

【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18年11月9日(2006.11.9)

【公表番号】特表2006-501246(P2006-501246A)

【公表日】平成18年1月12日(2006.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2006-002

【出願番号】特願2004-531954(P2004-531954)

【国際特許分類】

C 07 D 209/14 (2006.01)

A 61 K 31/4045 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 P 5/24 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

C 07 D 453/06 (2006.01)

【F I】

C 07 D 209/14 C S P

A 61 K 31/4045

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/444

A 61 K 31/496

A 61 P 5/24

A 61 P 13/08

A 61 P 35/00

C 07 D 401/14

C 07 D 453/06

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月22日(2006.9.22)

【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

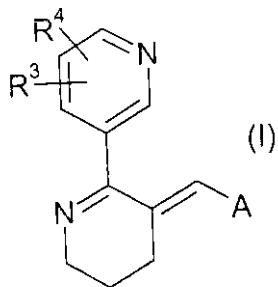
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式1:

## 【化1】



[式中、Aは、

(a)フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含むピラゾリル以外の5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び任意に更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COO R<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、ここで当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基により架橋されてもよく、

ここで当該フェニル又はピリジルは、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含み並びに当該ヘテロアリール基が、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b)フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキル

ルアルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1.8}$ -アルキル、 $\text{C}_{1.8}$ -アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

$\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原

子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

$R^5$ 及び $R^6$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合により $C_{1-4}$ のアルキル、 $C_{1-4}$ のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6~10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合により $C_{1-4}$ のアルキル、 $C_{1-4}$ のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5~14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。]で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩；

但し、3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾール；

3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-メチル-9H-カルバゾール；

3-(チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(5-プロモチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(5-メチルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
3-(チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
又はそれらの薬学的に許容される塩を除く。

【請求項 2】

Aが、ピロリル、チエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ピラゾリル、インダゾリル、フェニル又はインドリルであり、これは各々の場合において、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、ニトロ、オキシド、2~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、1~8個の炭素原子を有するアルキル-スルホニル、Ar、Ar-CO-、Ar-スルホニル、Ar-O-、アルキレン基は1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル-0-、Ar-チオ、ヘテロ、シアノ、トリフルオロメチル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化-アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化-アルコキシ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、アシル、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

Aが、ヘテロ環式基により置換されたフェニルであり、ここでAが更に、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、-COR<sup>5</sup>、もしくはこれらの組合せにより1又は複数回置換されている、請求項1記載の化合物。

【請求項 4】

3-キノリン-2-イルメチレン-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-キノリン-3-イルメチレン-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3,4-ジヒドロキノリン-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インドール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル-1H-インドール-6-カルボン酸メチルエステル；  
3-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インドール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(6-ベンジルオキシ-2H-ピロロ[3,3-c]ピリジン-1-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-インドール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(4-ベンジルオキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(2-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3H-イミダゾール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-ピロール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(5-フルオロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニ

ル；

3-(6-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(7-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(5-ベンジルオキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(2-メチル-5-ニトロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)ベンゾフラン-2-イル]フェニルメタノン；

6-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)クロメン-2-オン；

3-(5'-ブロモ-1H,1'H-[2,2']ビピロリル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフェン-2-カルボン酸；

3-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[5-(4-ブロモフェニル)-チオフェン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-メタンスルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾフラン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(5-プロピルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

4-[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)チオフェン-2-イル]フェノール；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]ジオキセピン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-(2,2-ジメチルクロマン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,2-ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(7-メトキシベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-2-ニトロフェノール；

3-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)シンノリン；

3-(3-ニトロ-4-ペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-(ピラゾール-1-イル)ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

7-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン；  
6-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン；  
3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(4-ピロリジン-1-イル-ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インダゾール-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インダゾール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(2-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(1H-ベンズトリアゾール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-1,3-ジヒドロベンズイミダゾール-2-オン、  
3-(1H-ベンズイミダゾール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(4-モルホリン-4-イル-ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-10-メチル-10H-フェノチアジン、  
7-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン、  
3-(1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(6-メトキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(4-メトキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(7-メトキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(1H-インドール-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾールジヒドロクロリド、  
3-(1-ベンジル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(5-ニトロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル、  
3-(5-クロロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル、  
3-(3-ニトロ-4-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジ

ニル；

3-(3-アミノ-4-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-アミノ-4-ピペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-アミノ-4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(5-クロロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1H-インダゾール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-ピペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(ベンゾチアゾール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-シクロプロピルメチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-エチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(ベンゾチアゾール-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-フェニル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[2-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)ピロール-1-イル]ベンゾニトリル；

3-(2-シクロヘキシルメチル-2H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(2-シクロペンチル-2H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(トランス-2,5-ジメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

