

【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21年11月26日(2009.11.26)

【公表番号】特表2009-514980(P2009-514980A)

【公表日】平成21年4月9日(2009.4.9)

【年通号数】公開・登録公報2009-014

【出願番号】特願2008-540217(P2008-540217)

【国際特許分類】

C 07 D 471/08	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 K 31/553	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/32	(2006.01)
A 61 P 25/34	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 23/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/08	C S P
A 61 K 31/551	
A 61 K 31/553	
C 07 D 519/00	3 1 1
A 61 P 25/00	
A 61 P 25/28	
A 61 P 25/18	
A 61 P 25/22	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/16	
A 61 P 25/14	
A 61 P 25/32	
A 61 P 25/34	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/20	
A 61 P 3/10	
A 61 P 3/04	

A 6 1 P 23/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 9/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年10月2日(2009.10.2)

## 【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

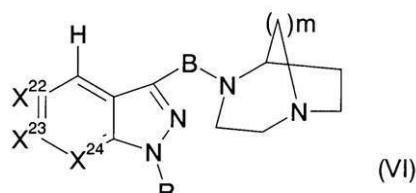
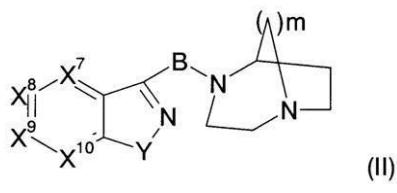
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式IIまたは式VIの化合物、薬学的に許容し得るその塩、薬学的に許容し得るその溶媒和物、または薬学的に許容し得るその塩の溶媒和物：

## 【化1】



式中、

BはCH<sub>2</sub>、C=O、またはC=Sであり；

Rは、H、炭素数1～4のアルキル、炭素数1～4のハロゲン化アルキル、炭素数3ないし7のシクロアルキル、炭素数4ないし7のシクロアルキルアルキル、または-C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル-Arであり；

mは2であり；

YはSであり；

X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>、X<sup>9</sup>およびX<sup>10</sup>は、各自独立にN、CH<sub>2</sub>、またはCR<sup>2</sup>であり、X<sup>7</sup>、X<sup>8</sup>、X<sup>9</sup>およびX<sup>10</sup>の多くても1つはNであり；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は各自独立に、

未置換、または1回以上F、Cl、Br、I、CN、OR<sup>1</sup><sub>6</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、SH、SR<sup>6</sup>、SOR<sup>6</sup>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、Ar、Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル；

未置換、または1回以上F、Cl、Br、I、CN、OR<sup>1</sup><sub>6</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、SH、SR<sup>6</sup>、SOR<sup>6</sup>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、Ar、Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>2</sub>-<sub>6</sub>アルケニル；

未置換、または1回以上F、Cl、Br、I、CN、OR<sup>1</sup><sub>6</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、SH、SR<sup>6</sup>、SOR<sup>6</sup>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、Ar、Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>2</sub>-<sub>6</sub>アルキニル；

未置換、または1回以上F、Cl、Br、I、CN、OR<sup>1</sup><sub>6</sub>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、SH、SR<sup>6</sup>、SOR<sup>6</sup>、未置換C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、Ar、Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル；

未置換、またはシクロアルキル部分において1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het, またはそれらの組合せにより、および/またはアルキル部分において1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het, またはそれらの組合せにより置換されたC<sub>4~10</sub>シクロアルキルアルキル；

ハロゲン；

CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, COOR<sup>6</sup>, NRF<sup>6</sup>COR<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CSR<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>COOR<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>COSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, OCONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, OCNSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>；

Ar；

Het；または

OR<sup>9</sup>であり；

R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は各自独立に、

H；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された炭素数1~6のアルキル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された炭素数3~6のアルケニル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された炭素数3~6のアルキニル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>3~8</sub>シクロアルキル；

未置換、またはシクロアルキル部分において1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換され、および/またはアルキル部分において1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, 炭素数1~6のモノアルキルアミノ、各アルキルの炭素数が1~6であるジアルキルアミノ、C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、Ar, Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>4~10</sub>シクロアルキルアルキル；

