

【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12月20日(2012.12.20)

【公表番号】特表2012-507567(P2012-507567A)

【公表日】平成24年3月29日(2012.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2012-013

【出願番号】特願2011-534828(P2011-534828)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/55 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 150

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/55

A 61 P 43/00 113

A 61 P 25/18

A 61 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月30日(2012.10.30)

【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

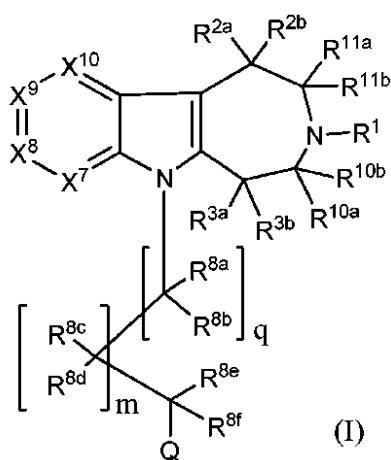
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

【化202】



(式中、

R¹は、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換の

ヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、C₁～C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、チオール、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであり、

各R^{2a}、R^{2b}、R^{3a}およびR^{3b}は、独立して、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、C₁～C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、チオール、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナルR²もしくはR³と一緒にになって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成し、

各R^{10a}、R^{10b}、R^{11a}およびR^{11b}は、独立して、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、C₁～C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、チオール、チオアルキル、置換されたアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナルR¹⁰もしくはR¹¹と一緒にになって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成し、

各X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、独立して、NまたはCR⁴であり、

各R⁴は、独立して、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、C₁～C₈ペルハロアルキル、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、C₁～C₈ペルハロアルコキシ、C₁～C₈アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、カルボニルアルコキシ、チオール、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、カルボニルアルキレンアルコキシ、アルキルスルホニルアミノまたはアシルであり、

各mおよびqは、独立して、0または1であり、

各R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、R^{8e}およびR^{8f}は、独立して、H、ヒドロキシル、アルコキシ、ハロ、C₁～C₈ペルハロアルキル、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₃～C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニルであるか、またはジェミナルR⁸と一緒にになって、式-OCH₂CH₂O-の部分を形成するか、これが結合している炭素およびジェミナルR⁸と一緒にになって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成するか、ジェミナルR⁸と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成するか、ビシナルR⁸およびこれらが結合している炭素原子と一緒にになって、置換もしくは非置換のC₃～C₈シクロアルキル、置換もしくは非置換のC₃～C₈シクロアルケニルまたは置換もしくは非置換のヘテロシクリル部分を形成するか、またはビシナルR⁸と一緒にになって、結合を形成するが、ただし、R⁸がビシナルR⁸と一緒にになって結合を形成する場合、前記

ジェミナル R⁸ は、ヒドロキシル以外であり、そして

Q は、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルケニル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアミノ、アルコキシ、アミノアシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、アミノカルボニルアルコキシ、アシルアミノ、カルボキシ、シアノまたはアルキニルであるが、ただし、該化合物は表 1 の化合物以外とする

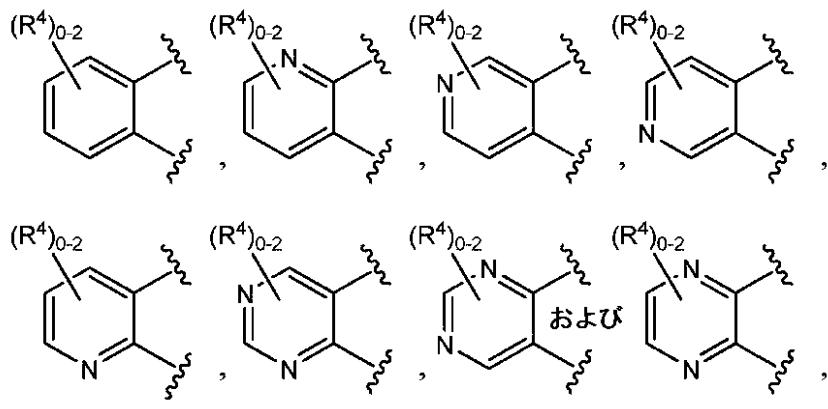
、

またはその塩もしくは溶媒和物。

【請求項 2】

(i) X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ が、一緒になって、

【化 203】

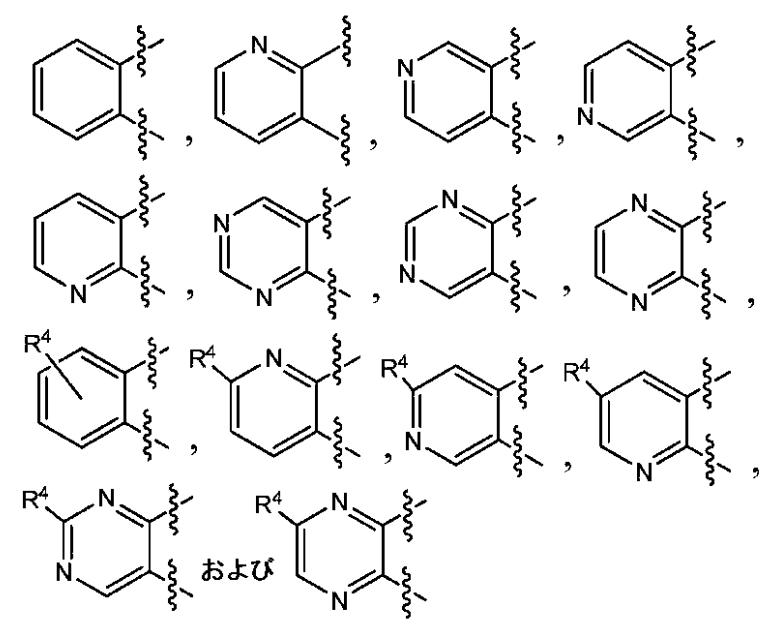


(式中、各 R⁴ は、独立して、ヒドロキシル、ハロ、C₁ ~ C₈ ペルハロアルキル、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、置換もしくは非置換の C₂ ~ C₈ アルケニル、置換もしくは非置換の C₂ ~ C₈ アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、C₁ ~ C₈ ペルハロアルコキシ、C₁ ~ C₈ アルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アルキルスルホニルアミノまたはアシルである)

からなる群から選択される芳香族部分を提供する、または

(ii) X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ が、一緒になって、

【化 204】



(式中、R⁴ は、ヒドロキシル、ハロ、C₁ ~ C₈ ペルハロアルキル、置換もしくは非置

換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルケニル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、 $C_1 \sim C_8$ ペルハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アルキルスルホニルアミノまたはアシルである)

からなる群から選択される芳香族部分を提供する、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

(i) R^1 が、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキルである、または、

(ii) R^1 が、メチル、エチル、シクロプロピル、プロピレート、トリフルオロメチル、イソプロピル、tert-ブチル、sec-ブチル、2-メチルブチル、プロパンール、1-メチル-2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエタナール、2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシプロピル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、置換されたフェニル、ピペリジン-4-イル、ヒドロキシシクロペニタ-3-イル、ヒドロキシシクロペニタ-2-イル、ヒドロキシシクロプロパ-2-イル、1-ヒドロキシ-1-メチルシクロプロパ-2-イル、または1-ヒドロキシ-1,2,2-トリメチル-シクロプロパ-3-イルである、請求項 1 から 2 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 4】

(i) 各 R^{2a} および R^{2b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノ、ニトロであるか、または R^{2a} および R^{2b} が、これが結合している炭素と一緒にになって、カルボニル部分を形成し、

各 R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノまたはニトロである、または

(ii) R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} および R^{3b} のそれぞれが、H である、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

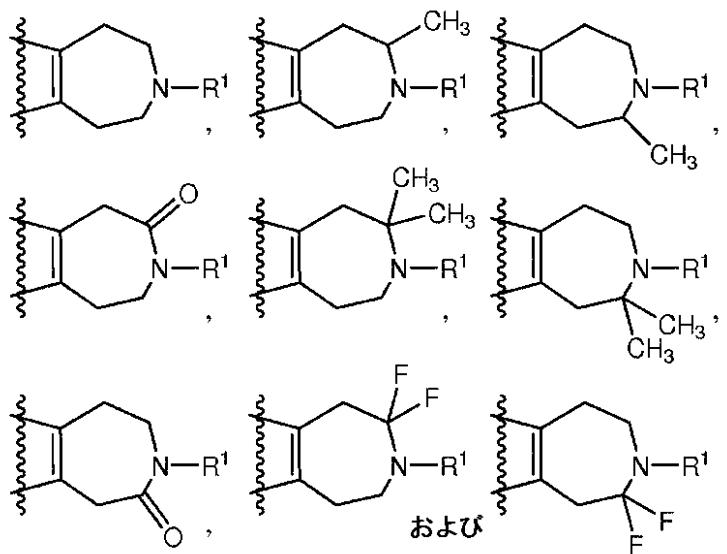
【請求項 5】

各 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} が、独立して、H、ハロ、非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ヒドロキシルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、請求項 1 から 4 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} が、一緒にになって、

【化 2 0 5 】



からなる群から選択される環を形成する、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

(i) 各 R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f が、独立して、H、ヒドロキシル、非置換の $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナル R^8 と一緒にになって、シクロアルキル部分を形成する、または、

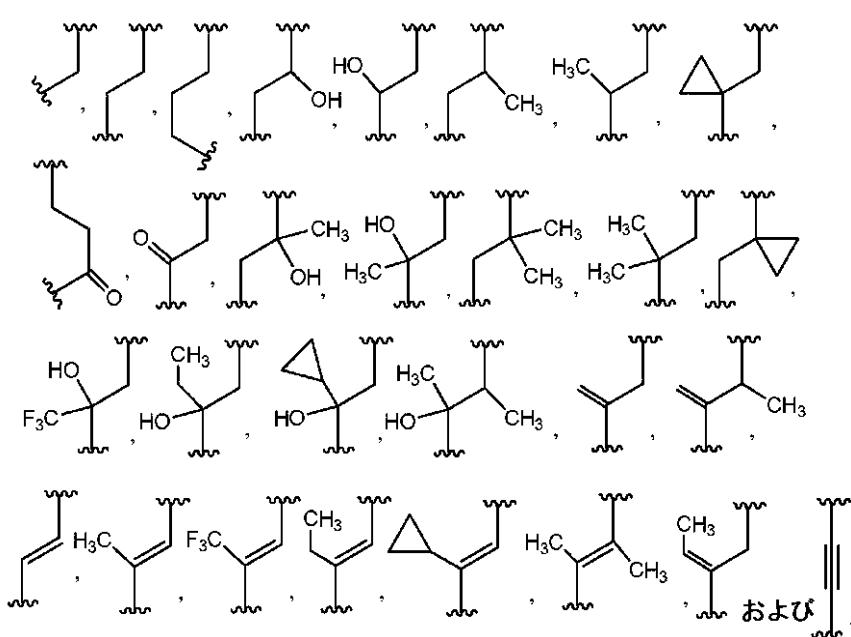
(i i) R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f のうちの少なくとも 1 つが、ジェミナル R^8 と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成する、または、

