

【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31年1月31日(2019.1.31)

【公表番号】特表2017-538756(P2017-538756A)

【公表日】平成29年12月28日(2017.12.28)

【年通号数】公開・登録公報2017-050

【出願番号】特願2017-533183(P2017-533183)

【国際特許分類】

C 0 7 D 453/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 453/00 C S P

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 519/00 3 0 1

C 0 7 D 519/00 3 1 1

C 0 7 D 453/02

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月28日(2018.11.28)

【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

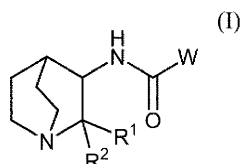
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



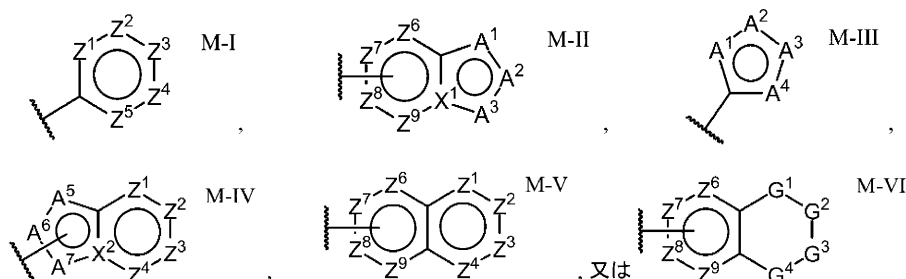
[式中:]

R^1 及び R^2 は独立に、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカルを表すか；又は $C(R^1)(R^2)$ 部分が (3 ~ 4 員) 炭素環を形成し、ここで R^1 及び R^2 は一緒になって $C_2 \sim C_3$ - アルキルジラジカルを表し；ここで前記 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカル及び前記 $C_2 \sim C_3$ - アルキルジラジカルは、- D、- F、- Cl、- Br、- I、- CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、= O、- OR^3 、又は - OCF_3 を含む 4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R^3 は独立に、- H；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカル； $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキルラジカルを表し；ここで前記 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカル及び前記 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキルラジカルは、- D、- F、- Cl、- Br、- I、- CN、= O、- OH、- $OC_1 \sim C_4$ - アルキル又は - OCF_3 を含む 4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；且つ

W は、環系 M - I、M - II、M - III、M - IV、M - V、又は M - VI：

【化2】



によって表される部分を表し、

式中：

Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、及び Z^5 は独立に、N 又は CR^4 を表し；但し、 Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、及び Z^5 のうちの 2 つ以下が N であるものとし；

R^4 は独立に、- H；- D；- F；- Cl；- Br；- I；- CN；- NO_2 ；- OR^5 ；- $N(R^5)(R^6)$ ；- $SO_2(CH_2)_mR^5$ ；- $(CO)(CH_2)_mR^5$ ；- $(CO)N(R^5)(R^6)$ ；- OCF_3 ； $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル；(3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；又はヘテロアリールラジカルを表し；又は Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、及び Z^5 のうちの隣接するメンバーが $(CR^4)(CR^4)$ である場合、前記 $(CR^4)(CR^4)$ は、前記隣接する R^4 置換基 (substituent) が一緒になって (3 ~ 6 員) - ヘテロアルキルジラジカルを表すような環を形成してもよく、前記 (3 ~ 6 員) - ヘテロアルキルジラジカル of の少なくとも 1 つの環原子は、酸素、窒素、及び硫黄からなる群から選択され、但し、前記少なくとも 1 つの環原子が窒素である場合、前記窒素は、- H、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキルラジカル、- (CO) - 分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_4$ - アルキル、又は - (SO_2) - 分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_4$ - アルキルで置換されているものとし、前記 $C_1 \sim C_4$ - アルキルラジカル及び前記 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキルラジカルは、- D、ハロゲン、= O、- OH、- $OC_1 \sim C_4$ - アルキル又は - OCF_3 を含む 4 個以