[3-[4-(シス-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-チオモルホリン-4-イル-ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(1-オキソ-1-4-チオモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(1,1-ジオキソ-1-6-チオモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(2,6-ジメチルモルホリン-4-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-[1,4]ジアゼパン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-ピペラジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(トランス-2,5-ジメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(シス-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-チオモルホリン-4-イル-ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[3-(2,6-ジメチルモルホリン-4-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3-[1,4]ジアゼパン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[3-(4-フェニルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-{3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3-ピペラジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-{3-[(1S,4S)-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3-[1,4]オキサゼパン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[4-(4-フェニルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-{4-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-{4-[(1S,4S)-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(4-[1,4]オキサゼパン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[4-(3-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[4-(2-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[3-(4-エチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[4-(4-エチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-クロロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-フルオロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-クロロベンジル)-1H-ピラゾール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-フルオロベンジル)-1H-ピラゾール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(2,6-ジクロロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(3,4-ジクロロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-ビフェニル-4-イルメチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(2-フルオロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']

ビピリジニル；

3-(1-メチルプロピル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-ピリジン-4-イルメチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(1-エチルプロピル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(2-クロロ-6-フルオロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-ペンタフルオロフェニルメチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(2,4,5-トリフルオロベンジル)-1H-ピロール-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-エチル-1H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-シクロプロピルメチル-1H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-シクロブチルメチル-1H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-(1-シクロヘキシルメチル-1H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-シクロベンチル-1H-ピラゾール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[5-ブロモ-2-(4-クロロベンジル)-2H-ピラゾール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-シクロプロピルメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-シクロベンチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[(1S,4S)-5-メチル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[(1S,4S)-5-エチル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[(1S,4S)-5-シクロプロピルメチル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-メチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-シクロプロピルメチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-シクロベンチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-イソブチル-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[(1S,4S)-5-(2-メチルプロピル)-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[(1S,4S)-5-シクロベンチル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-エチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビ

ピリジニル；

シクロプロピル- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]ピペラジン-1-イル } メタノン；

1- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]ピペラジン-1-イル } プロパン-1-オン；

1- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]ピペラジン-1-イル } -2,2,2-トリフルオロエタノン；

シクロプロピル- { (1S,4S)-5-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル } メタノン；

シクロプロピル- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } メタノン；

1- { (1S,4S)-5-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル } -2,2,2-トリフルオロエタノン；

1- { (1S,4S)-5-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル } プロパン-1-オン；

1- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } -2,2,2-トリフルオロエタノン；

1- { 4-[4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } プロパン-1-オン；

シクロプロピル- { (1S,4S)-5-[3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル } メタノン；

1- { (1S,4S)-5-[3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル]-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプチ-2-イル } -2,2,2-トリフルオロエタノン；

シクロプロピル- { 4-[3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } メタノン；

1- { 4-[3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } -2,2,2-トリフルオロエタノン；

1- { 4-[3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)フェニル][1,4]ジアゼパン-1-イル } プロパン-1-オン；

3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-5'-メチル-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-5'-メチル-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

5'-メチル-3-(1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-5'-フルオロ-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

5'-フルオロ-3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

5'-フルオロ-3-(1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルメチレン)-5'-フルオロ-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(1-シクロプロピルメチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-5'-フルオロ-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

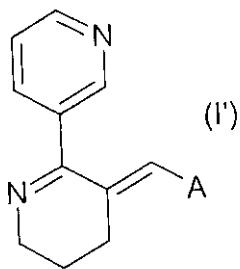
3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-6'-トリフルオロメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

から選ばれる化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩。

## 【請求項 5】

下記式 I' :

## 【化 2】



[式中、Aは、

(a)フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含むピラゾリル以外の5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニル又はピリジルは場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b)フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環と縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、6~10個の炭素原子を有するアリール、7~14個の炭素原子を有するアリールアルキル、当該アリール部分が未置換、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ、又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、 $NR^1R^2$ 、ニトロ、ヒドロキシリ、及びシアノから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、ここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、 $NR^1R^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、 $NR^1R^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、 $NR^1R^2$ 、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

$R^1$ 及び $R^2$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~10個の炭素原子を有するアリールであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合により $C_{1-4}$ のアルキル、 $C_{1-4}$ のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシリオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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

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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5~14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は複数回置換され、当該アルール基は場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】

で表される化合物；又は、それらの薬学的に許容される塩；

但し、3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾール；

3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-メチル-9H-カルバゾール；

3-(チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(5-ブロモチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(5-メチルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(4-ブロモチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

3-(チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

又はそれらの薬学的に許容される塩を除く。

#### 【請求項 6】

Aが、ピロリル、チエニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、又はインドリルであり、これは各々の場合において、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、オキシド、2~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、1~8個の炭素原子を有するアルキル-スルホニル、Ar、Ar-CO-、Ar-スルホニル、Ar-O-、アルキレン基は1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル-O-、Ar-チオ、ヘテロ、シアノ、トリフルオロメチル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化-アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化-アルコキシ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、アシル、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換されている、請求項5記載の化合物。

#### 【請求項 7】

Aが、ヘテロ環式基により置換されたフェニルであり、ここでAが更に、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換されている、請求項5記載の化合物。