(i i i) R^{8_a}、R^{8_b}、R^{8_c}、R^{8_d}、R^{8_e} および R^{8_f} のうちの少なくとも 1 つが、ビシナル R⁸ と一緒にになって、結合を形成する、または、

(i.v) q が 0 であり、 m が 1 または 0 である、または、

(v) q 、 m 、 R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f が、一緒になつて

【化 206】



からなる群から選択される部分を形成する、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 8】

(i) $R^8_c \sim R^8_f$ うちの少なくとも 1 つが H 以外である、または、

(i i) - R ⁸ c R ⁸ d R ⁸ e R ⁸ f - 、 およびこれらが結合している炭素が一緒にあって、 - C H ₂ - C (H) (O H) - 、 - C H ₂ - C (O H) (C H ₃) - 、 - C H ₂ - C (H) (C H ₃) - 、 - C (H) (C H ₃) - C H ₂ - 、 - C H ₂ - C (C H ₃) (C H ₃) - 、 - C (C H ₂ C H ₂) - C H ₂ - 、 および - C H ₂ - C (C H ₂ C H ₂) - からなる群から選択される部分を形成する、

請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 9】

(i) Q が、置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールである、または、

(i i) Q が、置換もしくは非置換のピリジル、置換もしくは非置換のフェニル、置換もしくは非置換のピリミジニル、置換もしくは非置換のピラジニル、置換もしくは非置換のイミダゾリル、置換もしくは非置換のフラニル、置換もしくは非置換のピロリルまたは置換もしくは非置換のチオフェニルである、または、

(i i i) Q が、置換もしくは非置換のフェニルまたは置換もしくは非置換のピリジルである、または、

(i v) Q が、少なくとも 1 つのメチル基で置換された、フェニルまたはピリジル基である、または、

(v) Q が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、ハロまたはペルハロアルキル部分の少なくとも 1 つで置換された、ピリジル、フェニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、フラニル、ピロリルまたはチオフェニル基である。または

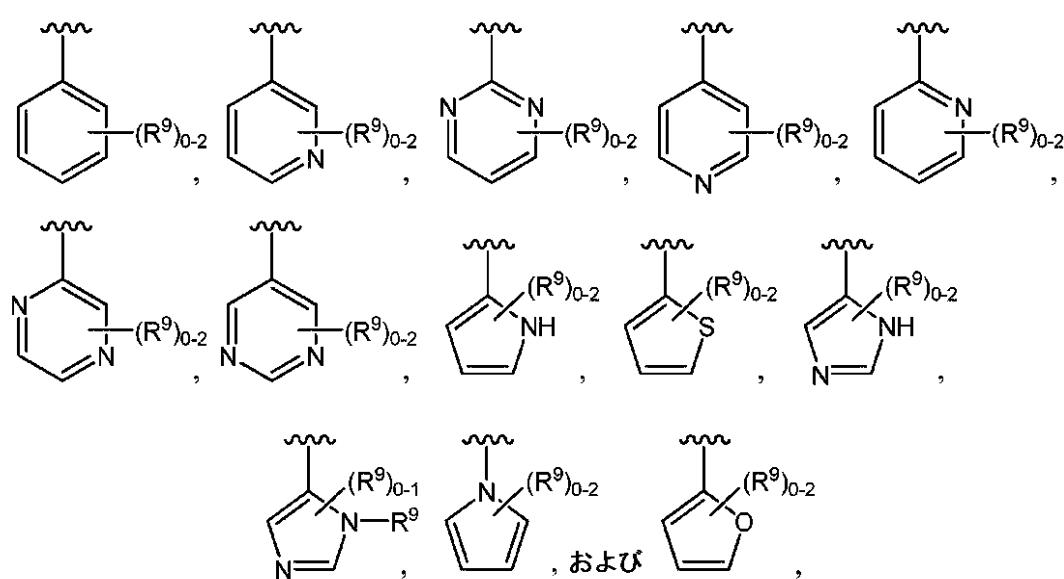
(v i) Q が、置換もしくは非置換の、ピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオキルホリニル基である、または、

(v i i) Q が、メチルまたはハロ基の少なくとも 1 つで置換された、ピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオモルホリニル基である、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物またはその塩

頂一月三〇〇〇

前　　水　　井　　ト　　ト

【化 3 0 7】



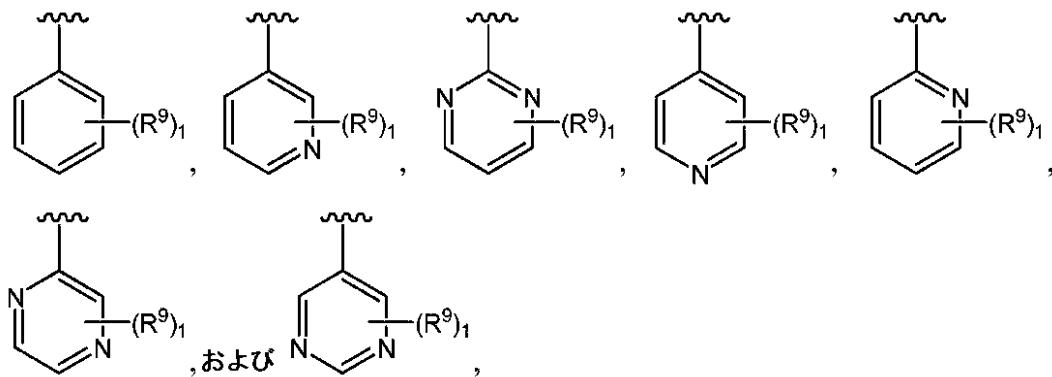
(式中、各 R^9 は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、ペルハロアルキル、ペルハロアルコキシ、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ ア

ルケニル、置換もしくは非置換の C₂ ~ C₈ アルキニル、アシリル、アシリルオキシ、カルボニルアルコキシ、チオアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、アルコキシ、置換もしくは非置換のアミノ、アシリルアミノ、スルホニルアミノ、スルホニル、アミノアシリルまたはアミノカルボニルアミノである)

からなる群から選択される、または、

(i) Q が、

【化 208】



(式中、R⁹ は、R^{8e} および R^{8f} を保持する炭素に Q が結合している位置に対して、Q のオルトまたはパラに結合している)

からなる群から選択される、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

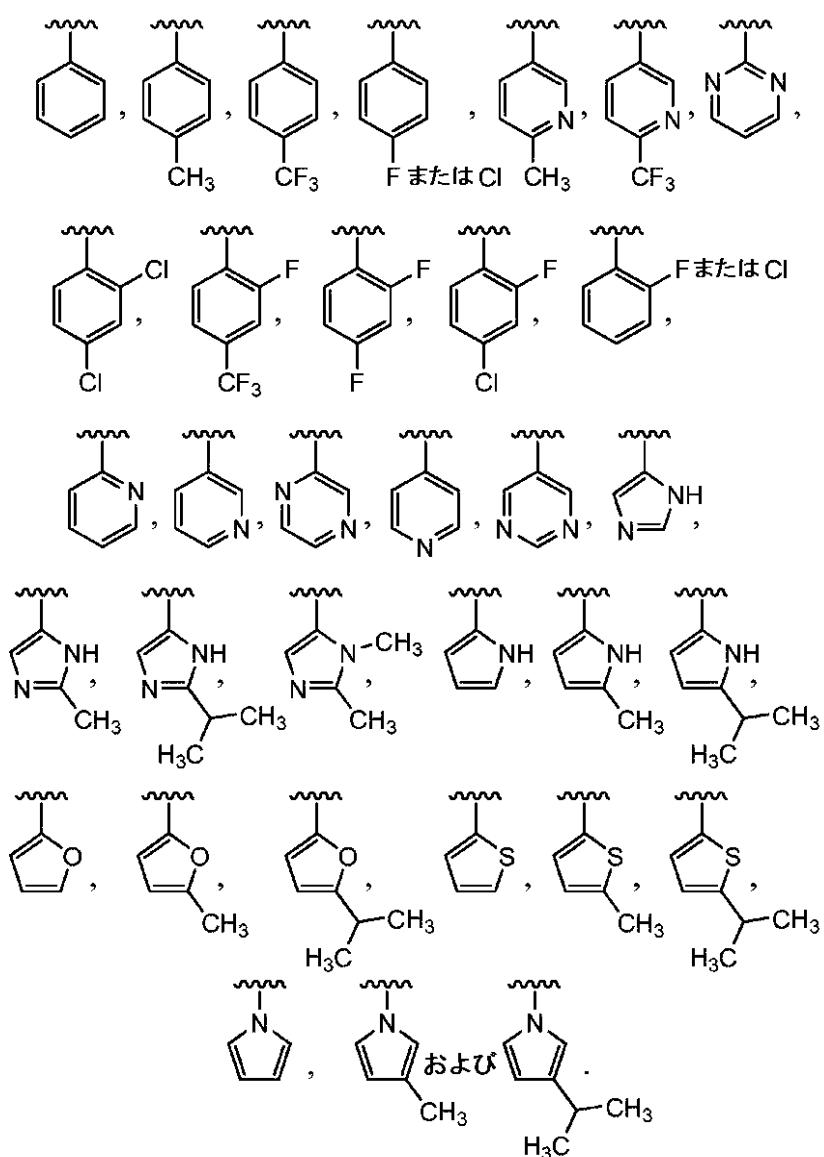
【請求項 11】

各 R⁹ が、独立して、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₄ アルキル、ハロ、トリフルオロメチルまたはヒドロキシリルである、請求項 10 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 12】

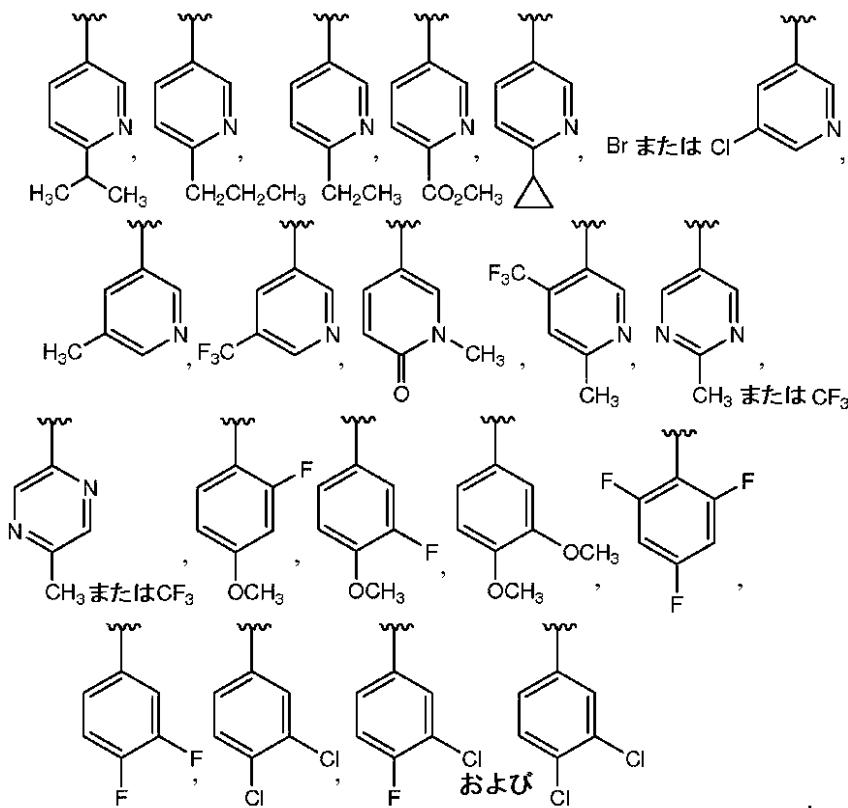
(i) Q が、

【化 2 1 1】



からなる群から選択される、または、
(i i) Q が、

【化 2 1 3】



からなる群から選択される、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 3】

R^1 が、非置換のアルキルであり、
 R^2a 、 R^2b 、 R^3a 、 R^3b 、 $R^{10}a$ 、 $R^{10}b$ 、 $R^{11}a$ および $R^{11}b$ が、それぞれ H であり、

