

【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16日(2006.11.16)

【公表番号】特表2006-504714(P2006-504714A)

【公表日】平成18年2月9日(2006.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-006

【出願番号】特願2004-541111(P2004-541111)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 403/06 C S P

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月29日(2006.9.29)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

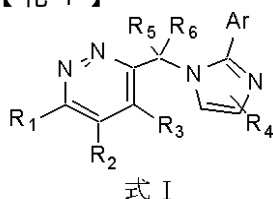
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物またはその医薬上許容される形態：

【化 1】

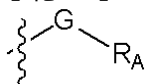


[式中、

R_1 は以下から選択される：

- (a) 水素、ハロゲン、ニトロおよびシアノ；および、
 (b) 下記式の基：

【化 2】



ここで：

G は、結合、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $-N(R_B)-$ 、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=O)N(R_B)-$ 、 $-N(R_B)C(=O)-$ 、 $-S(O)_m-$ 、 $-CH_2C(=O)-$ 、 $-S(O)_mN(R_B)-$ または $-N(R_B)S(O)_m-$ ；ここで m は 0、1 または 2；そして、

R_A および各 R_B は独立に以下から選択される：

(a) 水素；および

(b) $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニルおよびそれぞれ以下から独立に選択される 0 ~ 4 の置換基で置換されている 1 環または 2 縮合、ペンダントまたはスピロ環を有する 3 ~ 12 - 員環炭素環および複素環：ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルカノイル、モノ - およびジ ($C_1 - C_4$ アルキル) アミノ、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルおよび $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ；

R_2 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、またはモノ - またはジ - ($C_1 - C_4$ アルキル) アミノ；

R_3 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_8$ ハロアルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_1 - C_8$ ハロアルコキシ、 $C_2 - C_8$ アルキルエーテル、またはモノ - またはジ - ($C_1 - C_8$ アルキル) アミノ；

R_4 は以下から独立に選択される 0、1 または 2 の置換基を表す：ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、モノ - およびジ ($C_1 - C_4$ アルキル) アミノ、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ ハロアルキルおよび $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ；

Ar はフェニル、ナフチルまたは 5 ~ 10 - 員環ヘテロアリールを表し、そのそれぞれは以下から独立に選択される 0 ~ 4 の置換基で置換されている：ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_1 - C_8$ アルケニル、 $C_1 - C_8$ アルキニル、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル ($C_0 - C_8$ アルキル)、 $C_1 - C_8$ ハロアルキル、 $C_1 - C_8$ アルコキシ、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル ($C_1 - C_8$ アルコキシ)、 $C_1 - C_8$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_8$ アルキルエーテル、 $C_1 - C_8$ アルカノン、 $C_1 - C_8$ アルカノイル、3 ~ 7 - 員環ヘテロシクロアルキル ($C_0 - C_8$ アルキル)、オキソ、 $C_1 - C_8$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_8$ アミノアルキル、およびモノ - およびジ - ($C_1 - C_8$ アルキル) アミノ ($C_0 - C_8$ アルキル)；および、

R_5 および R_6 は独立に、水素、ハロゲン、メチルまたはエチル]。

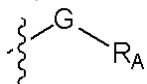
【請求項 2】

R_1 が以下から選択される請求項 1 の化合物またはその形態：

(a) 水素およびハロゲン；および、

(b) 下記式の基：

【化 3】



[式中：

(i) G は、結合、-NH-、-N(R_B)-、-O- または -C(=O)-；および、

(ii) R_A および各 R_B は独立に以下から選択される：C₁-C₆ アルキル、C₂-C₆ アルケニル、C₂-C₆ アルキニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チエニル、ピリジル、ピリミジニル、チアゾリルおよびピラジニル、そのそれぞれは以下から独立に選択される 0～4 の置換基で置換されている：ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、C₁-C₂ アルキル、および C₁-C₂ アルコキシ]。

【請求項 3】

R_1 が以下である請求項 2 の化合物：

(a) 水素またはハロゲン；または、

(b) C₁-C₆ アルキル、C₂-C₆ アルケニル、C₂-C₆ アルキニル、C₁-C₆ アルコキシ、C₂-C₄ アルカノイル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チエニル、ピリジル、チアゾリルまたはピリミジニル、そのそれぞれは非置換またはヒドロキシまたは C₁-C₂ アルコキシで置換されている。

