

【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8月9日(2012.8.9)

【公表番号】特表2011-526295(P2011-526295A)
 【公表日】平成23年10月6日(2011.10.6)
 【年通号数】公開・登録公報2011-040
 【出願番号】特願2011-516650(P2011-516650)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 C 0 7 D 413/14 (2006.01)
 C 0 7 D 401/14 (2006.01)
 C 0 7 D 405/14 (2006.01)
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/443 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 A 6 1 P 15/10 (2006.01)
 A 6 1 P 25/20 (2006.01)
 A 6 1 P 25/34 (2006.01)
 A 6 1 P 25/18 (2006.01)
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

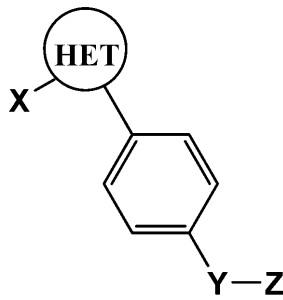
C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 413/14 C S P
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 405/12
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/443
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 15/10
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 25/34
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】
 【提出日】平成24年6月22日(2012.6.22)
 【手続補正1】
 【補正対象書類名】特許請求の範囲
 【補正対象項目名】全文
 【補正方法】変更
 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

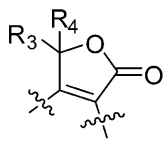
式(I)の化合物または薬学的に許容されるその塩：



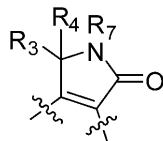
(I)

式中、

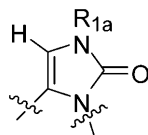
HETは下記式A7, A8, A10, A16, A17, A29 またはA30を有する複素環であり：



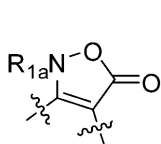
A7



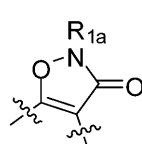
A8



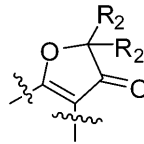
A10



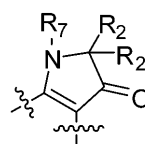
A16



A17



A29



A30

左端の基はX基に接続されており；

Xは置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいヘテロアリーールであり；

Yは-CH₂O-、または-OCH₂-であり、Y基の右端の基はZ置換基に接続されており；

Zは置換されていてもよいヘテロアリーールであり；

R_{1a}は水素であり；

各R₂は独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキルまたは置換されていてもよいアルコキシアリールであり、但し少なくとも1つのR₂は水素であり；

R₃およびR₄は独立して、水素、C₁~C₄アルキル、-CF₃または置換されていてもよいシクロアルキルであり、但し少なくとも1つのR₃またはR₄基は水素でなければならず；かつ

R₇は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル、または置換されていてもよいアルコキシアリールである。

【請求項 2】

Yが-CH₂O-であり、右端の基がZ置換基に接続されている、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

Yが-OCH₂-であり、右端の基がZ置換基に接続されている、請求項1記載の化合物。

【請求項 4】

Zが、6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロアリール、または置換されていてもよい複素二環式環系である、請求項1~3のいずれか一項記載の化合物。

【請求項5】

Zが、CおよびNより選択される6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロアリールであり、但し環窒素の総数が2以下であり；該環がC₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆シクロアルキルオキシ、C₄~C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニル、シアノおよびニトロからなる群より独立して選択される最大2個の置換基で置換されていてもよい、請求項1~4のいずれか一項記載の化合物。

【請求項6】

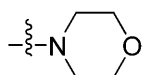
Zが、C₁~C₄アルキル、C₁~C₄アルコキシ、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆シクロアルキルオキシ、C₄~C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニル、シアノおよびニトロからなる群より独立して選択される最大3個の置換基で置換されている、ベンゾイミダゾリル、キノリニル、テトラヒドロキノリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル、テトラヒドロイソキノリル、5-メチルピリジン-2-イル、3,5-ジメチルピリジン-2-イル、6-フルオロキノリル、またはイソキノリニルである、請求項1~5のいずれか一項記載の化合物。

