メトキシ-3-(R)-テトラヒドロフリルオキシ -N-(3-カルボキシフェニル)-N-(1-オキシ-4-ピリジルメチル)アニリン、

4-メトキシ-3-(R)-テトラヒドロフリルオキシ -N-(3-ピリジル)-N-(1-オキシ-4-ピリジルメチル)アニリン、

- 3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシ-N-(4-カルボキシ-3-クロロフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 2-アセチル-7-メトキシ-4-(N-(4-シアノフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル))アミノベンゾフラン、
- 2-アセチル-7-メトキシ-4-(N-フェニル-N-(1-オキシ-4-ピリジルメチル))アミノベンゾフラン、
- 2-アセチル-7-メトキシ-4-(N-(3-カルボキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル))アミノベンゾフラン、
- 1-シクロペンチル-3-エチル-6-(N-(3-カルボキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル))アミノインドゾール、
- 2-アセチル-7-メトキシ-4-(N-(4-アセチルフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル))アミノベンゾフラン、
- N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-4-メチルスルホニルアミノカルボニル-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 4-(4-フルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 3-クロロ-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 3-アミノ-N-(5-フルオロ-1-オキシ-3-ピリジルメチル)-N-(4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]安息香酸、
- 3-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-2-ピリジルメチル)安息香酸、
- 3-アミノ-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-5-トリフルオロメチル安息香酸、
- 4-エチルスルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 4-(2-フルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 4-(3-クロロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- 3-アミノ-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-6-トリフルオロメチル安息香酸、
- 4-アミノ-N-[4-ジフルオロメトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、
- N-[4-ジフルオロメトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-4-メチルスルホニルアミノカルボニル-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、
- N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4-フェニルスルホニルアミノカルボニルアニリン、
- 3-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(5-フルオロ-1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、
- 4-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(5-フルオロ-1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、
- 3-アミノ-N-[4-ジフルオロメトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、
- 3-アミノ-N-(3-シクロブチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、
- 3-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-5-フルオロ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-[3,4-ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル]-5-フルオロ-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-アミノ-N-(3-シクロブチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-アミノ-N-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-アミノ-N-(3-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

N-[4-ジフルオロメトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-4-(3,4-ジフルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-アミノ-N-(3-シクロプロピルメトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

N-[3,4-ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル]-4-(4-フルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-(2,4-ジフルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-(4,3-ジフルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

N-[4-ジフルオロメトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-4-エチルスルホニルアミノカルボニル-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

3-アミノ-N-(3,4-ジメトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-(3-イソプロポキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-(3,4-ジフルオロフェニル)スルホニルアミノカルボニル-N-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

3-アミノ-N-[3,4-ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-(4-ジフルオロメトキシ-3-エトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-アミノ-N-(4-ジフルオロメトキシ-3-エトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-(4-ジフルオロメトキシ-3-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

4-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシピリジン-3-イルメチル)ピリジン、

N-[ビス-3,4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4-[2-(2-テトラヒドロピラニル)-2H-テトラゾール-5-イル]アニリン、

N-[ビス-3,4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-(2H-テトラゾール-5-イル)アニリン；並びに

医薬として許容されるそれらの塩

から選ばれ、ここで光学活性化合物は、その分離されたエナンチオマーの形態であるか、又はその混合体の形態であり、ラセミ体を含みうる、請求項1に記載の単離された化合物。

【請求項67】

前記化合物が、以下：

4-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシピリジン-3-イルメチル)ピリジン、

N-[ビス-3,4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-4-[2-(2-テトラヒドロピラニル)-2H-テトラゾール-5-イル]アニリン、

3-クロロ-N-[4-メトキシ-3-((3R)-3-テトラヒドロフラニル)オキシフェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)アニリン、

4-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-(3-シクロペンチルオキシ-4-メトキシフェニル)-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

3-アミノ-N-[ビス-3,4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)安息香酸、

N-[ビス-3,4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-N-(1-オキシ-3-ピリジルメチル)-3-(2H-テトラゾール-5-イル)アニリン；並びに