下のラジカル置換基によって置換されていてもよく、更に、但し、前記少なくとも1つの環原子が硫黄である場合、前記硫黄は0又は2個の=Oによって置換されていてもよいものとし；前記 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、前記(3~6員)-ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、前記ヘテロアリールラジカル、及び前記(3~6員)-ヘテロアルキルジラジカルの前記アルキル部分は、-D、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-NO₂、-OR⁵、-(CH₂)_mOR⁵、-N(R⁵)(R⁶)、-(CH₂)_mN(R⁵)(R⁶)、-SO₂(CH₂)_mR⁵、-(CO)(CH₂)_mR⁵、-(CO)N(R⁵)(R⁶)、-OCF₃、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカル、 $C_1 \sim C_6$ -ヒドロキシアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルラジカルを含む4個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R⁵及びR⁶は独立に、-H；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカルを表すか；又はN(R⁵)(R⁶)部分が環を形成し、ここでR⁵及びR⁶は一緒になって $C_2 \sim C_6$ -アルキルジラジカル又は(3~6員)-ヘテロアルキルジラジカルを表し；

Z⁶、Z⁷、Z⁸、及びZ⁹は独立に、N又はCR⁷を表し；但し、Z⁶、Z⁷、Z⁸、及びZ⁹のうち2つ以下がNであるものとし；

R⁷は独立に、-H；-D；-F；-Cl；-Br；-I；-CN；-NO₂；-OR⁸；-N(R⁸)(R⁹)；-SO₂(CH₂)_mR⁸；-(CO)(CH₂)_mR⁸；-(CO)N(R⁸)(R⁹)；-OCF₃； $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカル；(3~6員)-ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；ヘテロアリールラジカル；又は前記W部分をカルボニル部分に直接付加する結合を表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、前記(3~6員)-ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、-D、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-NO₂、-OR⁸、-(CH₂)_mOR⁸、-N(R⁸)(R⁹)、-(CH₂)_mN(R⁸)(R⁹)、-SO₂(CH₂)_mR⁸、-(CO)(CH₂)_mR⁸、-(CO)N(R⁸)(R⁹)、-OCF₃、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカル、 $C_1 \sim C_6$ -ヒドロキシアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルラジカルを含む4個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R⁸及びR⁹は独立に、-H；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカルを表すか；又はN(R⁸)(R⁹)部分が環を形成し、ここでR⁸及びR⁹は一緒になって $C_2 \sim C_6$ -アルキルジラジカル又は(3~6員)-ヘテロアルキルジラジカルを表し；

X¹は独立に、N又はCを表し；

A¹、A²、A³及びA⁴は独立に、N；NR¹⁰；N(CH₂)_mR¹⁰；O；S；又はCR¹¹を表し；但し、1つのA¹、A²、A³及びA⁴のみがNR¹⁰、O、又はSであるものとし；更に、但し、X¹がNである場合には、A¹、A²、及びA³は独立に、N又はCR¹¹を表すものとし；

R¹⁰は独立に、-H；-D；-SO₂(CH₂)_mR¹²；-(CO)(CH₂)_mR¹²；-(CO)N(R¹²)(R¹³)； $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカル；(3~6員)-ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；又はヘテロアリールラジカルを表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、前記(3~6員)-ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、-D、-F、-Cl、-Br、-I、-CN、-NO₂、-OR¹²、-(CH₂)_mOR¹²、-N(R¹²)(R¹³)、-(CH₂)_mN(R¹²)(R¹³)、-SO₂(CH₂)_mR¹²、-(CO)(CH₂)_mR¹³、-(CO)N(R¹²)(R¹³)、-OCF₃、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ -アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルラジカル、 $C_1 \sim C_6$ -ヒドロキシアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルラジカルを含む

