

【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 10 月 5 日 (2006.10.5)

【公表番号】特表 2002-522359 (P2002-522359A)

【公表日】平成 14 年 7 月 23 日 (2002.7.23)

【出願番号】特願 2000-563228 (P2000-563228)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 K 31/4174 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/4523 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

C 0 7 D 231/16 (2006.01)

C 0 7 D 233/64 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/415

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/4174

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/4523

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/30

C 0 7 D 231/12 B

C 0 7 D 231/16

C 0 7 D 233/64 1 0 3

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 409/06

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 7 月 27 日 (2006.7.27)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

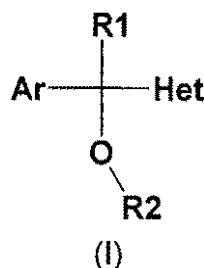
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 過剰のサブスタンス P によって引き起こされるヒトを含む哺乳類の不安、鬱病、精神分裂病、躁鬱病、性的機能障害、薬物中毒、認識障害および運動障害を含む中枢神経系障害の処置用医薬の製造における一般式 (I) で表されるアリール (またはヘテロアリール) アゾリルカルビノール誘導体および該誘導体の生理学的に許容される塩の使用：

【化 1】



式中、

Ar は未置換のフェニル基もしくはチエニル基、またはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、トリフルオロメチル基およびメトキシ基から成る群から選択される 1、2 もしくは 3 個の同一もしくは異なる置換基によって随意に置換されたフェニル基もしくはチエニル基を示し、

R 1 は水素原子、シクロヘキシル基、N-メチルピペリジル基、フェニル基、ビニル基または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル基を示し、

R 2 は水素原子、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキル) アザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基またはアザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基を示し、

H e t は窒素原子を 1 - 3 個有する未置換の含窒素ヘテロ環状五員環、またはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキル基、ベンジル基、シアノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、カルボキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、メトキシカルボニル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基およびアザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基から成る群から選択される 1 もしくは 2 個の同一もしくは異なる置換基によって随意に置換されていてもよい該五員環を示す。

【請求項 2】 一般式 (I) で表される化合物が下記の化合物群から選択される化合物である請求項 1 記載の使用：

[1] 2-{-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[2] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[3] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[4] 2-{3-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[5] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[6] 2-{4-フルオロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[7] 2-{-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチル-3-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

- [8] 2-{3-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [9] 2-{3-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -プロピルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [10] 1-ブチル-2-(4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル)-1H-イミダゾール
- [11] 2-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチル-4-メトキシベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [12] 2-{3-クロロ- -メチル- -[2-(N-ピロリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [13] 2-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -プロピル-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1-ドデシル-1H-イミダゾール
- [14] 1-ブチル-2-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-4-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1H-イミダゾール
- [15] 1-メチル-2-{ -メチル- -[2-(N-ピペリジル)エトキシ]-3(トリフルオロメチル)ベンジル}-1H-イミダゾール
- [16] 2-{ -シクロヘキシル-3,4-ジクロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [17] 2-{3,4-ジクロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -プロピルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [18] 2-{3,4-ジクロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [19] 2-{3,4-ジクロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [20] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-[2-(N-ピペリジル)エチル]-1H-イミダゾール
- [21] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-[2-(N-ピペリジル)プロピル]-1H-イミダゾール
- [22] 1-(3-シアノプロピル)-2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1H-イミダゾール
- [23] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -(N-メチル-4-ピペリジル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [24] 1-ベンジル-2-{ -[2-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)エトキシ]-4-クロロベンジル}-1H-イミダゾール
- [25] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-7-メチル-6,7,8,9-テトラヒドロ-1H-イミダゾール[1,5-a][1,4]ジアゼピナ
- [26] 2-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-7-メチル-6,7,8,9-テトラヒドロ-1H-イミダゾール[1,5-a][1,4]ジアゼピナ
- [27] 1-ブチル-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [28] 5-{ -(4-クロロフェニル)- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [29] 1-ブチル-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1H-ピラゾール
- [30] 1-ブチル-5-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1H-ピラゾール
- [31] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [32] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [33] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール

