

【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24年4月5日(2012.4.5)

【公表番号】特表2011-511810(P2011-511810A)  
 【公表日】平成23年4月14日(2011.4.14)  
 【年通号数】公開・登録公報2011-015  
 【出願番号】特願2010-546107(P2010-546107)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 209/32 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/30 (2006.01)  
 A 6 1 P 17/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

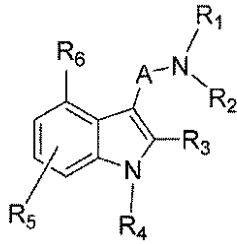
【F I】

|                 |       |
|-----------------|-------|
| C 0 7 D 209/32  | C S P |
| A 6 1 P 3/04    |       |
| A 6 1 P 25/18   |       |
| A 6 1 P 3/10    |       |
| A 6 1 P 25/00   |       |
| A 6 1 P 25/08   |       |
| A 6 1 P 25/28   |       |
| A 6 1 P 15/10   |       |
| A 6 1 P 25/30   |       |
| A 6 1 P 17/00   | 1 7 1 |
| A 6 1 P 43/00   | 1 1 4 |
| A 6 1 K 31/4045 |       |

【手続補正書】  
 【提出日】平成24年2月10日(2012.2.10)  
 【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】

構造式 I であらわされる化合物

## 【化103】



(式I)

〔式中、

Aは、 $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_2 \sim C_4$ アルケニレンまたは $C_2 \sim C_4$ アルキニレンであり；

$R_1$ および $R_2$ は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、ここで、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択され；

$R_3$ は、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、ここで、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_3$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミルおよびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_5$ は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_8$ アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$ は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_6$ は、FまたはOR<sub>7</sub>であり；

R<sub>7</sub> は、1～3個の置換基で場合により置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される。]

またはその医薬的に許容される塩。

【請求項2】

R<sub>1</sub> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R<sub>2</sub> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R<sub>1</sub> およびR<sub>2</sub> が、両方ともC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R<sub>1</sub> およびR<sub>2</sub> が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R<sub>3</sub> が水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R<sub>3</sub> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

R<sub>5</sub> が、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基が、それぞれ独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルからなる群から選択され、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれ

の炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

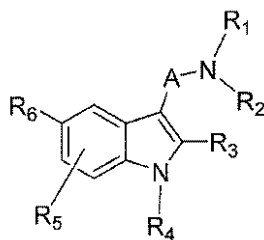
【請求項10】

$R_6$ が $OR_7$ であり、そして $R^7$ が、 $C_1 \sim C_8$ アルキルであり、ここで、該 $C_1 \sim C_8$ アルキルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

構造式IIであらわされる化合物

【化111】



(式II)

〔式中、

Aは、 $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_2 \sim C_4$ アルケニレンまたは $C_2 \sim C_4$ アルキニレンであり；

$R_1$ および $R_2$ は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、ここで、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択され；

$R_3$ は、H、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、ここで、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_3$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミルおよび $COOH$ からなる

群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_8$  アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_6$  は、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $OH$ 、 $OC(O)R_7$ 、 $OSO_2OH$ 、 $SO_2NH_2$  または  $OR_7$  であり；

$R_7$  は、1～3個の置換基で場合により置換された  $C_1 \sim C_8$  アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$ ；フェニル、アラキルまたはベンジルからなる群から選択され；

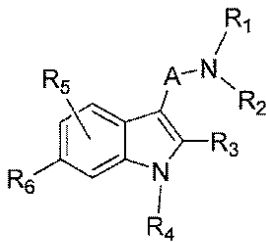
但し、 $R_5$  がヒドロキシである場合、 $R_6$  は、ヒドロキシでもなく、アルコキシでもない。]

またはその医薬的に許容される塩。

【請求項12】

構造式 III であらわされる化合物

【化113】



(式III)

〔式中、

A は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレン、 $C_2 \sim C_4$  アルケニレンまたは  $C_2 \sim C_4$  アルキニレンであり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択され；

$R_3$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ

独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_3$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミルおよび $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_5$ は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_8$ アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$ は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_6$ は、 $OP(O)(OH)_2$ 、 $OH$ 、 $OC(O)R_7$ 、 $OSO_2OH$ 、 $SO_2NH_2$ または $OR_7$ であり；

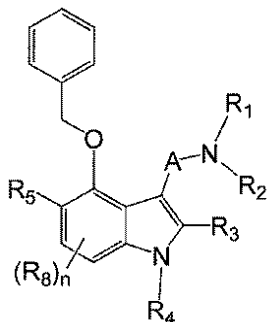
$R_7$ は、1～3個の置換基で場合により置換された $C_1 \sim C_8$ アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ ；フェニル、アラルキルまたはベンジルからなる群から選択される。]

またはその医薬的に許容される塩。

【請求項13】

構造式IVであらわされる化合物

【化115】



(式IV)

〔式中、

Aは、 $C_1 \sim C_4$ アルキレン、 $C_2 \sim C_4$ アルケニレンまたは $C_2 \sim C_4$ アルキニレン

であり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択され；

$R_3$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよび  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノであり；

$R_8$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノであり；

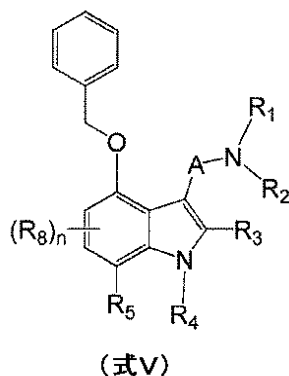
$n$  は、0、1または2である。]

またはその医薬的に許容される塩。

【請求項14】

式Vを有する化合物

## 【化 1 1 7】



〔式中、

A は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレン、 $C_2 \sim C_4$  アルケニレンまたは  $C_2 \sim C_4$  アルキニレンであり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択され；

$R_3$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノであり；

$R_8$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ

、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノであり；

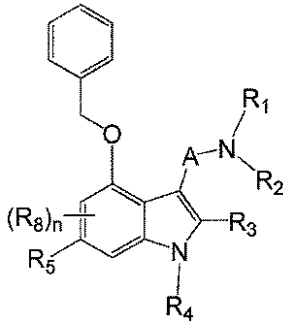
$n$  は、0、1 または 2 である。]

またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 15】

式 VI を有する化合物

【化 119】



(式VI)

〔式中、

A は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレン、 $C_2 \sim C_4$  アルケニレンまたは  $C_2 \sim C_4$  アルキニレンであり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択され；

$R_3$  は、水素、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよび  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-

S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

R<sub>5</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、またはジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノであり；

R<sub>8</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、またはジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノであり；

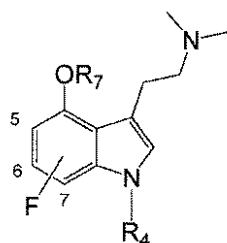
n は、0、1 または 2 である。]

またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 16】

構造式 VII によってあらわされる化合物

【化 121】



(式VII)

〔式中、

F は、5 位、6 位または 7 位の少なくとも 1 つに存在し；

R<sub>4</sub> および R<sub>7</sub> は、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルから選択される。〕

またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、投薬形態。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において肥満を処置するための組成物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において強迫性障害 (OCD) を処置するための組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において食欲を抑制するための組成物。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において統合失調症または精神病を処置するための組成物。

【請求項 23】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において不安または鬱病を処置するための組成物。

【請求項 24】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において糖尿病を処置するための組成物。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において注意欠陥多動性障

害 (ADHD) を処置するための組成物。

【請求項 26】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、被検体において中枢神経系の障害を処置するための組成物。

【請求項 27】

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む、イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎 (ALD) を処置するための組成物。

【請求項 29】

図 10 a または 10 b に開示されている化合物から選択される化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0270

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0270】

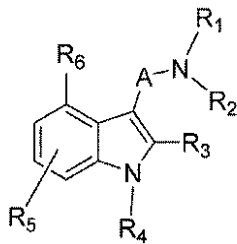
本発明の他の利点、他の局面および他の実施形態は、本明細書の記述の観点から明らかであろう。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

構造式 I であらわされる化合物

【化 103】



(式I)

〔式中、

A は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレン、 $C_2 \sim C_4$  アルケニレンまたは  $C_2 \sim C_4$  アルキニレンであり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択され；

$R_3$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ (C

$C_2 \sim C_8$  アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよび  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され

i

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_8$  アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_6$  は、FまたはOR<sub>7</sub>であり；

$R_7$  は、1～3個の置換基で場合により置換された  $C_1 \sim C_8$  アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択される。]

またはその医薬的に許容される塩。

(項目2)

Aが、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

Aが、 $C_2$  アルキレンである、項目2に記載の化合物。

(項目4)

$R_1$  が水素である、項目1に記載の化合物。

(項目5)

$R_1$  が  $C_1 \sim C_8$  アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目6)

$R_1$  が  $C_1$  アルキルである、項目5に記載の化合物。

(項目7)

$R_1$  が  $C_2$  アルキルである、項目5に記載の化合物。

(項目8)

$R_1$  が、1～3個の置換基で置換された  $C_1 \sim C_8$  アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目9)

$R_1$  が、1～3個の置換基で置換された  $C_1 \sim C_8$  アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン (例えばフッ素) である、項目8に記載の化合物。

(項目10)

R<sub>1</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目8に記載の化合物。

(項目11)

R<sub>1</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目10に記載の化合物。

(項目12)

R<sub>1</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目11に記載の化合物。

(項目13)

R<sub>1</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目12に記載の化合物。

(項目14)

R<sub>1</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目13に記載の化合物。

(項目15)

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目16)

R<sub>2</sub>が水素である、項目1に記載の化合物。

(項目17)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目18)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目17に記載の化合物。

(項目19)

R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目17に記載の化合物。

(項目20)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目21)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目20に記載の化合物。

(項目22)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目20に記載の化合物。

(項目23)

R<sub>2</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目22に記載の化合物。

(項目24)

R<sub>2</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目23に記載の化合物。

(項目25)

R<sub>2</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目24に記載の化合物。

(項目26)

R<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目25に記載の化合物。

(項目27)

R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～

C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目28)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目29)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>アルキルである、項目28に記載の化合物。

(項目30)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>2</sub>アルキルである、項目28に記載の化合物。

(項目31)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルであり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目28に記載の化合物。

(項目32)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目33)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目1に記載の化合物。

(項目34)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目32に記載の化合物。

(項目35)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目34に記載の化合物。

(項目36)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目35に記載の化合物。

(項目37)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目36に記載の化合物。

(項目38)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目37に記載の化合物。

(項目39)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目40)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目39に記載の化合物。

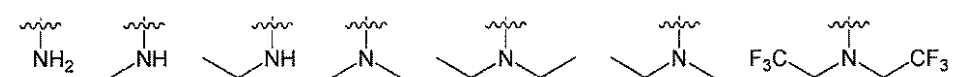
(項目41)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目39に記載の化合物。

(項目42)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目1に記載の化合物：

【化104】



(項目43)

R<sub>3</sub>が水素である、項目1に記載の化合物。

(項目44)

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルの

それぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目45)

$R_4$ が、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1~3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_4$ が、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、およびチオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキルからなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目46)

$R_4$ が、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目47)

$R_4$ が $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目48)

$R_4$ が $C_1$ アルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目49)

$R_4$ が $C_2$ アルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目50)

$R_4$ が $C_3$ アルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目51)

$R_4$ が $C_4$ アルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目52)

$R_4$ がシクロアルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目53)

$R_4$ が $C_3$ シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目54)

$R_4$ が $C_4$ シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目55)

$R_4$ が $C_5$ シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目56)

$R_4$ が $C_6$ シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目57)

$R_4$ が $C_7$ シクロアルキルである、項目52に記載の化合物。

(項目58)

$R_4$ が、シクロアルキルで置換されたアルキルである、項目47に記載の化合物。

(項目59)

$R_4$ が、シクロアルキルで置換された $C_1 \sim C_4$ アルキルである、項目58に記載の化合物。

(項目60)

R<sub>4</sub> が、シクロアルキルで置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 1)

R<sub>4</sub> が、シクロアルキルで置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 2)

R<sub>4</sub> が、シクロアルキルで置換された C<sub>3</sub> アルキルである、項目 5 9 に記載の化合物。

(項目 6 3)

R<sub>4</sub> が、シクロアルキルで置換された C<sub>4</sub> アルキルである、項目 5 9 に記載の化合物。

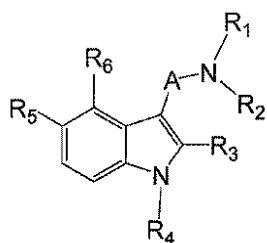
(項目 6 4)

R<sub>5</sub> が、1 個の置換基をあらわす、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6 5)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 6 4 に記載の化合物：

【化 1 0 5】



。  
(項目 6 6)

R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 6 5 に記載の化合物。

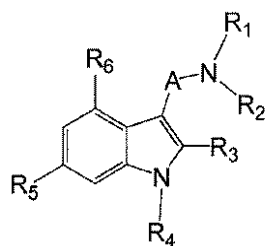
(項目 6 7)

R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 6 6 に記載の化合物。

(項目 6 8)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 6 4 に記載の化合物：

【化 1 0 6】



。  
(項目 6 9)

R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 6 8 に記載の化合物。

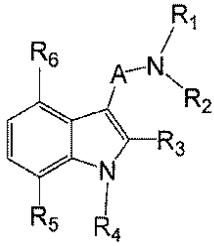
(項目 7 0)

R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 6 9 に記載の化合物。

(項目 7 1)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 6 4 に記載の化合物：

## 【化 1 0 7】



°  
(項目 7 2)

R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 7 1 に記載の化合物。

(項目 7 3)

R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 7 2 に記載の化合物。

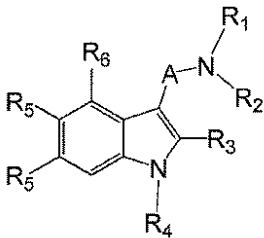
(項目 7 4)

R<sub>5</sub> が、2 個の置換基をあらわす、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 5)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 7 4 に記載の化合物：