4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R^{11} は独立に、- H；- D；- F；- Cl；- Br；- I；- CN；- NO_2 ；- OR^{12} ；- $N(R^{12})(R^{13})$ ；- $SO_2(CH_2)_m R^{12}$ ；- $(CO)(CH_2)_m R^{12}$ ；- $(CO)N(R^{12})(R^{13})$ ；- OCF_3 ； $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル；(3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；又はヘテロアリールラジカルを表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、前記 (3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、- D；- F；- Cl；- Br；- I；- CN；- NO_2 ；- OR^{12} ；- $(CH_2)_m OR^{12}$ ；- $N(R^{12})(R^{13})$ ；- $(CH_2)_m N(R^{12})(R^{13})$ ；- $SO_2(CH_2)_m R^{12}$ ；- $(CO)(CH_2)_m R^{12}$ ；- $(CO)N(R^{12})(R^{13})$ ；- OCF_3 ；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカルを含む 4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R^{12} 及び R^{13} は独立に、- H；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカルを表すか；又は $N(R^{12})(R^{13})$ 部分が環を形成し、ここで R^{12} 及び R^{13} は一緒になって $C_2 \sim C_6$ - アルキルラジカル又は (3 ~ 6 員) - ヘテロアルキルラジカルを表し；

X^2 は独立に、N 又は C を表し；

A^5 、 A^6 、及び A^7 は独立に、N； NR^{14} ； $N(CH_2)_m R^{14}$ ；O；S；又は CR^{15} を表し；但し、1 つの A^5 、 A^6 、及び A^7 のみが NR^{14} 、O、又は S であるものとし；更に、但し、 X^2 が N である場合には、 A^5 、 A^6 、及び A^7 は独立に、N 又は CR^{15} を表すものとし；

R^{14} は独立に、- H；- D；- $(CH_2)_m N(R^{16})(R^{17})$ ；- $SO_2(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)N(R^{16})(R^{17})$ ； $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル；(3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；ヘテロアリールラジカル；又は前記 W 部分をカルボニル部分に直接付加する結合を表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、前記 (3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、- D、- F、- Cl、- Br、- I、- CN、- NO_2 、- OR^{16} 、- $(CH_2)_m OR^{16}$ 、- $N(R^{16})(R^{17})$ 、- $(CH_2)_m N(R^{16})(R^{17})$ 、- $SO_2(CH_2)_m R^{16}$ 、- $(CO)(CH_2)_m R^{16}$ 、- $(CO)N(R^{16})(R^{17})$ 、- OCF_3 、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルを含む 4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R^{15} は独立に、- H；- D；- F；- Cl；- Br；- I；- CN；- NO_2 ；- OR^{16} ；- $N(R^{16})(R^{17})$ ；- $SO_2(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)N(R^{16})(R^{17})$ ；- OCF_3 ； $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル；(3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；ヘテロアリールラジカル；又は前記 W 部分をカルボニル部分に直接付加する結合を表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、前記 (3 ~ 6 員) - ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、- D；- F；- Cl；- Br；- I；- CN；- NO_2 ；- OR^{16} ；- $(CH_2)_m OR^{16}$ ；- $N(R^{16})(R^{17})$ ；- $(CH_2)_m N(R^{16})(R^{17})$ ；- $SO_2(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)(CH_2)_m R^{16}$ ；- $(CO)N(R^{16})(R^{17})$ ；- OCF_3 ；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカルを含む 4 個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；

R^{16} 及び R^{17} は独立に、- H；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル；C

$C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカルを表すか；又は $N(R^{16})(R^{17})$ 部分が環を形成し、ここで R^{16} 及び R^{17} は一緒になって $C_2 \sim C_6$ - アルキルジラジカル又は (3 ~ 6員) - ヘテロアルキルジラジカルを表し；

G^1 、 G^2 、 G^3 、及び G^4 は独立に、 $C(R^{18})(R^{18})$ ； $N(R^{19})$ ； $-N(CH_2)_m R^{18}$ ； O ； S ； SO_2 ；又は $(C=O)$ を表し；但し、 G^1 、 G^2 、 G^3 、及び G^4 のうちの2つ以下が $N(R^{19})$ ； $-N(CH_2)_m R^{18}$ 、 O ； S ； SO_2 ；又は $(C=O)$ を表すものとし；