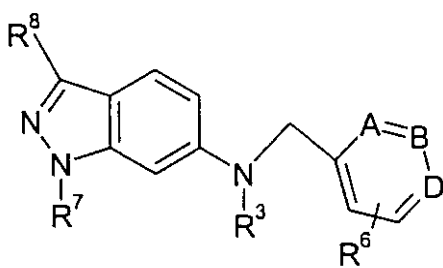
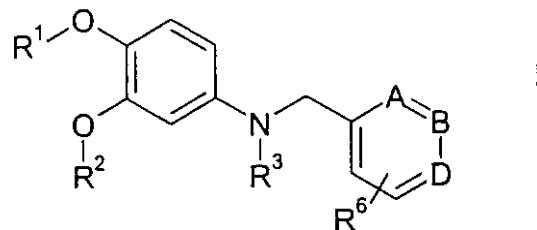
医薬として許容されるそれらの塩

から選ばれ、ここで光学活性化合物は、その分離されたエナンチオマーの形態であるか、又はその混合体の形態であり、ラセミ体を含みうる、請求項1に記載の単離された化合物。

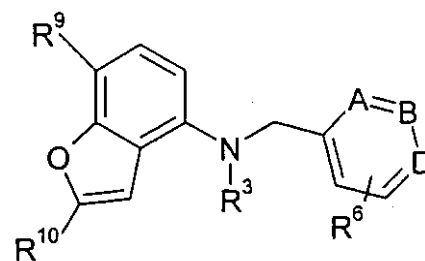
【請求項68】

医薬として許容される担体と以下の式I~III：

【化7】



II



III

[式中、

A、B、及びDの内の1は、N-Oであり、そして残りは、C R<sup>6</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、

1~4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、

1~12個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状

であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置換えられるアルキル、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリーールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリーールであり、

アリーールアルキルであって、該アリーール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、そしてここで該アリーールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリーール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリーールアルキルであり、

5 ~ 14 個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリーール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10 個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリーール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$  は、

Hであり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシク

ロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $\text{OCF}_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4$ -L-、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10 個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4$ -L-、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

$\text{R}^4$ は、

Hであり、

1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7 ~ 19 個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、



又は該アリアル成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の $-CH_2CH_2-$ 基は、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ に置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基は、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられるアリアルアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5~10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5~10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1~5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1~8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の $-CH_2-$ 基は、各々場合により $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^5-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-NH SO_2-$ 、 $-SO_2NR^5-$ 、 $-NR^5SO_2-$ 、 $-CO-$ 、 $-NR^5CO-$ 、 $-CONR^5-$ 、 $-NHCONH-$ 、 $-OCONH-$ 、 $-NHCOO-$ 、 $-SCONH-$ 、 $-SCSNH-$ 、又は $-NHCSNH-$ により置き換えられるラジカルであり；

$R^5$ は、

Hであり、

1~8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

6~14個の炭素原子を有するアリアルであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリアルであり、或いは

7~19個の炭素原子を有するアリアルアルキルであって、該アリアル成分が、6~14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1~5個の炭素原子を有し、ここで該アリアルアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリアル成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基は、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基は、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられるアリアル

ルアルキルであり；

$R^6$  は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

$R^7$  は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^8$  は、

Hであり、又は

1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $C_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ によ

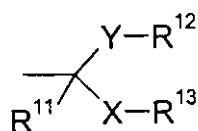
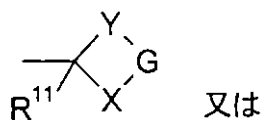
り置き換えられうるアルキルであり；

$R^9$  は、

各場合において 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$R^{10}$  は、 $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される  $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化 8】



{ 式中、

$R^{11}$  は、H 或いは 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{12}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{13}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y は各々独立して O 又は S であり；そして

G は、2 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである } で表される基である ]

で表される単離された化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合物を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩とを含む医薬組成物。