## 【化 1 0 8】



°  
(項目 7 6)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともハロゲンである、項目 7 5 に記載の化合物。

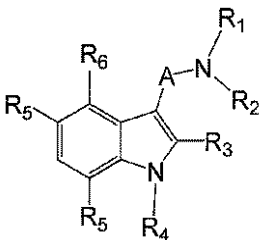
(項目 7 7)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともフッ素である、項目 7 6 に記載の化合物。

(項目 7 8)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 7 4 に記載の化合物：

## 【化 1 0 9】



°  
(項目 7 9)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともハロゲンである、項目 7 8 に記載の化合物。

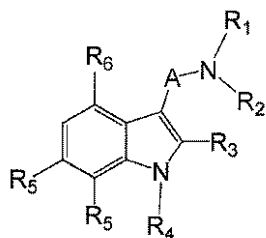
(項目 8 0)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともフッ素である、項目 7 9 に記載の化合物。

(項目 8 1)

前記化合物が、以下の式を有する、項目 7 4 に記載の化合物：

## 【化 1 1 0】



°

(項目 8 2)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともハロゲンである、項目 8 1 に記載の化合物。

(項目 8 3)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともフッ素である、項目 8 2 に記載の化合物。

(項目 8 4)

R<sub>5</sub> が、1 ~ 3 個の置換基をあらわし、これらの置換基が、それぞれ独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルからなる群から選択され、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル)アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8 5)

R<sub>6</sub> がフッ素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8 6)

R<sub>6</sub> が OR<sub>7</sub> である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8 7)

R<sub>7</sub> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 8 6 に記載の化合物。

(項目 8 8)

R<sub>7</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 8 7 に記載の化合物。

(項目 8 9)

R<sub>7</sub> が、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 8 6 に記載の化合物。

(項目 9 0)

R<sub>7</sub> が、1 ~ 3 個のハロゲンで置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 8 9 に記載の化合物

°

(項目 9 1)

R<sub>7</sub> が、1 ~ 3 個のフッ素で置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 9 0 に記載の化合物。

(項目 9 2)

R<sub>7</sub> が、2 個のフッ素で置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 9 1 に記載の化合物。

(項目 9 3)

R<sub>7</sub> が、3 個のフッ素で置換された C<sub>1</sub> アルキルである、項目 9 1 に記載の化合物。

(項目 9 4)

R<sub>7</sub> が、C<sub>2</sub> アルキルである、項目 8 7 に記載の化合物。

(項目 9 5)

R<sub>7</sub> が、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 8 6 に記載の化合物。

(項目 9 6)

R<sub>7</sub> が、1 個の置換基で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 9 5 に記載の化合物。

(項目 9 7)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH である、項目 9 6 に記載の化合物。

(項目98)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル)である、項目96に記載の化合物。

(項目99)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>である、項目98に記載の化合物。

(項目100)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ)である、項目96に記載の化合物。

(項目101)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である、項目100に記載の化合物。

(項目102)

R<sub>7</sub>が、C<sub>3</sub>アルキルである、項目87に記載の化合物。

(項目103)

R<sub>7</sub>がシクロアルキルである、項目87に記載の化合物。

(項目104)

R<sub>7</sub>が、C<sub>3</sub>シクロアルキルである、項目103に記載の化合物。

(項目105)

R<sub>7</sub>が、C<sub>4</sub>シクロアルキルである、項目103に記載の化合物。

(項目106)

R<sub>7</sub>が、C<sub>5</sub>シクロアルキルである、項目103に記載の化合物。

(項目107)

R<sub>7</sub>が、C<sub>6</sub>シクロアルキルである、項目103に記載の化合物。

(項目108)

R<sub>7</sub>が、C<sub>7</sub>シクロアルキルである、項目103に記載の化合物。

(項目109)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたアルキルである、項目87に記載の化合物。

(項目110)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目111)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目112)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目113)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたC<sub>3</sub>アルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目114)

R<sub>7</sub>が、シクロアルキルで置換されたC<sub>4</sub>アルキルである、項目109に記載の化合物。

(項目115)

R<sup>7</sup>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目86に記載の化合物。

(項目116)

項目1に記載の式Iの化合物を含む、医薬組成物。

(項目117)

項目1に記載の式Iの化合物を含む、投薬形態。

(項目118)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目117に記載の投薬形態。

(項目 1 1 9)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目 1 2 0)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、強迫性障害 (OCD) を処置する工程を含む、該被検体において OCD を処置する方法。

(項目 1 2 1)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目 1 2 2)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目 1 2 3)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目 1 2 4)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目 1 2 5)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害 (ADHD) を処置する工程を含む、該被検体において ADHD を処置する方法。

(項目 1 2 6)

被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目 1 2 7)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目 1 2 6 に記載の方法。

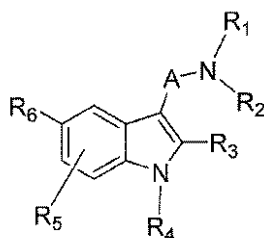
(項目 1 2 8)

イヌ被検体に項目 1 に記載の式 I の化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎 (ALD) を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目 1 2 9)

構造式 II であらわされる化合物

【化 1 1 1】



(式II)

〔式中、

A は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレン、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニレンまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニレンであり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、それぞれの場合について独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、

C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択され；

R<sub>3</sub> は、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択されるか；または、R<sub>3</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノおよびジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択され；

R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミルおよび COOH からなる群から選択されるか；または、R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択され；

R<sub>5</sub> は、1 ~ 3 個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルおよび C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

R<sub>5</sub> は、1 ~ 3 個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択され；

R<sub>6</sub> は、OP(O)(OH)<sub>2</sub>、OH、OC(O)R<sub>7</sub>、OSO<sub>2</sub>OH、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> または OR<sub>7</sub> であり；

R<sub>7</sub> は、1 ~ 3 個の置換基で場合により置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH；フェニル、アラキルまたはベンジルからなる群から選択され；

但し、R<sub>5</sub> がヒドロキシである場合、R<sub>6</sub> は、ヒドロキシでもなく、アルコキシでもない。

またはその医薬的に許容される塩。

(項目 130)

A が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンである、項目 129 に記載の化合物。

(項目 131)

A が、C<sub>2</sub> アルキレンである、項目 130 に記載の化合物。

(項目 132)

R<sub>1</sub> が水素である、項目 129 に記載の化合物。

(項目133)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目134)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目133に記載の化合物。

(項目135)

R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目133に記載の化合物。

(項目136)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目137)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目136に記載の化合物。

(項目138)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目136に記載の化合物

。

(項目139)

R<sub>1</sub>が、1~3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目138に記載の化合物。

(項目140)

R<sub>1</sub>が、1~3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目139に記載の化合物

。

(項目141)

R<sub>1</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目140に記載の化合物。

(項目142)

R<sub>1</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目141に記載の化合物。

(項目143)

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目129に記載の化合物。

(項目144)

R<sub>2</sub>が水素である、項目129に記載の化合物。

(項目145)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目146)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目145に記載の化合物。

(項目147)

R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目145に記載の化合物。

(項目148)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目149)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目148に記載の化合物。

(項目150)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目148に記載の化合物

。

(項目151)

