

【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20年10月9日 (2008.10.9)

【公表番号】特表2008-534568(P2008-534568A)

【公表日】平成20年8月28日 (2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報2008-034

【出願番号】特願2008-503608(P2008-503608)

【国際特許分類】

C 0 7 D 221/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 411/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 221/04 C S P

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 401/04
C 0 7 D 411/12
C 0 7 D 417/12
C 0 7 D 401/14
A 6 1 P 43/00 1 1 3
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 25/34
A 6 1 P 25/36
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 13/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年8月20日(2008.8.20)

【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

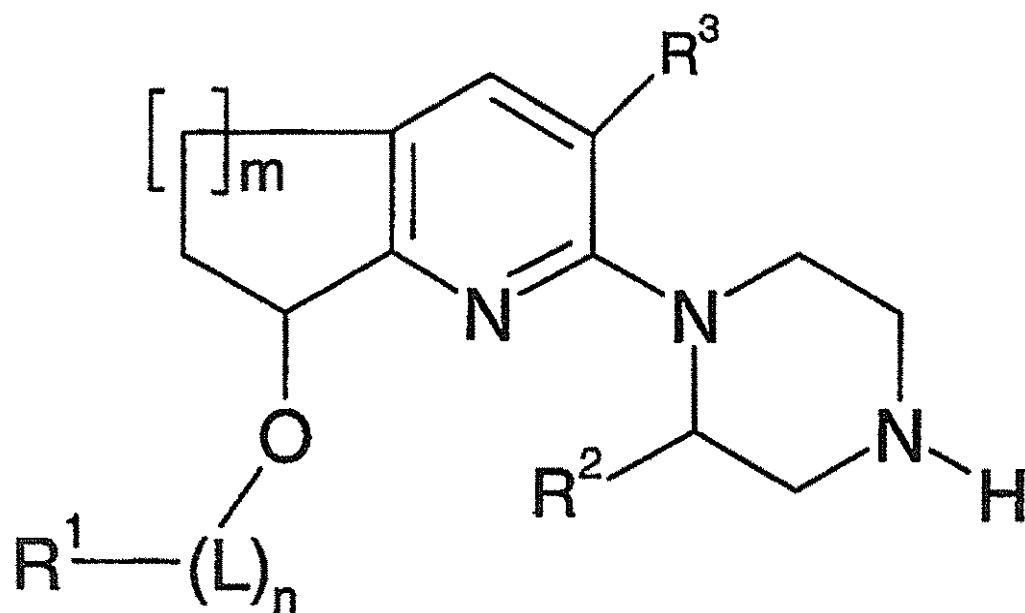
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式(Ⅰ)の化合物

【化 1】



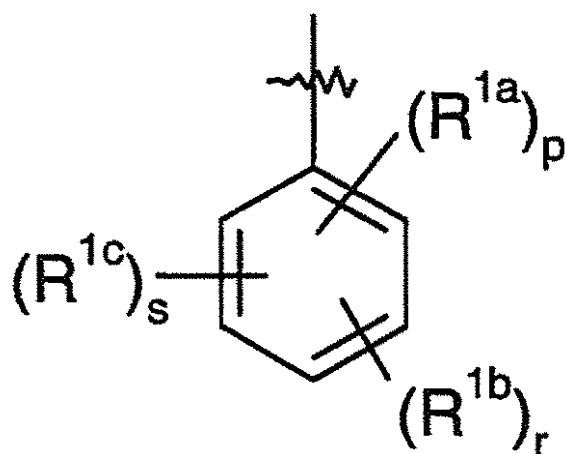
(I)

〔式中、

 m は、1または2であり、 n は、0または1であり、 L は、 $-CHR^{0a}-$ であり、 R^{0a} は、水素または($C_1 \sim C_4$)アルキルであり、 R^2 は、水素またはメチルであり、 R^3 は、H、Cl、Br、F、 CH_3 、およびCNからなる群から選択され、 R^1 は、

(a) 次式(1A)の基

【化 2】



(1A)

であって、

(i) p 、 r 、および s が、それぞれ独立に0または1であり、 R^{1a} 、 R^{1b} 、および R^{1c} が、F、Cl、Br、I、シアノ、 $-CH_2-CN$ 、 $-N$

H₂、-OH、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) アルコキシ、(C₁ ~ C₄) アルキルチオ、フルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルキル、フルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルコキシ、フルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルキルチオ、-NH-C(O)-(C₁ ~ C₄) アルキル、-C(O)-(C₁ ~ C₄) アルキル、-C(O)-O(C₁ ~ C₄) アルキル、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁ ~ C₄) アルキル、3 ~ 6 員炭素環、ならびにF、Cl、Br、またはIで置換されているフェニルからなる群からそれぞれ独立に選択されるもの、