Ar；または

Hetであり；

R<sup>8</sup>はC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

R<sup>9</sup>は、

H；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>1~6</sub>アルキル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>3~6</sub>アルケニル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3~8</sub>シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het、またはそれらの組合せで置換されたC<sub>3~6</sub>アルキニル；

未置換、または1回以上F, C<sub>1</sub>, Br, I, CN, OR<sup>1~6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, S

$R^6$ ,  $SOR^6$ , 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-8}$  シクロアルキル;

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより、置換された  $C_{4-8}$  シクロアルキルアルキルであり;

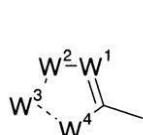
Ar; または

Het であり;

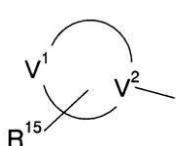
$X^{2-2}$  および  $X^{2-3}$  は、各自独立に CH または CR<sup>1-2</sup> であり、そのうち少なくとも  $X^{2-2}$  または  $X^{2-3}$  は CR<sup>1-2</sup> であり;

$R^{1-2}$  は、ハロゲン、1回以上F, -NHCONH-C<sub>1-4</sub> アルキル、Ar, Ar-C<sub>1-4</sub> アルキル-O-によって置換された C<sub>1-6</sub> アルコキシ、または式 IX-XI から選ばれ、

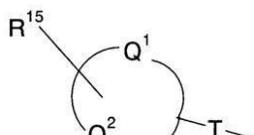
【化2】



(IX)



(X)



(XI)

ここで式 IX は  $W^2$  と  $W^3$  の結合が単結合であり、そして  $W^3$  と  $W^4$  の間の結合が二重結合であるか、または  $W^2$  と  $W^3$  の結合が二重結合であり、そして  $W^3$  と  $W^4$  の間の結合が単結合である、5員環不飽和複素環を表わし、式 X は炭素数 1 ~ 3 の 2価アルキレンによって橋かけされてもよく、そして任意にオキソによって置換されてもよい、飽和または部分飽和 5 ~ 8 員複素環を表わし、そして式 XI は炭素数 1 ~ 3 の 2価アルキレンによって橋かけされてもよい、飽和、部分飽和または不飽和 5 ~ 8 員環複素環を表わし；

$Q^1$  は O, S, N, NR<sup>1-3</sup> または NR<sup>1-3</sup>;

$Q^2$  は CH, CR<sup>1-4</sup>, CHR<sup>1-4</sup>, O, S, SO<sub>2</sub>, N または NR<sup>1-3</sup>;

T は O または NR<sup>1-0</sup>;

V<sup>1</sup> は O, S, SO<sub>2</sub>, N, NR<sup>1-3</sup>, CR<sup>1-4</sup> または CHR<sup>1-4</sup>;

W<sup>1</sup> は N;

$W^2$  および  $W^3$  は、各自独立に O, S, N, NR<sup>1-3</sup>, CH または CR<sup>1</sup> であり、そして  $W^2$  と  $W^3$  の間の結合は単結合であり、そして  $W^3$  と  $W^4$  の間の結合は 2重結合であるか、または  $W^2$  と  $W^3$  の間の結合が 2重結合であり、そして  $W^3$  と  $W^4$  の間の結合が単結合であり；

$W^4$  は O, S, N または NR<sup>1-3</sup>;

V<sup>2</sup> は C, CH, C-OH または N であり；

R<sup>1-3</sup> は H,

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3-8</sub> シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された C<sub>1-6</sub> アルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3-8</sub> シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された C<sub>3-6</sub> アルケニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, C<sub>3-8</sub> シクロアルキル、SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された C<sub>3-6</sub> アルキニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, S

$R^6$ ,  $SOR^6$ , 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-8}$  シクロアルキル；

未置換、またはシクロアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより、および/またはアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより置換された  $C_{4-10}$  シクロアルキルアルキル；

$SO_2R^6$ , CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, COOR<sup>6</sup>, CSOR<sup>6</sup>, COR<sup>7</sup>, CSR<sup>7</sup>；

Ar; または

Het であり；

$R^{1-4}$  はH,

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{1-6}$  アルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-6}$  アルケニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-6}$  アルキニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-8}$  シクロアルキル；