【請求項7】

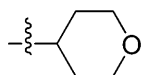
Z置換基が非置換である、請求項1~6のいずれか一項記載の化合物。

【請求項8】

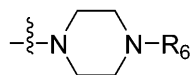
Xが、以下に示す式B1~B16を有するヘテロシクロアルキルである、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物：



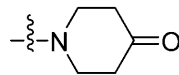
B1



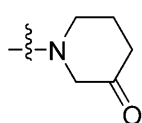
B2



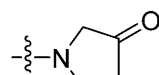
B3



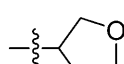
B4



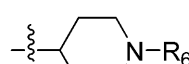
B5



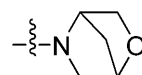
B6



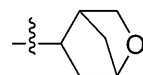
B7



B8



B9



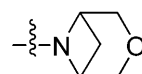
B10



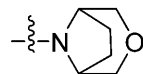
B11



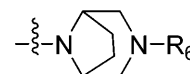
B12



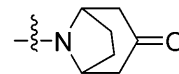
B13



B14



B15



B16

式中、R₆は水素、C₁~C₆アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、またはC₄~C₇シクロアルキルアルキルである。

【請求項9】

Xが置換されていてもよいヘテロアリールである、請求項1~8のいずれか一項記載の化合物。

【請求項10】

Xがフェニル、限定されたフェニルまたはピリジニルである、請求項1~8のいずれか一項記載の化合物。

【請求項11】

Xがベンゾ[d]オキサゾイル、ベンゾ[c][1,2,5]オキサジアジル、ベンゾ[c][1,2,5]チアジアゾリル、ベンゾ[d]イソオキサゾリル、1H-ベンゾ[d]イミダゾイル、ベンゾ[d]チアゾイル、ベンゾ[c]イソチアゾリル、ベンゾ[d]イソチアゾリル、ベンゾ[c]イソオキサゾリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニル、またはイミダゾ[1,5-a]ピリジニルである、請求項1~8のいずれか一項記載の化合物。

【請求項12】

実施例1~151、153~437、439~440、442~443、445~446、448~452、454~455、457~458、460~461、463~464、469~470、472~473、475~599、601~602、604~605、607~608、610~611、613~614、616~617、619~620、622~623、625~626、628~629、631~632、634~635、637~768、770~771、773~774、776~777、779~780、782~783、785~786、788~789、791~792、794~795、797~798、800~801、803~804、806~930、932~933、935~936、938~939、941~942、944~945、947~948、950~951、953~954、956~957、959~960、962~963、965~966、および968~1112のいずれかの化合物または薬学的に許容されるその塩。

【請求項13】

(i) 請求項1~12のいずれか一項記載の化合物または薬学的に許容されるその塩、および(ii)薬学的に許容される担体または賦形剤を含む薬学的組成物。

【請求項14】

CNS障害を処置するための方法であって、それを必要とするヒトに治療有効量の請求項13記載の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

【請求項15】

摂食障害、肥満、強迫性賭博、性障害、ナルコレプシー、睡眠障害を処置するためのまたは禁煙処置における使用のための方法であって、それを必要とするヒトに治療有効量の請求項13記載の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

【請求項16】

肥満、統合失調症、統合失調感情性状態、ハンチントン病、筋緊張異常状態および遅発性ジスキネジアを処置するための方法であって、それを必要とするヒトに治療有効量の請求項13記載の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0256