R<sub>2</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目150に記載の化合物。

(項目152)

R<sub>2</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目151に記載の化合物。

(項目153)

R<sub>2</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目152に記載の化合物。

(項目154)

R<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目153に記載の化合物。

(項目155)

R<sup>2</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目129に記載の化合物。

(項目156)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目157)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>アルキルである、項目156に記載の化合物。

(項目158)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>2</sub>アルキルである、項目156に記載の化合物。

(項目159)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルであり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目156に記載の化合物。

(項目160)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目161)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目160に記載の化合物。

(項目162)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目160に記載の化合物。

(項目163)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目162に記載の化合物。

(項目164)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目163に記載の化合物。

(項目165)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目164に記載の化合物。

(項目166)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目165に記載の化合物。

(項目167)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目129に記載の化合物。

(項目168)

R<sub>1</sub> が水素であり、R<sub>2</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 168 に記載の化合物。

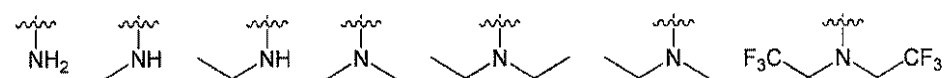
(項目 169)

R<sub>1</sub> が水素であり、R<sub>2</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 168 に記載の化合物。

(項目 170)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目 129 に記載の化合物：

【化 112】



。  
(項目 171)

R<sub>3</sub> が水素である、項目 129 に記載の化合物。

(項目 172)

R<sub>3</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル)アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 129 に記載の化合物。

(項目 173)

R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 129 に記載の化合物。

(項目 174)

R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub> アルキルである、項目 173 に記載の化合物。

(項目 175)

R<sub>4</sub> が、C<sub>2</sub> アルキルである、項目 173 に記載の化合物。

(項目 176)

R<sub>4</sub> が、C<sub>3</sub> アルキルである、項目 173 に記載の化合物。

(項目 177)

R<sub>4</sub> が、C<sub>4</sub> アルキルである、項目 173 に記載の化合物。

(項目 178)

R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル)アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 129 に記載の化合物。

(項目 179)

R<sub>5</sub> が、1 個の置換基をあらわす、項目 129 に記載の化合物。

(項目 180)

R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 179 に記載の化合物。

(項目 181)

R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 180 に記載の化合物。

(項目 182)

R<sub>5</sub> が、2 個の置換基をあらわす、項目 129 に記載の化合物。

(項目 183)

R<sub>5</sub> 置換基が両方ともハロゲンである、項目 182 に記載の化合物。

(項目184)

R<sub>5</sub>置換基が両方ともフッ素である、項目183に記載の化合物。

(項目185)

R<sub>5</sub>が、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基が、それぞれ独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルからなる群から選択され、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目129に記載の化合物。

(項目186)

R<sub>6</sub>がOHである、項目129に記載の化合物。

(項目187)

R<sub>6</sub>がOR<sub>7</sub>である、項目129に記載の化合物。

(項目188)

R<sub>7</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目187に記載の化合物。

(項目189)

R<sub>7</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目188に記載の化合物。

(項目190)

R<sub>7</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目187に記載の化合物。

(項目191)

R<sub>7</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目190に記載の化合物。

(項目192)

R<sub>7</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目191に記載の化合物。

(項目193)

R<sub>7</sub>が、2個のフッ素で置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目192に記載の化合物。

(項目194)

R<sub>7</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>1</sub>アルキルである、項目192に記載の化合物。

(項目195)

R<sub>7</sub>が、C<sub>2</sub>アルキルである、項目188に記載の化合物。

(項目196)

R<sub>7</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目187に記載の化合物。

(項目197)

R<sub>7</sub>が、1個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目196に記載の化合物。

(項目198)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OHである、項目197に記載の化合物。

(項目199)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル)である、項目197に記載の化合物。

(項目200)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>である、項目199に記載の化合物。

(項目201)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ)である、項目197に記載の化合物。

(項目202)

R<sub>7</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である、項目201に記載の化合物。

(項目203)

R<sub>7</sub>が、C<sub>3</sub>アルキルである、項目188に記載の化合物。

(項目204)

R<sup>7</sup>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目187に記載の化合物。

(項目205)

項目129に記載の式IIの化合物を含む、医薬組成物。

(項目206)

項目129に記載の式IIの化合物を含む、投薬形態。

(項目207)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目206に記載の投薬形態。

(項目208)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目209)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、強迫性障害(OCD)を処置する工程を含む、該被検体においてOCDを処置する方法。

(項目210)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目211)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目212)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目213)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目214)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害(ADHD)を処置する工程を含む、該被検体においてADHDを処置する方法。

(項目215)

被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目216)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目215に記載の方法。

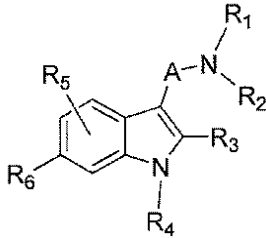
(項目217)

イヌ被検体に項目129に記載の式IIの化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎(ALD)を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目218)

構造式IIIであらわされる化合物

## 【化 1 1 3】



(式III)

〔式中、

A は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレン、 $C_2 \sim C_4$  アルケニレンまたは  $C_2 \sim C_4$  アルキニレンであり；

$R_1$  および  $R_2$  は、それぞれの場合について独立して、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択され；

$R_3$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよびCOOHからなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルおよび  $C_2 \sim C_8$  アルキニルからなる群から選択され、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$  アルキル)アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、1～3個の置換基をあらわし、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、COOH、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、-SH、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、

およびジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノからなる群から選択され；

R<sub>6</sub>は、OP(O)(OH)<sub>2</sub>、OH、OC(O)R<sub>7</sub>、OSO<sub>2</sub>OH、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>またはOR<sub>7</sub>であり；

R<sub>7</sub>は、1~3個の置換基で場合により置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOH；フェニル、アラキルまたはベンジルからなる群から選択される。]  
またはその医薬的に許容される塩。

(項目219)

Aが、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキレンである、項目218に記載の化合物。

(項目220)

Aが、C<sub>2</sub>アルキレンである、項目219に記載の化合物。

(項目221)

R<sub>1</sub>が水素である、項目218に記載の化合物。

(項目222)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目223)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目222に記載の化合物。

(項目224)

R<sub>1</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目222に記載の化合物。

(項目225)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目226)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目225に記載の化合物。

(項目227)

R<sub>1</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目225に記載の化合物。

(項目228)

R<sub>1</sub>が、1~3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目227に記載の化合物。

(項目229)

R<sub>1</sub>が、1~3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目228に記載の化合物。

(項目230)

R<sub>1</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目229に記載の化合物。

(項目231)

R<sub>1</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目230に記載の化合物。

(項目232)

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目233)

R<sub>2</sub>が水素である、項目218に記載の化合物。

(項目234)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目235)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目234に記載の化合物。

(項目236)

R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目234に記載の化合物。

(項目237)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目238)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目237に記載の化合物。

(項目239)

R<sub>2</sub>が、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目237に記載の化合物。

(項目240)

R<sub>2</sub>が、1~3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目239に記載の化合物。

(項目241)