未置換、またはシクロアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより、および/またはアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより置換された  $C_{4-10}$  シクロアルキルアルキル；

ハロゲン；

$CN$ ,  $NO_2$ ,  $NR^6R^7$ ,  $SR^6$ ,  $SOR^6$ ,  $SO_2R^6$ ,  $SO_2R^6R^7$ ,  $NR^6S$ ,  $O_2R^7$ , CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, COOR<sup>6</sup>, NRF<sup>6</sup>COR<sup>7</sup>,  $NR^6CS$ ,  $SR^7$ ,  $NR^6CONR^6R^7$ ,  $NR^6CSNR^6R^7$ ,  $NR^6COOR^7$ ,  $NR^6CS$ ,  $OR^7$ , OCONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, OCNSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>；

Ar;

Het; または

OR<sup>9</sup> であり；

$R^{1-5}$  はH；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{1-6}$  アルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{2-6}$  アルケニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{2-6}$  アルキニル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, S

$R^6$ ,  $SOR^6$ , 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-8}$  シクロアルキル；

未置換、またはシクロアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより、および/またはアルキル部分において1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せにより置換された  $C_{4-10}$  シクロアルキルアルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OR<sup>1-6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>,  $SO_2R^6$ , 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het, またはそれらの組合せによって置換された  $C_{3-8}$  シクロアルコキシ；

ハロゲン；

オキソ、チオ、CN, NO<sub>2</sub>, NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, COOR<sup>6</sup>, NR<sup>6</sup>CO<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CSR<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>COOR<sup>7</sup>, NR<sup>6</sup>CSOR<sup>7</sup>, OCONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, OCSNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>;

Ar；

Het；または

OR<sup>9</sup>であり；

R<sup>1-6</sup>はH；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OH, 炭素数1~4のアルコキシ、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された  $C_{1-6}$  アルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OH, 炭素数1~4のアルコキシ、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>, 未置換  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された  $C_{3-6}$  シクロアルキル；

未置換、または1回以上F, Cl, Br, I, CN, OH, 炭素数1~4のアルコキシ、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, SH, SR<sup>6</sup>, SOR<sup>6</sup>,  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $SO_2R^6$ ,  $SO_2NR^6R^7$ , Ar, Het、またはそれらの組合せで置換された  $C_{4-8}$  シクロアルキルアルキルであり；

Arは未置換、または1回以上以下の基によって置換された炭素数6~10のアリール基であり、該置換基は、

炭素数1~8のアルキル、

炭素数1~8のアルコキシ、

ハロゲン、

アミノ、

シアノ、

ヒドロキシ、

ニトロ、

炭素数1~8のハロゲン化アルキル、

炭素数1~8のハロゲン化アルコキシ、

炭素数1~8のヒドロキシアルキル、

炭素数2~8のヒドロキシアルコキシ、

炭素数3~8のアルケニルオキシ、

炭素数1~8のモノアルキルアミノ、

各アルキルの炭素数が1~8であるジアルキルアミノ、

カルボキシ、

アルコキシカルボニル、

アルキルアミノカルボニル、

アシルアミド、  
アシルオキシ、  
炭素数 1 ~ 8 のアルキルチオ、  
炭素数 1 ~ 8 のアルキルスルフィニル、  
炭素数 1 ~ 8 のアルキルスルホニル、  
スルホ、  
スルホニルアミノ、  
H e t、

シクロアルキル基が炭素数 3 ~ 7 を有し、そして任意にハロゲン、炭素数 1 ~ 8 のアルキル、炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルキル、炭素数 1 ~ 4 のアルコキシ、アミノ、炭素数 1 ~ 8 のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数 1 ~ 8 を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>, シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換されたシクロアルキルアミノ、

アリール部分が炭素数 6 ~ 10 を有し、そして任意にハロゲン、炭素数 1 ~ 8 のアルキル、炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルキル、炭素数 1 ~ 4 のアルコキシ、アミノ、炭素数 1 ~ 8 のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数 1 ~ 8 を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>, シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソまたはチオで置換されたアリールオキシ、