(ii) p および r が、それぞれ 0 または 1 であり、
s が 1 であり、

R^{1a} および R^{1b} が、F、Cl、Br、I、シアノ、-NH₂、-C(O)-(C₁ ~ C₄) アルキル、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) アルコキシ、(C₁ ~ C₄) アルキルチオ、フルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルキル、フルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルコキシ、またはフルオロ置換(C₁ ~ C₄) アルキルチオからそれぞれ独立に選択され、
(R^{1c})_s が、式 1 A の基が残りの分子にそれによって結合する炭素以外の隣接する環炭素原子に結合し、(R^{1c})_s が、その結合相手である 2 個の炭素と一緒に、
ケト基を含んでいてもよい 5 ~ 6 員炭素環、

O、S、またはNからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含み、ケト基を含んでいてもよい 5 ~ 6 員複素環、

6 員芳香環、および

O、S、またはNからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員芳香族複素環

からなる群から選択される環を形成し、

前記炭素環、前記複素環、前記芳香環、および前記芳香族複素環が、(C₁ ~ C₄) アルキル、シアノ、アセチル、F、Cl、Br、I、フェニルアミノ、(C₁ ~ C₄) アルキルアミノ；N、O、およびSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、(C₁ ~ C₄) アルキルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい 5 ~ 6 員複素環；ならびにN、O、およびSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、(C₁ ~ C₄) アルキルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロアリール環からなる群から選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていてもよいもの、あるいは

(iii) p および r が、それぞれ 0 であり、
s が 1 であり、

R^{1c} が、フェニル；F、Cl、Br、またはIで置換されていてもよいフェノキシ；ベンジル；ベンジルオキシ；-NH(C₁ ~ C₄) アルキル；-N[(C₁ ~ C₄) アルキル]₂；-CH₂-NH(C₁ ~ C₄) アルキル；-CH₂-N[(C₁ ~ C₄) アルキル]₂；-NH(フェニル)；-NH(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、1 ~ 3 個のハロ基で置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロアリール)；-N(CH₃)-SO₂(C₁ ~ C₄) アルキル；-NH-SO₂(C₁ ~ C₄) アルキル；-NHC(O)NH₂；-C(O)-N[(C₁ ~ C₄) アルキル]₂；-C(O)-(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員複素環)；-C(O)-NH(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員複素環)；-C(O)-(5 ~ 6 員炭素環)；-CH₂-C(O)-O(C₁ ~ C₄) アルキル；O、N、またはSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 ~ 6 員複素環；ならびにO、N、またはSからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含み、F、Cl、Br、I、および-CF₃からそれぞれ独立に選択される 1 個 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい 5 ~ 6 員ヘテロアリールからなる群からそれぞれ独立に選択されるもの、

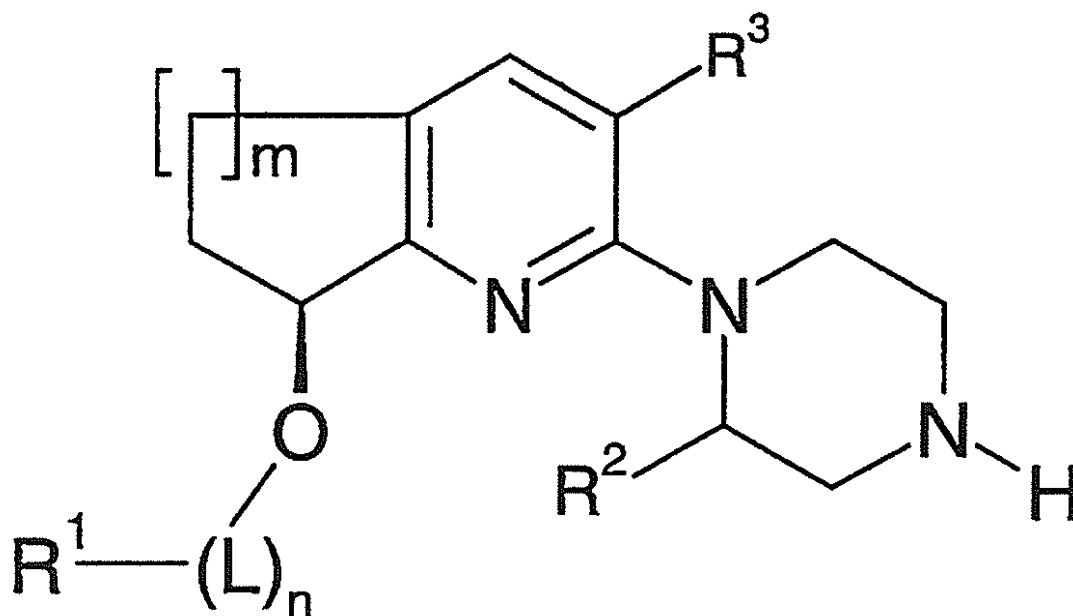
(b) O、S、またはNからそれぞれ独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員ヘテロアリールであって、前記ヘテロアリールが、5 ~ 6 員炭素環または 6 員芳香環に縮合していてもよく、前記ヘテロアリールが、シアノ、F、Cl、Br、I、(C₁ ~