【請求項 4】

R_2 が水素または C₁-C₄ アルキルである請求項 1 の化合物またはその形態。

【請求項 5】

R_2 が水素である請求項 4 の化合物またはその形態。

【請求項 6】

R_3 が、水素、ハロゲン、アミノ、C₁-C₆ アルキル、C₂-C₆ アルケニル、C₂-C₆ アルキニル、C₃-C₇ シクロアルキル、C₁-C₆ ハロアルキル、C₁-C₆ アルコキシ、C₁-C₆ ハロアルコキシまたはモノ-またはジ-(C₁-C₆ アルキル) アミノである請求項 1 の化合物またはその形態。

【請求項 7】

R_3 が水素、C₁-C₄ アルキル、C₁-C₄ アルコキシ、またはモノ-またはジ-(C₁-C₄ アルキル) アミノである請求項 6 の化合物またはその形態。

【請求項 8】

R_4 がハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシおよびトリフルオロメチルから独立に選択される 0、1 または 2 の置換基を表す、請求項 1 の化合物またはその形態。

【請求項 9】

R_4 が 0 の置換基を表す請求項 8 の化合物またはその形態。

【請求項 10】

A_r がフェニル、ピリミジルまたはピリジルを表し、そのそれぞれが以下から独立に選択される 0～4 の置換基で置換されている請求項 1 の化合物またはその形態：ハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、アミノ、C₁-C₆ アルキル、C₁-C₆ アルケニル、C₁-C₆ アルキニル、C₁-C₆ ハロアルキル、C₁-C₆ アルコキシ、C₁-C₆ ハロアルコキシ、C₃-C₇ シクロアルキル (C₀-C₆ アルキル)、C₃-C₇ シクロアルキル (C₁-C₆ アルコキシ)、3～7-員環ヘテロシクロアルキル (C₀-C₈ アルキル)、C₁-C₈ アミノアルキル、C₁-C₆ ヒドロキシアルキル、およびモノ-およびジ-(C₁-C₆ アルキル) アミノ (C₀-C₆ アルキル)。

【請求項 11】

A_r がフェニルまたはピリジルを表し、そのそれぞれが以下から独立に選択される 0～

3の置換基で置換されている請求項10の化合物またはその形態：クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、および $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ。

【請求項12】

Arがフェニルまたは2-ピリジルを表し、そのそれぞれがフルオロ、クロロおよびメチルから独立に選択される1、2または3の置換基で置換されている、請求項11の化合物またはその形態。

【請求項13】

R₁が：

(a) 水素またはハロゲン；または、

(b) $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_4$ アルカノイル、モノ-またはジ($C_1 - C_4$ アルキル)アミノ、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チエニル、ピリジル、ピラジニル、チアゾリルまたはピリミジニル、そのそれぞれは非置換またはハロゲン、ヒドロキシまたは $C_1 - C_2$ アルコキシで置換されている；

R₂は水素または $C_1 - C_4$ アルキル；

R₃は水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、またはモノ-またはジ- ($C_1 - C_4$ アルキル)アミノ；

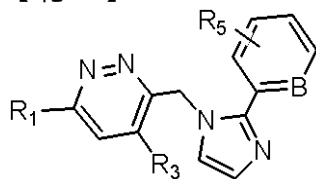
R₄は以下から独立に選択される0、1または2の置換基を表す：ハロゲン、ヒドロキシ、メチル、エチル、メトキシおよびトリフルオロメチル；および、

Arはフェニルまたはピリジルを表し、そのそれぞれが以下から独立に選択される0～3の置換基で置換されている：クロロ、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ ハロアルキル、および $C_1 - C_2$ ハロアルコキシ、である請求項1の化合物またはその形態。

【請求項14】

化合物が下記式を有する請求項1の化合物またはその形態：

【化4】



[式中：

BはCHまたはN；

R₁は(a) 水素またはハロゲン；あるいは(b) $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルキニル、モノ-またはジ($C_1 - C_4$ アルキル)アミノ、ピペリジニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、または $C_1 - C_6$ アルカノイル、そのそれぞれがヒドロキシまたは $C_1 - C_4$ アルコキシで置換されていてもよい；

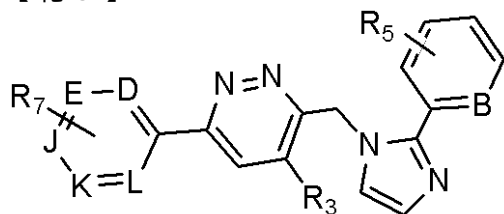
R₃は水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、またはモノ-またはジ- ($C_1 - C_4$ アルキル)アミノ；および、