#### 【請求項 8】

3-キノリン-2-イルメチレン-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-キノリン-3-イルメチレン-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3,4-ジヒドロキノリン-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-4-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル-1H-インドール-6-カルボン酸メチルエステル；  
3-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1H-インドール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(6-ベンジルオキシ-2H-ピロール[3,3-c]ピリジン-1-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-インドール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(4-ベンジルオキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(2-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(3H-イミダゾール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(1-メチル-1H-ピロール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(5-フルオロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(6-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(7-メチル-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(5-ベンジルオキシ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(2-メチル-5-ニトロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)ベンゾフラン-2-イル]フェニルメタノン；  
6-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)クロメン-2-オン；  
3-(5'-ブロモ-1H,1'H-[2,2']ビピロリル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフェン-2-カルボン酸；  
3-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[5-(4-ブロモフェニル)-チオフェン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-[1-メタンスルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
3-(ベンゾフラン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(5-プロピルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 4-[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)チオフェン-2-イル]フェノール；  
 3-(ベンゾ[b]チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(ベンゾ[b]チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ビピリジニル；  
 3-(2,2-ジメチルクロマン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(2,2-ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(7-メトキシベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-2-ニトロフェノール；  
 3-(1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)シンノリン；  
 3-(3-ニトロ-4-ペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(4-(ピラゾール-1-イル)ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 7-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン；  
 6-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン；  
 3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(3-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル

から選ばれる化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩

**【請求項 9】**

請求項 1 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含有する、医薬組成物。

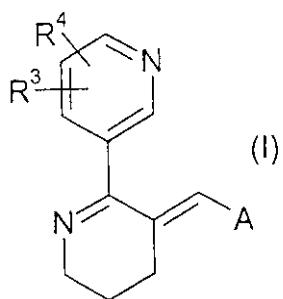
**【請求項 10】**

請求項 5 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含有する、医薬組成物。

**【請求項 11】**

式(1)：

【化 3】



[式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Het又はこれらの組合せによって1又は複数回置換され、当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基によって架橋されていてもよく、

ここで、当該フェニル又はピリジルは、場合によりハロゲン、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、 $\text{NR}^1\text{NR}^2$ 、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ及びそれらの組合せから選ばれる1以上の置換基によって更に置換されていてもよく、

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、当該ヘテロ環式環は各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{NR}^1\text{NR}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Het、又はそれらの組合せによって1又は複数回置換されていてもよく、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分は未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及びノ又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4～14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1～8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1～8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

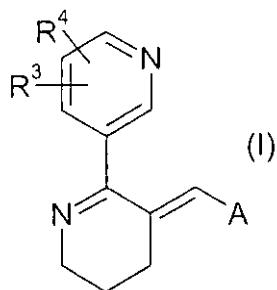
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、-7ニコチン受容体を選択的に活性化/刺激することによって患者の記憶障害を治療するための医薬組成物であって、それらを必要としている患者に投与される、前記組成物。

【請求項 1 2】

式(1)：

【化 4】



[式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Het又はこれらの組合せによって1又は複数回置換され、当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基によって架橋されていてもよく、

ここで、当該フェニル又はピリジルは、場合によりハロゲン、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、 $\text{NR}^1\text{NR}^2$ 、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ及びそれらの組合せから選ばれる1以上の置換基によって更に置換されていてもよく、

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、当該ヘテロ環式環は各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{NR}^1\text{NR}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Het、又はそれらの組合せによって1又は複数回置換されていてもよく、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、当該アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及びノ又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここでヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4～14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1～8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1～8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、精神病疾患、コリン作用性システムの機能障害を含む神経変性疾患、並びに記憶及び／又は認知障害の症状に罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

### 【請求項13】

前記患者が、痴呆及びその他の記憶喪失を伴う症状に罹患している、請求項12記載の医薬組成物。

### 【請求項14】

前記患者が、認知障害、アルツハイマー病、精神分裂病、パーキンソン病、ハンチントン病、ピック病、クロイツフェルト-ヤコブ病、鬱病、加齢、頭部外傷、卒中、CNS低酸素

症、大脳老化、加齢に起因した軽度の認知障害又は多発脳梗塞性痴呆に罹患している、請求項12記載の医薬組成物。

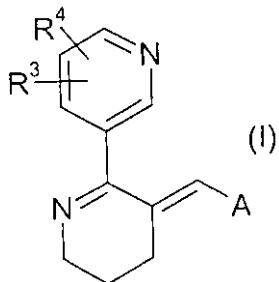
【請求項15】

前記患者が、痴呆に罹患したアルツハイマー病患者であり、アミロイドペプチドのnAChRへの結合を阻害するために、当該患者に投与される、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項16】

式(1)：

【化5】



[式中、Aは、

(a)フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Het又はこれらの組合せによって1又は複数回置換され、当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基によって架橋されていてもよく、

ここで、当該フェニル又はピリジルは、場合によりハロゲン、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、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ及びそれらの組合せから選ばれる1以上の置換基によって更に置換されていてもよく、