C₄) アルキル、(C₁ ~ C₄) アルコキシ、および -C(O)-O(C₁ ~ C₄) アルキルからなる群からそれぞれ独立に選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されていてもよいものである]、
あるいは薬学的に許容できるその塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 2】

前記式 (I) の化合物が、次式 (II)

【化 3】



(II)

[式中、m、n、L、R¹、R²、および R³ は請求項 1 で規定したとおりである] の化合物、

あるいは薬学的に許容できるその塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R² が (R) - メチルである請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 4】

R² が (R) - メチルである請求項 2 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 5】

R^{0 a} が H または CH₃ である請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 6】

R³ が H である請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 7】

m が 1 であり、n が 1 である請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 8】

(7S) - 7 - [(2, 5 - ジフルオロベンジル)オキシ] - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(3 - フルオロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(2 - クロロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

3 - [({(7S) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン - 7 - イル} オキシ)メチル]ベンゾニトリル、

(7S) - 7 - [(2, 5 - ジフルオロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(2, 5 - ジクロロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(2 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(2 - メチル - 5 - クロロベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(5 - フルオロ - 2 - メチル - ベンジル)オキシ] - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、および

4 - メチル - 3 - [({(7S) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン - 7 - イル} オキシ)メチル]ベンゾニトリルからなる群から選択される請求項 7 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 9】

m が 1 であり、n が 0 である請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 10】

(7S) - 7 - (2 - クロロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - (3 - クロロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

3 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン - 7 - イル] オキシ } ベンゾニトリル、

3 - { [(7R) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン - 7 - イル] オキシ } ベンゾニトリル、

(7R) - 7 - (3, 5 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - [(6 - フルオロ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル)オキシ] - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ[b]ピリジン、

(7S) - 7 - (1 - ナフチルオキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン、
 5 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } イソキノリン、
 8 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } キノリン、
 8 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } キノリン - 2 - カルボニトリル、
 4 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } - 1, 3 - ベンゾキサゾール、
 7 - (2 - クロロフェノキシ) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン、
 (7S) - 7 - (2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン、
 (7S) - 7 - (6 - フルオロ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン、および
 4 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } イソキノリンからなる群から選択される請求項9に記載の化合物、
 あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項11】

7 - (2 - クロロフェノキシ) - 2 - [(2R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジンまたは
 4 - { [(7S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6, 7 - ジヒドロ - 5H - シクロペンタ [b] ピリジン - 7 - イル] オキシ } イソキノリンである請求項10に記載の化合物、
 または薬学的に許容できるその塩。

【請求項12】

mが2でありnが0である請求項1に記載の化合物、
 あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項13】

8 - (2 - フルオロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、
 (8S) - 8 - (3 - フルオロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、
 3 - { [(8R) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン - 8 - イル] オキシ } ベンゾニトリル、
 3 - { [(8S) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン - 8 - イル] オキシ } ベンゾニトリル、
 (8S) - 8 - (5 - フルオロ - 2 - メチルフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、
 (8S) - 8 - (2 - クロロ - 5 - メチルフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、
 (8S) - 8 - (3, 5 - ジフルオロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、
 (8S) - 8 - (3 - クロロ - 2 - フルオロフェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロキノリン、

(8 S) - 8 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロキノリン、

(8 S) - 8 - (6 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロキノリン、および

(8 S) - 8 - (6 - フルオロ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルオキシ) - 2 - [(2 R) - 2 - メチルピペラジン - 1 - イル] - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロキノリンからなる群から選択される請求項 1 2 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 1 4】

R³ が Cl、Br、F、CH₃、または CN である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

3 - クロロ - 7 (S) - (2 , 5 - ジフルオロ - ベンジルオキシ) - 2 - (2 - (R) - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - [1] - ピリジン、

3 - クロロ - 7 - (5 - フルオロ - 2 - メチル - ベンジルオキシ) - 2 - (2 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - [1] ピリジン、

3 - [3 - クロロ - 2 - (2 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - [1] ピリジン - 7 - イルオキシメチル] - 4 - メチル - ベンゾニトリル、