R₅はシアノ、ハロゲンおよび $C_1 - C_4$ アルキルから独立に選択される0～3の置換基を表す]。

【請求項15】

化合物が下記式を有する、請求項1の化合物またはその形態：

【化 5】



[式中：

B は C H または N ；

D、E、J、K および L は独立に C H または N ；

R₃ は水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、またはモノ - またはジ - (C₁ - C₄ アルキル) アミノ ；R₅ はシアノ、ハロゲンおよび C₁ - C₄ アルキルから独立に選択される 0 ~ 3 の置換基を表す；および、R₇ はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、および C₁ - C₄ ハロアルキルから独立に選択される 0 ~ 3 の置換基を表す]。

【請求項 16】

D および L が独立に N ；および E、J および K が独立に C H である請求項 15 の化合物またはその形態。

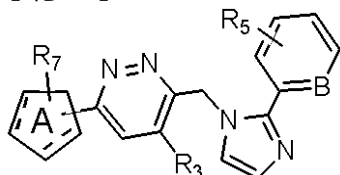
【請求項 17】

E および K が独立に N ；および D、J および L が独立に C H である請求項 15 の化合物またはその形態。

【請求項 18】

化合物が下記式を有する請求項 1 の化合物またはその形態：

【化 6】



[式中：

【化 7】



は 5 - 員環複素環：

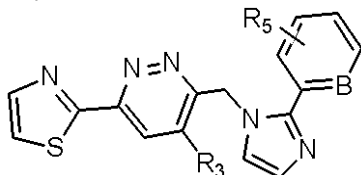
B は C H または N ；

R₃ は水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、またはモノ - またはジ - (C₁ - C₄ アルキル) アミノ ；R₅ はハロゲンおよび C₁ - C₄ アルキルから独立に選択される 0 ~ 3 の置換基を表す；および、R₇ はハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、および C₁ - C₄ ハロアルキルから独立に選択される 0 または 1 の置換基を表す]。

【請求項 19】

化合物が下記式を有する請求項 18 の化合物またはその形態。

【化 8】



【請求項 20】

化合物が以下から選択される請求項 1 の化合物またはその形態：

- { 6 - クロロ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 4 - イル } - エチル - アミン；
- { 6 - クロロ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 4 - イル } - プロピル - アミン；
- { 6 - クロロ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 4 - イル } - ジエチル - アミン；
- 1 - (6 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 5 - プロピルピリダジン - 3 - イル) エタノン；
- 1 - { 5 - エチル - 6 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 3 - イル } - ピペリジン - 4 - オール；
- 1 - { 6 - [2 - (3 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 5 - メトキシ - ピリダジン - 3 - イル } - エタノン；
- 3 - [2 - (2 , 3 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - エチル - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (2 , 5 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - エチル - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (3 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - エチル - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (3 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - メトキシ - 6 - チアジール - ピリダジン；
- 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリミジン - 5 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - メトキシ - 4 - プロピル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピラジン - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリジン - 4 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリジン - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリミジン - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリジン - 3 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - ピリミジン - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - プロピル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 5 - メチル - 4 - プロピル - ピリダジン；
- 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - メチル - 4 - プロピル - ピリダジン；
- 3 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 4 , 6 - ジプロピルピリダジン；

3 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 6 - (3 - メトキシプロブ - 1 - イニル) - 4 - プロピルピリダジン ;
 3 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 6 - (3 - メトキシプロピル) - 4 - プロピルピリダジン ;
 3 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 6 - メトキシ - 4 - プロピルピリダジン ;
 3 - クロロ - 6 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 4 - メチル - 5 - プロピル - ピリダジン ;
 4 - (6 - { [2 - (6 - フルオロピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } - 5 - プロピルピリダジン - 3 - イル) - 2 - メチルブチ - 3 - イン - 2 - オール ;
 4 , 6 - ジエトキシ - 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン ;
 4 , 6 - ジエトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン ;
 4 , 6 - ジメトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン ;
 4 - { 5 - エトキシ - 6 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 3 - イル } - 2 - メチル - ブチ - 3 - イン - 2 - オール ;
 4 - { 5 - エチル - 6 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン - 3 - イル } - モルホリン ;
 4 - { 6 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 5 - プロピル - ピリダジン - 3 - イル } - 2 - メチル - ブタン - 2 - オール ;
 4 - エトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - (2 - チアジル) - ピリダジン ;
 4 - エトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - (3 - チフェニル) - ピリダジン ;
 4 - エトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - メチル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - (2 - メトキシ - エトキシ) - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - (3 - メトキシ - プロブ - 1 - イニル) - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - メトキシ - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - ビペリジン - 1 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (5 - フルオロ - 2 - メチル - フェニル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - ピリジン - 3 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イルメチル] - 6 - チアゾール - 2 - イル - ピリダジン ;
 4 - エチル - 3 - { [2 - (3 - フルオロフェニル) - イミダゾール - 1 - イル] メチル } ピリダジン ;