R^{18} は独立に、 $-H$ ； $-D$ ； $-F$ ； $-Cl$ ； $-Br$ ； $-I$ ； $-CN$ ； $-NO_2$ ； $-OR^{19}$ ； $-N(R^{19})(R^{20})$ ； $-SO_2(CH_2)_m R^{19}$ ； $-(CO)(CH_2)_m R^{19}$ ； $-(CO)N(R^{19})(R^{20})$ ； $-OCF_3$ ； $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル；(3 ~ 6員) - ヘテロシクロアルキルラジカル；アリールラジカル；又はヘテロアリールラジカルを表し；ここで前記 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、前記 (3 ~ 6員) - ヘテロシクロアルキルラジカル、前記アリールラジカル、及び前記ヘテロアリールラジカルは、 $-D$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OR^{19}$ 、 $-(CH_2)_m OR^{19}$ 、 $-N(R^{19})(R^{20})$ 、 $-(CH_2)_m N(R^{19})(R^{20})$ 、 $-SO_2(CH_2)_m R^{19}$ 、 $-(CO)(CH_2)_m R^{19}$ 、 $-(CO)N(R^{19})(R^{20})$ 、 $-OCF_3$ 、分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカル、又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルラジカルを含む4個以下のラジカル置換基によって置換されていてもよく；且つ

R^{19} 及び R^{20} は独立に、 $-H$ ；分枝又は非分枝 $C_1 \sim C_6$ - アルキルラジカル； $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルラジカルを表すか；又は $N(R^{19})(R^{20})$ 部分が環を形成し、ここで R^{19} 及び R^{20} は一緒になって $C_2 \sim C_6$ - アルキルジラジカル又は (3 ~ 6員) - ヘテロアルキルジラジカルを表し；又は $C(R^{19})(R^{20})$ 部分が環を形成し、ここで R^{19} 及び R^{20} は一緒になって $C_2 \sim C_6$ - アルキルジラジカル又は (3 ~ 6員) - ヘテロアルキルジラジカルを表し；

m は独立に、1 ~ 6の整数を表す] によって表されるジェミナル置換キヌクリジンアミド化合物；又はその薬学的に許容可能な塩。

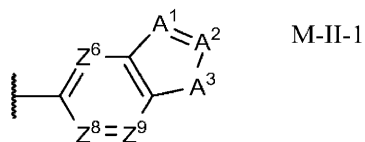
【請求項2】

Wが、環系 M - II によって表される部分を表す請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

M - II が、環系 M - II - 1：

【化3】



[式中：

Z^6 、 Z^8 、及び Z^9 は独立に、 CR^7 を表し；

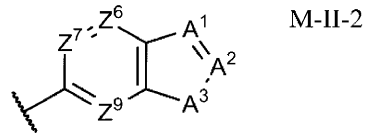
A^1 及び A^2 は独立に、 N 又は CR^{11} を表し；且つ

A^3 は NR^{10} ； O ；又は S を表す] によって表される部分を表す請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

M - II が、環系 M - II - 2：

【化 4】



[式中：

Z⁶、Z⁸、及び Z⁹ は独立に、C R⁷ を表し；

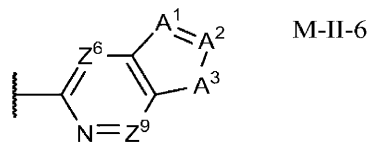
A¹ 及び A² は独立に、N 又は C R¹¹ を表し；且つ

A³ は N R¹⁰；O；又は S を表す] によって表される部分を表す請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

M - I I が、環系 M - I I - 6：

【化 5】



[式中：

Z⁶ 及び Z⁹ は独立に、C R⁷ を表し；

A¹ 及び A² は独立に、N 又は C R¹¹ を表し；且つ

A³ は N R¹⁰；O；又は S を表す] によって表される部分を表す請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

