

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 18 年 6 月 15 日 (2006.6.15)

【公表番号】特表 2006-501245 (P2006-501245A)

【公表日】平成 18 年 1 月 12 日 (2006.1.12)

【年通号数】公開・登録公報 2006-002

【出願番号】特願 2004-531589 (P2004-531589)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 307/80 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/343 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/353 (2006.01)**

**A 6 1 P 27/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 27/06 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 311/04 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 307/80

A 6 1 K 31/343

A 6 1 K 31/353

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 43/00 1 1 4

C 0 7 D 311/04 C S P

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 4 月 18 日 (2006.4.18)

【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

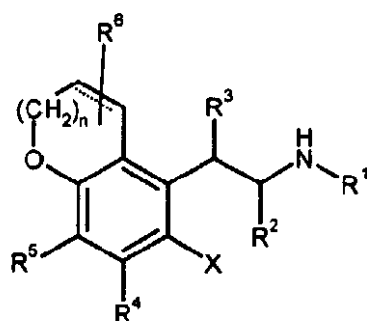
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式 I によって示される化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物：

【化 1】



式中、

R<sup>1</sup> は、水素またはアルキル基である；

$R^2$ は、水素、アルキル基であるか、または $R^1$ と $R^2$ が $(CH_2)_{2-4}$ を示して複素環を完成する；  
 $R^3$ は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、またはハロゲンである；  
 $R^4$ および $R^5$ は、水素、ハロゲン、ニトリル、アルコキシ基、アルキルチオール、置換されたもしくは未置換のアルキル基から独立して選択されるか、あるいは $R^4$ と $R^5$ が $(CH_2)_m$ を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは $R^4$ と $R^5$ がフェニルまたはチオフェン環を示すかもしくはそれらを完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、アルキル基、もしくはアルコキシ基で置換されている；

$m=3\sim 4$ ；

$n=1\sim 2$ ；

$R^6$ は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、または、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換されたアルコキシ、 $OC(=O)$ アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、または置換されたもしくは未置換のアルキル基であり、

$X$ は、アルコキシ基、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

$R^7$ および $R^8$ は、水素、アルキル基、または $C(=O)$ アルキルから独立して選択される。

【請求項2】

$R^1$ が、水素または $C_{1-4}$ アルキルである；

$R^2$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキルであるか、または $R^1$ と $R^2$ が $(CH_2)_{2-4}$ を示して複素環を完成する；

$R^3$ が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、またはハロゲンである；

$R^4$ および $R^5$ が、水素、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオール、 $C_{1-4}$ アルキル、ハロゲンもしくは $C_{1-6}$ アルコキシで置換された $C_{1-4}$ アルキルから独立して選択されるか、あるいは $R^4$ と $R^5$ が $(CH_2)_m$ を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは $R^4$ と $R^5$ が一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキル、もしくは $C_{1-4}$ アルコキシで置換されている；

$m=3\sim 4$ ；

$n=1\sim 2$ ；

$R^6$ が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、または、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルキルであり、

$X$ が、 $C_{1-4}$ アルコキシ、またはヒドロキシルである；

$R^7$ および $R^8$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、または $C(=O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される、

請求項1に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物。

【請求項3】

前記 $R^2$ が水素または $C_{1-4}$ アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

$R^1$ および $R^3$ が水素である；

$R^2$ が $C_{1-4}$ アルキルである；

$R^4$ および $R^5$ が、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオール、 $C_{1-4}$ アルキル、ハロゲンで置換された $C_{1-4}$ アルキルから独立して選択されるか、あるいは $R^4$ と $R^5$ が一緒に $(CH_2)_m$ を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは $R^4$ と $R^5$ が一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成し、それは未置換であるか、もしくはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキルで置換されている；

$m=3\sim 4$ ；

$n=1$ ；

$R^6$ が、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $NR^7R^8$ 、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルキルであり、

$X$ が、 $C_{1-4}$ アルコキシまたはヒドロキシルである；

$R^7$ および $R^8$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、または $C(=O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される

、  
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

前記化合物が以下の化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物：

5-(2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノ-1-ヒドロキシ-プロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

シクロプロパンカルボン酸5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-イルエステル；

[5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-イル]-メタノール；

5-(2-アミノプロピル)-8-ヨード-クロマン-3,6-ジオール；または

[4-(2-アミノプロピル)-5-メトキシ-7-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-2-イル]-メタノール。