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、当該ヘテロ環式環は各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het、又はそれらの組合せによって1又は複数回置換されていてもよく、

(b)フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並

びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het

もしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル又は6～14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4～14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1～8個の炭素原子を有するA-r-アルキル、又はアルキル部分が1～8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

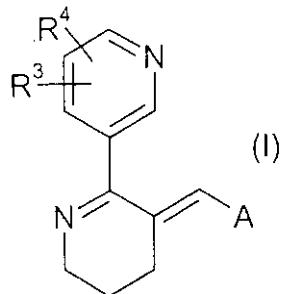
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1～4</sub>のアルキル、C<sub>1～4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1～4</sub>のアルキル、C<sub>1～4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、アルコール禁断症状のための患者の治療又は抗-中毒療法中の患者の治療のための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

## 【請求項 17】

式(1)：

## 【化6】



【式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Het又はこれらの組合せによって1又は複数回置換され、当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基によって架橋されていてもよく、

ここで、当該フェニル又はピリジルは、場合によりハロゲン、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、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ及びそれらの組合せから選ばれる1以上の置換基によって更に置換されていてもよく、

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、当該ヘテロ環式環は各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het、又はそれらの組合せによって1又は複数回置換されていてもよく、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキ

ルアルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、未置換であるか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-8}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-8}$ -アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

$\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原

子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

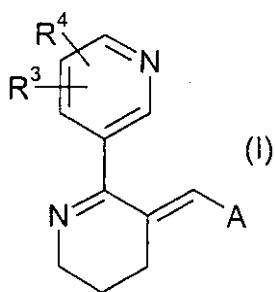
Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6~10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5~14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、卒中及び虚血に関連した損傷及びグルタミン酸誘導興奮毒性に対する神経保護を提供するために患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

【請求項 1 8】

式(1)：

【化 7】



[式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Het又はこれらの組合せによって1又は複数回置換され、当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基によって架橋されていてもよく、

ここで、当該フェニル又はピリジルは、場合によりハロゲン、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、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシ、シアノ及びそれらの組合せから選ばれる1以上の置換基によって更に置換されていてもよく、

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、当該ヘテロ環式環は各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子であるHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR<sup>1</sup>NR<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het、又はそれらの組合せによって1又は複数回置換されていてもよく、

(b)フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1-8</sub>-アルキル、C<sub>1-8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4～14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1～8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1～8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、ニコチン中毒、疼痛、時差ぼけ、肥満及び／又は糖尿病に罹患した患者を治療し、あるいは患者において禁煙を誘導するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

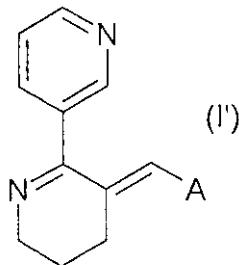
#### 【請求項 19】

前記患者が、軽度の認知障害、血管性痴呆、年齢が関連した認知減退、広く切開した心臓手術、心停止、全身麻酔に関連した健忘症、麻酔薬への曝露による記憶欠落、睡眠剥夺が誘導した認知障害、慢性疲労症候群、ナルコレプシー、AIDSに関連した痴呆、てんかんに関連した認知障害、ダウン症、アルコール中毒症に関連した痴呆、薬物／物質誘導記憶障害、ボクシング痴呆、又は動物痴呆に罹患している、請求項 12 記載の医薬組成物。

#### 【請求項 20】

下記式 I' :

【化 8】



[式中、Aは、]

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニル又はピリジルは場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環と縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、6~10個の炭素原子を有するアリール、7~14個の炭素原子を有するアリールアルキル、未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換された7~15個の炭素原子を有するアロイルによって、1又は複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、及びシアノから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、ここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

$R^1$  及び  $R^2$  は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~10個の炭素原子を有するアリールであり；

Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、アルキルス

ルホニル、フェノキシ、アシリオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシリアミド、アシリオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5~14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は複数回置換され、当該アルール基は場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】

で表される化合物；又は、それらの薬学的に許容される塩の治療上有効量を含む、-7ニコチン受容体を選択的に活性化/刺激することによって患者の記憶喪失を治療するための医薬組成物。

#### 【請求項 2 1】

請求項5記載の化合物の有効量を含む、精神病疾患、コリン作用性システムの機能障害を含む神経変性疾患、並びに記憶及び/又は認知障害の症状に罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 2】

請求項5記載の化合物の有効量を含む、痴呆又はその他の記憶喪失を伴う症状に罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 3】

請求項5記載の化合物の有効量を含む、認知障害、アルツハイマー病、精神分裂病、パーキンソン病、ハンチントン病、ピック病、クロイツフェルト-ヤコブ病、鬱病、加齢、頭部外傷、卒中、CNS低酸素症、大脳老化、加齢に起因した軽度の認知障害、又は多発脳梗塞性痴呆によるに罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 4】

請求項5記載の化合物の治療上有効量を含む、アルツハイマー病患者の痴呆を治療及び/又は予防するための医薬組成物であって、当該患者にアミロイドペプチドのnAChRへの結合を阻害するために投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 5】