【補正方法】変更

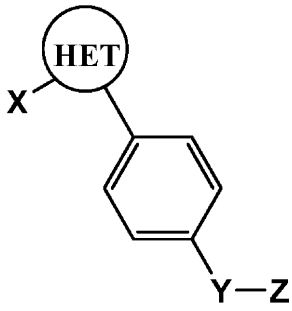
【補正の内容】

【0256】

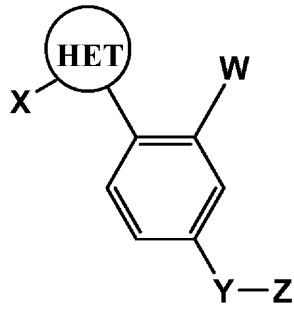
限定されたフェニルとはハロゲン、CF₃、CN、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリーロキシ、アルコキシアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキルオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリーロキシ、-OCH₂CH₂OCH₃、-OC(O)R_a、-OC(O)OR_a、-OC(O)N(R_a)、-N(R_a)(R_b)、-NHC(O)R_a、-N(R_a)C(O)R_b、-NHC(O)OR_a、-N(R_a)C(O)OR_b、-C(O)N(R_a)(R_b)、-COR_aより選択される最大3個の基で独立して置換されていてもよいベンゼン環のことであり、R_aおよびR_bはアルキル、アルコキシアルキル、-CH₂CH₂OH、-CH₂CH₂OMe、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロシクロアルキルおよびヘテロシクロアルキルアルキルより独立して選択され、いずれもハロゲン、Me、Et、ⁱPr、^tBu、非置換シクロプロピル、非置換シクロブチル、CN、NO₂、NH₂、CF₃、NHMe、NMe₂、OMe、OCF₃のみより選択される最大3個の基で独立して置換されていてもよく、いずれも炭素-炭素または炭素-窒素または炭素-酸素単結合を経由して結合しており；あるいはR_aおよびR_bはそれらが結合している原子と一緒になって5~6員環を形成する。

[本発明1001]

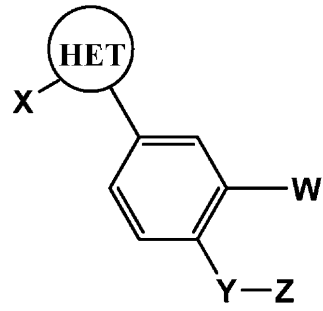
式(I)もしくは(II)もしくは(III)の化合物または薬学的に許容されるその塩:



(I)



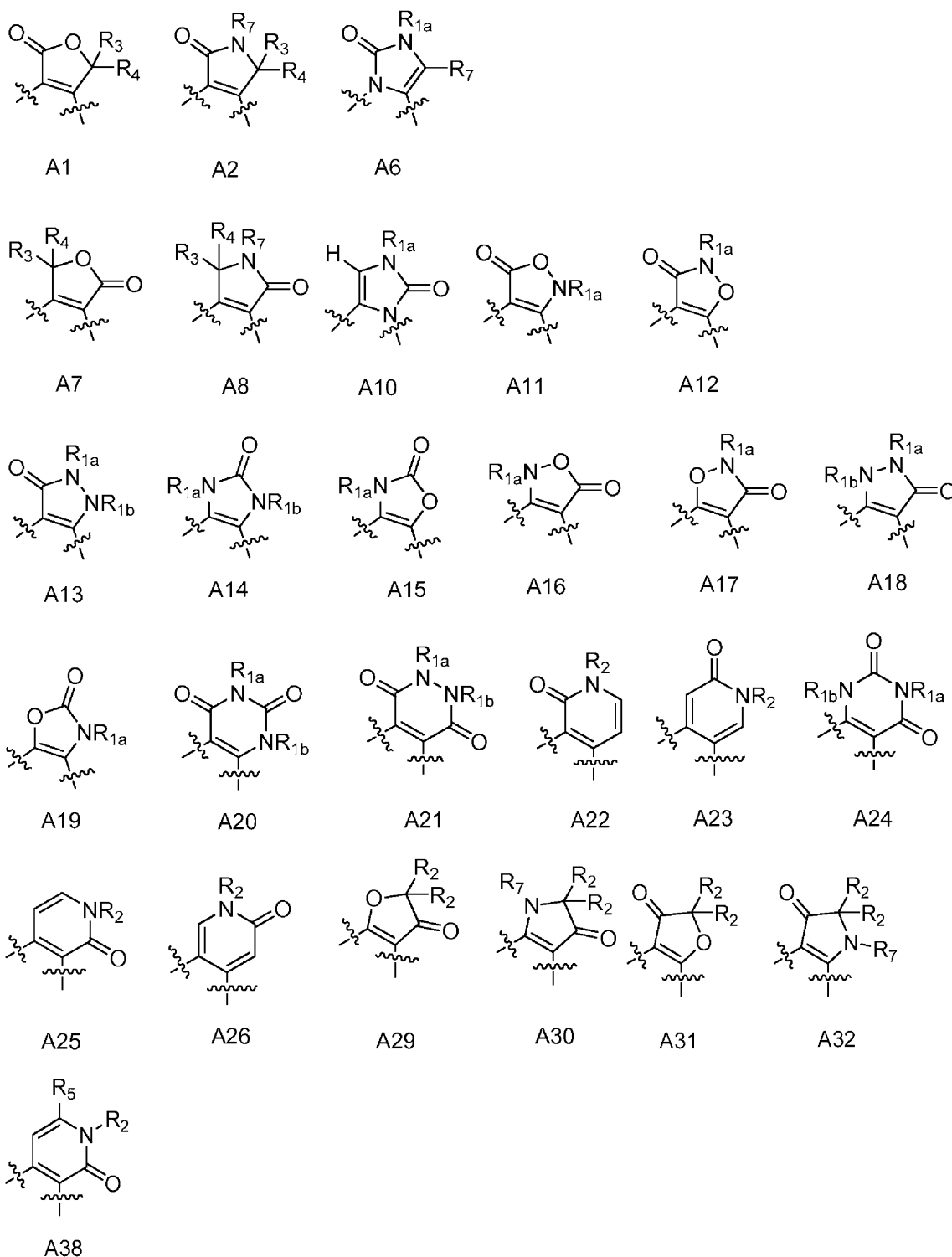
(II)