【請求項 6】

前記Xがヒドロキシルである、請求項 1 に記載の化合物。

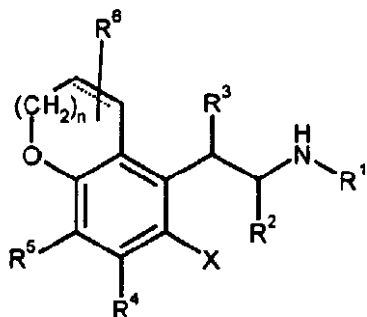
【請求項 7】

前記Xがアルコキシ基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

以下の式Iによって示される少なくとも1つの化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物を含む組成物の薬学的に有効な量を投与することを含む、正常な眼圧または高い眼圧を調節する方法：

【化 1】



式中、

R<sup>1</sup>は、水素またはアルキル基である；

R<sup>2</sup>は、水素、アルキル基であるか、またはR<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>が(CH<sub>2</sub>)<sub>2-4</sub>を示して複素環を完成する；

R<sup>3</sup>は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、またはハロゲンである；

R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、水素、ハロゲン、ニトリル、アルコキシ基、アルキルチオール、置換されたもしくは未置換のアルキル基から独立して選択されるか、あるいはR<sup>4</sup>とR<sup>5</sup>が(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいはR<sup>4</sup>とR<sup>5</sup>がフェニルまたはチオフェン環を示すかもしくはそれらを完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、アルキル基、もしくはアルコキシ基で置換されている；

m=3~4；

n=0~2；

R<sup>6</sup>は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、または、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくはNR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>で置換されたアルコキシ、OC(=O)アルキル、=O、NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、または置換されたもしくは未置換のアルキル基であり、式中、n=0の場合にはR<sup>6</sup>は水素ではない；

Xは、アルコキシ基、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は、水素、アルキル基、またはC(=O)アルキルから独立して選択される。

【請求項 9】

化合物が、

$R^1$  が、水素または  $C_{1-4}$  アルキルである；

$R^2$  が、水素、 $C_{1-4}$  アルキルであるか、または  $R^1$  と  $R^2$  が  $(CH_2)_{2-4}$  を示して複素環を完成する；

$R^3$  が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、またはハロゲンである；

$R^4$  および  $R^5$  が、水素、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-6}$  アルキルチオール、 $C_{1-4}$  アルキル、ハロゲンもしくは  $C_{1-6}$  アルコキシで置換された  $C_{1-4}$  アルキルから独立して選択されるか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が  $(CH_2)_m$  を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が一緒にフェニルまたはチオフエン環を完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキル、もしくは  $C_{1-4}$  アルコキシで置換されている；

$m=3 \sim 4$ ；

$n=0 \sim 2$ ；

$R^6$  が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、または  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$  アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、 $C_{1-4}$  アルキル、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルキルであり、式中、 $n=0$  の場合には  $R^6$  は水素ではない；

$X$  が、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

$R^7$  および  $R^8$  が、水素、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C(=O)C_{1-6}$  アルキルから独立して選択される；

化合物あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物である、  
請求項 8 に記載の方法。

#### 【請求項 10】

化合物が、

$R^1$  および  $R^3$  が水素である；

$R^2$  が  $C_{1-4}$  アルキルである；

$R^4$  および  $R^5$  が、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-6}$  アルキルチオール、 $C_{1-4}$  アルキル、ハロゲンで置換された  $C_{1-4}$  アルキルから独立して選択されるか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が一緒に  $(CH_2)_m$  を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が一緒にフェニルまたはチオフエン環を完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$  アルキルで置換されている；

$m=3 \sim 4$ ；

$n=1$ ；

$R^6$  が、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$  アルキル、 $NR^7R^8$ 、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルキルであり；

$X$  が、 $C_{1-4}$  アルコキシまたはヒドロキシルである；

$R^7$  および  $R^8$  が、水素、 $C_{1-4}$  アルキル、または  $C(=O)C_{1-6}$  アルキルから独立して選択される；

請求項 8 に記載の方法。

#### 【請求項 11】

前記化合物が以下の化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物、あるいはそれらの組み合わせである請求項 8 に記載の方法：

5-(2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノ-1-ヒドロキシ-プロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