請求項5記載の化合物の治療上有効量を含む、アルコール禁断症状のための患者の治療又は抗-中毒療法中の患者の治療のための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 6】

請求項5記載の化合物の治療上有効量を含む、卒中及び虚血に関連した損傷及びグルタミン酸誘導興奮毒性に対する神経保護を提供するために患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 7】

請求項5記載の化合物の有効量を含む、ニコチン中毒、疼痛、及び/又は時差ぼけに罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

#### 【請求項 2 8】

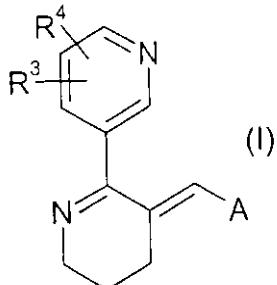
請求項5記載の化合物の有効量を含む、軽度の認知障害、血管性痴呆、年齢が関連した認知減退、広く切開した心臓手術、心停止、及び/又は全身麻酔が関連した健忘症、睡眠剥奪が誘導した認知障害、慢性疲労症候群、ナルコレプシー、AIDSに関連した痴呆、てんかんに関連した認知障害、ダウン症、アルコール中毒症に関連した痴呆、薬物/物質誘導

記憶障害、ボクシング痴呆、又は動物痴呆に罹患した患者を治療するための医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。

【請求項 29】

下記式 I :

【化 9】



[式中、Aは、]

(a) フェニル又はピリジルであり、各々O、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び任意に更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、ここで当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基により架橋されてもよく、

ここで当該フェニル又はピリジルは、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、及び/又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含み並びに当該ヘテロアリール基が、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシア

ルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシリ、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシリ、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシリアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシリアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシリアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素

原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2～8個の炭素原子を有するアルケニル、2～8個の炭素原子を有するアルキニル、3～10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4～14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1～8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1～8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1-4</sub>のアルキル、C<sub>1-4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩；

但し、3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾール；3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-メチル-9H-カルバゾール；又はそれらの薬学的に許容される塩を除く；

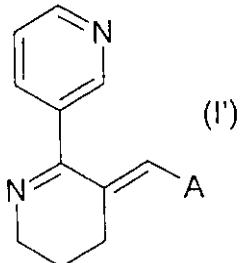
更に、式1の化合物のAが5～7員のヘテロ環式環によって置換されたフェニルであるとき

に、当該5~7員のヘテロ環式環はピラゾリルでない。

【請求項 30】

下記式I'：

【化 10】



[式中、Aは、

(a)フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニル又はピリジルは場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b)フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環と縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、6~10個の炭素原子を有するアリール、7~14個の炭素原子を有するアリールアルキル、当該アリール部分が未置換、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ、又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシリル、及びシアノから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、ここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c) チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該チエニル、ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~10個の炭素原子を有するアリールであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5~14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は複数回置換され、当該アルール基は場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】

で表される化合物；又は、それらの薬学的に許容される塩；

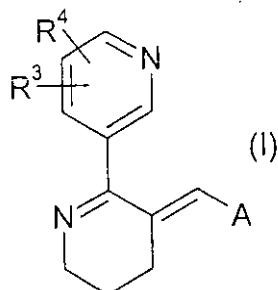
但し、3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾール；3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-メチル-9H-カルバゾール；又はそれらの薬学的に許容される塩を除く；

更に、式Iの化合物のAが5~7員のヘテロ環式環によって置換されたフェニルであるときに、当該5~7員のヘテロ環式環はピラゾリルでない。

【請求項 3 1】

下記式I：

【化 1 1】



【式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々O、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び任意に更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、ここで当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基により架橋されてもよく、

ここで当該フェニル又はピリジルは、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシリル、シアノ、及び/又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含み並びに当該ヘテロアリール基が、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシリル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシリル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

(c) ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここでヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原

子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6~10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5~14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又

は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はこれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 3 2】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾフラニルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 3】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾジオキシニルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 4】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、クロマニルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 5】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾジオキセピニルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 6】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより置換された、インドリルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 7】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換されている、ベンゾオキサジニルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 8】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、インダゾリルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 3 9】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ベンゾイミダゾリルである、請求項3\_1記載の化合物。

【請求項 4 0】

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル

、Arもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、フェニルピペラジニルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_1】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ベンゾチアゾリルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_2】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、未置換又はハロゲン、ハロゲン化アルキルもしくはハロゲン化アルコキシにより置換されたアリール、未置換又はハロゲン、ハロゲン化アルキル、もしくはハロゲン化アルコキシにより置換されたアリールアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ピロリルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_3】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、未置換又はハロゲン、ハロゲン化アルキル、もしくはハロゲン化アルコキシにより置換されたAr、未置換又はハロゲン、ハロゲン化アルキル、もしくはハロゲン化アルコキシにより置換されたアリールアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ピラゾリルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_4】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジアザビシクロヘプチルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_5】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ベンゾジオキソリルである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_6】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾジオイニルである、請求項3\_1記載の化合物。