R<sub>2</sub>が、1~3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目240に記載の化合物。

(項目242)

R<sub>2</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目241に記載の化合物。

(項目243)

R<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目242に記載の化合物。

(項目244)

R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目245)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目246)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>アルキルである、項目245に記載の化合物。

(項目247)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>2</sub>アルキルである、項目245に記載の化合物。

(項目248)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルであり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目245に記載の化合物。

(項目249)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目250)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目249に記載の化合物。

(項目251)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1~3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目

249に記載の化合物。

(項目252)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目251に記載の化合物。

(項目253)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目252に記載の化合物。

(項目254)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目253に記載の化合物。

(項目255)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目254に記載の化合物。

(項目256)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目257)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目256に記載の化合物。

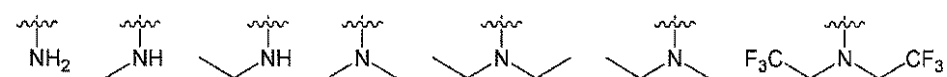
(項目258)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目256に記載の化合物。

(項目259)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目218に記載の化合物：

【化114】



。

(項目260)

R<sub>3</sub>が水素である、項目218に記載の化合物。

(項目261)

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目262)

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目218に記載の化合物。

(項目263)

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>アルキルである、項目262に記載の化合物。

(項目264)

R<sub>4</sub>が、C<sub>2</sub>アルキルである、項目262に記載の化合物。

(項目265)

R<sub>4</sub>が、C<sub>3</sub>アルキルである、項目262に記載の化合物。

(項目266)

R<sub>4</sub>が、C<sub>4</sub>アルキルである、項目262に記載の化合物。

(項目267)

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれ

の炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目268)

$R_5$ が、1個の置換基をあらわす、項目218に記載の化合物。

(項目269)

$R_5$ がハロゲンである、項目268に記載の化合物。

(項目270)

$R_5$ がフッ素である、項目269に記載の化合物。

(項目271)

$R_5$ が、2個の置換基をあらわす、項目218に記載の化合物。

(項目272)

$R_5$ 置換基が両方ともハロゲンである、項目271に記載の化合物。

(項目273)

$R_5$ 置換基が両方ともフッ素である、項目272に記載の化合物。

(項目274)

$R_5$ が、1~3個の置換基をあらわし、これらの置換基が、それぞれ独立して、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルからなる群から選択され、該 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目275)

$R_6$ が $OH$ である、項目218に記載の化合物。

(項目276)

$R_6$ が $OR_7$ である、項目218に記載の化合物。

(項目277)

$R_7$ が $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目276に記載の化合物。

(項目278)

$R_7$ が $C_1$ アルキルである、項目277に記載の化合物。

(項目279)

$R_7$ が、1~3個の置換基で置換された $C_1$ アルキルである、項目276に記載の化合物

。

(項目280)

$R_7$ が、1~3個のハロゲンで置換された $C_1$ アルキルである、項目279に記載の化合物。

(項目281)

$R_7$ が、1~3個のフッ素で置換された $C_1$ アルキルである、項目280に記載の化合物

。

(項目282)

$R_7$ が、2個のフッ素で置換された $C_1$ アルキルである、項目281に記載の化合物。

(項目283)

$R_7$ が、3個のフッ素で置換された $C_1$ アルキルである、項目281に記載の化合物。

(項目284)

$R_7$ が、 $C_2$ アルキルである、項目277に記載の化合物。

(項目285)

R<sub>7</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目276に記載の化合物。

(項目286)

R<sub>7</sub> が、1個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目285に記載の化合物。

(項目287)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OHである、項目286に記載の化合物。

(項目288)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル)である、項目286に記載の化合物。

(項目289)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>である、項目288に記載の化合物。

(項目290)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-(ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ)である、項目286に記載の化合物。

(項目291)

R<sub>7</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>である、項目290に記載の化合物。

(項目292)

R<sub>7</sub> が、C<sub>3</sub>アルキルである、項目277に記載の化合物。

(項目293)

R<sup>7</sup> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基が、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目218に記載の化合物。

(項目294)

項目218に記載の式IIIの化合物を含む、医薬組成物。

(項目295)

項目218に記載の式IIIの化合物を含む、投薬形態。

(項目296)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目295に記載の投薬形態。

(項目297)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目298)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、強迫性障害( OCD )を処置する工程を含む、該被検体においてOCDを処置する方法。

(項目299)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目300)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目301)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目302)

被検体に項目218に記載の式IIIの化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目303)

被検体に項目 2 1 8 に記載の式 I I I の化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害 ( A D H D ) を処置する工程を含む、該被検体において A D H D を処置する方法。

( 項目 3 0 4 )

被検体に項目 2 1 8 に記載の式 I I I の化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

( 項目 3 0 5 )

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目 3 0 4 に記載の方法。

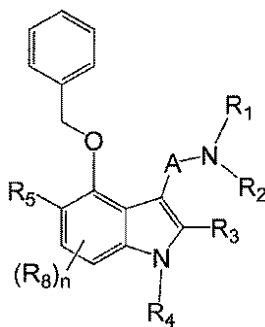
( 項目 3 0 6 )

イヌ被検体に項目 2 1 8 に記載の式 I I I の化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎 ( A L D ) を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

( 項目 3 0 7 )

構造式 I V であらわされる化合物

【化 1 1 5】



(式IV)

[ 式中、

A は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレン、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニレンまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニレンであり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、それぞれの場合について独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル ) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および C O O H からなる群から選択され；

R<sub>3</sub> は、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルは、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル ) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および C O O H からなる群から選択されるか；または、R<sub>3</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、C O O H、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノおよびジ ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル ) アミノからなる群から選択され；

R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-

S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミルおよび C O O H からなる群から選択されるか；または、R<sub>4</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択される；

R<sub>5</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1 ~ 3 個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、およびジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

R<sub>5</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、C O O H、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、またはジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノであり；

R<sub>8</sub> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、C O O H、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、またはジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノであり；

n は、0、1 または 2 である。]

またはその医薬的に許容される塩。

(項目 3 0 8)

A が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンである、項目 3 0 7 に記載の化合物。

(項目 3 0 9)

A が、C<sub>2</sub> アルキレンである、項目 3 0 8 に記載の化合物。

(項目 3 1 0)

R<sub>1</sub> が水素である、項目 3 0 7 に記載の化合物。

(項目 3 1 1)

R<sub>1</sub> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 3 0 7 に記載の化合物。

(項目 3 1 2)

R<sub>1</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 3 1 1 に記載の化合物。

(項目 3 1 3)

R<sub>1</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 3 1 1 に記載の化合物。

(項目 3 1 4)

R<sub>1</sub> が、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 3 0 7 に記載の化合物。

(項目 3 1 5)

R<sub>1</sub> が、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルであり、少なくとも 1 個の置換基がハロゲン (例えばフッ素) である、項目 3 1 4 に記載の化合物。

(項目 3 1 6)

R<sub>1</sub> が、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 3 1 4 に記載の化合物。

(項目 3 1 7)

R<sub>1</sub> が、1 ~ 3 個のハロゲンで置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 3 1 6 に記載の化合物。

(項目 3 1 8)