(III)

式中、

HETは下記式A1~A2、A6~A8、A10~A32およびA38より選択される複素環であり:



左端の基はX基に接続されており；

Wはハロゲン、シアノ、ニトロ、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシ、アミド、アルキルアミドおよびジアルキルアミドより選択され；

XはC₃~C₈アルキル、置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルキル、置換されていてもよいC₄~C₇シクロアルキルアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキルアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリールアルキル、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいヘテロアリールアルキルより選択され；

Yは結合、または-CH₂-、-O-、-SO₂-、-CH₂O-、-OCH₂-および-CH₂CH₂-より選択される二価のリンカー基であり、Y基の右端の基はZ置換基に接続されており；

Zは置換されていてもよいヘテロアリールであり；

R_{1a}は水素、C₁~C₄アルキル、置換されていてもよいC₃~C₆シクロアルキル、置換されていてもよいC₄~C₇シクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいC₄~C₇アルコキシアルキルより選択され、但しR_{1a}が水素ではない場合、R_{1b}は水素であり、あるいはR_{1b}が存在しない場合、R_{1a}は水素でなければならず;

R_{1b}は水素、C₁~C₄アルキル、C₃~C₆の置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいC₄~C₇シクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいC₄~C₇アルコキシアルキルより選択され、但しR_{1b}が水素ではない場合、R_{1a}は水素であり;

各R₂は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいアルコキシアルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つのR₂は水素であり;

R₃およびR₄は水素、C₁~C₄アルキル、CF₃および置換されていてもよいシクロアルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つのR₃またはR₄基は水素でなければならず;

R₅はアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいアルコキシアルキルより選択され;

R₇は水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいシクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいアルコキシアルキルより選択され;

nは1および2より独立して選択される。

[本発明1002]

式(II)の化合物が選択される、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

式(III)の化合物が選択される、本発明1001の化合物。

[本発明1004]

式(I)の化合物が選択される、本発明1001の化合物。

[本発明1005]

Yが-CH₂CH₂-であり、右端の基がZ置換基に接続されている、本発明1001~1004のいずれかの化合物。

[本発明1006]

