

【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21年8月13日(2009.8.13)

【公表番号】特表2009-503076(P2009-503076A)

【公表日】平成21年1月29日(2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-525054(P2008-525054)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/26	(2006.01)
C 0 7 D 471/04	(2006.01)
C 0 7 D 487/04	(2006.01)
C 0 7 D 239/74	(2006.01)
C 0 7 D 471/18	(2006.01)
A 6 1 K 31/519	(2006.01)
A 6 1 K 31/55	(2006.01)
A 6 1 K 31/517	(2006.01)
A 6 1 K 31/505	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
A 6 1 K 31/529	(2006.01)
C 0 7 D 487/18	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/20	(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 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/32	(2006.01)
A 6 1 P 25/36	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/14	(2006.01)
A 6 1 P 3/00	(2006.01)
A 6 1 P 5/00	(2006.01)
A 6 1 P 15/10	(2006.01)
A 6 1 P 15/12	(2006.01)
A 6 1 P 1/08	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
A 6 1 P 9/02	(2006.01)
A 6 1 P 9/08	(2006.01)
A 6 1 P 7/00	(2006.01)
A 6 1 P 13/12	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/12	(2006.01)
A 6 1 P 1/10	(2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/26 C S P

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N

C 0 7 D 487/04 1 5 0

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 239/74

C 0 7 D 471/18

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/529

C 0 7 D 487/18

A 6 1 P 43/00 1 1 4

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/32

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/02

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成21年6月26日(2009.6.26)

【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

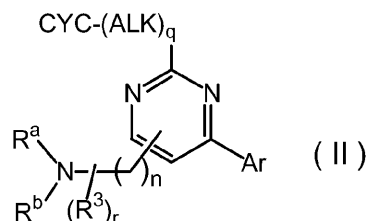
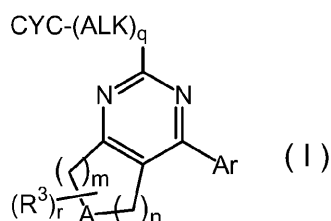
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)または(II):

【化1】



{ 式中、

mは、1, 2または3であり;

nは、1, 2または3であり;

mおよびnが存在する場合、m + nは2に等しいか或はそれ以上から4に等しいかあるそれ以下であり;

R^aおよびR^bは、独立して、-H, -C₁₋₇アルキルまたは-C₃₋₇シクロアルキルであるか、或はR^aとR^bが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^aおよびR^bは各々独立して-C₁₋₄アルキルにより置換されていてもよく;

qは、0または1であり;

Aは、>NR¹, >CHNR^cR^d, >CHOHまたは-CH₂-であり、ここで、

R¹は、-H, -C₁₋₇アルキル, -C₃₋₇シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル, シクロアルキルまたはベンジルは各々R^eにより一置換、二置換または三置換されていてもよく;

R^eは、-C₁₋₄アルキル, -C₂₋₄アルケニル, -C₂₋₄アルキニル, -C₃₋₆シクロアルキル, ハロ, -CF₃, -OH, -OC₁₋₄アルキル, -OCF₃, -N(R^f)R^g(ここで、R^fおよびR^gは独立して-Hまたは-C₁₋₄アルキルであるか、或はR^fとR^gが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており), -C(O)N(R^f)R^g, -N(R^h)C(O)R^h, -N(R^h)SO₂C₁₋₇アルキル(ここで、R^hは-Hまたは-C₁₋₄アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個のR^hが結合しているアミドと一緒になってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成しており), -S(O)₀₋₂-C₁₋₄アルキル, -SO₂N(R^f)R^g, -SCF₃, -C(O)C₁₋₄アルキル, -CN, -COOHおよび-COOC₁₋₄アルキルから成る群から選択され;

R^cおよびR^dは、独立して、-H, -C₁₋₇アルキル, -C₃₋₇アルケニル, -C₃₋₇アルキニル, -C₃₋₇シクロアルキル, -C₁₋₇アルキルC₃₋₇シクロアルキルおよび-C₃₋₇シクロアルキルC₁₋₇アルキルから成る群から選択されるか、或はR^cとR^dが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^cおよびR^dは各々独立してR^eにより置換されていてもよく;

R³は、各々が-C₁₋₃アルキル, -OHまたはハロにより置換されていてもよい-C₁₋₄

アルキル, $-C_{1-4}$ アルケニルまたはベンジルであるか、或は2個の R^3 置換基が一緒になって $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ またはハロにより置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており;

r は、0または $m+n+1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり;