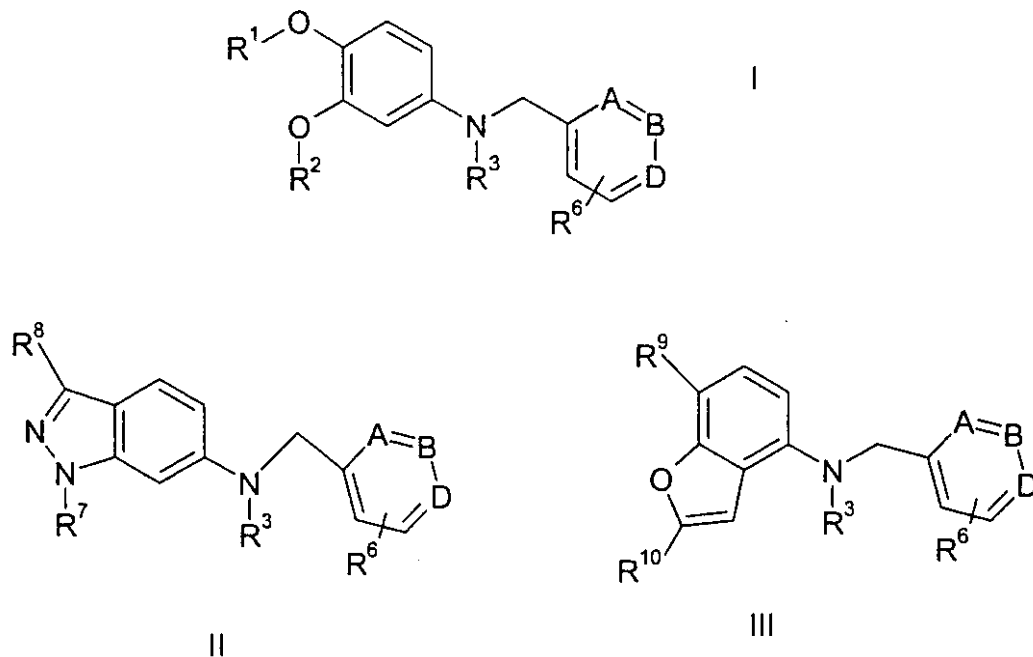
【請求項 69】

前記化合物が、0.1 ~ 50 mg の単位投与量で提供される、請求項 68 に記載の組成物。

【請求項 70】

患者において PDE 4 酵素阻害をもたらす、認知を亢進し、及び/又は精神病を治療する方法であって、該患者に、以下の式 I ~ III :

## 【化9】



[式中、

A、B、及びDの内の1は、N-Oであり、そして残りは、C R<sup>6</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、

1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、

1 ~ 12 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1 以上の -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-基が、各場合において、-CH=CH-又は-C=C-により置換えられるアルキル、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、そしてここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され

、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり

5 ~ 14 個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10 個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$  は、

H であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $OCF_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10 個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

R<sup>4</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1～8個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1～5個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1～4個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7～19個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-に置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一

筒所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1～8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>5</sup>-、-SO<sub>2</sub>NH-、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>-、-NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>-、-CO-、-NR<sup>5</sup>CO-、-CONR<sup>5</sup>-、-NHCONH-、-OCONH、-NHCOO-、-SCONH-、-SCSNH-、又は-NHCSNHにより置き換えられるラジカルであり；

R<sup>5</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

6～14個の炭素原子を有するアリーールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリーールであり、或いは

7～19個の炭素原子を有するアリーールアルキルであって、該アリーール成分が、6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリーールアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリーール成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-により置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリーールアルキルであり；

R<sup>6</sup>は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

R<sup>7</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリーールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリーールであり、

アリーールアルキルであって、該アリーール成分が6～14個の炭素原子を有し、か

つ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$\text{R}^8$ は、

Hであり、又は

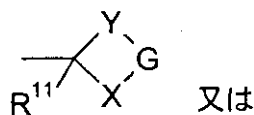
1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $\text{C}_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基が、各場合において、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられうるアルキルであり；

$\text{R}^9$ は、

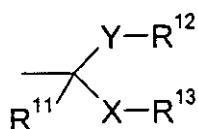
各場合において1～4個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$\text{R}^{10}$ は、 $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化10】



又は





{ 式中、

$R^{11}$  は、H 或いは 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

$R^{12}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{13}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y は各々独立して O 又は S であり；そして

G は、2 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである } で表される基である ]

で表される単離された化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合体を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩を投与することを含む、前記方法。