Yが-CH₂O-または-OCH₂-より選択され、右端の基がZ置換基に接続されている、本発明1001~1004のいずれかの化合物。

[本発明1007]

Yが-CH₂O-であり、右端の基がZ置換基に接続されている、本発明1001~1004のいずれかの化合物。

[本発明1008]

Yが-OCH₂-であり、右端の基がZ置換基に接続されている、本発明1001~1004のいずれかの化合物。

[本発明1009]

Zが、6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロアリアル、および置換されていてもよい複素二環式環系より選択される、本発明1001~1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

Zが置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1008のいずれかの化合物。

[本発明1011]

Zが、一方の環が芳香族である置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1008のいずれかの化合物。

[本発明1012]

Zが、両方の環が芳香族である置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1008のいずれかの化合物。

[本発明1013]

Zが、正確に9個の環原子を含有する置換されていてもよい複素二環式環系である、本発

明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1014]

Zが、正確に10個の環原子を含有する置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1015]

Zが、CおよびNより選択される6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロアリールであり、但し環窒素の総数が2以下であり；該環がC₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大2個の置換基で置換されていてもよい、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1016]

Zが、CおよびNより選択される6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロアリールであり、但し環窒素の総数が2以下である、本発明1001～1008のいずれかの化合物

。

[本発明1017]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大3個の置換基で置換されているベンゾイミダゾリル、キノリニル、テトラヒドロキノリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル、テトラヒドロイソキノリル、5-メチルピリジン-2-イル、3,5-ジメチルピリジン-2-イル、6-フルオロキノリルおよびイソキノリニルより選択される、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1018]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニル、シアノおよびニトロより独立して選択される最大3個の置換基で置換されているベンゾイミダゾリル、キノリニル、テトラヒドロキノリル、テトラヒドロイソキノリルおよびイソキノリニルより選択される、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1019]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大3個の置換基で置換されているキノリニル、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル、5-メチルピリジン-2-イル、3,5-ジメチルピリジン-2-イルおよび6-フルオロキノリン-2-イルより選択される、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1020]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大2個の置換基で置換されていてもよい2-ピリジニルである、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1021]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、アルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大3個の置換基で置換されている6-フルオロキノリン-2-イルである、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1022]

Zが、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキルオキシ、C₄～C₇シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、ハロゲン、ア

ルキルスルホニルならびにシアノおよびニトロより独立して選択される最大3個の置換基で置換されている2-キノリニルである、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1023]

Zが2-キノリニルおよび6-フルオロキノリン-2-イルより選択される、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1024]

Zが2-キノリニルである、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1025]

Z置換基が非置換である、本発明1001～1008のいずれかの化合物。

[本発明1026]

HETが式A7、A8、A14、A15、A19、A25、A29、A30、A31、A32およびA38より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1027]

HETが式A7、A8、A25、A29、A30、A31、A32およびA38より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1028]

HETが式A7、A8、A25、A29、A30およびA38より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1029]

HETが式A1、A2、A7、A8、A14、A15およびA19より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1030]

HETが式A1、A2、A7およびA8より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1031]

HETが式A29、A30、A31およびA32より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1032]

HETが式A7、A8、A29およびA31より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物

。

[本発明1033]

HETが式A7およびA8より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1034]

HETが式A25およびA26より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1035]

HETが式A29およびA31より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1036]

HETが式A31およびA32より選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1037]

HETが式A1である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1038]

HETが式A2である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1039]

HETが式A7である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1040]

HETが式A8である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1041]

HETが式A25である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1042]

HETが式A29である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1043]

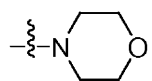
HETが式A31である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1044]

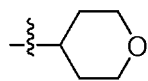
HETが式A38である、本発明1001～1025のいずれかの化合物。

[本発明1045]

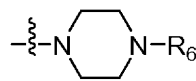
Xが、以下に示す式B1～B16より選択されるヘテロシクロアルキル基である、本発明1001～1044のいずれかの化合物：