4 - プロピル - 3 - [(2 - ピリジン - 2 - イル - イミダゾール - 1 - イル) メチル]
ピリダジン ;

6 - アリル - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 -
イルメチル] - 4 - プロピル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (2 , 3 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イル
メチル] - 4 - エチル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (2 , 5 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1 - イル
メチル] - 4 - エチル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (3 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾー
ル - 1 - イルメチル] - 4 - メトキシ - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (3 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - イミダゾー
ル - 1 - イルメチル] - 4 - エチル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 -
イルメチル] - 4 - プロピル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 -
イルメチル] - 4 - エトキシ - ピリダジン ;

6 - クロロ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 -
イルメチル] - 4 - プロピル - ピリダジン ;

6 - クロロ - 4 - エチル - 3 - [2 - (3 - フルオロ - フェニル) - イミダゾール - 1
- イルメチル] - ピリダジン ;

6 - クロロ - 4 - エチル - 3 - [2 - (5 - フルオロ - 2 - メチル - フェニル) - イミ
ダゾール - 1 - イルメチル] - ピリダジン ;

6 - エトキシ - 4 - エチル - 3 - { [2 - (3 - フルオロフェニル) - イミダゾール -
1 - イル] メチル } ピリダジン ; および、

エトキシ - 3 - [2 - (6 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - イミダゾール - 1 - イ
ルメチル] - 6 - (3 - ピリジル) - ピリダジン。

【請求項 2 1】

化合物がGABA_A受容体結合のアッセイにおいて1マイクロモル以下のK_iを示す請求項
1の化合物またはその形態。

【請求項 2 2】

化合物がGABA_A受容体結合のアッセイにおいて100ナノモル以下のK_iを示す請求項
1の化合物またはその形態。

【請求項 2 3】

化合物がGABA_A受容体結合のアッセイにおいて10ナノモル以下のK_iを示す請求項1
の化合物またはその形態。

【請求項 2 4】

生理的に許容される担体または賦形剤と組み合わせて請求項1の化合物またはその形態
を含む医薬組成物。

【請求項 2 5】

医薬組成物が注射可能液体、エアロゾル、クリーム、ゲル、丸剤、カプセル、シロップ
または経皮パッチとして製剤される、請求項24の医薬組成物。

【請求項 2 6】

GABA_A受容体活性を調節する量の請求項1の化合物またはその形態を含む不安、抑鬱、
睡眠障害、注意欠陥障害またはアルツハイマー痴呆の治療のための医薬組成物。

【請求項 2 7】

請求項1の化合物またはその形態を含み、CNS薬と組み合わせて投与される、CNS
薬の治療効果を増強させるための医薬組成物。

【請求項 2 8】

GABA_A受容体活性を調節する量の請求項1の化合物またはその形態を含む患者における
短期記憶を向上させるための医薬組成物。

【請求項 29】

以下の工程を含むサンプルにおけるGABA_A受容体の存在または不在を判定する方法：

(a) 化合物のGABA_A受容体への結合を可能とする条件下でサンプルと請求項1の化合物またはその形態を接触させる工程；

(b) GABA_A受容体に結合していない化合物またはその形態を除去する工程；および、

(c) GABA_A受容体に結合した化合物またはその形態のレベルを検出する工程；

およびそれからサンプルにおけるGABA_A受容体の存在または不在を判定する工程。

【請求項 30】

結合した化合物の存在または不在をオートラジオグラフィーを用いて検出する請求項29の方法。

【請求項 31】

GABA_A受容体を発現する細胞と、細胞の電気生理を検出可能に変化させるのに十分な量の請求項1の化合物またはその形態とを接触させることにより、GABA_A受容体シグナル伝達活性を変化させることを含む、GABA_A受容体のシグナル伝達活性を変化させる方法。

【請求項 32】

細胞が組換えにより異種GABA_A受容体を発現し、細胞の電気生理の変化が細胞内記録またはパッチクランプ記録によって検出される請求項31の方法。

【請求項 33】

容器中の請求項24の医薬組成物および該組成物の使用上の注意書を含む、不安、抑鬱、睡眠障害、注意欠陥障害、アルツハイマー痴呆、または短期記憶喪失を患う患者を治療するためのパッケージ化医薬調製物。

【請求項 34】

不安、抑鬱、睡眠障害、注意欠陥障害、アルツハイマー痴呆、または短期記憶喪失の治療薬の製造のための請求項1の化合物またはその形態の使用。