3 - クロロ - 8 - (2 , 3 - ジクロロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 8 - (2 - フルオロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 8 - (5 - フルオロ - 2 - メチル - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 8 - (3 , 5 - ジフルオロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 8 - (3 - フルオロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 8 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン、

3 - クロロ - 7 - (2 - クロロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - [1] ピリジン、および

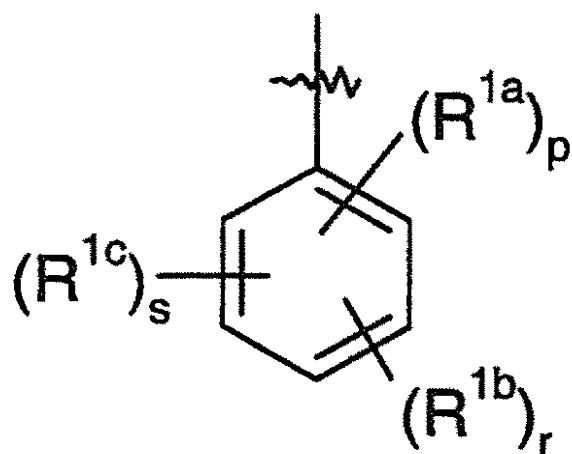
3 - クロロ - 7 - (3 - クロロ - フェノキシ) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - [1] ピリジンからなる群から選択される請求項 1 4 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 1 6】

R¹ が次式 (I A) の基

【化 4】



(1A)

[式中、

(i) p 、 r 、および s は、それぞれ独立に 0 または 1 であり、
 R^{1a} 、 R^{1b} 、および R^{1c} は、クロロ、フルオロ、ブromo、シアノ、 $-CH_2-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルチオ、 $(1 \sim 3)$ フルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(1 \sim 3)$ フルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、および $(1 \sim 3)$ フルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルチオからなる群からそれぞれ独立に選択される] である、請求項 1 に記載の化合物、あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 17】

R^2 がメチルであり、 R^{0a} が H または CH_3 であり、 R^3 が H または Cl である請求項 16 に記載の化合物、
 あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 18】

(ii) p および r がそれぞれ 0 または 1 であり、 s が 1 であり、
 R^{1a} および R^{1b} が、F、Cl、Br、I、シアノ、 $-NH_2$ 、 $-C(O)-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルチオ、フルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、フルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、またはフルオロ置換 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルチオからそれぞれ独立に選択され、
 $(R^{1c})_s$ が、式 1A の基が残りの分子にそれによって結合している炭素以外の隣接する環炭素原子に結合し、 $(R^{1c})_s$ が、その結合相手である 2 個の炭素と一緒になっ

て、
 ケト基を含んでもよい 5 ～ 6 員炭素環、

O、S、または N からそれぞれ独立に選択される 1 ～ 2 個のヘテロ原子を含み、ケト基を含んでもよい 5 ～ 6 員複素環、

6 員芳香環、および

O、S、または N からそれぞれ独立に選択される 1 ～ 2 個のヘテロ原子を含む 5 ～ 6 員芳香族複素環からなる群から選択される環を形成し、

前記炭素環、前記複素環、前記芳香環、および前記芳香族複素環が、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、シアノ、アセチル、F、Cl、Br、I、フェニルアミノ、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルアミノ；N、O、および S からそれぞれ独立に選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を含み、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキルから選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい 5 ～

6員複素環；ならびにN、O、およびSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含み、(C₁～C₄)アルキルから選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい5～6員ヘテロアリール環からなる群から選択される1～2個の置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項19】

(iii)pおよびrがそれぞれ0であり、sが1であり、

R^{1c}が、フェニル；F、Cl、Br、またはIで置換されていてもよいフェノキシ；ベンジル；ベンジロキシ；-NH(C₁～C₄)アルキル；-N[(C₁～C₄)アルキル]₂；-CH₂-NH(C₁～C₄)アルキル；-CH₂-N[(C₁～C₄)アルキル]₂；-NH(フェニル)；-NH(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含み、1～3個のハロ基で置換されていてもよい5～6員ヘテロアリール)；-N(CH₃)-SO₂(C₁～C₄)アルキル；-NH-SO₂(C₁～C₄)アルキル；-NHC(O)NH₂；-C(O)-N[(C₁～C₄)アルキル]₂；-C(O)-(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含む5～6員複素環)；-C(O)-NH(O、N、およびSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含む5～6員複素環)；-C(O)-(5～6員炭素環)；-CH₂-C(O)-O(C₁～C₄)アルキル；O、N、またはSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含む3～6員複素環；ならびにO、N、またはSからそれぞれ独立に選択される1～3個のヘテロ原子を含み、F、Cl、Br、I、および-CF₃からそれぞれ独立に選択される1個～3個の置換基で置換されていてもよい5～6員ヘテロアリールからなる群からそれぞれ独立に選択される、請求項1に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項20】