各 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} が、独立して、N または CH であり、

各 R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f が、独立して、H、C₁～C₄アルキルまたはヒドロキシルであり、

Q が、置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールである

請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 14】

R^1 が、非置換のアルキルであり、
 R^2a 、 R^2b 、 R^3a 、 R^3b 、 $R^{10}a$ 、 $R^{10}b$ 、 $R^{11}a$ および $R^{11}b$ が、それぞれ H であり、

各 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} が、独立して、N または CH であり、

各 R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f が、独立して、H または $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、または、ジェミナル R^8 と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成し、

Q が、置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールである

請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 15】

R^8a 、 R^8b 、 R^8c 、 R^8d 、 R^8e および R^8f のうちの少なくとも1つが、ジエミナル R^8 と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成する、請求項14に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 6】

R¹ が、非置換のアルキルであり、
R^{2 a}、R^{2 b}、R^{3 a}、R^{3 b}、R^{1 0 a}、R^{1 0 b}、R^{1 1 a} および R^{1 1 b} が、それぞれ H であり、
各 X⁷、X⁸、X⁹ および X^{1 0} が、独立して、N または CH であり、
各 R^{8 a}、R^{8 b}、R^{8 c}、R^{8 d}、R^{8 e} および R^{8 f} が、独立して、H または C₁ ~ C₄ アルキルであるか、またはビシナル R⁸ と一緒にになって、結合を形成し、
Q が、置換または非置換のアリールまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールである、
請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 7】

Q が、置換もしくは非置換のフェニルまたは置換もしくは非置換のピリジルである、請求項 1 3 から 1 6 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 1 8】

R¹ が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、アシリル、アシリルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリールであり、

各 R^{2 a} および R^{2 b} が、独立して、H、非置換の C₁ ~ C₈ アルキルまたはハロであり、

各 R^{3 a} および R^{3 b} が、独立して、H またはハロであり、

各 X⁷、X⁸、X⁹ および X^{1 0} が、CR⁴ であり、

各 R^{1 0 a}、R^{1 0 b}、R^{1 1 a} および R^{1 1 b} が、独立して、H またはメチルであり、

Q が、置換もしくは非置換のアリールまたは置換もしくは非置換のヘテロアリールである、

、

請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

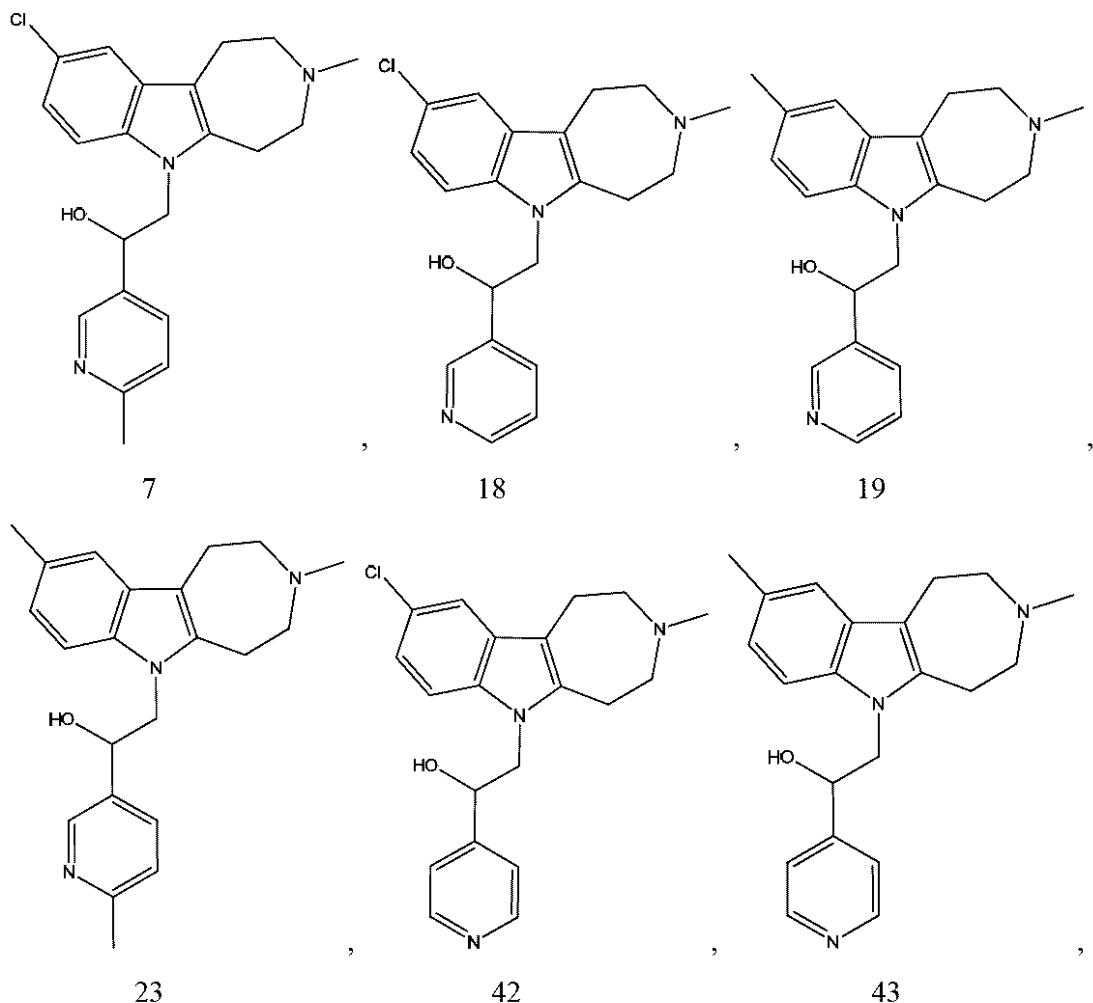
【請求項 1 9】

Q が、置換もしくは非置換のピリジル、置換もしくは非置換のフェニル、置換もしくは非置換のピリミジニル、置換もしくは非置換のピラジニル、置換もしくは非置換のイミダゾリル、置換もしくは非置換のフラニル、置換もしくは非置換のピロリルまたは置換もしくは非置換のチオフェニルである、請求項 1 8 に記載の化合物またはその塩。

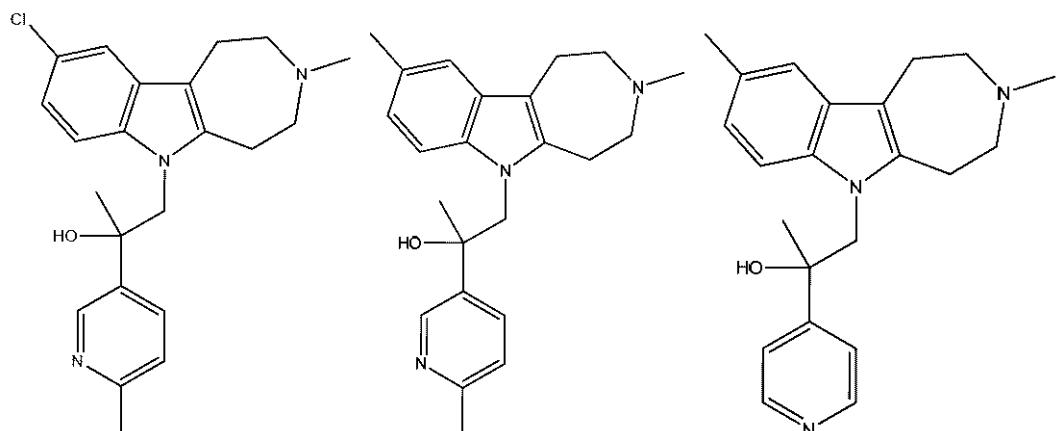
【請求項 2 0】

前記化合物は、以下：

【化 1 A】



【化2A】

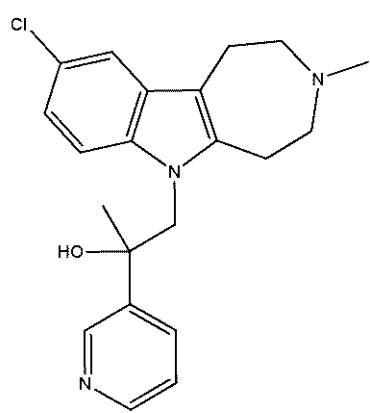


129

147

K-52

, および



K-54

からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項21】

個体においてヒスタミン受容体を調節するための組成物であって、請求項1から20のいずれかに記載の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項22】

請求項1から20のいずれかに記載の化合物またはその塩と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

【請求項23】

請求項1から20のいずれかに記載の化合物またはその塩と、使用のための指示書とを含むキット。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0050

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0050】

認知障害または認識機能障害 (impaired cognition) に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害を処置する方法であって、それを必要とする個体に、本明細書中で詳述されている化合物、またはその薬学的に許容される塩の低用量を投与するステップを含む方法も提供される。 (i) 精神病性障害、 (ii) 認知の改善 (improved cognition) も必要な個体における精神病性障害、または (iii) 少なくとも1つの精神病性症状および認識機能障害に伴う少なくとも1

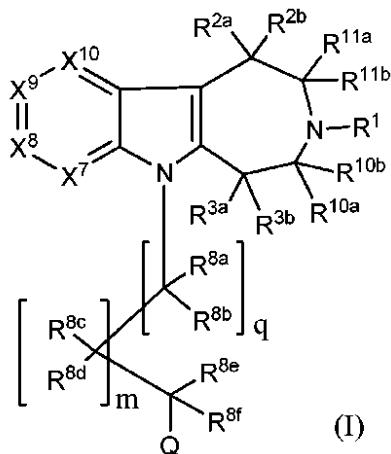
つの症状を引き起こすことを特徴とする障害を処置する方法であって、それを必要とする個体に、本明細書内で詳述されている化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量を投与するステップを含む方法もまた提供される。認知障害または認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置のための薬物の製造における、本明細書中に詳述されている化合物、またはその薬学的に許容される塩の低用量の使用も提供される。(i)精神病性障害、(ii)認知の改善も必要な個体における精神病性障害、または(iii)少なくとも1つの精神病性症状および認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置のための薬物の製造における、本明細書中に詳述されている化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量の使用も同様に提供される。一例では、化合物の低用量と、認知障害または認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における前認識効果(procognitive effect)を達成するための指示書とを含むキットが提供される。別の例では、本明細書中に詳述されている化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量と、(i)認知障害または認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における前認識効果、ならびに(ii)精神病性障害、認知の改善も必要な個体における精神病性障害、または少なくとも1つの精神病性症状および認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における抗精神病性効果を達成するための指示書とを含むキットが提供される。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目1)