【請求項 7 1】

前記化合物が、0.01 ~ 100 mg/kg 体重/日の量で投与される、請求項 7 0 に記載の方法。

【請求項 7 2】

前記患者がヒトである、請求項 7 0 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

前記患者が、認知障害又は認知低下を患う、請求項 7 0 に記載の方法。

【請求項 7 4】

前記患者が、記憶障害を患う、請求項 7 0 に記載の方法。

【請求項 7 5】

前記患者が、アルツハイマー病、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、多系統萎縮症、統合失調症、パーキンソン病、ハンチントン舞踏病、ピック病、クロイツフェルト-ヤコブ病、うつ病、加齢、頭部外傷、脳卒中、脊椎損傷、CNS 低酸素状態、大脳性老衰、糖尿病性認知障害、幼少期に麻酔薬に晒されることに起因する記憶障害、多発脳梗塞性痴呆、HIV、循環器疾患、又は老年性認知低下に起因する記憶障害を患う、請求項 7 4 に記載の方法。

【請求項 7 6】

前記患者が、痴呆に起因する記憶障害を患う、請求項 7 4 に記載の方法。

【請求項 7 7】

前記患者が、精神病を患う、請求項 7 0 に記載の方法。

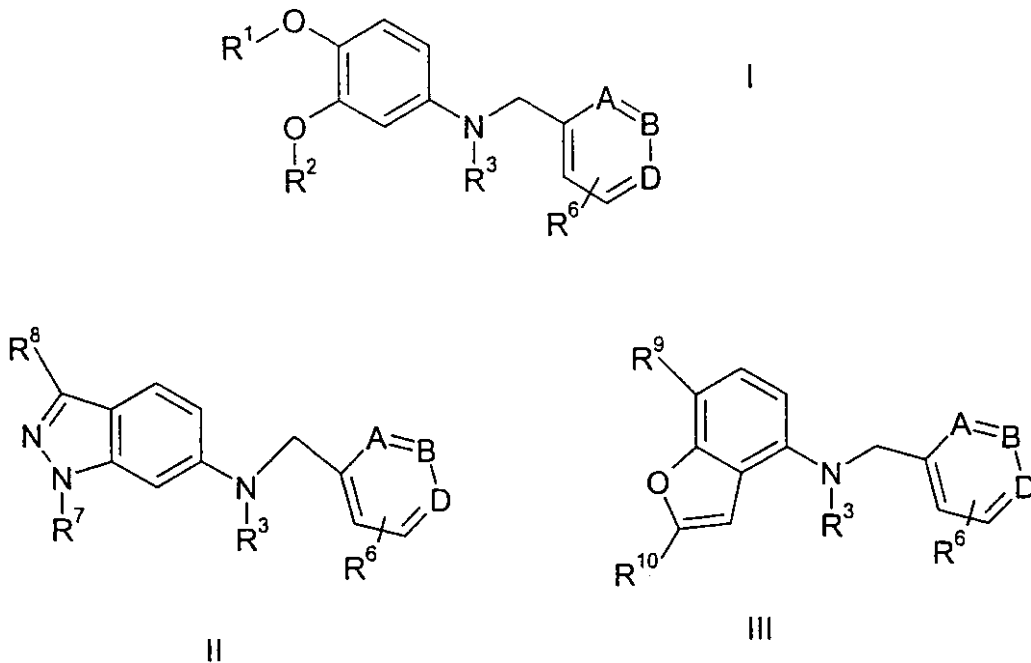
【請求項 7 8】

前記精神病が、統合失調症、双極性うつ病又は躁鬱病、大うつ病、薬剤中毒、又はモルヒネ依存症である、請求項 7 7 に記載の方法。

【請求項 7 9】

cAMP レベルの低下を含む疾患を有する患者の治療方法であって、該患者に、以下の式 I ~ III :

## 【化 1 1】



[式中、

A、B、及びDの内の1は、N-Oであり、そして残りは、C R<sup>6</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、

1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、

1 ~ 12 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-基が、各場合において、-CH=CH-又は-C=C-により置換えられるアルキル、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、そしてここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され

、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

5 ~ 14 個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10 個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$  は、

H であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $OCF_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10 個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

R<sup>4</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1～8個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1～5個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1～4個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7～19個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-に置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一

筒所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1～8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>5</sup>-、-SO<sub>2</sub>NH-、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>-、-NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>-、-CO-、-NR<sup>5</sup>CO-、-CONR<sup>5</sup>-、-NHCONH-、-OCONH、-NHCOO-、-SCONH-、-SCSNH-、又は-NHCSNHにより置き換えられるラジカルであり；