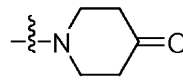
B1



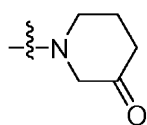
B2



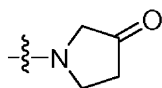
B3



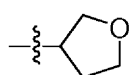
B4



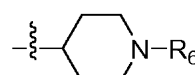
B5



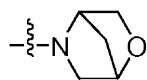
B6



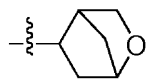
B7



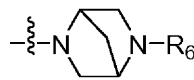
B8



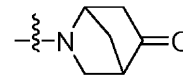
B9



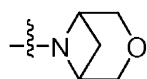
B10



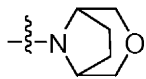
B11



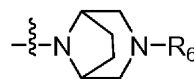
B12



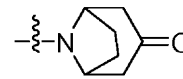
B13



B14



B15



B16

式中、 R_6 は水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルおよび $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルより選択される。

[本発明1046]

Xが、6個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロシクロアルキルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1047]

Xが、5個の環原子のみを有する置換されていてもよいヘテロシクロアルキルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1048]

Xが置換されていてもよいヘテロアールである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1049]

Xが、C、O、SおよびNより選択される5個の環原子を有する置換されていてもよい単環式芳香環であって、但し環ヘテロ原子の総数が4以下でありかつヘテロ原子の総数のうちの1つだけが酸素または硫黄であり得る単環式芳香環、ならびにCおよびNより選択される6個の原子を有する単環式芳香環であって、但し3個以下の環原子がNでありかつ該環が $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 CF_3 、カルボキシル、アルコシアルキル、 $C_1 \sim C_4$ シクロアルキルアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、チオアルキル、ハロゲン、シアノおよびニトロより選択される最大2個の基で独立して置換されていてもよい単環式芳香環より選択される、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1050]

Xが、CおよびNより選択される6個の環原子を有する置換されていてもよい単環式芳香環であって、但し3個以下の環原子がNでありかつ該環がC₁~C₄アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、C₁~C₄アルコキシ、CF₃、カルボキシル、アルコキシアルキル、C₁~C₄シクロアルキルアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、チオアルキル、ハロゲン、シアノおよびニトロより選択される最大2個の基で独立して置換されていてもよい単環式芳香環である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1051]

Xが、C、O、SおよびNより選択される5個の環原子を有する置換されていてもよい単環式芳香環であって、但し環ヘテロ原子の総数が4以下でありかつヘテロ原子の総数のうち1つだけが酸素または硫黄であり得るものでありかつ該環がC₁~C₄アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、C₁~C₄アルコキシ、CF₃、カルボキシル、アルコキシアルキル、C₁~C₄シクロアルキルアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アミド、アルキルアミド、ジアルキルアミド、チオアルキル、ハロゲン、シアノおよびニトロより選択される最大2個の基で独立して置換されていてもよい単環式芳香環である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1052]

Xが置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1053]

Xが、一方の環が芳香族である置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1054]

Xが、両方の環が芳香族である置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1055]

Xが、正確に9個の環原子を含有する置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1056]

Xが、正確に10個の環原子を含有する置換されていてもよい複素二環式環系である、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1057]

Xがフェニルおよびピリジニルより選択される、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1058]

Xが限定されたフェニルである、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1059]

Xが、F、Cl、CN、NO₂、CF₃、OCF₃、OCHF₂、CH₂CF₃およびOMeより選択される1個または複数の置換基で置換されていてもよいフェニルである、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1060]

Xが3,4-二置換フェニル、3-置換フェニルおよび4-置換フェニルより選択される、本発明1001~1044、1058および1059のいずれかの化合物。

[本発明1061]

Xが3,4-二置換フェニルおよび4-置換フェニルより選択される、本発明1001~1044、1058および1059のいずれかの化合物。

[本発明1062]

Xが4-置換フェニルである、本発明1001~1044、1058および1059のいずれかの化合物。

[本発明1063]