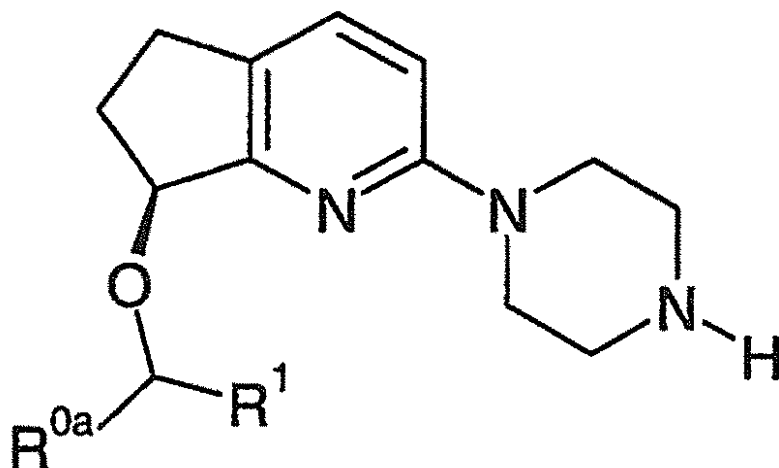
R¹が、ピリジルまたはピリミジニルである5～6員ヘテロアリールであり、前記ピリジルおよび前記ピリミジニルが、シアノ、F、Cl、Br、I、メチル、メトキシ、または-C(O)OCH₃で置換されていてもよい請求項1に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項21】