式(I)の化合物

【化202】



(式中、

R¹は、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、C₁～C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシル、チオール、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであり、

各R^{2a}、R^{2b}、R^{3a}およびR^{3b}は、独立して、H、ヒドロキシル、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁～C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂～C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、

ラルキル、C₁ ~ C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシリ、チオール、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナルR²もしくはR³と一緒になって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成し、

各R^{10a}、R^{10b}、R^{11a}およびR^{11b}は、独立して、H、ヒドロキシリ、ニトロ、シアノ、ハロ、置換もしくは非置換のC₁ ~ C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルキニル、ペルハロアルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキル、C₁ ~ C₈ペルハロアルコキシ、アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシリ、チオール、チオアルキル、置換されたアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、アルキルスルホニルアミノ、またはカルボニルアルキレンアルコキシであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナルR¹⁰もしくはR¹¹と一緒になって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成し、

各X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰は、独立して、NまたはCR⁴であり、

各R⁴は、独立して、H、ヒドロキシリ、ニトロ、シアノ、ハロ、C₁ ~ C₈ペルハロアルキル、置換もしくは非置換のC₁ ~ C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、C₁ ~ C₈ペルハロアルコキシ、C₁ ~ C₈アルコキシ、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボニルアルコキシ、チオール、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、アミノアシル、アミノカルボニルアミノ、アミノカルボニルオキシ、アミノスルホニル、スルホニルアミノ、スルホニル、カルボニルアルキレンアルコキシ、アルキルスルホニルアミノまたはアシルであり、

各mおよびqは、独立して、0または1であり、

各R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、R^{8e}およびR^{8f}は、独立して、H、ヒドロキシリ、アルコキシ、ハロ、C₁ ~ C₈ペルハロアルキル、カルボキシリ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のC₁ ~ C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₃ ~ C₆シクロアルキル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルケニルであるか、またはジェミナルR⁸と一緒になって、式-OCH₂CH₂O-の部分を形成するか、これが結合している炭素およびジェミナルR⁸と一緒になって、シクロアルキル部分もしくはカルボニル部分を形成するか、ジェミナルR⁸と一緒になって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成するか、ビシナルR⁸およびこれらが結合している炭素原子と一緒になって、置換もしくは非置換のC₃ ~ C₈シクロアルキル、置換もしくは非置換のC₃ ~ C₈シクロアルケニルまたは置換もしくは非置換のヘテロシクリル部分を形成するか、またはビシナルR⁸と一緒になって、結合を形成するが、ただし、R⁸がビシナルR⁸と一緒になって結合を形成する場合、前記ジェミナルR⁸は、ヒドロキシリ以外であり、

Qは、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルケニル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアミノ、アルコキシ、アミノアシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、アミノカルボニルアルコキシ、アシルアミノ、カルボキシリ、シアノまたはアルキニルである）、

またはその塩もしくは溶媒和物。

(項目2)

X⁷、X⁸、X⁹およびX¹⁰がCR⁴である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの少なくとも1つがNである、項目1に記載の化合物。

（項目4）

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの少なくとも2つがNである、項目1に記載の化合物。

（項目5）

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの2つがNであり、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの2つがC R⁴である、項目1に記載の化合物。

(項目6)

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの1つがNであり、 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの3つがC R⁴である、項目1に記載の化合物。

(項目 7)

各 R⁴ が、独立して、H、ハロ、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、C₁ ~ C₈ ペルハロアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換のアリールである、項目 1 から 6 のいずれかに記載の化合物。

(項目 8)

各 R^4 が、独立して、H または置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキルである、項目 1 から 6 のいずれかに記載の化合物。

（項目9）

各 B^{-4} が H である、項目 8 に記載の化合物。

— 10 —

各 R^4 が、独立して、H、ハロ、非置換の $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ペルハロアルキル、または置換もしくは非置換のアリールである、項目 1 から 6 のいずれかに記載の化合物

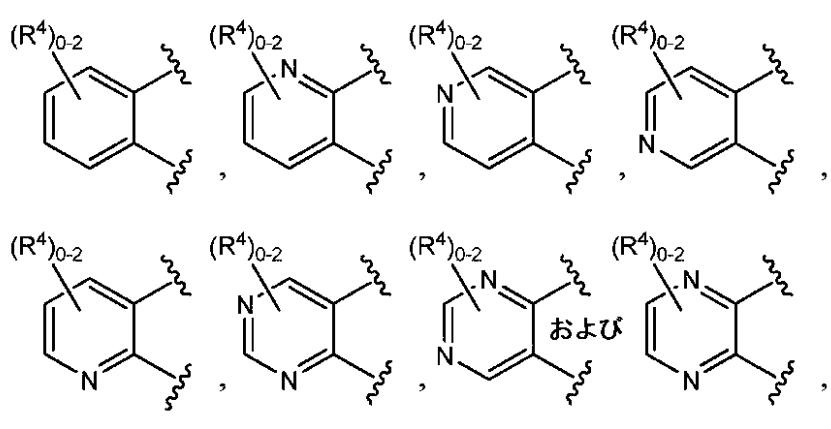
化 口 份。

(項目 11) 各 R^4 が、独立して、H、ハロ、メチル、トリフルオロメチルまたはシクロプロピルである。項目 1.0 に記載の化合物

のる、項目 1

(項目 12) $\times^7 \times^8 \times^9$ お上げ \times^{10} が 一緒になつて

八、八



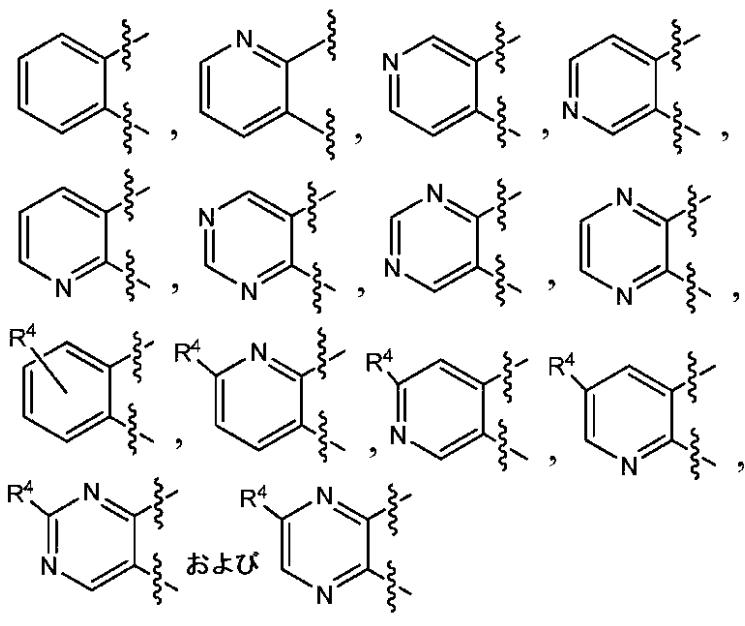
(式中、各 R⁴ は、独立して、ヒドロキシル、ハロ、C₁ ~ C₈ペルハロアルキル、置換もしくは非置換のC₁ ~ C₈アルキル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルケニル、置換もしくは非置換のC₂ ~ C₈アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、C₁ ~ C₈ペルハロアルコキシ、C₁ ~ C₈アルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノアルキルスルホニルアミノまたはアシルである)

からなる群から選択される基委族部分を提供する。項目 1 に記載の化合物

かうなる書力

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} が、一緒になって、

【化204】



(式中、 R^4 は、ヒドロキシル、ハロ、 $C_1 \sim C_8$ ペルハロアルキル、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルケニル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルキニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、 $C_1 \sim C_8$ ペルハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアラルキル、チオアルキル、置換もしくは非置換のアミノ、アルキルスルホニルアミノまたはアシルである)

からなる群から選択される芳香族部分を提供する、項目1に記載の化合物。

(項目14)

各 R^4 が、独立して、ハロ、非置換の $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ペルハロアルキルである、項目12または13に記載の化合物。

(項目15)

R^1 が、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロアリール、置換もしくは非置換のアラルキルである、項目1から14のいずれかに記載の化合物。

(項目16)

R^1 が、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換のアリールである、項目1から14のいずれかに記載の化合物。

(項目17)

R^1 が、メチル、エチル、シクロプロピル、プロピレート、トリフルオロメチル、イソプロピル、tert-ブチル、sec-ブチル、2-メチルブチル、プロパナール、1-メチル-2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエタナール、2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシプロピル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル、シクロブチル、シクロペニチル、シクロヘキシル、置換されたフェニル、ピペリジン-4-イル、ヒドロキシシクロペニタ-3-イル、ヒドロキシシクロペニタ-2-イル、ヒドロキシシクロプロパ-2-イル、1-ヒドロキシ-1-メチルシクロプロパ-2-イル、または1-ヒドロキシ-1,2,2-トリメチル-シクロプロパ-3-イルである、項目1から14のいずれかに記載の化合物。

(項目18)

各 R^{2a} および R^{2b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノ、ニトロであるか、または R^{2a} および R^{2b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノまたはニトロである、

項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目19)

各 R^{2a} および R^{2b} が、独立して、H、非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロであるか、または R^{2a} および R^{2b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H、非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロであるか、または R^{3a} および R^{3b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成する、

項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目20)

各 R^{2a} および R^{2b} が、独立して、H、メチル、ハロであるか、または R^{2a} および R^{2b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H、メチル、ハロであるか、または R^{3a} および R^{3b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成する、

項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目21)

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} および R^{3b} のそれぞれが、Hである、項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目22)

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} および R^{3b} のうちの少なくとも1つが、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノ、ニトロであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナル R^2 もしくは R^3 と一緒にになって、カルボニル部分を形成する、項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目23)

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} および R^{3b} のうちの少なくとも2つが、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロ、シアノ、ニトロであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナル R^2 もしくは R^3 と一緒にになって、カルボニル部分を形成する、項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目24)

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} および R^{3b} のうちの少なくとも1つが、フルオロ、メチルであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナル R^2 もしくは R^3 と一緒にになって、カルボニル部分を形成する、項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目25)

R^{2a} および R^{2b} または R^{3a} および R^{3b} のいずれかが、それぞれメチル、フルオロであるか、またはこれが結合している炭素およびジェミナル R^2 もしくは R^3 と一緒にになって、カルボニル部分を形成する、項目1から17のいずれかに記載の化合物。

(項目26)

各 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} が、独立して、H、ハロ、非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ヒドロキシルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目27)

各 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} が、独立して、H、ハロ、非置換の $C_1 \sim C_4$ アルキル、ヒドロキシルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から

25のいずれかに記載の化合物。(項目28)

各 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} 、および R^{11b} が、独立して、H、プロモ、メチル、ヒドロキシルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目29)

R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} のうちの少なくとも1つが、非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ヒドロキシル、ハロであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目30)