R<sup>5</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一筒所以上置換されるアルキルであり；

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一筒所以上置換されるアリールであり、或いは

7～19個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が、6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一筒所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-により置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリールアルキルであり；

R<sup>6</sup>は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

R<sup>7</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一筒所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一筒所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一筒所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一筒所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、か

つ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$\text{R}^8$ は、

Hであり、又は

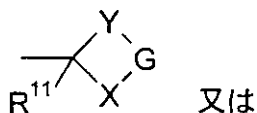
1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $\text{C}_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基が、各場合において、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられうるアルキルであり；

$\text{R}^9$ は、

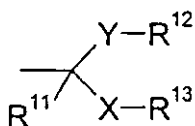
各場合において1～4個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$\text{R}^{10}$ は、 $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化12】



又は



{ 式中、

$R^{11}$  は、H 或いは 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

$R^{12}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

$R^{13}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

X 及び Y は各々独立して O 又は S であり、そして

G は、2 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである } で表される基である ]

で表される化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合体を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩の有効量を投与することを含む、前記方法。

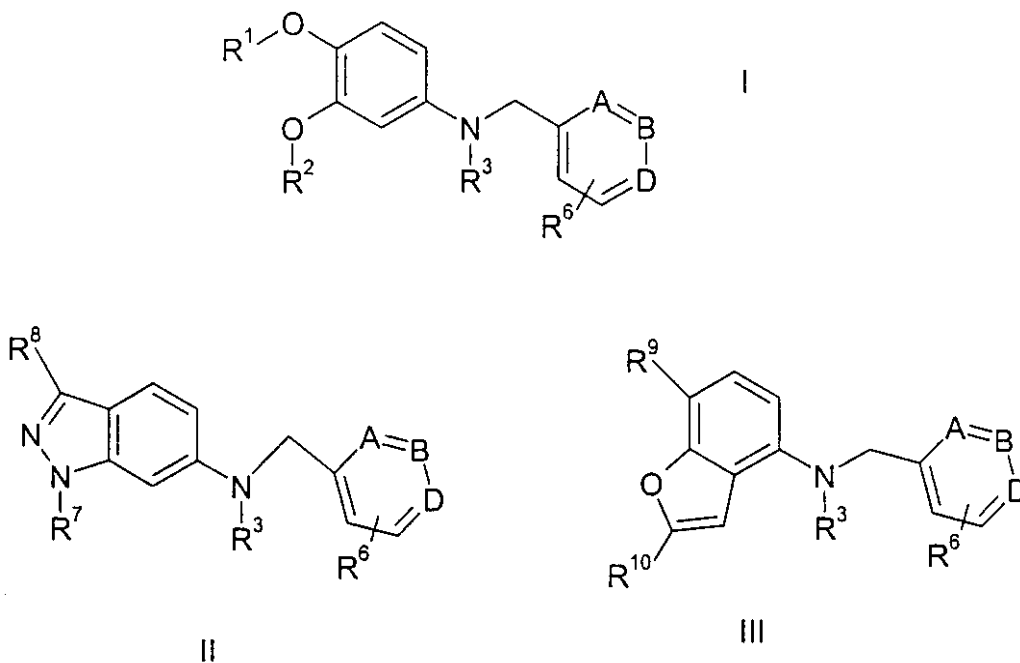
【請求項 80】

前記患者が PDE 4 酵素阻害をもたらすために治療される、請求項 70 に記載の方法。

【請求項 81】

アレルギー性又は炎症性疾患を患う患者の治療方法であって、該患者に、以下の式 I ~ III :

【化 13】



[ 式中、

A、B、及び D の内の 1 は、N-O であり、そして残りは、C R<sup>6</sup> であり、

$R^1$  は、

1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されているアルキルであり、

$R^2$  は、

1 ~ 12 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状

であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $C_{1-4}$ アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置換えられるアルキル、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、そしてここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり

5 ~ 14 個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10 個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$  は、

Hであり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシク



ロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $\text{OCF}_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4$ -L-、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10 個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $\text{R}^4$ -L-、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

$\text{R}^4$ は、

Hであり、

1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7 ~ 19 個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、