次式の化合物

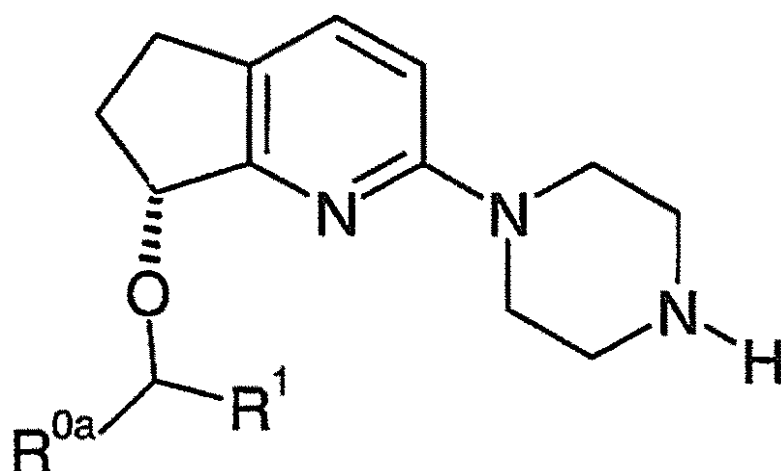
【化5】



[式中、各化合物のR^{0a}およびR¹は表1Aのものである]、

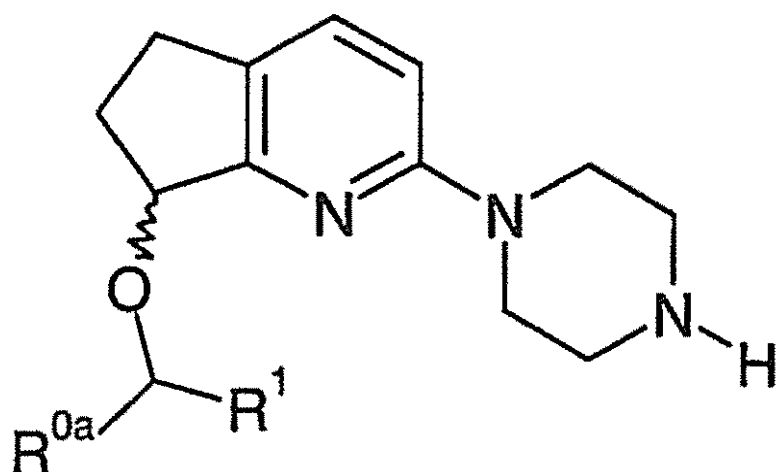
次式の化合物

【化 6】



[式中、各化合物の R^{0a} および R^1 は表 1 B のものである]、および
次式の化合物

【化 7】



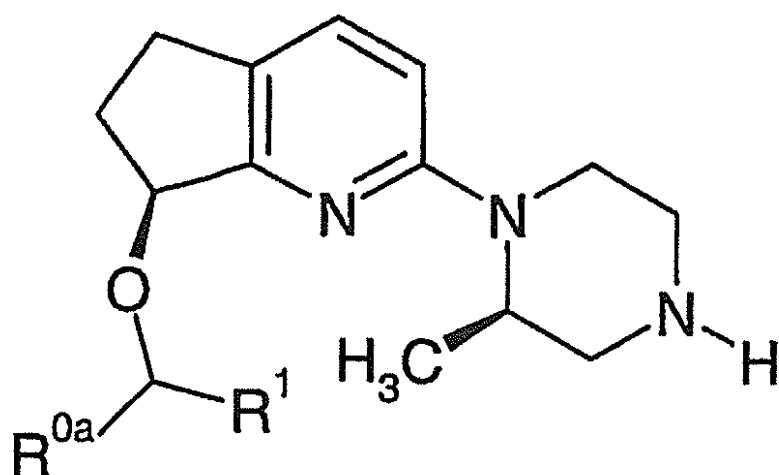
[式中、各化合物の R^{0a} および R^1 は表 1 C のものである] からなる群から選択される
請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物
もしくは水和物。

【請求項 2 2】

次式の化合物

【化 8】



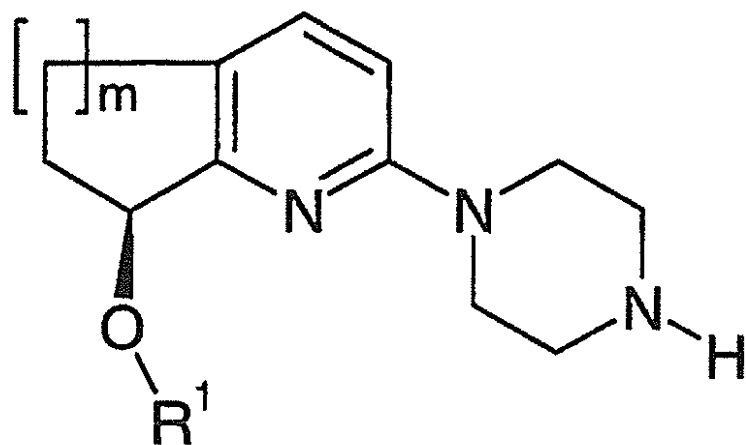
〔式中、各化合物の R^{0a} および R^1 は表 2 A のものである〕からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 23】

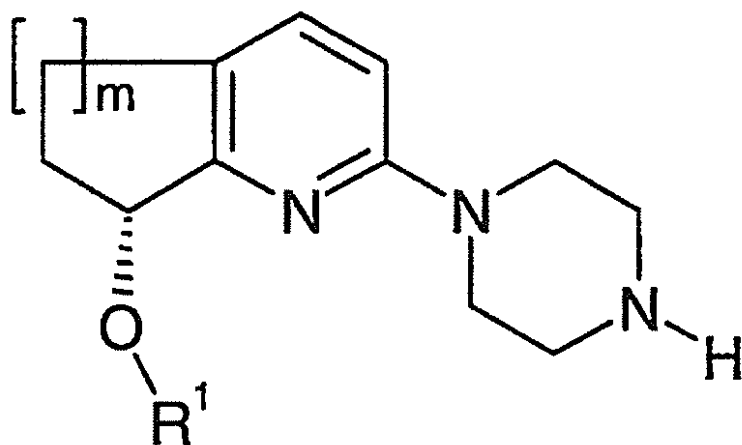
次式の化合物

【化 9】



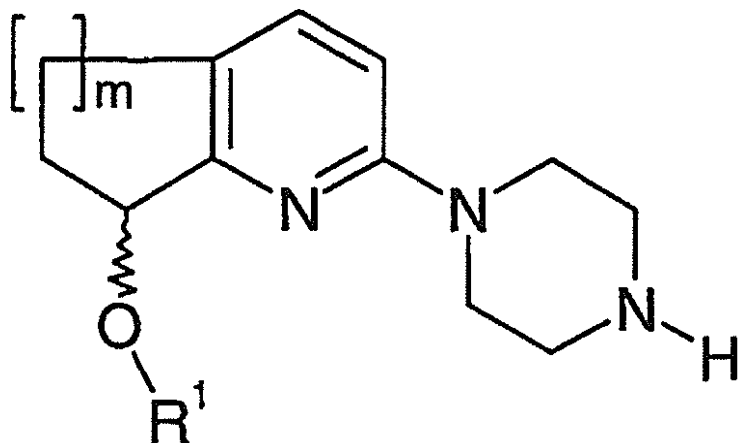
〔式中、各化合物の m および R^1 は表 3 A のものである〕、
次式の化合物