- [34] 1-メチル-5-{ -[2-(N-ピロリジル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [35] 1-メチル-5-{ -[2-(N-モルホリニル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [36] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチル-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [37] 4-ブromo-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [38] 1,3-ジメチル-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1H-ピラゾール
- [39] 1,3-ジメチル-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [40] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [41] 4-クロロ-5-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [42] 5-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [43] 5-{3-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [44] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-4-メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [45] 5-{2-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [46] 1-メチル-5-{ -[2-(N-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [47] 1-メチル-5-{ -[2-(N-プロピル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [48] 5-{ -[2-(N-エチル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [49] 1-メチル-5-{ -[2-(N-メチル-2-ピロリジル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [50] 5-{ -[2-(ジイソプロピルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [51] 1-メチル-5-{ -[2-(N-メチル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [52] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [53] 2-{3-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [54] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -エチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [55] 2-{ -ブチル-3-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [56] 2-{ -シクロヘキシル-4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [57] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-4-フルオロ- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [58] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチル-3-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [59] 2-{2-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [60] 2-{3-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [61] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチル-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [62] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチル-4-メトキシベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [63] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [64] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [65] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [66] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-3-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

ル-1H-イミダゾール

[67] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-4-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[68] 2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-4-メトキシベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[69] 2-{ -ブチル- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-3-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[70] 1-ブチル-2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1H-イミダゾール

[71] 1-ブチル-2-{ -ブチル- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-3,4,5-トリメトキシベンジル}-1H-イミダゾール

[72] 1-ブチル-2-{ -ブチル-2-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1H-イミダゾール

[73] 1-ブチル-2-{ -ブチル-2,4-ジクロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1H-イミダゾール

[74] 1-ブチル-2-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-4-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1H-イミダゾール

[75] 2-{4-クロロ- -[3-(N-ピペリジル)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[76] 1-メチル-2-{ -メチル- -[3-(N-ピペリジル)プロポキシ]-4-(トリフルオロメチル)ベンジル}-1H-イミダゾール

[77] 2-{ -ブチル-2-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[78] 2-{ -ブチル-3,4-ジクロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[79] 2-{3,4-ジクロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[80] 2-{3,4-ジクロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[81] 2-{ -シクロヘキシル-3,4-ジクロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[82] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}- -[2-(N-ピペリジル)エチル]-1H-イミダゾール

[83] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-[2-(N-ピペリジル)プロポキシ]-1H-イミダゾール

[84] 2-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -(N-メチル-4-ピペリジル)ベンジル}-1-メチル-1H-イミダゾール

[85] 1-ブチル-5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール

[86] 1-ブチル-5-{4-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1H-ピラゾール

[87] 5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール

[88] 5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール

[89] 1,3-ジメチル-5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]- -メチルベンジル}-1H-ピラゾール

[90] 1,3-ジメチル-5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール

[91] 5-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]-2-メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール

[92] 5-クロロ-544-クロロ- -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール

- [93] 1-メチル-5-{ -[3-(N-ピペリジル)プロポキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [94] 1-メチル-5-{ -[3-(N-ピロリジル)プロポキシ]ベンジル}-1H-ピラゾール
- [95] 4-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [96] 4-{4-クロロ- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチルベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [97] 4-{4-クロロ- -[2-(N-プロピル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [98] 4-{4-クロロ- -[2-(N-メチル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [99] 4-{4-クロロ- -[2-(N-エチル-2-ピペリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [100] 4-{4-クロロ- -[2-(ジイソプロピルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [101] 4-{4-クロロ- -[2-(N-メチル-2-ピロリジル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [102] 4-{ -[3-(ジメチルアミノ)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [103] 4-{4-クロロ- -[3-(N-モルホリニル)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [104] 4-{4-クロロ- -[3-(N-ピロリジル)プロポキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [105] 2-( -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [106] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [107] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [108] 2-(3-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [109] 2-(4-フルオロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [110] 2-[ -ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール
- [111] 2-[ -ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール
- [112] 2-( -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [113] 2-(3,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [114] 1-ブチル-2-[ -ヒドロキシ-4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-イミダゾール
- [115] 1-ブチル-2-(3,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [116] 1-ブチル-2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [117] 1-ブチル-2-( -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [118] 1-ドデシル-2-( -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1H-イミダゾール
- [119] 2-( -ブチル-3-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [120] 2-(3-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [121] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [122] 2-[4-クロロ- -ヒドロキシ- -(N-メチル-4-ピペリジル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール
- [123] 2-(4-クロロ- -エチル- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [124] 2-( -ブチル-4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [125] 2-( -シクロヘキシル-4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [126] 2-(2-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [127] 2-( -ブチル-2-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール
- [128] 2-[ -ヒドロキシ- -メチル-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール
- [129] 2-[ -ブチル- -ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール
- [130] 2-[ -シクロヘキシル- -ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-