又は該アリアル成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}(\text{C})-$ に置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられるアリアルアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5~10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5~10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1~5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1~8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{NR}^5-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NH}-$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^5-$ 、 $-\text{NR}^5\text{SO}_2-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{NR}^5\text{CO}-$ 、 $-\text{CONR}^5-$ 、 $-\text{NHCONH}-$ 、 $-\text{OCONH}$ 、 $-\text{NHCOO}-$ 、 $-\text{SCONH}-$ 、 $-\text{SCSNH}-$ 、又は $-\text{NHCSNH}-$ により置き換えられるラジカルであり；

$\text{R}^5$ は、

Hであり、

1~8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-4}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-4}$ -アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

6~14個の炭素原子を有するアリアルであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリアルであり、或いは

7~19個の炭素原子を有するアリアルアルキルであって、該アリアル成分が、6~14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1~5個の炭素原子を有し、ここで該アリアルアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリアル成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}(\text{C})-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基は、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられるアリアル

ルアルキルであり；

$R^6$  は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

$R^7$  は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$ -アルキル、 $C_{1-4}$ -アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリーールであって、置換されないか、又はハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリーールであり、

アリーールアルキルであって、該アリーール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリーールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリーール成分においてハロゲン、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリーールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $CF_3O$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^8$  は、

Hであり、又は

1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $C_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各場合において、 $-CH=CH-$ 又は $-C=C-$ によ

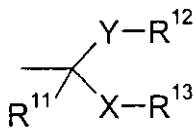
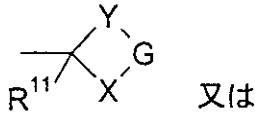
り置き換えられうるアルキルであり；

$R^9$  は、

各場合において 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$R^{10}$  は、 $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される  $-CO-C_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化 1 4】



{ 式中、

$R^{11}$  は、H 或いは 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{12}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{13}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y は各々独立して O 又は S であり；そして

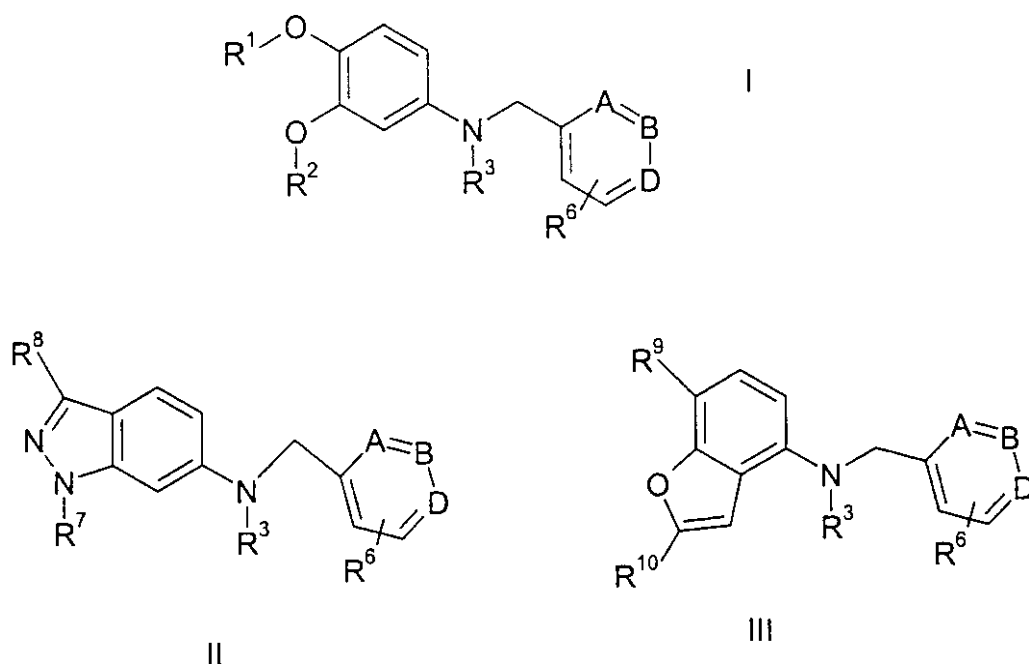
G は、2 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである } で表される基である ]

で表される単離された化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合物を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩の有効量を投与することを含む、前記方法。