【化 1 0】



[式中、各化合物の m および R^1 は表 3 B のものである]、および
次式の化合物

【化 1 1】



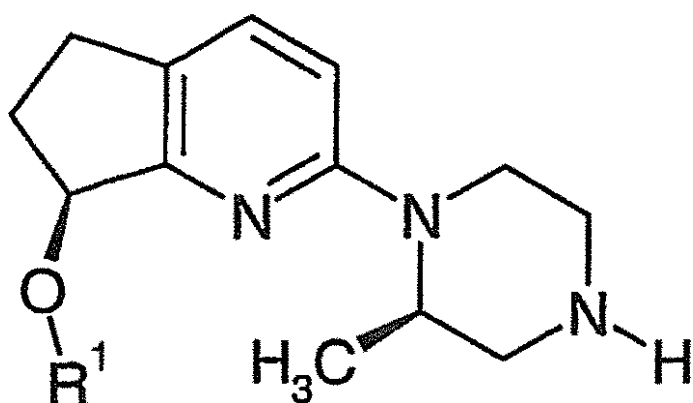
[式中、各化合物の m および R^1 は表 3 C のものである] からなる群から選択される請求
項 1 に記載の化合物、

あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物
もしくは水和物。

【請求項 2 4】

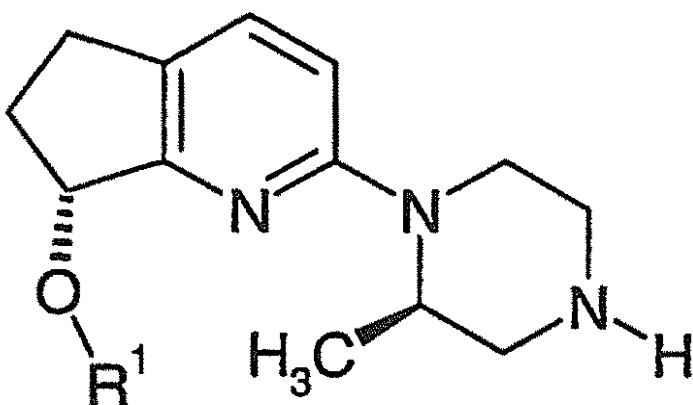
次式の化合物

【化 1 2】



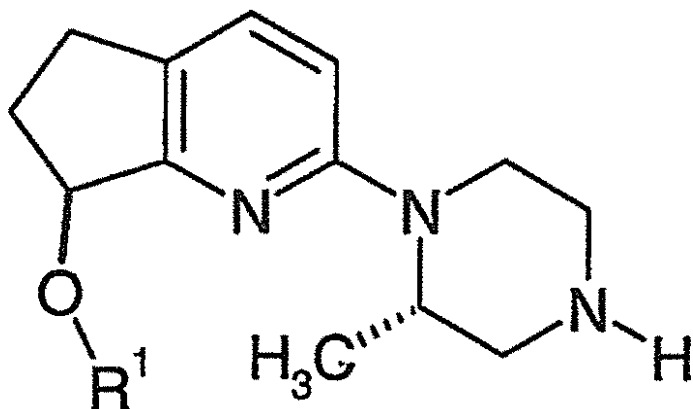
[式中、各化合物の R^1 は表 4 A のものである]、
次式の化合物

【化 1 3】



[式中、各化合物の R^1 は表 4 B のものである]、および
次式の化合物

【化 1 4】



[式中、各化合物の R^1 は表 4 C のものである] からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物、
あるいは前記化合物の薬学的に許容できる塩または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物
もしくは水和物。

【請求項 2 5】

(a) 請求項 1 に記載の化合物、薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物と、

(b) 薬学的に許容できる担体とを含む医薬組成物。

【請求項 26】

哺乳動物における $5 - H T_2 c$ 受容体が関与する疾患、状態、または障害を治療するための医薬組成物であって、当該疾患、状態、または障害を治療することにおいて有効な量の請求項 1 に記載の化合物、薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物を含む、医薬組成物。