アリール部分が炭素数 6 ~ 10 を有し、そして任意にハロゲン、炭素数 1 ~ 8 のアルキル、炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルキル、炭素数 1 ~ 4 のアルコキシ、アミノ、炭素数 1 ~ 8 のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数 1 ~ 8 を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>, シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソまたはチオで置換されたアリールチオ、

シクロアルキル基が炭素数 3 ~ 7 を有し、そして任意にハロゲン、炭素数 1 ~ 8 のアルキル、炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルキル、炭素数 1 ~ 4 のアルコキシ、アミノ、炭素数 1 ~ 8 のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数 1 ~ 8 を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>, シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換されたシクロアルキルオキシ、またはそれらの組合せであり；そして

H e t は、少なくとも 1 個の環原子が N, O または S である環原子 5 ~ 10 の完全飽和、部分飽和または完全不飽和複素環基であって、未置換か、または 1 回以上以下の基によって置換され、該置換基は、

炭素数 1 ~ 8 のアルキル、  
炭素数 1 ~ 8 のアルコキシ、  
炭素数 3 ~ 8 のシクロアルキル、  
炭素数 4 ~ 8 のシクロアルキルアルキル、  
ハロゲン、  
アミノ、  
シアノ、  
ヒドロキシ、  
ニトロ、  
炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルキル、  
炭素数 1 ~ 8 のハロゲン化アルコキシ、  
炭素数 1 ~ 8 のヒドロキシアルキル、  
炭素数 2 ~ 8 のヒドロキシアルコキシ、  
炭素数 3 ~ 8 のアルケニルオキシ、  
炭素数 1 ~ 8 のモノアルキルアミノ、  
各アルキルの炭素数が 1 ~ 8 であるジアルキルアミノ、  
カルボキシ、  
アルコキシカルボニル、  
アルキルアミノカルボニル、

アシルアミド、  
 アシルオキシ、  
 炭素数1～8のアルキルチオ、  
 炭素数1～8のアルキルスルフィニル、  
 炭素数1～8のアルキルスルホニル、  
 スルホ、  
 スルホニルアミノ、  
 H e t、

シクロアルキル基が炭素数3～7を有し、そして任意にハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換されたシクロアルキルアミノ、炭素数6～10を有するアリールであって、任意にハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換された前記アリール、

アリール部分が炭素数6～10を有し、アルキレン部分が炭素数1～4を有するアリール-アルキレン基であって、未置換か、または1回以上ハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換された前記アリール-アルキレン、

アリール部分が炭素数6～10を有し、そして任意にハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソまたはチオで置換されたアリールオキシ、

アリール部分が炭素数6～10を有し、そして任意にハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソまたはチオで置換されたアリールチオ、

シクロアルキル基が炭素数3～7を有し、そして任意にハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、アミノ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソ、またはチオで置換されたシクロアルキルオキシ、少なくとも1個の環原子がN, OまたはSである環原子5～10を有する完全飽和、部分飽和または完全不飽和複素環基であって、未置換か、または1回以上ハロゲン、炭素数1～8のアルキル、炭素数1～8のハロゲン化アルキル、炭素数1～4のアルコキシ、炭素数1～8のモノアルキルアミノ、各アルキル部分が炭素数1～8を有するジアルキルアミノ、C O R<sup>9</sup>, C S R<sup>9</sup>、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、オキソまたはチオ、またはそれらの組合せて置換された前記複素環基であり；

ここでX<sup>8</sup>またはX<sup>9</sup>の少なくとも一方はC R<sup>2</sup>であり、そしてR<sup>2</sup>はイミダゾリジニル以外のH e tであるか、またはR<sup>2</sup>はO R<sup>9</sup>であって、R<sup>9</sup>はH e tであり、そして

ここでX<sup>2</sup><sup>2</sup>およびX<sup>2</sup><sup>3</sup>の少なくとも一方はC R<sup>1</sup><sup>2</sup>であり、そしてR<sup>1</sup><sup>2</sup>はハロゲン、-N H C O N H-C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキルか、またはW<sup>4</sup>がNかN H R<sup>1</sup><sup>3</sup>であって、V<sup>2</sup>がNである式I X-X Iから選ばれる。