(R) - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) ベンゾフラン - 5 - カルボキサミド；

(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾフラン - 5 - カルボキサミド；

(R) - 2 - クロロ - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾフラン - 5 - カルボキサミド；

(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) - 1 H - インドール - 6 - カルボキサミド；

(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 6 - カルボキサミド；

(R) - 2 - クロロ - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 6 - カルボキサミド；

(R) - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) フロ [2 , 3 - c] ピリジン - 5 - カルボキサミド；及び

(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) フロ [2 , 3 - c] ピリジン - 5 - カルボキサミドからなる群から選択される請求項 2 に記載の化合物。

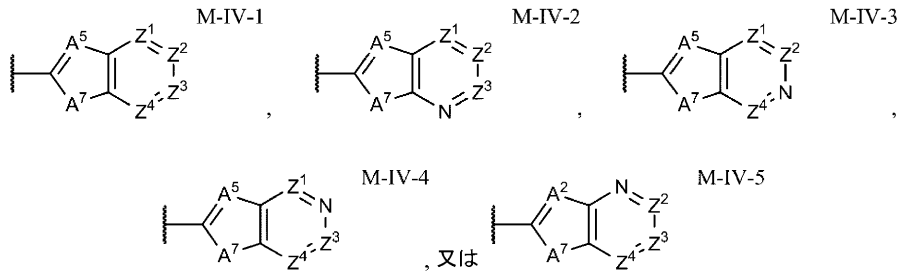
【請求項 7】

W が、環系 M - I V によって表される部分を表す請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

M - I V が、以下のうちの 1 つ：

【化 6】



[式中：

A⁵ は N 又は C R^{1 5} を表し；且つA⁷ は N R^{1 4}；N (C H₂)_m R^{1 4}；O；又は S を表す] によって表される部分を表す請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

(R) - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) - 7 - フルオロ - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - クロロ - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 7 - クロロ - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) - 6 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - N - (2 , 2 - ジメチルキヌクリジン - 3 - イル) - 7 - フルオロ - 6 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - クロロ - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - メチル - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - シクロプロピル - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - メトキシ - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - プロモ - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 7 - フルオロ - 6 - メチル - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 , 7 - ジクロロ - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (1 ' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2 ' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3 ' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 -

カルボキサミド；

(R) - 7 - シアノ - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 7 - シクロプロピル - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) - 7 - (トリフルオロメトキシ) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 5 - フルオロ - 6 - メトキシ - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；

(R) - 7 - エトキシ - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミド；及び

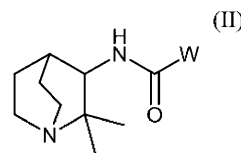
(R) - N - (1' - アザスピロ [シクロプロパン - 1 , 2' - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタン] - 3' - イル) - 7 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボキサミドからなる群から選択される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物であって、

R¹ 及び R² が独立に、非分枝 C₁ - アルキルラジカルを表し、且つ前記化合物が式 (I I) ；

【化 7】

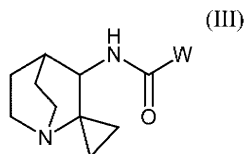


；又は

によって表されるか；又は

R¹ 及び R² が一緒になって C₂ - アルキルジラジカルを表し、且つ前記化合物が式 (I I I) ；

【化 8】



によって表される、化合物。

【請求項 11】

i) 請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩；及び

i i) 少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な担体、賦形剤又は希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項 12】

認知障害、認知障害に関連する認知欠損又は認知障害に関連する 1 つ以上の症状の治療又は改善用の請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記認知障害が、限定的認知障害 (L C I)、軽度認知障害 (M C I)、アルツハイマ

一病、アルツハイマー型認知症、統合失調症、統合失調症様障害、統合失調感情障害、妄想性障害、統合失調症の陽性症状、統合失調症の陰性症状又は認知症を伴う統合失調症を含む請求項 1 2 に記載の医薬組成物。