【請求項 8 2】

疾患又は損傷に起因する神経変性を患う患者の治療方法であって、該患者に以下の式 I ~ IIII：

## 【化 15】



[式中、

A、B、及びDの内の1は、N-Oであり、そして残りは、C R<sup>6</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、

1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンより一箇所以上置換されているアルキルであり；

R<sup>2</sup>は、

1 ~ 12 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状であるか又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、オキソ、若しくはそれらの組合せにより一箇所以上置換され、そしてここで、場合により、1以上の-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-基が、各場合において、-CH=CH-又は-C C-により置換えられるアルキル、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4 ~ 16 個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6 ~ 14 個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1 ~ 5 個の炭素原子を有し、そしてここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され

、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2-CH_2-$ 基が、各々場合により $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

5 ~ 14 個の炭素原子を有する部分的に不飽和な炭素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環基であり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、ここで少なくとも1の環原子はN、O、又はS原子であり、該複素環が、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、ここで該複素環基成分は飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして5 ~ 10 個の環原子を有し、ここで少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子であり、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、そして1 ~ 5 個の炭素原子を有し、該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、 $OCF_3$ 、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、ここで、該アルキル成分において、1以上の $-CH_2CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-CH_2-$ 基が、各々場合により、 $-O-$ 又は $-NH-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$R^3$  は、

H であり、

3 ~ 10 個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、 $OCF_3$ 、アミノ、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、ピロリル、テトラゾール-5-イル、2(-複素環)テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアリールであり、

少なくとも1の環原子がヘテロ原子である5 ~ 10 個の環原子を有するヘテロアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、トリアルキルシリルオキシ、 $R^4-L-$ 、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるヘテロアリールであり、又は

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5 ~ 10 個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、アリール、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、オキソ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり；

R<sup>4</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり、

アルキルアミノ又はジアルキルアミノであって、各アルキル成分が、独立して1～8個の炭素原子を有するアルキルアミノ又はジアルキルアミノであり、

部分的に不飽和の炭素環-アルキル基であって、該炭素環成分が、5～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、1～5個の炭素原子を有し、該炭素環-アルキル基は、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、アルコキシ、ニトロ、シアノ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される炭素環-アルキル基であり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、アルコキシ、1～4個の炭素原子を有するアルキル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

7～19個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であり又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-に置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、そして少なくとも1の環原子が、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状であるか又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで、該複素環-アルキル基は、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一

筒所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、又はメチル又はそれらの組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

Lは、

単結合又は1～8個の炭素原子を有する二価脂肪族ラジカルであって、1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NR<sup>5</sup>-、-SO<sub>2</sub>NH-、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>-、-NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>-、-CO-、-NR<sup>5</sup>CO-、-CONR<sup>5</sup>-、-NHCONH-、-OCONH、-NHCOO-、-SCONH-、-SCSNH-、又は-NHCSNH-により置き換えられるラジカルであり；

R<sup>5</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲン、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、オキソ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロシアルコキシ、カルボキシ、アルコシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、或いは

7～19個の炭素原子を有するアリールアルキルであって、該アリール成分が、6～14個の炭素原子を有し、かつ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキルラジカルは、置換されないか、又は該アリール成分において、ハロゲン、トリフルオロメチル、CF<sub>3</sub>O、ニトロ、アミノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、シアノ、メチル、又はそれらの組合せにより置換され、ここで該アルキル成分において、1以上の-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-CH=CH-又は-C=C-により置き換えられ、及び/又は1以上の-CH<sub>2</sub>-基は、各々場合により-O-又は-NH-により置き換えられるアリールアルキルであり；

R<sup>6</sup>は、H、ハロゲン、1～4個の炭素原子を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、CN、又はヒドロキシルであり；

R<sup>7</sup>は、

Hであり、

1～8個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるアルキルであり、

3～10個の炭素原子を有するシクロアルキルであって、置換されないか、又はハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、1～4個炭素を有するアルキル、1～4個の炭素原子を有するアルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルであり、

4～16個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルであって、置換されないか、又は該シクロアルキル成分において及び/又は該アルキル成分において、ハロゲン、オキソ、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ、又はそれらの組合せにより、一箇所以上置換されるシクロアルキルアルキルであり、