## 【請求項2】

X<sup>2</sup><sup>4</sup>がNである請求項1の化合物。

## 【請求項 3】

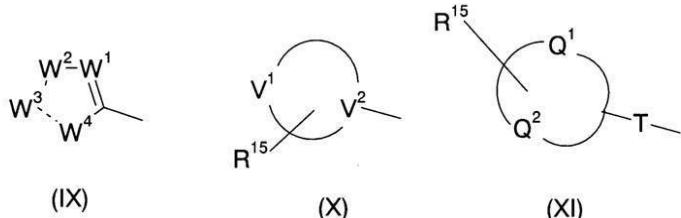
$X^{2-3}$  が  $CR^{2-0}$  であり、そして  $R^{2-0}$  がハロゲンである請求項 2 の化合物。

## 【請求項 4】

前記化合物は式 V I から選ばれ、ここで  $X^{2-4}$  は、CH であり、

$X^{2-2}$  または  $X^{2-3}$  の少なくとも一方は  $CR^{2-1}$  であって、 $R^{2-1}$  は式 I  $X-XI$

## 【化 3】

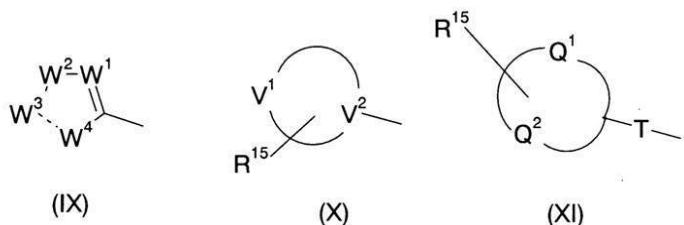


から選ばれ、ここで  $W^{4-}$  は N または  $NR^{1-3}$  であり、そして  $V^{2-}$  は N である請求項 1 の化合物。

## 【請求項 5】

前記化合物は式 V I から選ばれ、ここで  $X^{2-3}$  は  $CR^{2-1}$  であって、 $R^{2-1}$  は式 I  $X-XI$

## 【化 4】

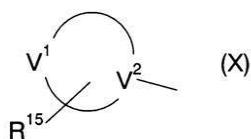


から選ばれ、ここで  $W^{4-}$  は N または  $NR^{1-3}$  であり、そして  $V^{2-}$  は N である請求項 4 の化合物。

## 【請求項 6】

$X^{2-3}$  が  $CR^{2-1}$  であり、ここで  $R^{2-1}$  は式 X

## 【化 5】



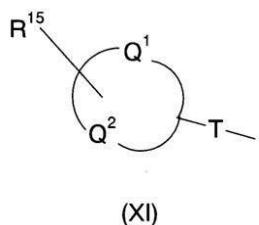
であり、

ここで  $V^{2-}$  は N である請求項 5 の化合物。

## 【請求項 7】

$X^{2-3}$  が  $CR^{2-1}$  であり、ここで  $R^{2-1}$  は式 XI

## 【化6】



である、請求項5の化合物。

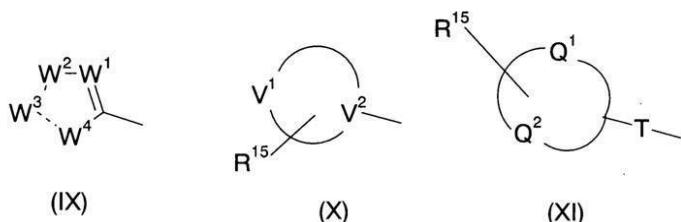
## 【請求項8】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここで

$X^{2 \sim 4}$ はC Hであり、

$X^{2 \sim 3}$ はCR<sup>2~1</sup>であって、R<sup>2~1</sup>は式IX-XI

## 【化7】



から選ばれ、ここでW<sup>4</sup>はNまたはNR<sup>1~3</sup>であり、V<sup>2</sup>はNである請求項1の化合物。

## 【請求項9】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでX<sup>2~2</sup>およびX<sup>2~3</sup>の少なくとも一方はCR<sup>1~2</sup>であって、R<sup>1~2</sup>は-NHCONH-C<sub>1~4</sub>アルキルか、または置換もしくは未置換ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、ジアゼパニル、オキサゼパニル、テトラヒドロピラニルオキシ、ジヒドロイミダゾリル、またはイミダゾジニルである請求項1の化合物。