R<sub>1</sub> が、1 ~ 3 個のフッ素で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 3 1 7 に記載の化合物。

(項目 3 1 9)

R<sub>1</sub> が、3 個のフッ素で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 3 1 8 に記載の化合物。

(項目 3 2 0)

R<sub>1</sub> が、- C H<sub>2</sub> - C F<sub>3</sub> である、項目 3 1 9 に記載の化合物。

(項目321)

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目307に記載の化合物。

(項目322)

R<sub>2</sub>が水素である、項目307に記載の化合物。

(項目323)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目324)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目323に記載の化合物。

(項目325)

R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目323に記載の化合物。

(項目326)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目327)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目326に記載の化合物。

(項目328)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目326に記載の化合物。

(項目329)

R<sub>2</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目328に記載の化合物。

(項目330)

R<sub>2</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目329に記載の化合物。

(項目331)

R<sub>2</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目330に記載の化合物。

(項目332)

R<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目331に記載の化合物。

(項目333)

R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目307に記載の化合物。

(項目334)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目335)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>1</sub>アルキルである、項目334に記載の化合物。

(項目336)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方ともC<sub>2</sub>アルキルである、項目334に記載の化合物。

(項目337)

R<sub>1</sub>がC<sub>1</sub>アルキルであり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目334に記載の化合物。

(項目338)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目339)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目338に記載の化合物。

(項目340)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目338に記載の化合物。

(項目341)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目340に記載の化合物。

(項目342)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目341に記載の化合物。

(項目343)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目342に記載の化合物。

(項目344)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が、両方とも、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目343に記載の化合物。

(項目345)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目346)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目345に記載の化合物。

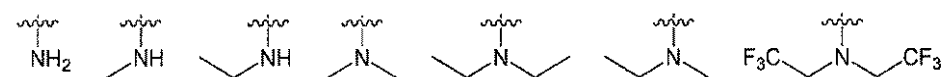
(項目347)

R<sub>1</sub>が水素であり、R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目345に記載の化合物。

(項目348)

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目307に記載の化合物：

【化116】



(項目349)

R<sub>3</sub>が水素である、項目307に記載の化合物。

(項目350)

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目307に記載の化合物。

(項目351)

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目307に記載の化合物。

(項目352)

R<sub>4</sub>が、C<sub>1</sub>アルキルである、項目351に記載の化合物。

(項目353)

R<sub>4</sub>が、C<sub>2</sub>アルキルである、項目351に記載の化合物。

(項目354)

R<sub>4</sub>が、C<sub>3</sub>アルキルである、項目351に記載の化合物。

(項目355)

R<sub>4</sub>が、C<sub>4</sub>アルキルである、項目351に記載の化合物。

(項目356)

R<sup>4</sup>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目307に記載の化合物。

(項目357)

R<sub>5</sub>がハロゲンである、項目307に記載の化合物。

(項目358)

R<sub>5</sub>がフッ素である、項目357に記載の化合物。

(項目359)

R<sub>5</sub>が、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、それぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目307に記載の化合物。

(項目360)

nが0である、項目307に記載の化合物。

(項目361)

nが1である、項目307に記載の化合物。

(項目362)

R<sub>8</sub>がハロゲンである、項目361に記載の化合物。

(項目363)

R<sub>8</sub>がフッ素である、項目362に記載の化合物。

(項目364)

項目307に記載の式IVの化合物を含む、医薬組成物。

(項目365)

項目307に記載の式IVの化合物を含む、投薬形態。

(項目366)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目365に記載の投薬形態。

(項目367)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目368)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、強迫性障害(OCD)を処置する工程を含む、該被検体においてOCDを処置する方法。

(項目369)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目370)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目371)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目372)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目373)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害(ADHD)を処置する工程を含む、該被検体においてADHDを処置する方法。

(項目374)

被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目375)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目374に記載の方法。

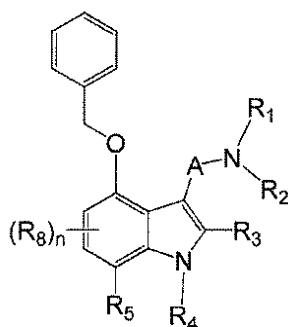
(項目376)

イヌ被検体に項目307に記載の式IVの化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎(ALD)を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目377)

式Vを有する化合物

【化117】



(式V)

[式中、

Aは、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキレン、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニレンまたはC<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニレンであり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、それぞれの場合について独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルは、場合により、1~3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択され；

R<sub>3</sub>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニルは、場合により、1~3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ

独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、および $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_3$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノおよびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミルおよび $COOH$ からなる群から選択されるか；または、 $R_4$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択され；

$R_5$ は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、およびジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、またはジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノであり；

$R_8$ は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシル、 $-SH$ 、チオ( $C_2 \sim C_8$ )アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、またはジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノであり；

$n$ は、0、1または2である。]

またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

(項目378)

Aが、 $C_1 \sim C_4$ アルキレンである、項目377に記載の組成物。

(項目379)

Aが、 $C_2$ アルキレンである、項目378に記載の組成物。

(項目380)

$R_1$ が水素である、項目377に記載の組成物。

(項目381)

$R_1$ が $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目382)

$R_1$ が $C_1$ アルキルである、項目381に記載の組成物。

(項目383)

$R_1$ が $C_2$ アルキルである、項目381に記載の組成物。

(項目384)

$R_1$ が、1～3個の置換基で置換された $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目385)

$R_1$ が、1～3個の置換基で置換された $C_1 \sim C_8$ アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目384に記載の組成物。

(項目386)

$R_1$ が、1～3個の置換基で置換された $C_2$ アルキルである、項目384に記載の組成物

(項目387)

R<sub>1</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目386に記載の組成物。

(項目388)

R<sub>1</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目387に記載の組成物。

(項目389)

R<sub>1</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目388に記載の組成物。

(項目390)

R<sub>1</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目389に記載の組成物。

(項目391)

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目377に記載の組成物。

(項目392)

R<sub>2</sub>が水素である、項目377に記載の組成物。

(項目393)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目394)

R<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目393に記載の組成物。

(項目395)

R<sub>2</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目393に記載の組成物。

(項目396)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目397)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目396に記載の組成物。

(項目398)

R<sub>2</sub>が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目396に記載の組成物。

(項目399)

R<sub>2</sub>が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目398に記載の組成物。

(項目400)

R<sub>2</sub>が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目399に記載の組成物。

(項目401)

R<sub>2</sub>が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目400に記載の組成物。

(項目402)

R<sub>2</sub>が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目401に記載の組成物。

(項目403)

R<sub>2</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)ア

ルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_8$ アルキル)アミノ、 $C_1 \sim C_8$ アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目377に記載の組成物。

(項目404)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目405)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも $C_1$ アルキルである、項目404に記載の組成物。

(項目406)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも $C_2$ アルキルである、項目404に記載の組成物。

(項目407)

$R_1$ が $C_1$ アルキルであり、 $R_2$ が $C_2$ アルキルである、項目404に記載の組成物。

(項目408)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、1~3個の置換基で置換された $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目409)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、1~3個の置換基で置換された $C_1 \sim C_8$ アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目408に記載の組成物。