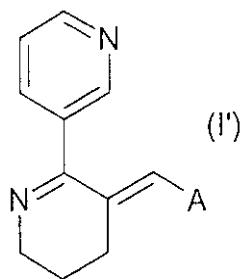
**【請求項4\_7】**

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が各々Hである、請求項3\_1記載の化合物。

**【請求項4\_8】**

下記式I'：

【化12】



[式中、Aは、]

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニル又はピリジルは場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環と縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、6~10個の炭素原子を有するアリール、7~14個の炭素原子を有するアリールアルキル、当該アリール部分が未置換、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ、又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、及びシアノから選択された1又は複数の置換基により置換され、又は

(c) ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリ

ル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該ピロリル、ジエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシリ、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~10個の炭素原子を有するアリールであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシリ、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び場合によりハロゲン、アルキル、ヒドロキシ、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、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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5~14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は

複数回置換され、当該アルール基は場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】

で表される化合物；又は、それらの薬学的に許容される塩。

**【請求項 4 9】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾフラニルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 0】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾジオキシニルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 1】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、クロマニルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 2】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ジヒドロベンゾジオキセピニルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 3】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキルもしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、インドリルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 4】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ベンゾオキサジニルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 5】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、インダゾリルである、請求項4 8記載の化合物。

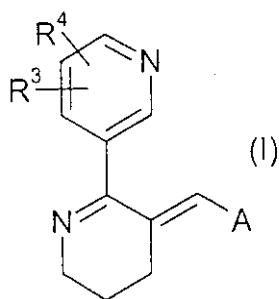
**【請求項 5 6】**

Aが、未置換、又はアルキル、アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヒドロキシル、ヒドロキシアルキル、もしくはそれらの組合せにより1又は複数回置換された、ベンゾイミダゾリルである、請求項4 8記載の化合物。

**【請求項 5 7】**

下記式1：

## 【化13】



[式中、Aは、]

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び任意に更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、アルキルチオ、アルキルスルフィル、アルキルスルホニル、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、ここで当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基により架橋されてもよく、

ここで当該フェニル又はピリジルは、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、及び/又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含み並びに当該ヘテロアリール基が、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキ

ルアルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、 $\text{C}_{1-8}$ -アルキル、 $\text{C}_{1-8}$ -アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c)ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここでヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、 $\text{COR}^5$ 、 $\text{COOR}^5$ 、 $\text{CONR}^5\text{R}^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 $\text{NR}^1\text{R}^2$ 、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

$\text{R}^1$ 及び $\text{R}^2$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

$\text{R}^3$ 及び $\text{R}^4$ は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原

子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

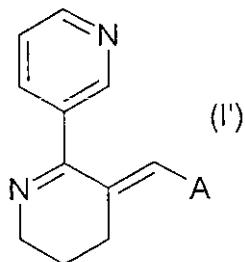
Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6~10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合せによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5~14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩；但し、Aはカルバゾールではない。

### 【請求項 5 8】

下記式I'：

## 【化14】



[式中、Aは、]

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び場合により更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニル又はピリジルは場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ又はそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環と縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、6~10個の炭素原子を有するアリール、7~14個の炭素原子を有するアリールアルキル、当該アリール部分が未置換、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ、又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、及びシアノから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリー

ル基又はヘテロアリール基と縮合され、ここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c)ピロリル、ジエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該ピロリル、ジエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリール基は、各々0、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~10個の炭素原子を有するアリールであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、

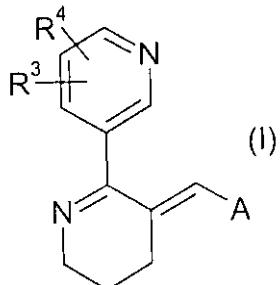
されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5~14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は複数回置換され、当該アルール基は場合により1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又は、それらの薬学的に許容される塩；但し、Aはカルバゾールでない。

【請求項 5 9】

下記式I：

【化 1 5】



【式中、Aは、

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾフラニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾジオキシニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、クロマニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾジオキセピニル (dihydrobenzodioxepinyl) であり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、インドリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、4-(4-モルホリニル)-フェニルであ、4-(ピロリジン-1-イル)-フェニル、4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル、3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル、4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル、4-(チオモルホリン-4-イル)-フェニル、4-(1,4-ジアゼパン-1-イル)-フェニル、又は4-(1,4-オキサゼパン-4-イル)-フェニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ベンゾオキサジニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、インダゾリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ベンゾイミダゾリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、フェニルピペラジニルであり；



キル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジアザビシクロヘプチルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ベンゾジオキソリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾジオイニルであり；並びに

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>は、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1~8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1~8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6~10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6~14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3~10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1~4</sub>のアルキル、C<sub>1~4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1~4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~4個の炭素原子を

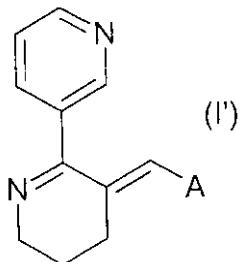
有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシリルアミド、アシリルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5~14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6~14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物、又は、それらの薬学的に許容される塩。