## 【請求項10】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでX<sup>2~2</sup>およびX<sup>2~3</sup>の少なくとも一方はCR<sup>1~2</sup>であって、R<sup>1~2</sup>は炭素1ないし6のアルコキシ、アミノ、炭素数1ないし6のモノアルキルアミノ、または各アルキル基が炭素数1ないし6のジアルキルアミノによって置換されたピロリジニルである請求項9の化合物。

## 【請求項11】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでRはHまたは炭素数1ないし4のアルキルである請求項1ないし10のいずれかの化合物。

## 【請求項12】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでRはHである請求項1ないし10のいずれかの化合物。

## 【請求項13】

BがCOである請求項1ないし12のいずれかの化合物。

## 【請求項14】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでX<sup>8</sup>またはX<sup>9</sup>の少なくとも一方はCR<sup>2</sup>であって、R<sup>2</sup>はイミダゾリジニル以外のHetであるか、またはR<sup>2</sup>はOR<sup>9</sup>であり、R<sup>9</sup>はHetである請求項1の化合物。

## 【請求項15】

前記化合物は式V Iから選ばれ、ここでX<sup>8</sup>またはX<sup>9</sup>の少なくとも一方はCR<sup>2</sup>であって、R<sup>2</sup>は置換または未置換のピロリジニル、ジアザビシクロヘプチル、ジアザビシク

ロノニル、ピペラジニル、ジアゼパニル、ヘキサヒドロピロロピラジニル、ジアザビシクロオクチル、ピロリジニルオキシ、またはアザビシクロオクチルオキシである請求項1の化合物。

#### 【請求項16】

BがC Oである請求項1, 14および15のいずれかの化合物。

#### 【請求項17】

以下の化合物から選ばれた請求項1の化合物：

3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - ピロリジン - 1 - イル - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (3 - メトキシピロリジン - 1 - イル) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - モルホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール；  
 1 - [3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 1 H - インダゾール - 6 - イル] - 3 - プロピルイミダゾリジン - 2 - オン；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - チオモルホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (1 , 4 - オキサゼパン - 4 - イル) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - フルオロ - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - b] ピリジンギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(3 R) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 H - インダゾールジギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 5 - [(3 S) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 H - インダゾールジギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 5 - [(3 R) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 H - インダゾールジギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(3 S) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 H - インダゾールジギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 5 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イルオキシ) - 1 H - インダゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(3 R) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(3 S) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール；  
 N - [3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 1 - メチル - 1 H - インダゾール - 6 - イル] - N' - プロピル尿素ギ酸塩；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(1 S , 4 S) - 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル] - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール；  
 3 - (1 , 4 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 2] ノン - 4 - イルカルボニル) - 6 - [(1 R , 4 R) - 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 2 - イル]

- 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 6 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - [ 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ] - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ピロリジン - 1 - イル - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ヘキサヒドロピロロ [ 1 , 2 - a ] ピラジン - 2 ( 1 H ) - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 2 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 5 - シクロプロピル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 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 ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 t - ブチル ( 1 S , 4 S ) - 5 - [ 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール - 6 - イル ] - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプタン - 2 - カルボキシレート ;  
 6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - [ ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) オキシ ] - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 6 - ( 1 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルオキシ ) - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 1 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 1 H - インダゾール ;

ここで上に列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物は溶媒和物の形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物は N - オキシドの形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基またはその溶媒和物または N - オキシドの形、または薬学的に許容し得る塩またはその溶媒和物の形の化合物は多形の形にあることができ、そして

ここでもし化合物がキラリティーを示すならば、それはラセミ体またはジアステレオマーの混合物のようなエナンチオマーの混合物の形、または単一のエナンチオマーまたは单一ジアステレオマーの形にあることができる。