R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} のうちの少なくとも1つが、メチル、プロモ、ヒドロキシルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目31)

R^{10a} および R^{10b} の両方がメチルであるか、または R^{11a} および R^{11b} の両方がメチルである、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目32)

R^{10a} および R^{10b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成するか、または R^{11a} および R^{11b} が、これらが結合している炭素と一緒にになって、カルボニルを形成する、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目33)

R^{10a} がHであり、 R^{10b} がメチルまたはプロモである、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

(項目34)

R^{10a} および R^{10b} を保持する炭素が、R配置またはS配置にある、項目33に記載の実質的に純粋な化合物を含む組成物。

(項目35)

R^{11a} がHであり、 R^{11b} がメチルである、項目1から25のいずれかに記載の化合物。

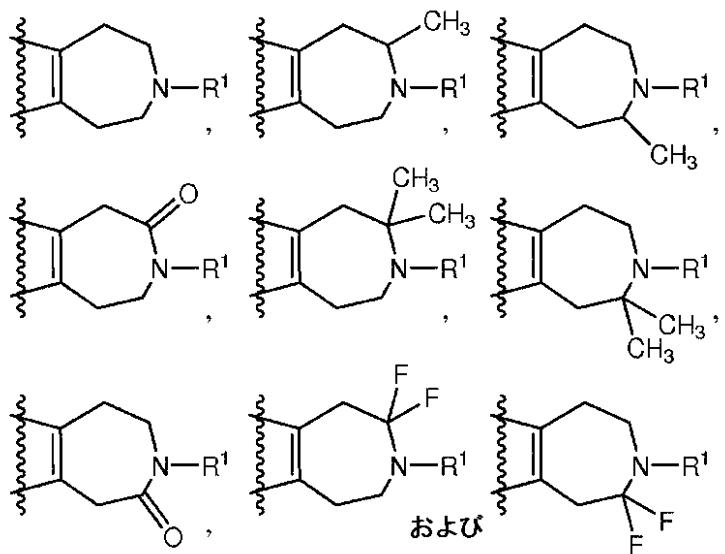
(項目36)

R^{11a} および R^{11b} を保持する炭素が、R配置またはS配置にある、項目35に記載の実質的に純粋な化合物を含む組成物。

(項目37)

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11a} および R^{11b} が、一緒にになって、

【化 2 0 5】



からなる群から選択される環を形成する、項目 1 から 30 のいずれかに記載の化合物。

(項目 38)

各 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} および R^{8f} が、独立して、H、ヒドロキシル、非置換の C_1 ~ C_4 アルキルであるか、またはこれが結合している炭素およびジエミナル R^8 と一緒にになって、シクロアルキル部分を形成する、項目 1 から 37 のいずれかに記載の化合物。

(項目 39)

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} および R^{8f} のうちの少なくとも 1 つが、ジエミナル R^8 と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成する、項目 1 から 37 のいずれかに記載の化合物。

(項目 40)

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} および R^{8f} のうちの少なくとも 1 つが、ビシナル R^8 と一緒にになって、結合を形成する、項目 1 から 37 のいずれかに記載の化合物。

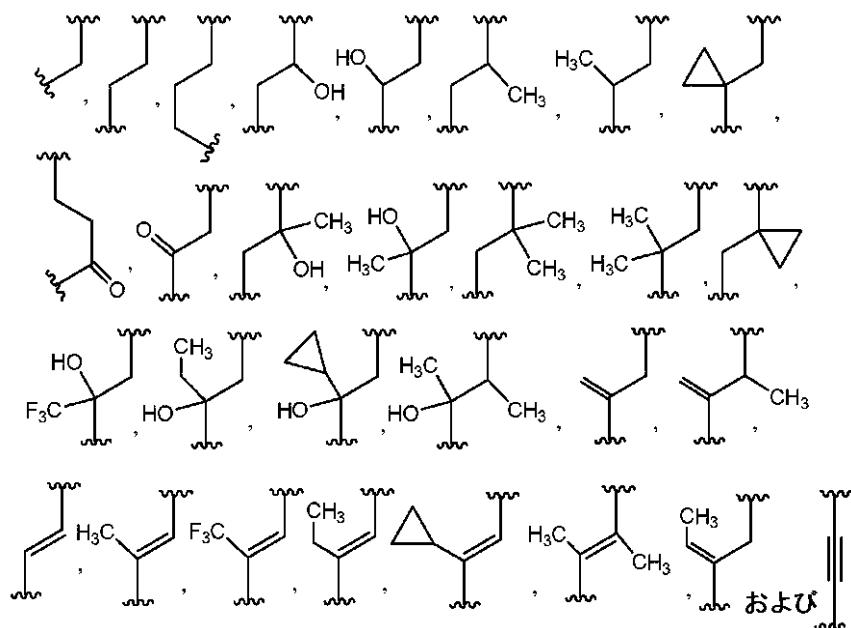
(項目 41)

q が 0 であり、 m が 1 または 0 である、項目 1 から 37 のいずれかに記載の化合物。

(項目 42)

q 、 m 、 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} および R^{8f} が、一緒にになって、

【化206】



からなる群から選択される部分を形成する、項目1から37のいずれかに記載の化合物。
(項目43)

R^1 が、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、アシリル、アシリルオキシ、カルボニルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリルまたは置換もしくは非置換のアリールであり、

各 R^2^a および R^2^b が、独立して、H、メチル、フルオロであるか、または R^2^a および R^2^b が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R^3^a および R^3^b が、独立して、Hまたはフルオロであり、

各 R^{10^a} および R^{10^b} が、独立して、H、フルオロまたはメチルであるか、または R^{10^a} および R^{10^b} が、一緒になって、カルボニルを形成し、

各 R^{11^a} および R^{11^b} が、独立して、H、フルオロまたはメチルであるか、または R^{11^a} および R^{11^b} が、一緒になって、カルボニルを形成する、

項目1に記載の化合物。

(項目44)

Qが、置換もしくは非置換のアリールである、項目1から43のいずれかに記載の化合物。

(項目45)

Qが、置換もしくは非置換のピリジル、フェニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、フラニル、ピロリルまたはチオフェニル基である、項目1から43のいずれかに記載の化合物。

(項目46)

Qが、置換もしくは非置換のフェニルまたはピリジル基である、項目1から43のいずれかに記載の化合物。

(項目47)

Qが、少なくとも1つのメチル基で置換された、フェニルまたはピリジル基である、項目1から43のいずれかに記載の化合物。

(項目48)

Qが、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、ハロまたはペルハロアルキル部分の少なくとも1つで置換された、ピリジル、フェニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、フラニル、ピロリルまたはチオフェニル基である、項目1から43のいずれかに

記載の化合物。

(項目 49)

Q が、置換もしくは非置換のシクロアルキルまたは置換もしくは非置換のヘテロシクリルである、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 50)

Q が、置換もしくは非置換のピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオモルホリニル基である、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 51)

Q が、メチルまたはハロ基の少なくとも 1 つで置換された、ピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオモルホリニル基である、項目 50 に記載の化合物。

(項目 52)

Q が、非置換のシクロアルキルまたは非置換のヘテロシクリルである、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 53)

Q が、置換もしくは非置換のシクロヘキシル、モルホリニル、ピペラジニル、チオモルホリニル、シクロペンチルまたはピロリジニル部分である、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

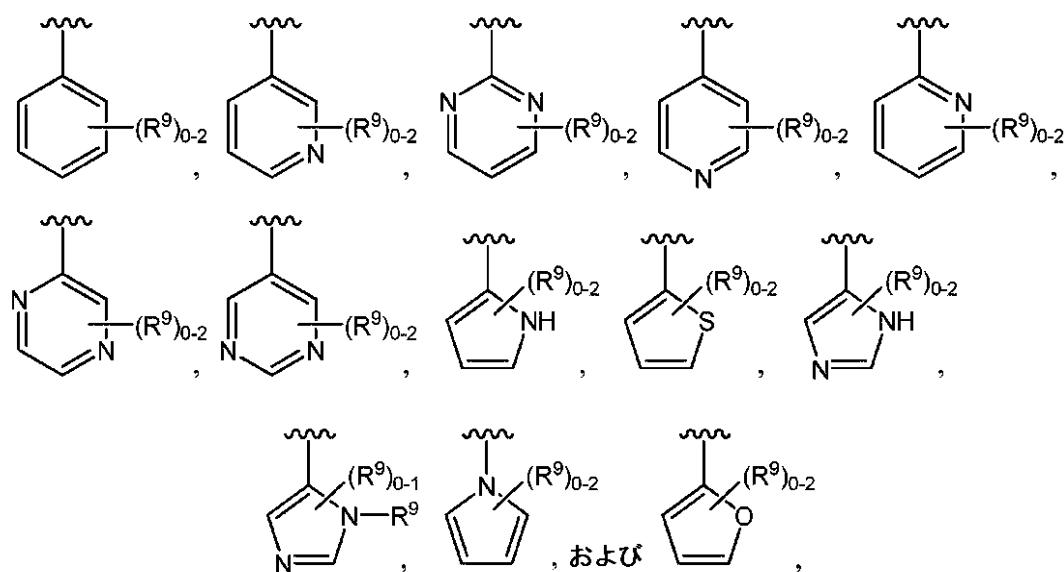
(項目 54)

Q が、カルボニル、ヒドロキシメチル、メチルまたはヒドロキシル基の少なくとも 1 つで置換された、置換されたシクロヘキシル、モルホリニル、ピペラジニル、チオモルホリニル、シクロペンチルまたはピロリジニル部分である、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 55)

Q が、

【化 207】



(式中、各 R⁹ は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、ペルハロアルキル、ペルハロアルコキシ、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、置換もしくは非置換の C₂ ~ C₈ アルケニル、置換もしくは非置換の C₂ ~ C₈ アルキニル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、チオアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、アルコキシ、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、スルホニルアミノ、スルホニル、アミノアシルまたはアミノカルボニルアミノである)

からなる群から選択される、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 5 6)

Q が、1つ以下の R⁹ 基で置換されている、項目 5 5 に記載の化合物。

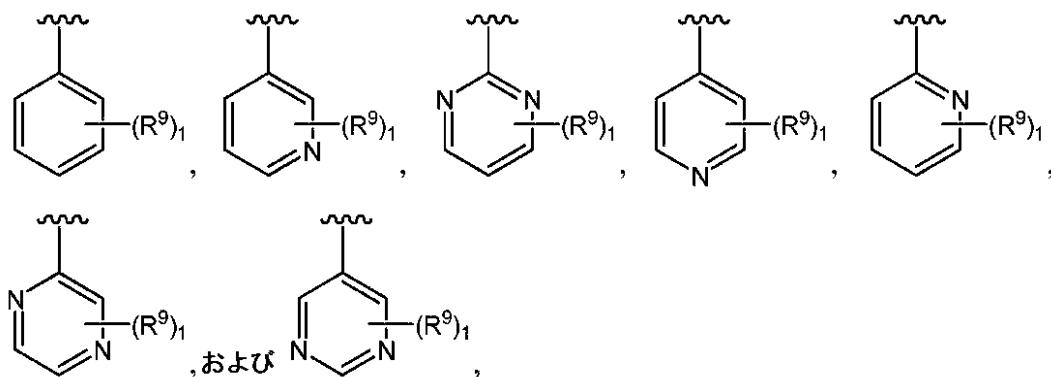
(項目 5 7)