6～14個の炭素原子を有するアリールであって、置換されないか、又はハロゲン、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、シアノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換されるアリールであり、

アリールアルキルであって、該アリール成分が6～14個の炭素原子を有し、か



つ該アルキル成分が、分枝状又は非分枝状であり、1～5個の炭素原子を有し、ここで該アリールアルキル・ラジカルが、置換されないか、又は該アリール成分においてハロゲン、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{OCF}_3$ 、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ニトロ、シアノ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、またはそれらの組合せにより、一箇所以上置換され、そして該アルキル成分において、1以上の $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられ、及び/又は1以上の $-\text{CH}_2-$ 基が、各々場合により $-\text{O}-$ 又は $-\text{NH}-$ により置き換えられ、及び/又は該アルキル成分が、場合によりハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、シアノ、又はその組合せにより置換されるアリールアルキルであり、

飽和、部分的に飽和、又は不飽和であり、少なくとも1の環原子がN、O、又はS原子である5～10個の環原子を有する複素環基であって、置換されないか又はハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、ニトロ、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリフルオロメチル、アミノ、アミノメチル、アミノアルキル、アミノアルコキシ・ジアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、ヒドロキサム酸、テトラゾール-5-イル、ヒドロキシアルコキシ、カルボキシ、アルコキシカルボニル、シアノ、アシル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、フェノキシ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換される複素環基であり、又は

複素環-アルキル基であって、該複素環成分が、飽和、部分的に飽和、不飽和であり、かつ少なくとも1の環原子は、N、O、又はS原子である5～10個の環原子を有し、そしてアルキル成分が、分枝状又は非分枝状でありかつ1～5個の炭素原子を有し、ここで該複素環-アルキル基が、置換されないか、又は該複素環成分において、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、ニトロ、オキソ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより一箇所以上置換され、及び/又は該アルキル成分においてハロゲン、シアノ、又はメチル又はその組合せにより置換される複素環-アルキル基であり；

$\text{R}^8$ は、

Hであり、又は

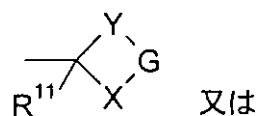
1～4個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつハロゲン、シアノ、及び/又は $\text{C}_{1-4}$ アルコキシにより1回以上置換されるアルキルであり、そして1以上の $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 基が、各場合において、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{C}=\text{C}-$ により置き換えられうるアルキルであり；

$\text{R}^9$ は、

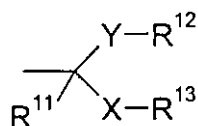
各場合において1～4個の炭素原子を有するアルコキシ又はアルキルチオであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか、又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルコキシ又はアルキルチオであり；

$\text{R}^{10}$ は、 $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換される $-\text{CO}-\text{C}_{1-4}$ -アルキルであるか、或いは以下の

【化16】



又は



{ 式中、

$R^{11}$  は、H 或いは 1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{12}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

$R^{13}$  は、1 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルであって、分枝状又は非分枝状であり、かつ置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキルであり；

X 及び Y は各々独立して O 又は S であり；そして

G は、2 ~ 7 個の炭素原子を有するアルキレンであって、置換されないか又はハロゲンにより一箇所以上置換されるアルキレンである } で表される基である ]

で表される単離された化合物或いは医薬として許容されるその塩であって、光学活性化合物が、分離されたエナンチオマーの一の形態又はそれらの混合体であり、ラセミ混合体を含みうる、前記化合物或いは医薬として許容されるその塩の有効量を投与することを含む、前記方法。

【請求項 83】

前記疾患又は損傷が脳卒中、脊椎損傷、アルツハイマー病、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症 (ALS)、又は多系統萎縮症 (MSA) である、請求項 82 に記載の方法。

【請求項 84】

前記患者が、アルツハイマー病、統合失調症、パーキンソン病、ハンチントン舞踏病、ピック病、クロイツフェルト-ヤコブ病、うつ病、加齢、頭部外傷、脳卒中、CNS 低酸素状態、大脳性老衰、多発脳梗塞性痴呆、急性神経性疾患、HIV、又は循環器疾患に起因する記憶障害を患う、請求項 74 に記載の方法。

【請求項 85】

前記化合物が、実質的に純粋なエナンチオマーの形態である、請求項 1 に記載の単離された化合物。