シクロプロパンカルボン酸 5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-イルエステル；

[5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-イル]-メタノール；

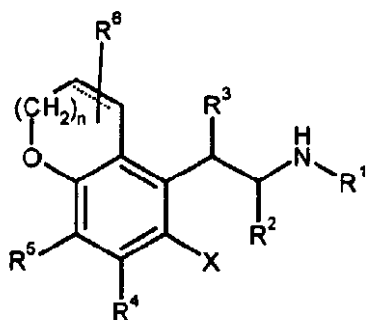
5-(2-アミノプロピル)-8-ヨード-クロマン-3,6-ジオール；または

[4-(2-アミノプロピル)-5-メトキシ-7-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-2-イル]-メタノール。

【請求項 1 2】

以下の式 I によって示される少なくとも 1 つの化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物を含む組成物の薬学的に有効な量を投与することを含む、緑内障の治療方法：

【化 1】



式中、

$R^1$  は、水素またはアルキル基である；

$R^2$  は、水素、アルキル基であるか、または  $R^1$  と  $R^2$  が  $(CH_2)_{2-4}$  を示して複素環を完成する；

$R^3$  は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、またはハロゲンである；

$R^4$  および  $R^5$  は、水素、ハロゲン、ニトリル、アルコキシ基、アルキルチオール、置換されたもしくは未置換のアルキル基から独立して選択されるか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が  $(CH_2)_m$  を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  がフェニルまたはチオフェン環を示すかもしくはそれらを完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、アルキル基、もしくはアルコキシ基で置換されている；

$m=3 \sim 4$ ；

$n=0 \sim 2$ ；

$R^6$  は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ基、または、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換されたアルコキシ、 $OC(=O)$ アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、または置換されたもしくは未置換のアルキル基であり、式中、 $n=0$  の場合には  $R^6$  は水素ではない；

X は、アルコキシ基、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

$R^7$  および  $R^8$  は、水素、アルキル基、または  $C(=O)$ アルキルから独立して選択される。

【請求項 1 3】

化合物が、

$R^1$  が、水素または  $C_{1-4}$ アルキルである；

$R^2$  が、水素、 $C_{1-4}$ アルキルであるか、または  $R^1$  と  $R^2$  が  $(CH_2)_{2-4}$  を示して複素環を完成する；

$R^3$  が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、またはハロゲンである；

$R^4$  および  $R^5$  が、水素、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオール、 $C_{1-4}$ アルキル、ハロゲンもしくは  $C_{1-6}$ アルコキシで置換された  $C_{1-4}$ アルキルから独立して選択されるか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が  $(CH_2)_m$  を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは  $R^4$  と  $R^5$  が一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキル、もしくは  $C_{1-4}$ アルコキシで置換されている；

$m=3 \sim 4$ ；

$n=0 \sim 2$ ；

$R^6$  が、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、または  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$ アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、 $C_{1-4}$ アルキル、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$ アルキルであり、式中、 $n=0$  の場合には  $R^6$  は水素ではない；

Xが、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

$R^7$ および $R^8$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、または $C(=O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される；

化合物あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物である、  
請求項12に記載の方法。

【請求項14】

$R^1$ および $R^3$ が水素である；

$R^2$ が $C_{1-4}$ アルキルである；

$R^4$ および $R^5$ が、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、 $C_{1-6}$ アルキルチオール、 $C_{1-4}$ アルキル、ハロゲンで置換された $C_{1-4}$ アルキルから独立して選択されるか、あるいは $R^4$ と $R^5$ と一緒に $(CH_2)_m$ を示してシクロアルキル環を完成するか、あるいは $R^4$ と $R^5$ と一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成し、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキルで置換されている；

$m=3\sim 4$ ；

$n=1$ ；

$R^6$ が、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルコキシ、 $OC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $NR^7R^8$ 、またはヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルキルであり；

Xが、 $C_{1-4}$ アルコキシまたはヒドロキシルである；

$R^7$ および $R^8$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、または $C(=O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択される；

請求項12に記載の方法。

【請求項15】

前記化合物が以下の化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩または溶媒和物、あるいはそれらの組み合わせである、請求項12に記載の方法：

5-(2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-オール；

5-((R)-2-アミノ-1-ヒドロキシ-プロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-オール；