Xがベンゾ[d]オキサゾイル、ベンゾ[c][1,2,5]オキサジアジル、ベンゾ[c][1,2,5]チア

ジアゾリル、ベンゾ[d]イソオキサゾリル、1H-ベンゾ[d]イミダゾイル、ベンゾ[d]チアゾイル、ベンゾ[c]イソチアゾリル、ベンゾ[d]イソチアゾリル、ベンゾ[c]イソオキサゾリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジニルおよびイミダゾ[1,5-a]ピリジニルより選択される、本発明1001～1044および1055のいずれかの化合物。

[本発明1064]

Xがベンゾ[c][1,2,5]オキサジアジールおよびベンゾ[c][1,2,5]チアジアゾリルより選択される、本発明1001～1044および1063のいずれかの化合物。

[本発明1065]

Xがベンゾ[d]オキサゾイル、1H-ベンゾ[d]イミダゾイルおよびベンゾ[d]チアゾイルより選択される、本発明1001～1044および1063のいずれかの化合物。

[本発明1066]

Xがモルホリニル、ピラニルおよびテトラヒドロフラニルより選択される、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1067]

Xが、C₁～C₄アルキル、シクロプロピル、シクロプロピルオキシ、シクロプロピルメチル、C₁～C₄アルコキシ、CF₃、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、チオアルキル、ハロゲンおよびシアノより選択される1個の基で置換されていてもよい4-ピリジニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1068]

Xがモルホリニル(式B1を有する)および4-ピラニル(式B2を有する)より選択される、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1069]

Xが4-ピリジニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1070]

Xがベンゾ[c][1,2,5]オキサジアゾイルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1071]

Xがベンゾ[c][1,2,5]チアジアゾリルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1072]

Xが3-クロロ-4-メトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1073]

Xが3-シアノ-4-メトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1074]

Xが3-クロロ-4-ジフルオロメトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1075]

Xが3-シアノ-4-ジフルオロメトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1076]

Xが4-ニトロフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1077]

Xが4-メトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1078]

Xが4-クロロフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1079]

Xが4-シアノフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1080]

Xが4-トリフルオロメトキシフェニルである、本発明1001～1044のいずれかの化合物。

[本発明1081]

Wがニトロ、カルボキシ、アミド、アルキルアミドおよびジアルキルアミドより選択さ

れる、本発明1001～1080のいずれかの化合物。

[本発明1082]

Wがハロゲン、シアノおよび $C_1 \sim C_4$ アルコキシより選択される、本発明1001～1080のいずれかの化合物。

[本発明1083]

Wがハロゲンおよびシアノより選択される、本発明1001～1080のいずれかの化合物。

[本発明1084]

R_{1a} が水素、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルより選択され、但し R_{1b} が水素であり、あるいは R_{1b} が存在しない場合、 R_{1a} が水素でなければならない、本発明1001～1083のいずれかの化合物。

[本発明1085]

R_{1a} が水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルより選択され、但し R_{1a} がアルキルである場合、 R_{1b} が水素であり、あるいは R_{1b} が存在しない場合、 R_{1a} が水素でなければならない、本発明1001～1083のいずれかの化合物。

[本発明1086]

R_{1a} が水素および置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルより選択され、但し R_{1b} が水素であり、あるいは R_{1b} が存在しない場合、 R_{1a} が水素でなければならない、本発明1001～1083のいずれかの化合物。

[本発明1087]

R_{1a} が水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルより選択され、但し R_{1b} が水素であり、あるいは R_{1b} が存在しない場合、 R_{1a} が水素でなければならない、本発明1001～1083のいずれかの化合物

。

[本発明1088]

R_{1a} が水素である、本発明1001～1083のいずれかの化合物。

[本発明1089]

R_{1b} が置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルより選択され、但し R_{1a} が水素である、本発明1001～1088のいずれかの化合物。

[本発明1090]

R_{1b} が水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルより選択され、但し R_{1b} がアルキルである場合、 R_{1a} が水素である、本発明1001～1088のいずれかの化合物。

[本発明1091]

