

【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 0 7 D 209/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 453/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 209/14 C S P

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 401/14

C 0 7 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

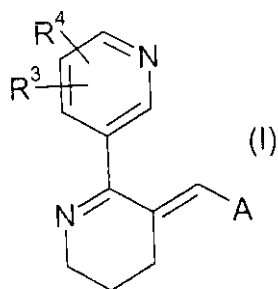
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式I:

【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リル、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、NR¹R²、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リル、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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リル、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^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、アリアル部分が未置換であるか、又はハロゲン、 C_{1-8} -アルキル、 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^1R^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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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6～14個の炭素原子を有するアリアルであり；

R^3 及び 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_{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、当該アリール基は、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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

3-(4-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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

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 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、-COR⁵、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 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']ピピリジニル；
 3-キノリン-3-イルメチレン-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；

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'-プロモ-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-プロモフェニル)-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[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-プロモ-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル;
 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']ピピリジニル;
 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']ピピリジニル;
 3-(ベンゾ[1,3]ジオキサール-4-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル;
 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']ピピリジニル;
 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']ピピリジニル;
 3-(1H-インダゾル-6-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル;
 3-(1H-インダゾル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジニル、
 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']ピピリジ

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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 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']ピピリジニル ;
- 3-(1-ピフェニル-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']ピピリジニル ;
- 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-シクロペンチル-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-プロモ-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-シクロペンチルピペラジン-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-シクロペンチル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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]ジオキサール-5-イルメチレン)-5'-メチル-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

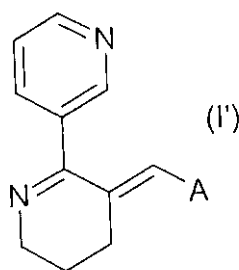
3-(1H-インドール-3-イルメチレン)-6'-トリフルオロメチル-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル

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^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、

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^1R^2 、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^1R^2 、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^1R^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、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^2 、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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、ここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^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、ヒドロキシル、 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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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^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アルであり；

Arは、6～14個の炭素原子を含むアリアル基であり、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、アリアル部分が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アルオキシ、当該アリアル部分が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、ヒドロキシアシル、ヒドロキシアシルコキシ、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C₁₋₄のアルキル、C₁₋₄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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

3-(4-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']ピピリジル；

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']ピピリジル；

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-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シル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアシルコキシ、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、ヒドロキシアシル、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']ピピリジニル；

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

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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル-3-イリデンメチル)クロメン-2-オン ;
3-(5'-プロモ-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']ピピリジニル ;
5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル ;
3-[5-(4-プロモフェニル)-チオフェン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ-[2,3']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピピリジニル ;
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']ピ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']ピピリジニル；
 4-[5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 3-(5-プロモ-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']ピピリジニル；
 4-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル；
 3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-3-イリデンメチル)シンノリン；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 7-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル-3-イリデンメチル)-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン；
 3-(3-ホルホルリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル；
 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']ピピリジニル

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む、医薬組成物。

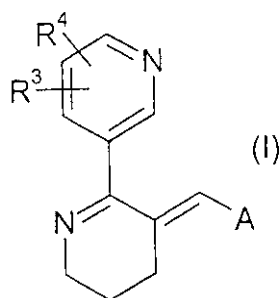
【請求項 10】

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む、医薬組成物。

【請求項 11】

式 (I)：

【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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹NR²、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るともよく、

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、NR¹NR²、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るともよく、

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ール基又はヘテロアリーール基と縮合され、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、ここで当該アリーール基又はヘテロアリーール基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR¹NR²、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るともよく、

(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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^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、 COR^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素原子を有するアリールであり；

R^3 及び 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；

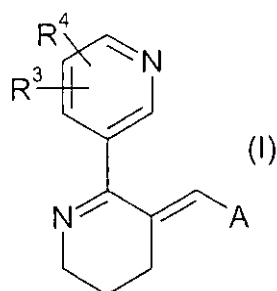
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭素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、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_{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、当該アリール基は、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 12】

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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹NR²、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るとよく、