シクロプロパンカルボン酸5-((R)-2-アミノプロピル)-8-ブromo-6-メトキシ-クロマン-3-イルエステル；

[5-(2-アミノプロピル)-6-メトキシ-8-メチル-クロマン-3-イル]-メタノール；

5-(2-アミノプロピル)-8-ヨード-クロマン-3,6-ジオール；または

[4-(2-アミノプロピル)-5-メトキシ-7-メチル-2,3-ジヒドロ-ベンゾフラン-2-イル]-メタノール。

【請求項16】

請求項1に記載の化合物および少なくとも1つの担体を含む、医薬組成物。

【請求項17】

有効量の請求項1に記載の少なくとも1つの化合物を患者に投与することを含む、セロトニン受容体を遮断するか、あるいはセロトニン受容体に対する結合を形成させる方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0016

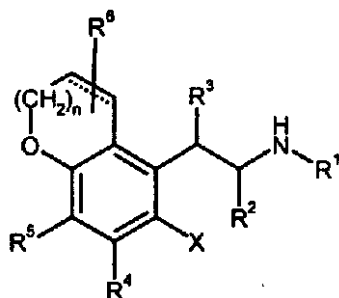
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0016】

これらおよび他の利点を達成するため、ならびに本発明の目的に従って、本明細書中に具体化されておりそして広く記載されているように、本発明は以下の式Iで示される化合物に関する：

## 【化 1】



式中、 $R^1$ は、水素、または $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基である；

$R^2$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基であるか、または $R^1$ と $R^2$ と一緒に $(CH_2)_{2-4}$ であり、複素環を完成することができる；

$R^3$ は、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、またはハロゲンである；

$R^4$ および $R^5$ は、水素、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオールのようなアルキルチオ、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、ハロゲンもしくは $C_{1-6}$ アルコキシで置換された $C_{1-4}$ アルキルのような置換されたアルキル基から独立して選択されるか；あるいは、 $R^4$ と $R^5$ と一緒に $(CH_2)_m$ であり、シクロアルキル環を完成することができるか、あるいは、 $R^4$ と $R^5$ と一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成することができ、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、もしくは $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基で置換されていてよい；

$m=3 \sim 4$ ；

$n=0 \sim 2$ ；

$R^6$ は、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルコキシのような置換されたアルコキシ、または、 $OC(=O)C_{1-6}$ アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは $NR^7R^8$ で置換された $C_{1-4}$ アルキルのような置換されたアルキル基であるが、式中、 $n=0$ の場合には $R^6$ は水素ではあり得ない；

Xは、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、ヒドロキシル、またはハロゲンである；

$R^7$ および $R^8$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、または $C(=O)C_{1-6}$ アルキルから独立して選択され；点線で示した結合は単結合または二重結合を示す。

## 【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

この式において、 $R^1$ は、水素、または $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基である；

$R^2$ は、水素、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基であるか、または $R^1$ と $R^2$ と一緒に $(CH_2)_{2-4}$ であり、複素環を完成することができる；

$R^3$ は、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、またはハロゲンである；

$R^4$ および $R^5$ は、水素、ハロゲン、ニトリル、 $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオールのようなアルキルチオ、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、ハロゲンもしくは $C_{1-6}$ アルコキシで置換されたアルキル基から独立して選択されるか；あるいは、 $R^4$ と $R^5$ と一緒に $(CH_2)_m$ であり、シクロアルキル環を完成することができるか、あるいは、 $R^4$ と $R^5$ と一緒にフェニルまたはチオフェン環を完成することができ、それは未置換であるか、またはハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキルのようなアルキル基、もしくは $C_{1-4}$ アルコキシのようなアルコキシ基で置換されていてよい；

$m=3 \sim 4$  ;

$n=0 \sim 2$  ;

$R^6$  は、水素、ヒドロキシル、 $C_{1-4}$  アルコキシのようなアルコキシ基、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルコキシのような置換されたアルコキシ基、 $OC(=O)C_{1-6}$  アルキル、 $=O$ 、 $NR^7R^8$ 、 $C_{1-4}$  アルキルのようなアルキル基、または、ヒドロキシル、ハロゲン、もしくは  $NR^7R^8$  で置換された  $C_{1-4}$  アルキルのような置換されたアルキル基であるが、式中、 $n=0$  の場合には  $R^6$  は水素ではあり得ない ;

$X$  は、 $C_{1-4}$  アルコキシのようなアルコキシ基、ヒドロキシル、またはハロゲンである ;

$R^7$  および  $R^8$  は、水素、 $C_{1-4}$  アルキルのようなアルキル基、または  $C(=O)C_{1-6}$  アルキルから独立して選択され ; 点線で示した結合は単結合または二重結合を示す。