Q が、1つの R⁹ 基のみで置換されている、項目 5 5 に記載の化合物。

(項目 5 8)

Q が、

【化 2 0 8】



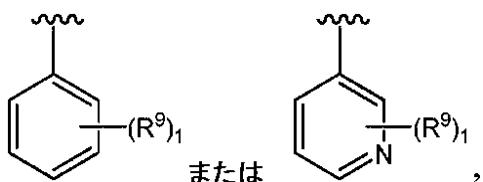
(式中、R⁹ は、R^{8e} および R^{8f} を保持する炭素に Q が結合している位置に対して、Q のオルトまたはパラに結合している)

からなる群から選択される、項目 5 7 に記載の化合物。

(項目 5 9)

Q が、

【化 2 0 9】



であり、

R⁹ が、R^{8e} および R^{8f} を保持する炭素に Q が結合している位置に対して、Q のパラに結合している、

項目 5 8 に記載の化合物。

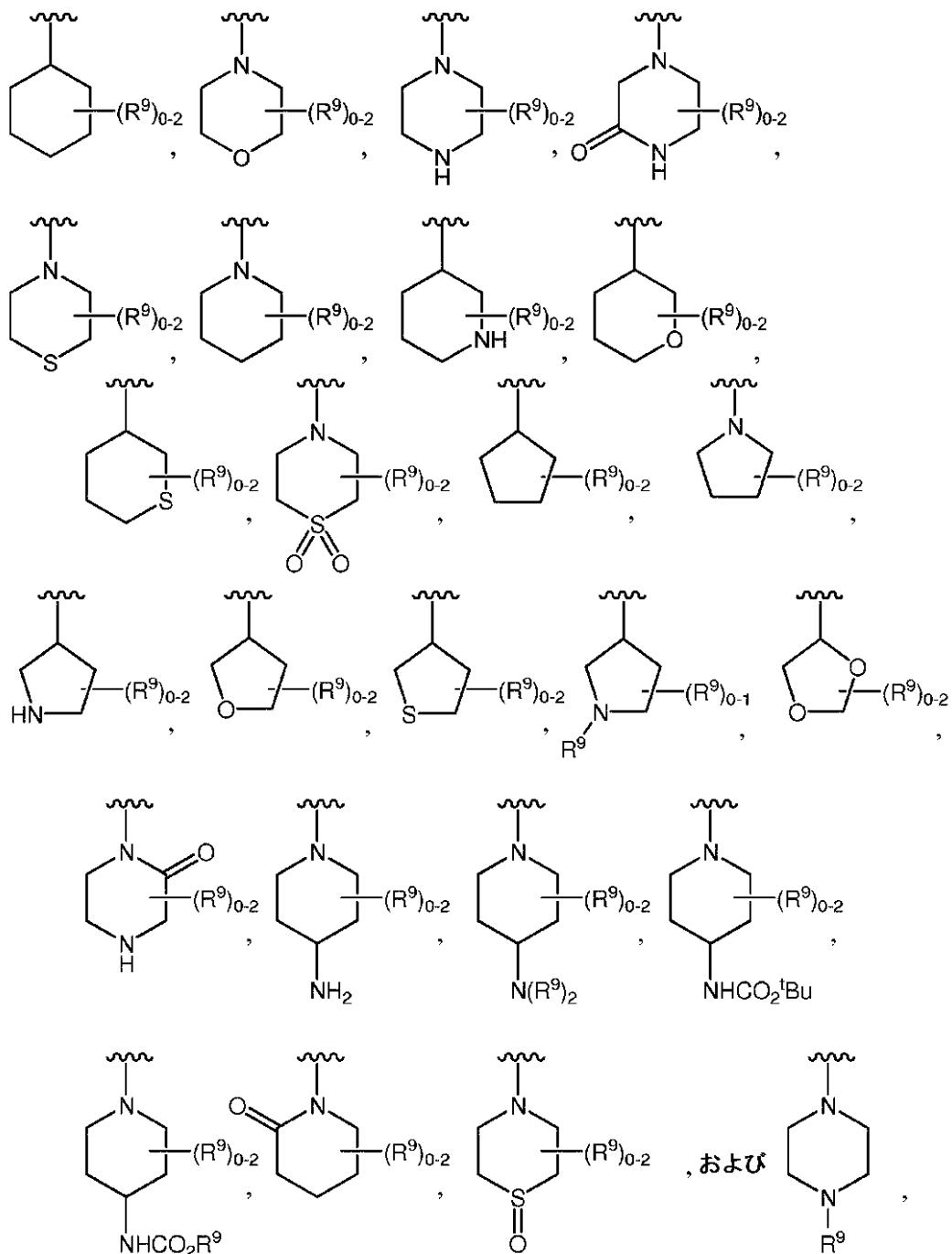
(項目 6 0)

Q が、2つの R⁹ 基で置換されている、項目 5 5 に記載の化合物。

(項目 6 1)

Q が、

【化 2 1 0】



(式中、各 R^9 は、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、ペルハロアルキル、ペルハロアルコキシ、置換もしくは非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルケニル、置換もしくは非置換の $C_2 \sim C_8$ アルキニル、アシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、チオアルキル、アルコキシ、置換もしくは非置換のアミノ、アシルアミノ、スルホニルアミノ、スルホニル、アミノアシルまたはアミノカルボニルアミノである)からなる群から選択される、項目 1 から 43 のいずれかに記載の化合物。

(項目 62)

Q が、1つ以下の R^9 基で置換されている、項目 61 に記載の化合物。

(項目 63)

Q が、1つの R^9 基のみで置換されている、項目 61 に記載の化合物。

(項目 64)

Q が、2つの R^9 基で置換されている、項目 61 に記載の化合物。

(項目 6 5)

各 R⁹ が、独立して、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₄ アルキル、ハロ、トリフルオロメチルまたはヒドロキシリである、項目 55 から 64 のいずれかに記載の化合物。

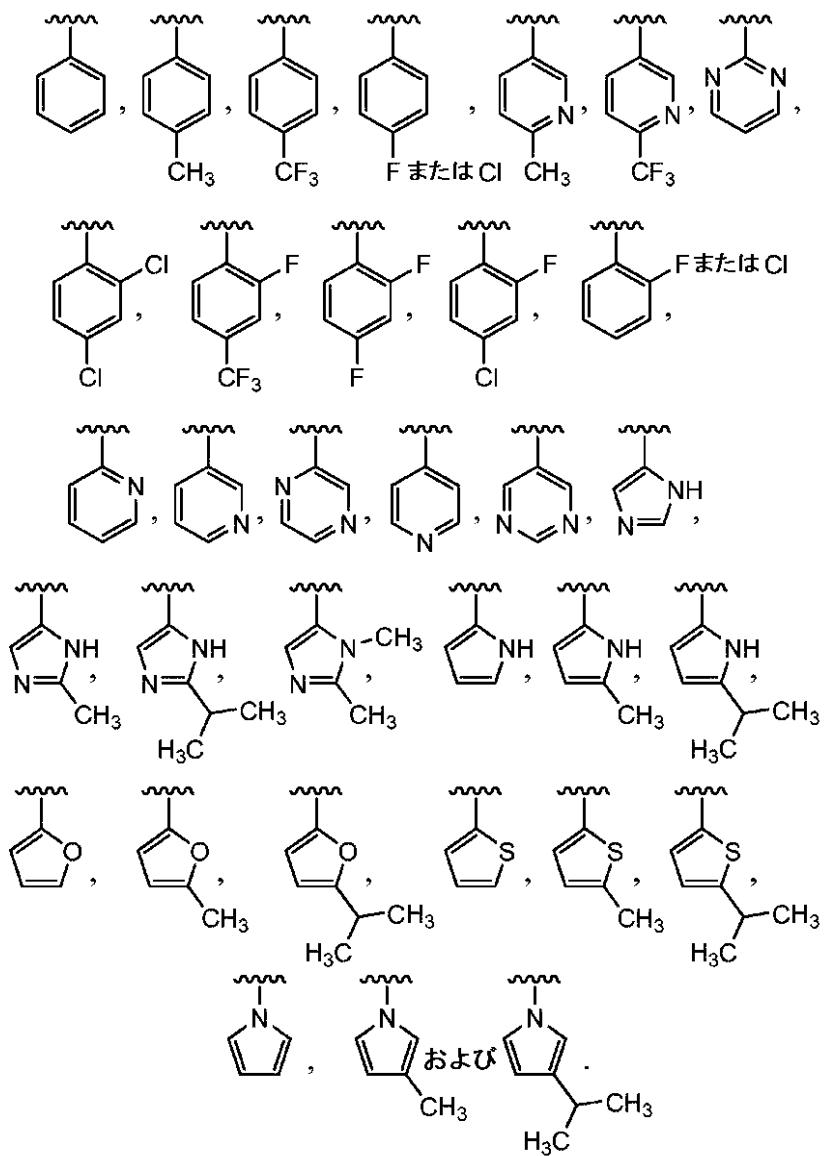
(項 目 6 6)

各 R⁹ が、独立して、メチル、-CH₂OH、イソプロピル、ハロ、トリフルオロメチルまたはヒドロキシルである、項目 55 から 64 のいずれかに記載の化合物。

(項 目 6 7)

Q が、

【化 2 1 1 】

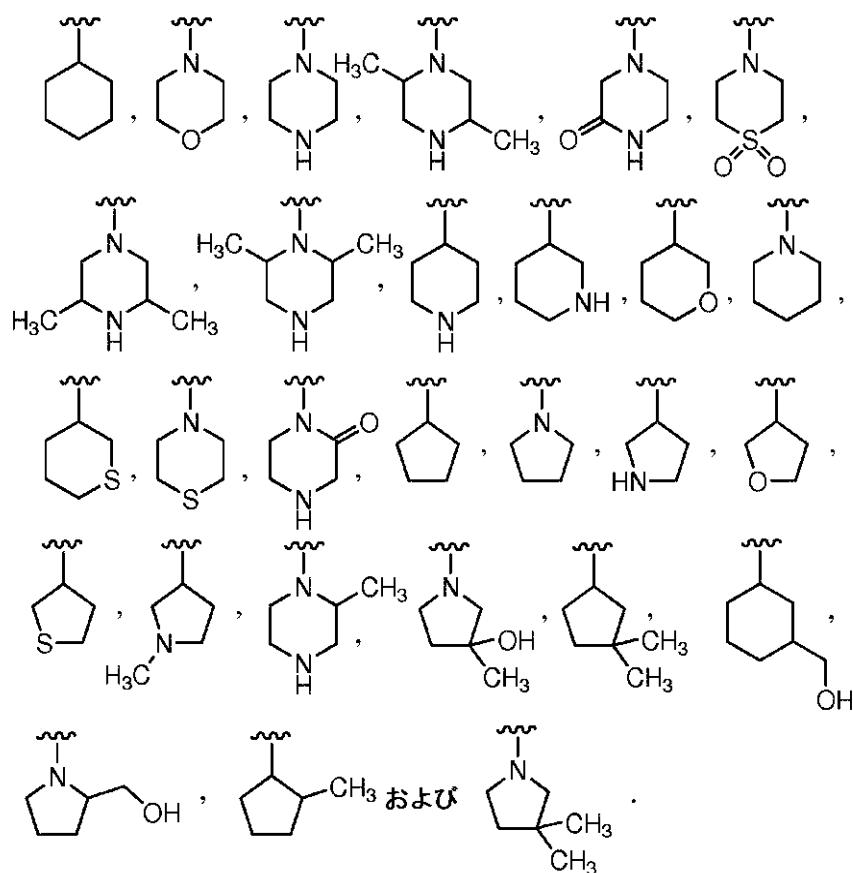


からなる群から選択される、項目 1 から 4 3 のいずれかに記載の化合物。

(項目68)