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、NR¹NR²、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るとよく、

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ール基又はヘテロアリーール基と縮合され、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、ここで当該アリーール基又はヘテロアリーール基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR¹NR²、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るとよく、

(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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^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、 COR^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素原子を有するアリールであり；

R^3 及び 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、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、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_{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、当該アルキル基は、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 1 3】

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 1 2 記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

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 1 2 記載の医薬組成物。

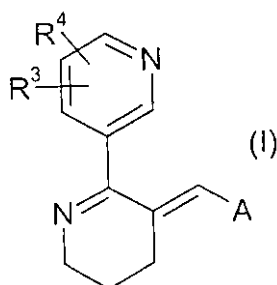
【請求項 1 5】

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 nA ChR 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 1 2 記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

式 (I) :

【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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹NR²、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、NR¹NR²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR¹NR²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、C₁₋₈-アルキル、C₁₋₈-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ロ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、NR¹R²、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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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6～14個の炭素原子を有するアリールであり；

R^3 及び 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；

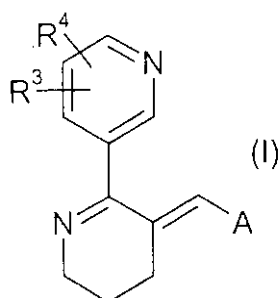
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭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

【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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹NR²、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、NR¹NR²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR¹NR²、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^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、 C_{1-8} -アルキル、 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ロ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^1R^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、 COR^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素原子を有するアリールであり；

R^3 及び 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、

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；

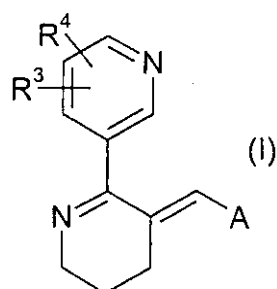
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭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_{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、当該アリール基は、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 18】

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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹NR²、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るともよく、

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、NR¹NR²、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るともよく、

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ール基又はヘテロアリーール基と縮合され、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、ここで当該アリーール基又はヘテロアリーール基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシ、NR¹NR²、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るともよく、

(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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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_{1-8} -アルキル、 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ロ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^1R^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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素原子を有するアリアルであり；

R^3 及び 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、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、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_{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、当該アルキル基は、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。

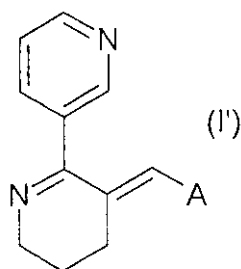
【請求項19】

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^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、

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^1R^2 、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^1R^2 、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^1R^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、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^2 、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リル、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^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リル、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^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、

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
するヒドロキシアリル、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^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；

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
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リル、2～8個
の炭素原子を有するヒドロキシアリル、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
ロキシアリル、ヒドロキシアリル、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、ヒドロキシアリル、ヒドロキシアリル、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C₁₋₄のアルキル、C₁₋₄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、当該アルキル基は場合により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】

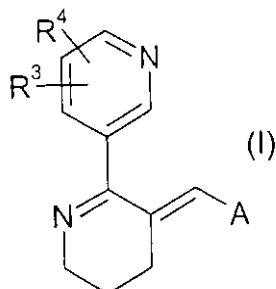
請求項 5 記載の化合物の有効量を含む、軽度の認知障害、血管性痴呆、年齢に関連した認知減退、広く切開した心臓手術、心停止、及び/又は全身麻酔に関連した健忘症、睡眠剥奪が誘導した認知障害、慢性疲労症候群、ナルコレプシー、AIDSに関連した痴呆、てんかんに関連した認知障害、ダウン症、アルコール中毒症に関連した痴呆、薬物/物質誘導

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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、NR¹R²、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アル基が、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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、並びにここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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

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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^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、アリアル部分が未置換であるか、又はハロゲン、 C_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素

原子を有するアリールであり；

R^3 及び 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_{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、当該アルキル基は、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']ピピリジニル-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']ピピリジニル-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；