(項目410)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、1~3個の置換基で置換された $C_2$ アルキルである、項目408に記載の組成物。

(項目411)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、1~3個のハロゲンで置換された $C_2$ アルキルである、項目410に記載の組成物。

(項目412)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、1~3個のフッ素で置換された $C_2$ アルキルである、項目411に記載の組成物。

(項目413)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、3個のフッ素で置換された $C_2$ アルキルである、項目412に記載の組成物。

(項目414)

$R_1$ および $R_2$ が、両方とも、 $-CH_2-CF_3$ である、項目413に記載の組成物。

(項目415)

$R_1$ が水素であり、 $R_2$ が $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目377に記載の組成物。

(項目416)

$R_1$ が水素であり、 $R_2$ が $C_1$ アルキルである、項目415に記載の組成物。

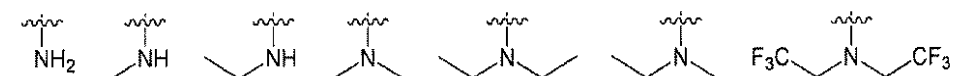
(項目417)

$R_1$ が水素であり、 $R_2$ が $C_2$ アルキルである、項目415に記載の組成物。

(項目418)

$R_1$ および $R_2$ と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目377に記載の組成物：

【化118】



(項目419)

$R_3$ が水素である、項目377に記載の組成物。

(項目420)

R<sub>3</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 377 に記載の組成物。

(項目 421)

R<sub>4</sub> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 377 に記載の組成物。

(項目 422)

R<sub>4</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 421 に記載の組成物。

(項目 423)

R<sub>4</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 421 に記載の組成物。

(項目 424)

R<sub>4</sub> が C<sub>3</sub> アルキルである、項目 421 に記載の組成物。

(項目 425)

R<sub>4</sub> が C<sub>4</sub> アルキルである、項目 421 に記載の組成物。

(項目 426)

R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 377 に記載の組成物。

(項目 427)

R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 377 に記載の組成物。

(項目 428)

R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 427 に記載の組成物。

(項目 429)

R<sub>5</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 377 に記載の組成物。

(項目 430)

n が 0 である、項目 377 に記載の組成物。

(項目 431)

n が 1 である、項目 377 に記載の組成物。

(項目 432)

R<sub>8</sub> がハロゲンである、項目 431 に記載の組成物。

(項目 433)

R<sub>8</sub> がフッ素である、項目 432 に記載の組成物。

(項目 434)

項目 377 に記載の式 V の化合物を含む、投薬形態。

(項目 435)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目 434 に記載の投薬形態。

(項目 436)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目 4 3 7)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、強迫性障害 (OCD) を処置する工程を含む、該被検体において OCD を処置する方法。

(項目 4 3 8)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目 4 3 9)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目 4 4 0)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目 4 4 1)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目 4 4 2)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害 (ADHD) を処置する工程を含む、該被検体において ADHD を処置する方法。

(項目 4 4 3)

被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目 4 4 4)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目 4 4 3 に記載の方法。

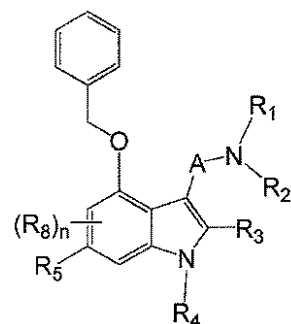
(項目 4 4 5)

イヌ被検体に項目 3 7 7 に記載の式 V の化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎 (ALD) を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目 4 4 6)

式 VI を有する化合物

【化 1 1 9】



(式VI)

〔式中、

A は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレン、C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルケニレンまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキニレンであり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、それぞれの場合について独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、

$C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択され；

$R_3$  は、水素、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、ここで、該  $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルは、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、および  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_3$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノおよびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミルおよび  $COOH$  からなる群から選択されるか；または、 $R_4$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択され；

$R_5$  は、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニルまたは  $C_2 \sim C_8$  アルキニルであり、これらはそれぞれ、場合により、1～3個の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、およびジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノからなる群から選択されるか；または

$R_5$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノであり；

$R_8$  は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_8$  アルキルスルホニル、ホルミル、 $COOH$ 、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシル、 $-SH$ 、チオ ( $C_2 \sim C_8$ ) アルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_8$  アルキルアミノ、またはジ ( $C_1 \sim C_8$  アルキル) アミノであり；

$n$  は、0、1または2である。]

またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

(項目447)

Aが、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンである、項目446に記載の組成物。

(項目448)

Aが、 $C_2$  アルキレンである、項目447に記載の組成物。

(項目449)

$R_1$  が水素である、項目446に記載の組成物。

(項目450)

$R_1$  が  $C_1 \sim C_8$  アルキルである、項目446に記載の組成物。

(項目451)

$R_1$  が  $C_1$  アルキルである、項目450に記載の組成物。

(項目452)

$R_1$  が  $C_2$  アルキルである、項目450に記載の組成物。

(項目453)

R<sub>1</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目446に記載の組成物。

(項目454)

R<sub>1</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目453に記載の組成物。

(項目455)

R<sub>1</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目453に記載の組成物。

(項目456)

R<sub>1</sub> が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目455に記載の組成物。

(項目457)

R<sub>1</sub> が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目456に記載の組成物。

(項目458)

R<sub>1</sub> が、3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目457に記載の組成物。

(項目459)

R<sub>1</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>である、項目458に記載の組成物。

(項目460)

R<sub>1</sub> が、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルであり、ここで、該C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>アルキニルのそれぞれの炭素が、2個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルキル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルスルホニル、ホルミル、およびCOOHからなる群から選択される、項目446に記載の組成物。

(項目461)

R<sub>2</sub> が水素である、項目446に記載の組成物。

(項目462)

R<sub>2</sub> がC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目446に記載の組成物。

(項目463)

R<sub>2</sub> がC<sub>1</sub>アルキルである、項目462に記載の組成物。

(項目464)

R<sub>2</sub> がC<sub>2</sub>アルキルである、項目462に記載の組成物。

(項目465)

R<sub>2</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、項目446に記載の組成物。

(項目466)

R<sub>2</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、少なくとも1個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目465に記載の組成物。

(項目467)

R<sub>2</sub> が、1～3個の置換基で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目465に記載の組成物。

(項目468)

R<sub>2</sub> が、1～3個のハロゲンで置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目467に記載の組成物。

(項目469)

R<sub>2</sub> が、1～3個のフッ素で置換されたC<sub>2</sub>アルキルである、項目468に記載の組成物。

(項目470)

R<sub>2</sub> が、3 個のフッ素で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 6 9 に記載の組成物。

(項目 4 7 1)

R<sub>2</sub> が、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> である、項目 4 7 0 に記載の組成物。

(項目 4 7 2)

R<sub>2</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、-SH、チオ(C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル)アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および COOH からなる群から選択される、項目 4 4 6 に記載の組成物。

(項目 4 7 3)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 4 4 6 に記載の組成物。

(項目 4 7 4)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも C<sub>1</sub> アルキルである、項目 4 7 3 に記載の組成物。