【請求項 27】

疾患、状態、または障害が、摂食障害（たとえば、大食摂食障害、食欲不振症、および過食症）、体重減少または体重抑制（たとえば、カロリーもしくは食物摂取の減少、および/または食欲抑制）、肥満、尿崩症、I I 型糖尿病、うつ病、非定型うつ病、双極性障害、精神病、統合失調症、行為嗜癖、報酬関連行動の抑制（たとえば、コカインおよびモルヒネによって誘発される条件付け場所嗜好性の抑制などの条件付け場所回避）、物質乱用、嗜癖障害、衝動性、アルコール中毒（たとえば、アルコール摂取の禁断、欲求低下、および再発予防のための治療を含めて、アルコールの乱用、中毒、および/または依存症）、タバコ乱用（たとえば、喫煙の欲求低下および再発予防のための治療を含めて、喫煙の中毒、休止、および/または依存症）、月経前症候群または黄体期遅発症候群、偏頭痛、パニック障害、（広場恐怖、特定恐怖症、対人恐怖、外傷後ストレス障害、急性ストレス障害、および全般性不安障害を含む）不安、外傷後症候群、（記憶喪失、アルツハイマー病、加齢認知症、脳血管性痴呆、軽度認知障害、加齢関連認知機能低下、および軽度神経系認知障害を含む）認知症、発作性疾患、てんかん、消化器疾患（たとえば、消化管運動または腸の推進力の機能不全）、注意欠陥障害または注意多動性障害（A D D / A D H D）、破壊的な行動異常、衝動制御障害、境界性人格障害、強迫性障害、慢性疲労症候群、拒食症、睡眠障害（たとえば睡眠時無呼吸）、自閉症、てんかん、無言症、脊椎損傷、中枢神経系の損傷（たとえば、外傷、脳卒中、神経変性疾患、または毒もしくは感染による C N S 疾患（たとえば、脳炎または髄膜炎））、心臓血管障害（たとえば血栓症）、パーキンソン病、ハンチントン病、ドーパミン作動薬療法に関連するジスキネジア、不隠下肢症候群、本態性振戦、注意および/または認知の欠陥を症状として含む障害、（うつ病性障害を含む）気分障害または気分エピソード、神経変性障害または状態、トゥレット症候群、チック障害、男性性機能不全（M S D）、女性性機能不全（F S D）、ならびに（尿失禁を含む）下部尿路機能不全からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

疾患、状態、または障害が、精神病；（たとえば、妄想型、解体型、緊張型、鑑別不能型、または残遺型の）統合失調症；統合失調症様障害；（たとえば、妄想型またはうつ病型の）分裂感情障害；妄想性障害；物質誘発性精神病性障害（たとえば、アルコール、アンフェタミン、大麻、コカイン、幻覚発現物質、吸入剤、オピオイド、またはフェンシクリジンによって誘発される精神病）；妄想型の人格障害；ならびに統合失調質型の人格障害からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

疾患、状態、または障害が、不安、パニック障害、広場恐怖、特定恐怖症、対人恐怖、強迫性障害、外傷後ストレス障害、急性ストレス障害、および全般性不安障害からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

疾患、状態、または障害が、認知症；アルツハイマー病の認知障害症状；アルツハイマー病の注意欠陥症状；多発梗塞性痴呆、アルコール依存性認知症、または他の薬物関連認知症；頭蓋内腫瘍または脳外傷に関連する認知症；ハンチントン病またはパーキンソン病に関連する認知症；A I D S に関連した認知症；せん妄；健忘性障害；外傷後ストレス障

害；知能障害；学習障害（たとえば、読書障害、数学障害、または筆記表現障害）；注意欠陥／多動性障害；加齢関連認知機能低下；精神病に関連する認知障害；ならびに統合失調症に関連する認知障害からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

疾患、状態、または障害が、気分障害、気分エピソード；軽度、中等度、または重度の型の大うつ病エピソード；躁病または混合性気分エピソード、軽躁病気分エピソード；非定型の特徴を有するうつ病エピソード；メランコリー型の特徴を有するうつ病エピソード；緊張病性の特徴を有するうつ病エピソード；産後の発症を伴う気分エピソード；脳卒中後うつ病；大うつ病性障害；気分変調障害；軽症うつ病性障害；月経前不快気分障害；統合失調症の精神病後うつ病性障害；妄想性障害や統合失調症などの精神病性障害との混合型の大うつ病性障害；双極性障害、たとえば双極Ⅰ型障害、双極ⅠⅡ型障害、ならびに気分循環性障害からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

疾患、状態、または障害が、パーキンソン病；ハンチントン病；アルツハイマー病、多発梗塞性痴呆、A I D S に関連した認知症、および前頭側頭型痴呆（F r o n t o t e m p e r a l D e m e n t i a ）に関連する神経変性；脳外傷に関連する神経変性；脳卒中に関連する神経変性；脳梗塞に関連する神経変性；低血糖によって誘発される神経変性；てんかん性痙攣に関連する神経変性；神経毒中毒に関連する神経変性；ならびに多系統萎縮症からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

疾患、状態、または障害が統合失調症である、請求項 28 に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

疾患、状態、または障害が、摂食障害（たとえば、大食摂食障害、食欲不振症、および過食症）、体重減少もしくは体重抑制（たとえば、カロリーもしくは食物摂取の減少、および／または食欲抑制）、または肥満からなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

哺乳動物における 5 - H T _{2c} 受容体が関与する疾患、状態、または障害を治療するための医薬組成物であって、当該疾患、状態、または障害を治療することにおいて有効な量の請求項 1 に記載の化合物、薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは前記塩の溶媒和物もしくは水和物と、薬学的に活性のある薬剤を含む、医薬組成物。

【請求項 36】

薬学的に活性のある薬剤が抗精神病薬である、請求項 34 に記載の医薬組成物。