**【請求項 60】**

下記式I'：

**【化16】**



[式中、Aは、

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾフラニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾジオキシニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、クロマニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原

子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ジヒドロベンゾジオキセピニル (dihydrobenzodioxepinyl) であり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、インドリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、4-(4-モルホリニル)-フェニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ベンズオキサジニルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、インダゾリルであり；

未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、カルボキシ、オキソ、ニトロ、アルコキシ部分が1~8個の炭素原子を有するアルコキシカルボニル、シアノ、トリフルオロメチル、アミノ、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、アルキル部分の各々が1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、ヒドロキシル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換された、ベンゾイミダゾリルであり；並びに

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンである。】

で表される化合物、又は、それらの薬学的に許容される塩。

**【請求項 6 1】**

請求項 2 9 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

**【請求項 6 2】**

請求項 3 0 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

**【請求項 6 3】**

請求項 3 1 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

**【請求項 6 4】**

請求項 4 8 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

**【請求項 6 5】**

請求項 5 7 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 6 6】

請求項 5 8 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 6 7】

請求項 5 9 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 6 8】

請求項 6 0 記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 6 9】

前記化合物が、ハイドロクロリド又はハイドロプロミドの塩の形態である、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 7 0】

3-(5'-ブロモ-1H,1'H-[2,2']ビピロリル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフェン-2-カルボン酸ジヒドロクロリド；

3-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[5-(4-ブロモフェニル)-チオフェン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[1-メタンスルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾフラン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(5-ブロピルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

4-[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)チオフェン-2-イル]フェノールジヒドロプロミド；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,2-ジメチルクロマン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,2-ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(7-メトキシベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾ[1,3]ジオキソール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-9-エチル-9H-カルバゾールジヒドロクロリド；

3-(5-クロロ-1H-インドール-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル

ジヒドロクロリド；

3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド

から選ばれる、請求項6 9記載の化合物。

【請求項7 1】

ハイドロクロリド又はハイドロプロミドの塩の形態である、請求項8記載の化合物。

【請求項7 2】

3-(5'-ブロモ-1H,1'H-[2,2']ビピロリル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフェン-2-カルボン酸ジヒドロクロリド；

3-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[5-(4-ブロモフェニル)-チオフェン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[1-(トルエン-4-スルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-[1-メタンスルホニル-1H-インドール-3-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾフラン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(5-ブロピルチオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

4-[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ビピリジニル-3-イリデンメチル)チオフェン-2-イル]フェノールジヒドロプロミド；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-2-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(ベンゾ[b]チオフェン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,2-ジメチルクロマン-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(2,2-ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド；

3-(7-メトキシベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニルジヒドロクロリド

から選ばれる、請求項7 1記載の化合物。

【請求項7 3】

3-(3-ニトロ-4-ピペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-(ピラゾール-1-イル)ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-ピロリジン-1-イル)ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジ

ニル；

3-(2-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-ニトロ-4-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-アミノ-4-ピロリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-アミノ-4-ピペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-アミノ-4-モルホリン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-ピペリジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(trans-2,5-ジメチルピペラジン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(cis-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(1-オキソ-1-4-チオモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(1,1-ジオキソ-1-6-チオモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(2,6-ジメチルモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(4-ピペラジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(trans-2,5-ジメチルピペラジン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(cis-3,5-ジメチルピペラジン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(2,6-ジメシリモルホリン-4-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-[1,4]ジアゼパン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[3-(4-フェニルピペラジン-1-イル)-ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-ピペラジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{3-[(1S,4S)-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-(3-[1,4]オキセパン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-[4-(4-フェニルピペラジン-1-イル)ベンジリデン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3-{4-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]ベンジリデン}-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

3- { 4- [(1S,4S)-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (4-[1,4]オキゼパン-4-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (3-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (2-メチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [3- (4-エチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-エチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-シクロプロピルメチルピペラジン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- { 4- [(1S,4S)-5-メチル-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- { 4- [(1S,4S)-5-エチル-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- { 4- [(1S,4S)-5-シクロプロピルメチル-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-メチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-シクロプロピルメチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-シクロペンチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-イソブチル-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- { 4- [(1S,4S)-5-(2-メチルプロピル)-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- { 4- [(1S,4S)-5-シクロペンチル-2,5-ジアザビシクロ [2.2.1]ヘプト-2-イル]ベンジリデン } -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- [4- (4-エチル[1,4]ジアゼパン-1-イル)-ベンジリデン] -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；

及びそれらの薬学的に許容される塩から選ばれる、請求項4記載の化合物。

【請求項74】

3- (4-(ピラゾール-1-イル)ベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (3-モルホリン-4-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (3-ピロリジン-1-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (4-ピロリジン-1-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (2-モルホリン-4-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (4-モルホリン-4-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (3-ペペリジン-1-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (4-[1,4]ジアゼパン-1-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；  
 3- (4-ピペラジン-1-イルベンジリデン) -3,4,5,6-テトラヒドロ [2,3']ビピリジニル；