ル-1H-ミダゾール

[131] 2-[ -ヒドロキシ- -メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1-メチル-1H-イミダゾール

[132] 2-(4-フルオロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[133] 2-( -ヒドロキシ- -メチル-4-メトキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[134] 2-(3,4-ジクロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[135] 2-( -ブチル-3,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[136] 2-( -シクロヘキシル-3,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[137] 2-( -ヒドロキシ- -メチル-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-メチル-1H-イミダゾール

[138] 1-ブチル-2-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1H-イミダゾール

[139] 1-ブチル-2-( -ブチル-4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[140] 1-ブチル-2-[4-クロロ- -ヒドロキシ- -(N-メチル-4-ピペリジル)ベンジル]-1H-ミダゾール

[141] 1-ブチル-2-( -ブチル- -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1H-イミダゾール

[142] 1-ブチル-2-( -ブチル-2-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[143] 1-ブチル-2-[ -エチル- -ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-イミダゾール

[144] 1-ブチル-2-( -ブチル-2,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[145] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-[2-(N-ピペリジル)エチル]-1H-イミダゾール

[146] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-(3-ジメチルアミノプロピル)-1H-イミダゾール

[147] 2-( -ブチル- -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-ドデシル-1H-イミダゾール

[148] 1-ベンジル-2-[ -ブチル- -ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-イミダゾール

[149] 1-ベンジル-2-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1H-イミダゾール

[150] 1-(2-シアノエチル)-2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[151] 1-(3-アミノプロピル)-2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[152] 3-[2-(3-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール-1-イル]プロパン酸

[153] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-イミダゾール

[154] 3-[2-(3-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール-1-イル]メチルプロパノエート

[155] 2-( -ヒドロキシベンジル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-イミダゾール

[156] 2-( -ヒドロキシ-4-メチルベンジル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-イミダゾール

[157] 2-( -ヒドロキシ-4-メトキシベンジル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-イミダゾール

[158] 2-(3,4-ジクロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-(3-ヒドロキシプロピル)-1H-イミダゾール

[159] 3-{2-( -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール-1-イル}メチルプロパノエート

[160] 2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-(4-ヒドロキシブチル)-1H-イミダゾール

[161] 1-(3-シアノプロピル)-2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール

[162] 4-[2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール-1-イル]ブタン酸

[163] 4-[2-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1H-イミダゾール-1-イル]メチルブタノエート

- [164] 1-ブチル-5-( -ヒドロキシベンジル)-1H-ピラゾール
- [165] 5-(4-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [166] 5-( -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [167] 1-ブチル-5-( -ヒドロキシ-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1H-ピラゾール
- [168] 4-ブromo-5-( -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [169] 5-[ - (4-クロロフェニル)- -ヒドロキシベンジル]-1-メチル-1H-ピラゾール
- [170] 1-ブチル-5-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1H-ピラゾール
- [171] 5-( -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [172] 5-( -ヒドロキシ- -メチル-3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [173] 1,3-ジメチル-5-( -ヒドロキシ- -メチルベンジル)-1H-ピラゾール
- [174] 1-ブチル-5-( -ヒドロキシ- -ビニルベンジル)-1H-ピラゾール
- [175] 1-ブチル-5-(4-クロロ- -ヒドロキシ- -ビニルベンジル)-1H-ピラゾール
- [176] 4-クロロ-5-( -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [177] 5-( -ヒドロキシ-2-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [178] 5-(3-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [179] 5-( -ヒドロキシ-4-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [180] 5-(2-クロロ- -ヒドロキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [181] 5-( -ヒドロキシ-4-メトキシベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール
- [182] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [183] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1Hピラゾールシトレート
- [184] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-3-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [185] 2-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-イミダゾール
- [186] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-3-メチル-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [187] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-5-メチル-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [188] 5-{5-ブromo- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [189] 5-{4-ブromo- -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [190] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]- -メチル-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [191] 5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾールシトレート
- [192] (±)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)-1-(メチル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [193] (±)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)-1-(メチル)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [194] (+)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [195] (-)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール
- [196] (+)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾールシトレート
- [197] (-)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラ



ゾールシトレート

[198] (+)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール D-ジトルオイルタートレート

[199] (-)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-2-チエニルメチル}-1-メチル-1H-ピラゾール L-ジトルオイルタートレート

[200] (+)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾールシトレート

[201] (-)-5-{ -[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]ベンジル}-1-メチル-1H-ピラゾールシトレート

[202] 5-( -ヒドロキシ-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール

[203] 5-( -ヒドロキシ-3-メチル-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール

[204] 5-( -ヒドロキシ-5-メチル-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール

[205] 5-(5-ブromo- -ヒドロキシ-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール

[206] 5-(4-ブromo- -ヒドロキシ-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール

[207] 5-( -ヒドロキシ- -メチル-2-チエニルメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0010

【補正方法】変更

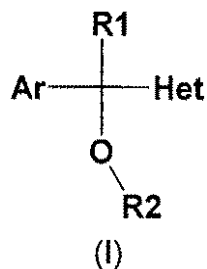
【補正の内容】

【0010】

(発明の開示)

即ち本発明は、過剰のサブスタンスPによって引き起こされるヒトを含む哺乳類の障害、特に中枢神経系障害、例えば不安、鬱病、精神分裂病、躁鬱病、性的機能障害、薬物中毒、認識障害および運動障害等の処置用医薬の製造における一般式(I)で表されるアリアル(またはヘテロアリアル)アゾリルカルビノール誘導体および該誘導体の生理学的に許容される塩の使用に関する：

【化3】



式中、

Arは未置換のフェニル基もしくはチエニル基、またはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、トリフルオロメチル基およびメトキシ基から成る群から選択される1、2もしくは3個の同一もしくは異なる置換基によって随意に置換されたフェニル基もしくはチエニル基を示し、

R1は水素原子、シクロヘキシル基、N-メチルピペリジル基、フェニル基、ビニル基またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を示し、

R2は水素原子、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)アミノ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキル)アザヘテロシクリル(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基またはアザヘテロシクリル(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基を示し、

Hetは窒素原子を1-3個有する未置換の含窒素ヘテロ環状五員環、またはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル基、ベンジル基、シアノ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、カルボキシ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、メトキシカルボニル(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、ヒドロキシ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、アミノ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)基、ジ

(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基およびアザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基から成る群から選択される 1 もしくは 2 個の同一もしくは異なる置換基によって随意に置換されていてもよい該五員環を示す。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 1】

「C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル基」という用語は、炭素原子数 1 - 4 の飽和炭化水素から誘導される直鎖状または分枝鎖状の基、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基および t-ブチル基を示す。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 2】

「ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキル) アザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基またはアザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、ジ (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) アミン、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキル) アザヘテロ環またはアザヘテロ環に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基、例えばジメチルアミノエチル基、ジメチルアミノプロピル基、ジエチルアミノエチル基、ピペリジルエチル基、N-エチルピペリジルエチル基、N-メチルピロリジニルエチル基、モルホリニルプロピル基およびピロリジニルアルキル基等を示す。

「(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキル) アザヘテロシクリル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub> アルキル) アザヘテロシクリルアルキルに結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 3】

「シアノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、シアノ官能基に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。

「カルボキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、カルボキシル官能基に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。

「メトキシカルボニル (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、メトキシカルボニル官能基に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。

「ヒドロキシ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、ヒドロキシ官能基に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。

「アミノ (C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキル) 基」という用語は、アミノ官能基に結合した炭素原子数 2 または 3 のアルキル基を示す。