#### 【請求項 18】

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ピロリジン - 1 - イル - 1 H - インダゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 3  
 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - モル  
 ホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール ;  
 1 - [ 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1  
 H - インダゾール - 6 - イル ] - 3 - プロピルイミダゾリジン - 2 - オン ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4  
 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - チオ  
 モルホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4  
 - メチルピペラジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 1  
 , 4 - オキサゼパン - 4 - イル ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - メト  
 キシ - 1 , 2 - ベンズイソチアゾールギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - フル  
 オロ - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジンギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 3 R ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾールジギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - ( ( 3 S ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾールジギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - ( ( 3 R ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾールジギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 3 S ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾールジギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - ( テ  
 トラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イルオキシ ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( テ  
 トラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルオキシ ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( テ  
 トラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イルオキシ ) - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 3 R ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 7 - フル  
 オロ - 6 - メトキシ - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 3 S ) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 N - [ 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1  
 - メチル - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] - N ' - プロピル尿素ギ酸塩 ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 - エチ  
 ル - 6 - メトキシ - 1 H - インダゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - フエ  
 ニル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 1 S , 4 S ) - 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル )  
 - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;  
 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ( 1 R , 4 R ) - 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル )  
 - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

6 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - ( 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ピロリジン - 1 - イル - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( ヘキサヒドロピロ口 [ 1 , 2 - a ] ピラジン - 2 ( 1 H ) - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 5 - メチル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 2 - イル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 5 - シクロプロビル - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 5 - ( シクロプロビルメチル ) - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

t - プチル ( 1 S , 4 S ) - 5 - [ 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール - 6 - イル ] - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプタン - 2 - カルボキシレート ;

6 - [ ( 1 S , 4 S ) - 2 , 5 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプト - 2 - イル ] - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - [ ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) オキシ ] - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

6 - ( 1 - ジアザビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクト - 3 - イルオキシ ) - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 , 2 - ベンズイソチアゾール ;

6 - ( ベンジルオキシ ) - 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1 H - インダゾール ;

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 1 - メチル - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 1 H - インダゾール ;  
から選ばれた化合物 :

ここで上に列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物は溶媒和物の形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物はN - オキシドの形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基またはその溶媒和物またはN - オキシドの形、または薬学的に許容し得る塩またはその溶媒和物の形の化合物は多形の形にあることができ、そして

ここでもし化合物がキラリティーを示すならば、それはラセミ体またはジアステレオマーの混合物のようなエナンチオマーの混合物の形、または単一のエナンチオマーまたは単一ジアステレオマーの形にあることができる。

【請求項 19】

前記化合物はギ酸塩の形にある請求項 1 8 の化合物。

【請求項 2 0】

以下の化合物から選ばれる請求項 1 8 の化合物：

3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ピロ  
リジン - 1 - イル - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 3  
- メトキシピロリジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - モル  
ホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール；  
1 - [ 3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 1  
H - インダゾール - 6 - イル ] - 3 - プロピルイミダゾリジン - 2 - オン；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4  
- メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - チオ  
モルホリン - 4 - イル - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 4  
- メチルピペラジン - 1 - イル ) - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - ( 1  
, 4 - オキサゼパン - 4 - イル ) - 1 H - インダゾール；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 5 - メト  
キシ - 1 , 2 - ベンズイソチアゾールギ酸塩；  
3 - ( 1 , 4 - ジアザビシクロ [ 3 . 2 . 2 ] ノン - 4 - イルカルボニル ) - 6 - フル  
オロ - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - b ] ピリジンギ酸塩；

ここで上に列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物は溶媒和物  
の形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基の形または薬学的に許容し得る塩の形の化合物は N - オキ  
シドの形にあることができ、

ここで上で列挙した遊離塩基またはその溶媒和物または N - オキシドの形、または薬学  
的に許容し得る塩またはその溶媒和物の形の化合物は多形の形にあることができ、そして

ここでもし化合物がキラリティーを示すならば、それはラセミ体またはジアステレオマ  
ーの混合物のようなエナンチオマーの混合物の形、または単一のエナンチオマーまたは单  
一ジアステレオマーの形にあることができる。

【請求項 2 1】

請求項 1 の化合物およびその薬学的に許容し得る塩を含んでいる薬剤組成物。