Q が、

【化 2 1 2】

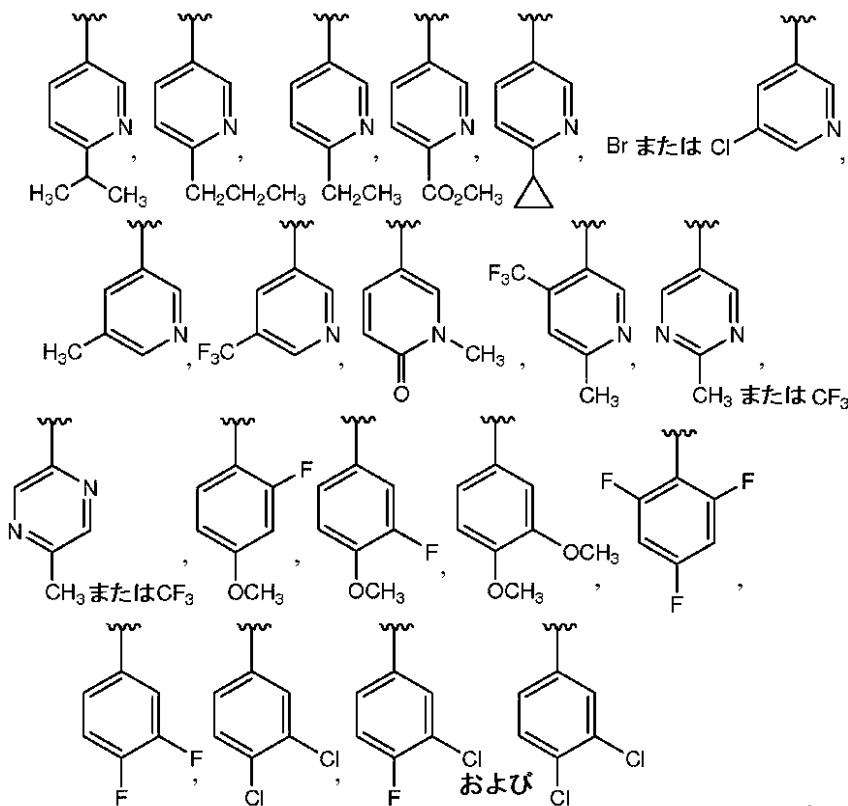


からなる群から選択される、項目 1 から 4 3 のいずれかに記載の化合物。

(項目69)

Q が、

【化 2 1 3】



からなる群から選択される、項目 1 から 4 3 のいずれかに記載の化合物。

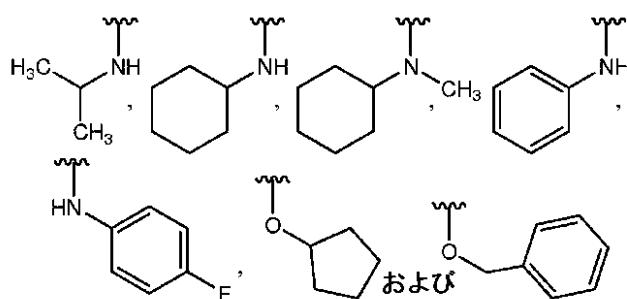
(項目 70)

Q が、置換もしくは非置換のアミノ、アルコキシ、アミノアシル、アシルオキシ、カルボニルアルコキシ、アミノカルボニルアルコキシまたはアシルアミノである、項目 1 から 4 3 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7.1)

〇が、

【化 2 1 4】



からなる群から選択される、項目 1 から 4 3 のいずれかに記載の化合物。

(項目 7 2)

R¹ が、非置換のアルキルであり、

R^2a 、 R^2b 、 R^3a 、 R^3b 、 $R^{10}a$ 、 $R^{10}b$ 、 $R^{11}a$ および $R^{11}b$ が、それぞれHであり。

各 X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} が、独立して、N または CH であり、

各 R^8 a、 R^8 b、 R^8 c、 R^8 d、 R^8 e および R^8 f が、独立して、H、C₁～C₄

アルキルまたはヒドロキシルであり、

Q が、置換もしくは非置換のアリールである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 3)

R¹ が、非置換のアルキルであり、

R² a、R² b、R³ a、R³ b、R¹ 0 a、R¹ 0 b、R¹ 1 a および R¹ 1 b が、それ
ぞれ H であり、

各 X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ が、独立して、N または CH であり、

各 R⁸ a、R⁸ b、R⁸ c、R⁸ d、R⁸ e および R⁸ f が、独立して、H または C₁ ~
C₄ アルキルであるか、または、ジェミナル R⁸ と一緒にになって、メチレンまたは置換さ
れたメチレンを形成し、

Q が、置換もしくは非置換のアリールである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 4)

R⁸ a、R⁸ b、R⁸ c、R⁸ d、R⁸ e および R⁸ f のうちの少なくとも 1 つが、ジ

エミナル R⁸ と一緒にになって、メチレンまたは置換されたメチレンを形成する、項目 7 3
に記載の化合物。

(項目 7 5)

R¹ が、非置換のアルキルであり、

R² a、R² b、R³ a、R³ b、R¹ 0 a、R¹ 0 b、R¹ 1 a および R¹ 1 b が、それ
ぞれ H であり、

各 X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ が、独立して、N または CH であり、

各 R⁸ a、R⁸ b、R⁸ c、R⁸ d、R⁸ e および R⁸ f が、独立して、H または C₁ ~
C₄ アルキルであるか、またはビシナル R⁸ と一緒にになって、結合を形成し、

Q が、置換または非置換のアリールである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 7 6)

R⁸ a、R⁸ b、R⁸ c、R⁸ d、R⁸ e および R⁸ f のうちの少なくとも 1 つが、ビ
シナル R⁸ と一緒にになって、結合を形成する、項目 7 5 に記載の化合物。

(項目 7 7)

Q が、置換もしくは非置換のフェニルまたはピリジル基である、項目 7 2 から 7 6 のい
ずれかに記載の化合物。

(項目 7 8)

Q が、少なくとも 1 つのメチル基で置換された、フェニルまたはピリジル基である、項
目 7 0 に記載の化合物。

(項目 7 9)

R¹ が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、アシル、アシルオキシ、カルボニ
ルアルコキシ、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のアリールで
あり、

各 R² a および R² b が、独立して、H、非置換の C₁ ~ C₈ アルキルまたはハロであり

、各 R³ a および R³ b が、独立して、H またはハロであり、

各 X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ が、CR⁴ であり、

各 R¹ 0 a、R¹ 0 b、R¹ 1 a および R¹ 1 b が、独立して、H またはメチルであり、

Q が、置換もしくは非置換のアリールである、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 8 0)

Q が、置換もしくは非置換のピリジル、フェニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダ
ゾリル、フラニル、ピロリルまたはチオフェニル基である、項目 7 9 に記載の化合物。

(項目 8 1)

Q が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキル、ハロまたはペルハロアルキル部分の

少なくとも 1 つで置換された、ピリジル、フェニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、フラニル、ピロリルまたはチオフェニル基である、項目 80 に記載の化合物。

(項目 82)

R⁴ が、H、ハロ、ピリジル、メチルまたはトリフルオロメチルである、項目 79 から 81 のいずれかに記載の化合物。

(項目 83)

R¹ が、プロピレート、メチル、エチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、イソプロピル、tert-ブチル、sec-ブチル、2-メチルブチル、プロパナール、1-メチル-2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエタナール、2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシプロピル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル、シクロブチル、シクロペニチル、シクロヘキシリル、置換されたフェニル、ピペリジン-4-イル、ヒドロキシシクロペニタ-3-イル、ヒドロキシシクロペニタ-2-イル、ヒドロキシシクロプロパ-2-イル、1-ヒドロキシ-1-メチルシクロプロパ-2-イル、または 1-ヒドロキシ-1,2,2-トリメチル-シクロプロパ-3-イルである、項目 79 から 82 のいずれかに記載の化合物。

(項目 84)

R¹ が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであり、

各 R^{2a}、R^{2b}、R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H またはハロであり、

各 R^{10a}、R^{10b}、R^{11a} および R^{11b} が、独立して、H またはメチルであり、

各 R⁴ が、独立して、H、ハロ、C₁ ~ C₈ ペルハロアルキル、置換または非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであり、

各 R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、R^{8e} および R^{8f} が、H であり、

Q が、置換もしくは非置換のシクロヘキシリル、モルホリニル、ピペラジニル、チオモルホリニル、シクロペンチルまたはピロリジニル部分である、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 85)

R¹ がメチルであり、X⁷、X⁸、X⁹ および X¹⁰ のうちの少なくとも 1 つが、CR⁴ であり、各 R⁴ が、独立して、H、ハロ、メチルまたはトリフルオロメチルである、項目 84 に記載の化合物。

(項目 86)

Q が、カルボニル、ヒドロキシメチル、メチルまたはヒドロキシリル基の少なくとも 1 つで置換されている、項目 84 または 85 に記載の化合物。

(項目 87)

R¹ が、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであり、

各 R^{2a} および R^{2b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであるか、または R^{2a} および R^{2b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R^{3a} および R^{3b} が、独立して、H、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであるか、または R^{3a} および R^{3b} が、一緒になって、カルボニル部分を形成し、

各 R⁴ が、独立して、H、ハロまたは置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであり、

各 R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{8d}、R^{8e} および R^{8f} が、H であり、

各 R^{10a} および R^{10b} が、独立して、H、ハロ、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであるか、または R^{10a} および R^{10b} が、一緒になって、カルボニル (=O) を形成し、

各 R^{11a} および R^{11b} が、独立して、H、ハロ、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₈ アルキルであるか、または R^{11a} および R^{11b} が、一緒になって、カルボニル (=O) を形成する、

項目 1 に記載の化合物。

(項目 88)

Q が、置換もしくは非置換のピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオモルホリニル基である、項目 87 に記載の化合物。

(項目 8 9)

Q が、メチルまたはハロ基の少なくとも 1 つで置換された、ピリジル、フェニル、ピラジニル、ピペラジニル、ピロリジニルまたはチオモルホリニル基である、項目 88 に記載の化合物。