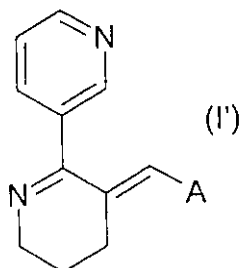
更に、式Iの化合物のAが5～7員のヘテロ環式環によって置換されたフェニルであるとき

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 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^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、

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^1R^2 、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^1R^2 、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^1R^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、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^2 、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リール、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^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リール、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^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、

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リール、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^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；

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リール、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアリール、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、ヒドロキシアリール、ヒドロキシアリール、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、ヒドロキシアリル、ヒドロキシアリコキシ、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_{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、当該アルキル基は場合により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；

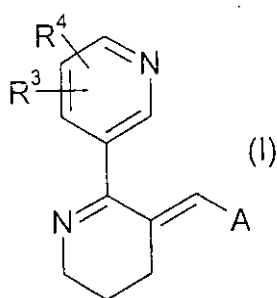
但し、3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル)-9-エチル-9H-カルバゾール；3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル)-3-イリデンメチル)-9-メチル-9H-カルバゾール；又はそれらの薬学的に許容される塩を除く；

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31】

下記式I：

【化11】



[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リル、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^5 、 $COOR^5$ 、 $CONR^5R^6$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^2 、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^1R^2 、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アル基が、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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、並びにここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^2 、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^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、アリアル部分が未置換であるか、又はハロゲン、 C_{1-8} -アルキル、 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ロ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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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リル、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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；

R¹及びR²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；

R³及びR⁴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；

R⁵及びR⁶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リル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアリルコキシ、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C₁₋₄のアルキル、C₁₋₄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、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、ヒドロキシアリル、ヒドロキシアリルコキシ、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、ヒドロキシアリル、ヒドロキシアリルコキシ、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C₁₋₄のアルキル、C₁₋₄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。

【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、ジアザピ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ニルである、請求項3_1記載の化合物。

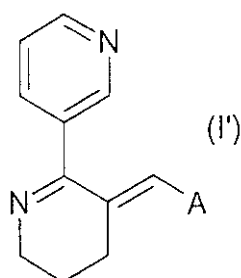
【請求項4_7】

R^3 及び R^4 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 1 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^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、

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^1R^2 、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^1R^2 、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^1R^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、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^2 、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、ヒドロキシル、 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、

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、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^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；

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_{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49】

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48記載の化合物。

【請求項50】

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48記載の化合物。

【請求項51】

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48記載の化合物。

【請求項52】

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48記載の化合物。

【請求項53】

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48記載の化合物。

【請求項54】

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48記載の化合物。

【請求項55】

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48記載の化合物。

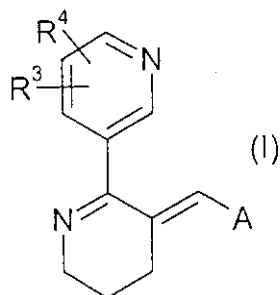
【請求項56】

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48記載の化合物。

【請求項57】

下記式I：

【化 1 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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 NR^1R^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、アリアル部分が未置換であるか、又はハロゲン、 C_{1-8} -アルキル、 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^1R^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アル基又はヘテロアリアル基と縮合され、及びここで当該ヘテロアリアル基は、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、ここで当該アリアル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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)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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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アル基又はヘテロアリアル基に縮合され、及びここでヘテロアリアル基は、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アル基又はヘテロアリアル基は、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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6～14個の炭素原子を有するアリアルであり；

R^3 及び 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、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^5 、 COOR^5 、 CONR^5R^6 、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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；

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；

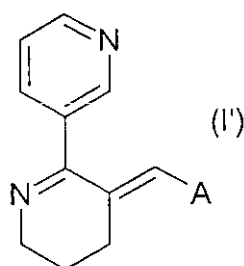
Arは、6～14個の炭素原子を含むアリール基であり、これは、未置換であるか、もしくは1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、ハロゲン、アルキル部分が各々1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、アミノ、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルキル、1～8個の炭素原子を有するハロゲン化アルコキシ、1～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル、2～8個の炭素原子を有するヒドロキシアルコキシ、3～8個の炭素原子を有するアルケニルオキシ、1～8個の炭素原子を有するアルキルチオ、1～8個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル、1～8個の炭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_{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、当該アリール基は、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58】