(項目 4 7 5)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 7 3 に記載の組成物。

(項目 4 7 6)

R<sub>1</sub> が C<sub>1</sub> アルキルであり、R<sub>2</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 7 3 に記載の組成物。

(項目 4 7 7)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 4 4 6 に記載の組成物。

(項目 4 7 8)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルであり、少なくとも 1 個の置換基がハロゲン(例えばフッ素)である、項目 4 7 7 に記載の組成物。

(項目 4 7 9)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、1 ~ 3 個の置換基で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、請求項 4 7 7 に記載の組成物。

(項目 4 8 0)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、1 ~ 3 個のハロゲンで置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 7 9 に記載の組成物。

(項目 4 8 1)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、1 ~ 3 個のフッ素で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 8 0 に記載の組成物。

(項目 4 8 2)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、3 個のフッ素で置換された C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 8 1 に記載の組成物。

(項目 4 8 3)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が、両方とも、-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub> である、項目 4 8 2 に記載の組成物。

(項目 4 8 4)

R<sub>1</sub> が水素であり、R<sub>2</sub> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 4 4 6 に記載の組成物。

(項目 4 8 5)

R<sub>1</sub> が水素であり、R<sub>2</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 4 8 4 に記載の組成物。

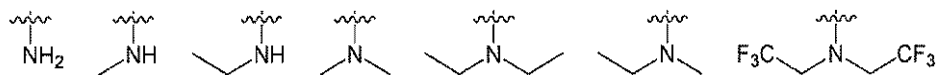
(項目 4 8 6)

R<sub>1</sub> が水素であり、R<sub>2</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 8 4 に記載の組成物。

(項目 4 8 7)

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> と、これらが結合している窒素とで、以下のものから選択される基を形成する、項目 4 4 6 に記載の組成物：

## 【化 1 2 0】

(項目 4 8 8)R<sub>3</sub> が水素である、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 8 9)R<sub>3</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および C O O H からなる群から選択される、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 9 0)R<sub>4</sub> が C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 9 1)R<sub>4</sub> が C<sub>1</sub> アルキルである、項目 4 9 0 に記載の組成物。(項目 4 9 2)R<sub>4</sub> が C<sub>2</sub> アルキルである、項目 4 9 0 に記載の組成物。(項目 4 9 3)R<sub>4</sub> が C<sub>3</sub> アルキルである、項目 4 9 0 に記載の組成物。(項目 4 9 4)R<sub>4</sub> が C<sub>4</sub> アルキルである、項目 4 9 0 に記載の組成物。(項目 4 9 5)R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および C O O H からなる群から選択される、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 9 6)R<sub>5</sub> がハロゲンである、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 9 7)R<sub>5</sub> がフッ素である、項目 4 9 6 に記載の組成物。(項目 4 9 8)R<sub>5</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルであり、ここで、該 C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキニルのそれぞれの炭素が、2 個以下の置換基で置換されており、これらの置換基は、それぞれ独立して、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルコキシル、- S H、チオ (C<sub>2</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル) アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルスルホニル、ホルミル、および C O O H からなる群から選択される、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 4 9 9)n が 0 である、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 5 0 0)n が 1 である、項目 4 4 6 に記載の組成物。(項目 5 0 1)

R<sub>8</sub>がハロゲンである、項目500に記載の組成物。

(項目502)

R<sub>8</sub>がフッ素である、項目501に記載の組成物。

(項目503)

項目446に記載の式VIの化合物を含む、投薬形態。

(項目504)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目503に記載の投薬形態。

(項目505)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目506)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、強迫性障害(OCD)を処置する工程を含む、該被検体においてOCDを処置する方法。

(項目507)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目508)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目509)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目510)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目511)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害(ADHD)を処置する工程を含む、該被検体においてADHDを処置する方法。

(項目512)

被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目513)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目512に記載の方法。

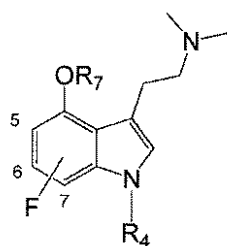
(項目514)

イヌ被検体に項目446に記載の式VIの化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎(ALD)を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目515)

構造式VIIによってあらわされる化合物

【化121】



(式VII)

〔式中、

Fは、5位、6位または7位の少なくとも1つに存在し；

R<sub>4</sub>およびR<sub>7</sub>は、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルから選択される。〕

またはその医薬的に許容される塩。

(項目516)

R<sub>4</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目517)

R<sub>4</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目518)

R<sub>4</sub>がC<sub>3</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目519)

R<sub>7</sub>がC<sub>1</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目520)

R<sub>7</sub>がC<sub>2</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目521)

R<sub>7</sub>がC<sub>3</sub>アルキルである、項目515に記載の化合物。

(項目522)

Fが5位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目523)

Fが6位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目524)

Fが7位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目525)

Fが5位および6位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目526)

Fが5位および7位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目527)

Fが6位および7位に存在する、項目515に記載の化合物。

(項目528)

項目515に記載の式V I Iの化合物を含む、医薬組成物。

(項目529)

項目515に記載の式V I Iの化合物を含む、投薬形態。

(項目530)

前記投薬形態が、経口投薬形態である、項目529に記載の投薬形態。

(項目531)

被検体に項目515に記載の式V I Iの化合物を投与し、肥満を処置する工程を含む、該被検体において肥満を処置する方法。

(項目532)

被検体に項目515に記載の式V I Iの化合物を投与し、強迫性障害(OCD)を処置する工程を含む、該被検体においてOCDを処置する方法。

(項目533)

被検体に項目515に記載の式V I Iの化合物を投与し、被検体の食欲を抑制する工程を含む、該被検体において食欲を抑制する方法。

(項目534)

被検体に項目515に記載の式V I Iの化合物を投与し、統合失調症または精神病を処置する工程を含む、該被検体において統合失調症または精神病を処置する方法。

(項目535)

被検体に項目515に記載の式V I Iの化合物を投与し、被検体の不安または鬱病を処置する工程を含む、該被検体において不安または鬱病を処置する方法。

(項目536)

被検体に項目515に記載の式VIIの化合物を投与し、被検体の糖尿病を処置する工程を含む、該被検体において糖尿病を処置する方法。

(項目537)

被検体に項目515に記載の式VIIの化合物を投与し、被検体の注意欠陥多動性障害(ADHD)を処置する工程を含む、該被検体においてADHDを処置する方法。

(項目538)

被検体に項目515に記載の式VIIの化合物を投与し、中枢神経系の障害を処置する工程を含む、該被検体において中枢神経系の障害を処置する方法。

(項目539)

前記中枢神経系の障害が、てんかん、アルツハイマー病、性的不全、依存症、神経性無食欲症、トゥレット症候群、および抜毛癖からなる群から選択される、項目538に記載の方法。

(項目540)

イヌ被検体に項目515に記載の式VIIの化合物を投与し、肢端舐性皮膚炎(ALD)を処置する工程を含む、該イヌ被検体において肢端舐性皮膚炎を処置する方法。

(項目541)

図10aまたは10bに開示されている化合物から選択される化合物、またはその医薬的に許容される塩。

(項目542)

前記化合物がHCl塩である、項目541に記載の化合物。