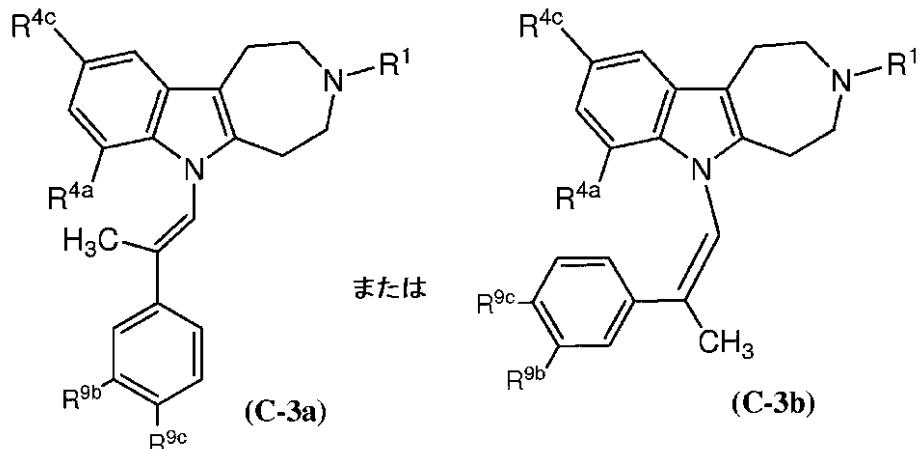
(項目90)

X^7 、 X^8 、 X^9 および X^{10} のうちの少なくとも1つが、 CR^4 であり、各 R^4 が、独立して、H、ハロまたはメチルである、項目87から89のいずれかに記載の化合物。

(項目 9 1)

式 (C - 3 a) または (C - 3 b) の化合物

【化 2 1 5 】



(式中、

R^1 は、 CH_3 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CF_3$ 、または $-CH_2CH_2C(CH_3)_2OH$ であり、

R^{4-a} は、H または F であり、

R^4C は、 H 、 C_2H_5 、 C_2F_5 、 Cl 、 F 、 C_2F_3 、 または -NHCH_3 であり、

R⁹ b は、HまたはFであり、

R^9C は、 FCF_3 、 OCH_3 、 $-CONH(CH_3)$ 、 または $-CON(CH_3)_2$ である)、

またはその塩もしくは濱媒和物。

（項目92）

R¹ が CH₃ であり、R^{4a} が H であり、R^{4c} が CH₃、Cl、F または -NHCH₃ であり、R^{9b} が H または F であり、R^{9c} が F、OCH₃、-CONH(CH₃) または -CON(CH₃)₂ である、項目 91 に記載の化合物。

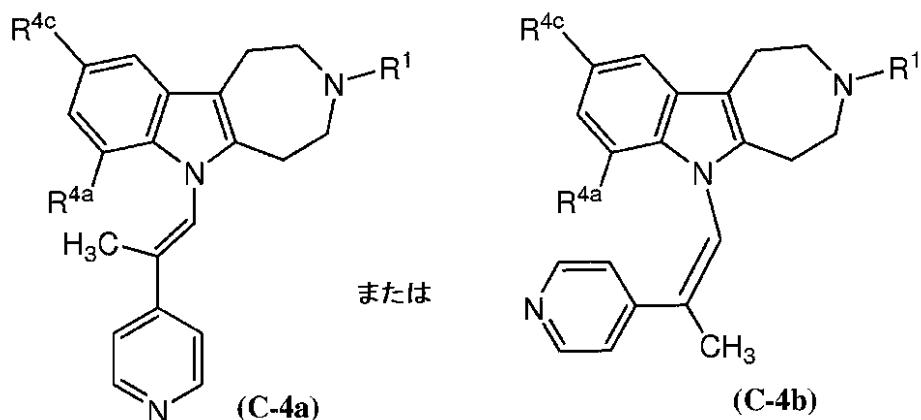
(項目 9 3)

R¹ が CH₃ であり、R^{4a} が H であり、R^{4c} が CH₃、Cl、F または -NHCH₃ であり、R^{9b} が H であり、R^{9c} が F または OCH₃ である、項目 91 に記載の化合物。

（項目 9 4 ）

式 (C - 4 a) または (C - 4 b) の化合物

【化216】



(式中、

R¹ は、 C H₃、 - C H₂ C H₂ F、 - C H₂ C F₃、 または - C H₂ C H₂ C (C H₃)₂ O H であり、

R^{4a} は、 H または F であり、

R^{4c} は、 H、 C H₃、 C F₃、 C l、 F、 または - N H C H₃ である）、
またはその塩もしくは溶媒和物。

(項目95)

R¹ が C H₃ であり、 R^{4a} が H であり、 R^{4c} が C H₃、 C l、 F または - N H C H₃ である、 項目94 に記載の化合物。

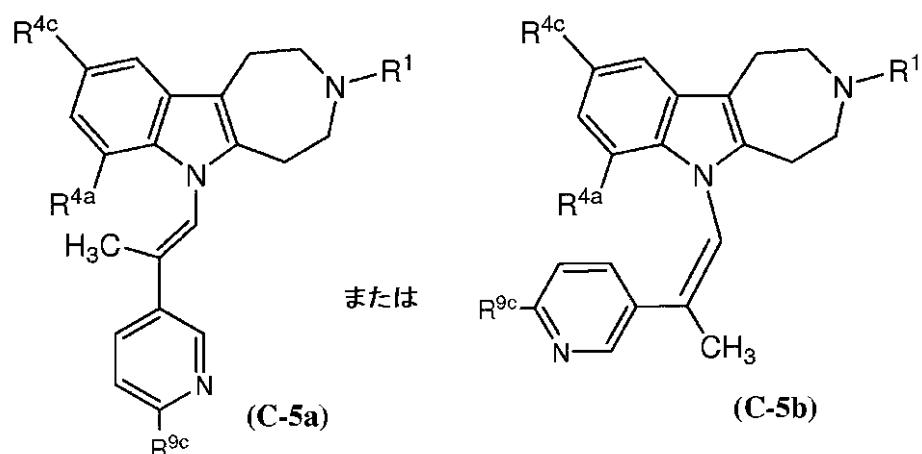
(項目96)

R¹ が C H₃ であり、 R^{4a} が H であり、 R^{4c} が C H₃、 C l、 F である、 項目94 に記載の化合物。

(項目97)

式 (C-5a) または (C-5b) の化合物

【化217】



(式中、

R¹ は、 C H₃、 - C H₂ C H₂ F、 - C H₂ C F₃、 または - C H₂ C H₂ C (C H₃)₂ O H であり、

R^{4a} は、 H または F であり、

R^{4c} は、 H、 C H₃、 C F₃、 C l、 F、 または - N H C H₃ であり、

R^{9c} は、 H、 F、 C H₃、 C F₃、 O C H₃、 - C O N H (C H₃)₂ 、 または - C O N (C H₃)₂ である）、

またはその塩もしくは溶媒和物。

(項 目 9 8)

R¹ が CH₃ であり、R^{4a} が H であり、R^{4c} が CH₃、Cl、F または -NHCH₃ であり、R^{9c} が H、F、または CH₃ である、項目 97 に記載の化合物。

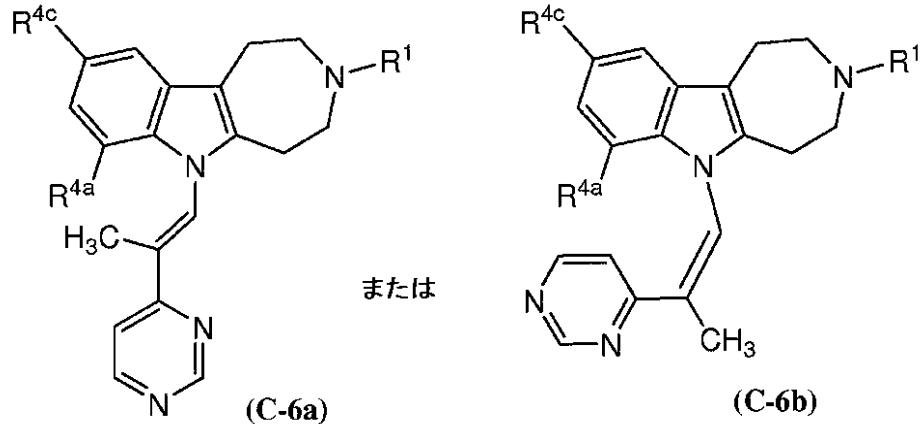
(項目99)

R¹ が CH₃ であり、R^{4-a} が H であり、R^{4-c} が CH₃、Cl、F であり、R^{9-c} が H または CH₃ である、項目 97 に記載の化合物。

(項目 1 0 0)

式 (C - 6 a) または (C - 6 b) の化合物

【化 2 1 8】



(式中、

R^1 は、 CH_3 、 $-CH_2CH_2F$ 、 $-CH_2CF_3$ 、または $-CH_2CH_2C(CH_3)_2OH$ であり、

R^{4-a} は、H または F であり、

R^4C は、H、 CH_3 、 CF_3 、Cl、F、または $-NHCH_3$ である）、

またはその塩もしくは溶媒和物。

(項目 1 0 1)

R¹ が CH₃ であり、R^{4a} が H であり、R^{4c} が CH₃、Cl、F または -NHCH₃ である、項目 100 に記載の化合物。

(項目 1 0 2)

R¹ が CH₃ であり、R^{4-a} が H であり、R^{4-c} が CH₃、Cl、F である、項目 100 に記載の化合物。

(項 目 1 0 3)

個体においてヒスタミン受容体を調節する方法であって、それを必要とする個体に、項目 1 から 102 のいずれかに記載の化合物を投与するステップを含む方法。

(項目 1 0 4)

項目 1 から 102 のいずれかに記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

(項 目 1 0 5)

項目 1 から 102 のいずれかに記載の化合物と、使用のための指示書とを含むキット。

(項 目 1 0 6)

認知障害、または認識機能障害に伴う少なくとも1つの症状を引き起こすことを特徴とする障害を処置する方法であって、それを必要とする個体に、項目1から102のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の低用量を投与するステップを含む方法。

(項目 107)

(i) 精神病性障害、(ii) 認知の改善も必要な個体における精神病性障害または(

i i i) 少なくとも 1 つの精神病性症状、および認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害を処置する方法であって、それを必要とする個体に、項目 1 から 1 0 2 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量を投与するステップを含む方法。

(項目 1 0 8)

認知障害、または認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置のための薬物の製造における、項目 1 から 1 0 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の低用量の使用。

(項目 1 0 9)

(i) 精神病性障害、(i i) 認知の改善も必要な個体における精神病性障害、または(i i i) 少なくとも 1 つの精神病性症状、および認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置のための薬物の製造における、項目 1 から 1 0 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量の使用。

(項目 1 1 0)

項目 1 から 1 0 2 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の低用量と、認知障害、または認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における前認識効果を達成するための指示書とを含むキット。

(項目 1 1 1)

項目 1 から 1 0 2 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩の高用量と、(i) 認知障害、または認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における前認識効果、ならびに(i i) 精神病性障害、認知の改善も必要な個体における精神病性障害、または少なくとも 1 つの精神病性症状、および認識機能障害に伴う少なくとも 1 つの症状を引き起こすことを特徴とする障害の処置における抗精神病性効果を達成するための指示書とを含むキット。

(項目 1 1 2)

化合物 2 、 1 6 0 、 2 4 8 、 2 5 3 、 2 5 4 および 2 8 3 、またはその塩からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物。