下記式I'：

【化 1 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、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、 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、

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^1R^2 、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^1R^2 、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^1R^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、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_{1-8} -アルキル、 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、 NR^1R^2 、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、ヒドロキシル、 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)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、ヒドロキシル、 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、

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、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^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；

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_{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

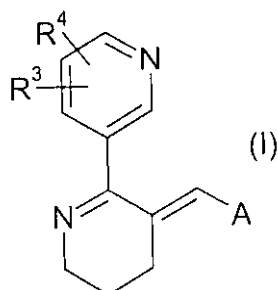
Hetは、ヘテロ環式基であり、これは完全に飽和、部分的に飽和又は完全に不飽和であり、5～14個の環原子を有し、ここで少なくとも1個の環原子は、N、O又はS原子であり、これは、ハロゲン、6～14個の炭素原子を有するアリール又はこれらの組合せにより1又は複数回置換され、当該アルキル基は場合により1～8個の炭素原子を有するアルキル、1～8個の炭素原子を有するアルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、1～8個の炭素原子を有するモノアルキルアミノ、各アルキル基が1～8個の炭素原子を有するジアルキルアミノ、又はそれらの組合せにより置換される。]

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59】

下記式I：

【化15】



[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、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；

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ルアル

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ニルであり；並びに

R^3 及び 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 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_{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、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_{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

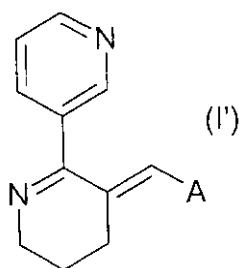
有するジアルキルアミノ又はそれらの組み合わせによって1又は複数回置換されたシクロアルキルオキシ、スルホ、スルホニルアミノ、アシルアミド、アシルオキシ又はそれらの組合せにより、1又は複数回、置換され；並びに

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、当該アリール基は、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^3 及び 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ブ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romo-1H,1'H-[2,2']ピピロリル-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニルジヒドロクロリド；

5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフエン-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']ピピリジニルジヒドロクロリド；

3-[5-(4-ブromoフェニル)-チオフエン-2-イルメチレン]-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピ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']ピ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']ピ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']ピピリジニルジヒドロクロリド；

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

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

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

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

3-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-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']ピピリジニル

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

5-(5,6-ジヒドロ-4H-[2,3']ピピリジニル-3-イリデンメチル)-1H-チオフエン-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']ピピリジニルジヒドロクロリド；

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

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

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

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

3-(ベンゾ[b]チオフエン-3-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピ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']ピ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']ピ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']ピ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]ジオキサール-5-イルメチレン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニルジヒドロクロリド；

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

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル；

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

3-(3-[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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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

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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;

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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;
 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']ピピリジニル ;

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 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】

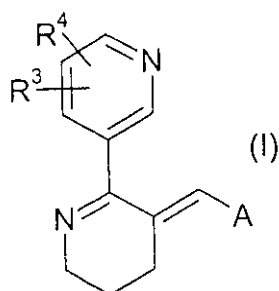
3-(3-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ;
 3-(2-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ;
 3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ;
 3-(4-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ;
 3-(3-チオモルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ;
 5'-フルオロ-3-(4-モルホリン-4-イルベンジリデン)-3,4,5,6-テトラヒドロ[2,3']ピピリジニル ; 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 8 記載の化合物。

【請求項 8 0】

下記式 I :

【化 1 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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、C₁₋₈-アルキル、C₁₋₈-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、NR¹R²、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、3～1
0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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ
、ヒドロキシル、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵
、CONR⁵R⁶、ハロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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、COR⁵、COOR⁵、CONR⁵R⁶、ハ
ロゲン、カルボキシ、シアノ、ヒドロキシル、NR¹R²、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；

R¹及びR²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；

R³及びR⁴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；

R⁵及びR⁶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
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_{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。