3-(3-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(3-[1,4]ジアゼパン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(3-ピペラジン-1-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(3-[1,4]オキサゼパン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 3-(4-[1,4]オキサゼパン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；  
 5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジルデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジニル；

及びそれらの薬学的に許容される塩から選ばれる、請求項7 3記載の化合物。

**【請求項7 5】**

3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(2-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(4-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(3-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；

及びそれらの薬学的に許容される塩から選ばれる、請求項7 4記載の化合物。

**【請求項7 6】**

ジヒドロクロリド塩の形態である、請求項7 3記載の化合物。

**【請求項7 7】**

ジヒドロクロリド塩の形態である、請求項7 4記載の化合物。

**【請求項7 8】**

ジヒドロクロリド塩の形態である、請求項7 5記載の化合物。

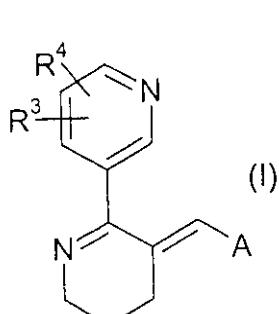
**【請求項7 9】**

3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(2-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(4-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 3-(3-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル；  
 5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ビピリジル； 及び  
それらの薬学的に許容される塩から選ばれる、請求項7 8記載の化合物。

**【請求項8 0】**

下記式I：

**【化17】**



[式中、Aは、

(a) フェニル又はピリジルであり、各々0、S、又はN環原子を含む5~7員のヘテロ環式環により置換され、及び任意に更にN環原子を含み、ここで当該ヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びに未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、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、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、ここで当該ヘテロ環式環は、1~3個の炭素原子を有する二価のアルキレン基により架橋されてもよく、

ここで当該フェニル又はピリジルは、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含み並びに当該ヘテロアリール基が、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含むアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、並びにここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Het又はそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

(b) フェニル又はピリジルであり、各々の場合において、各々0、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含む5~7員のヘテロ環式環に縮合され、二環式基を形成し、ここで当該縮合されたヘテロ環式環は、完全に不飽和、部分的に飽和又は完全に飽和であり、並びにここで当該二環式基は、未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、オキソ、チオ、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、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、アリール部分が未置換であるか、又はハロゲン、C<sub>1~8</sub>-アルキル、C<sub>1~8</sub>-アルコキシ、ニトロ、カルボキシ、ヒドロキシル、フェノキシもしくはベンジルオキシ又はそれらの組合せにより1又は複数回置換される7~15個の炭素原子を有するアロイルにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該フェニルもしくはピリジル及び/又は縮合された5~7員のヘテロ環式環は、場合により更に、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、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ及びそれらの組合せから選択された1又は複数の置換基により置換され、並びに

ここで当該5~7員のヘテロ環式環は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリー

ル基は、各々O、S、及びNから選択された1~3個のヘテロ原子を含み、ここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、又は

(c)ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル又はイソチアゾリルであり、各々未置換であるか、又は1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され、

ここで当該ピロリル、ジチエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、又はイソチアゾリル基は、場合により、各々の場合において5~10個の環原子を含む別のアリール基又はヘテロアリール基に縮合され、及びここでヘテロアリール基は、各々O、S、及びNから選択される1~3個のヘテロ原子を含み、及びここで当該アリール基又はヘテロアリール基は、場合により、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキル、COR<sup>5</sup>、COOR<sup>5</sup>、CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>、ニトロ、チオ、Ar、Hetもしくはそれらの組合せにより、1もしくは複数回、置換され；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル又は6~14個の炭素原子を有するアリールであり；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、又はハロゲンであり；

R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、2~8個の炭素原子を有するアルケニル、2~8個の炭素原子を有するアルキニル、3~10個の炭素原子を有するシクロアルキル、4~14個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、Ar、Het、アルキル部分が1~8個の炭素原子を有するAr-アルキル、又はアルキル部分が1~8個の炭素原子を有するHet-アルキルであり；

Arは、6~14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1~8個の炭素原子を有するアルキル、1~8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1~8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1~8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2~8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3~8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ

、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルホニル、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1～4</sub>のアルキル、C<sub>1～4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルアミノ、6～10個の炭素原子を有するアリール、アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールオキシ、当該アリール部分が6～14個の炭素原子を有し及び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、フェノキシ、アシルオキシ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたアリールチオ、シクロアルキル基が3～10個の炭素原子を有し及び場合によりC<sub>1～4</sub>のアルキル、C<sub>1～4</sub>のアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、1～4個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～4個の炭素原子を有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子である5～14個の環原子を有し、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール、又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され、当該アルール基は、場合により置換されたアリール、1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。】で表される化合物；又はそれらの薬学的に許容される塩の有効量を含む、炎症性疾患に罹患した患者を治療するために医薬組成物であって、当該患者に投与される、前記組成物。