R_{1b} が置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、但し R_{1a} が水素である、本発明1001～1088のいずれかの化合物。

[本発明1092]

R_{1b} が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、但し R_{1a} が水素である、本発明1001～1087のいずれかの化合物。

[本発明1093]

R_{1b} が水素である、本発明1001～1088のいずれかの化合物。

[本発明1094]

各 R_2 が水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_4 \sim C_7$ シクロアルキルアルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つの R_2 が水素である、本発明1001～1093のいずれかの化合物。

[本発明1095]

各 R_2 が水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つの R_2 が水素である、本発明1001～1093のいずれかの化合物。

[本発明1096]

各 R_2 が水素および $C_1 \sim C_4$ アルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つの R_2 が水素である、本発明1001～1093のいずれかの化合物。

[本発明1097]

各R₂が水素である、本発明1001～1093のいずれかの化合物。

[本発明1098]

R₃およびR₄が水素およびC₃～C₆シクロアルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つのR₃またはR₄基が水素でなければならない、本発明1001～1097のいずれかの化合物。

[本発明1099]

R₃およびR₄が水素およびC₁～C₄アルキルより独立して選択され、但し少なくとも1つのR₃またはR₄基が水素でなければならない、本発明1001～1097のいずれかの化合物。

[本発明1100]

R₃およびR₄が水素である、本発明1001～1097のいずれかの化合物。

[本発明1101]

R₅が置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルおよびC₁～C₄アルキルより選択される、本発明1001～1100のいずれかの化合物。

[本発明1102]

R₅が置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルである、本発明1001～1100のいずれかの化合物。

[本発明1103]

R₅がC₁～C₄アルキルである、本発明1001～1100のいずれかの化合物。

[本発明1104]

R₇が水素、C₁～C₄アルキル、置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキル、置換されていてもよいC₄～C₇シクロアルキルアルキルおよび置換されていてもよいC₄～C₇アルコキシアルキルより選択される、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1105]

R₇が水素、C₁～C₄アルキル、置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルおよび置換されていてもよいC₄～C₇シクロアルキルアルキルより選択される、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1106]

R₇がC₁～C₄アルキル、置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルおよび置換されていてもよいC₄～C₇シクロアルキルアルキルより選択される、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1107]

R₇がC₁～C₄アルキルおよび置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルより選択される、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1108]

R₇がC₁～C₄アルキルである、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1109]

R₇が置換されていてもよいC₃～C₆シクロアルキルである、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1110]

R₇が水素である、本発明1001～1103のいずれかの化合物。

[本発明1111]

実施例1～151、153～437、439～440、442～443、445～446、448～452、454～455、457～458、460～461、463～464、469～470、472～473、475～599、601～602、604～605、607～608、610～611、613～614、616～617、619～620、622～623、625～626、628～629、631～632、634～635、637～768、770～771、773～774、776～777、779～780、782～783、785～786、788～789、791～792、794～795、797～798、800～801、803～804、806～930、932～933、935～936、938～939、941～942、944～945、947～948、950～951、953～954、956～957、959～960、962～963、965～966および968～1112のいずれかより選択される化合物または薬学的に許容されるその塩。

[本発明1112]

本発明1001～1111のいずれかの化合物および薬学的に許容される担体または賦形剤を含

む薬学的組成物。

[本発明1113]

CNS障害を処置するための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

[本発明1114]

摂食障害、肥満、強迫性賭博、性障害、ナルコレプシー、睡眠障害を処置するためのまたは禁煙処置における使用のための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

[本発明1115]

肥満、統合失調症、統合失調感情性状態、ハンチントン病、筋緊張異常状態および遅発性ジスキネジアを処置するための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

[本発明1116]

統合失調症および統合失調感情性状態を処置するための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

[本発明1117]

ハンチントン病を処置するための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。

[本発明1118]

肥満およびメタボリックシンドロームを処置するための方法であって、それを有するヒトに治療有効量の本発明1112の薬学的組成物を投与する段階を含む前記方法。