Ar は、

a) フェニル [R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$, または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{2-7}$ アルケニル, $-C_{2-7}$ アルキニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ アルケニル, $-OC_{3-7}$ アルキニル, $-N(R^j)R^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル, $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ アルキル, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される];

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$, $>S$, $>NH$ または $>N(C_{1-4}アルキル)$ に置き換わっており、2個以下の追加炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい];

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]; および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル, フェノキシ, ピリジル, チオフェニル, オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は更に R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい];

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

ALK は、 R^m により一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン, C_{2-7} アルケニレン, C_{2-7} アルキニレン, C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり;

R^m は、ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^t は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ アルキル, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され;

CYC は、 $-H$ であるか、或は

i) フェニル [R^u により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$ または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, フェニル, ベンジル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-O$ フェニル, $-O$ ベンジル, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (ここで、 R^v および R^w は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して $-OH$ または $-C_{1-7}$ アルキルにより置換されていてもよい), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^x は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個の R^x が結合しているアミドと一

緒になってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成している), $-N-(SO_2C_{1-6}\text{アルキル})_2$, $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}\text{アルキル}$, $-SO_2N(R^v)R^w$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}\text{アルキル}$, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}\text{アルキル}$ から成る群から選択される];

i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$, $>S$, $>NH$ または $>N(C_{1-4}\text{アルキル})$ に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、場合により R^u で一置換または二置換されていてもよい];

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]; および

i v) 4から8員の非芳香複素環式環 [前記環は、 O , S , $-N=$, $>NH$ および $>N(C_{1-4}\text{アルキル})$ から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が0, 1または2であり、二重結合の数が0, 1または2であり、カルボニルである炭素員数が0, 1または2であり、場合により1個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基 R^u の数が0から5であり、そしてqが0の場合には、前記環の結合点は炭素原子である]; から成る群から選択される環系であるが、但し

式(I)中、

(a) ALK がメチレン, エチレン, プロピレンまたはイソプロピレンであり、 CYC が $-H$ であり、 Ar がフェニルまたは一置換フェニルであり、mが2であり、nが1でありそしてAが $>NR^1$ の時には R^1 が $-C_{1-4}\text{アルキル}$ でもベンジルでもなく;

(b) qが0であり、 CYC がフェニルであり、 Ar がフェニルまたは3-クロロフェニルであり、mが2でありそしてnが1の時にはAが非置換 $-CH_2-$ ではなく; かつ

(c) qが0であり、 CYC が2-ピリジルであり、 Ar が2-ピリジルであり、mが2でありそしてnが1の時にはAが非置換 $-CH_2-$ ではない;

ことを条件とする}

で表される化合物、または該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物もしくは製薬学的に受け入れられる塩、エステルもしくはアミド。

【請求項2】

mが1でありそしてnが1である請求項1記載の化合物。

【請求項3】

mが1でありそしてnが2である請求項1記載の化合物。

【請求項4】

mが2でありそしてnが1である請求項1記載の化合物。

【請求項5】

mが2でありそしてnが2である請求項1記載の化合物。

【請求項6】

mが1でありそしてnが3である請求項1記載の化合物。

【請求項7】

mが3でありそしてnが1である請求項1記載の化合物。

【請求項8】

式(II)中のnが1である請求項1記載の化合物。

【請求項9】

式(II)中のnが2である請求項1記載の化合物。

【請求項10】

qが1である請求項1記載の化合物。

【請求項11】

$-N(R^a)R^b$ がアミノ, メチルアミノ, エチルアミノ, イソプロピルアミノ, ジメチルアミノ, ジエチルアミノ, ジイソプロピルアミノ, シクロプロピルアミノ, シクロペンチルアミノ, ピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペ

ラジニルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 2】

- N (R^a) R^b がアミノ , メチルアミノ , ジメチルアミノまたは N - メチルピペラジニルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

A が > N R¹ である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 4】

R¹ が水素 , メチル , エチル , イソプロピル , ブチル , ヘキシル , シクロプロピル , シクロブチル , シクロペンチルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、各々が R[°] により一置換、二置換または三置換されていてもよい請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 5】

R[°] により置換されていてもよい R¹ が水素 , メチル , エチル , イソプロピルおよびベンジルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 6】

R¹ が水素またはメチルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 7】

置換されていてもよい R³ がメチル , エチル , プロピル , イソプロピル , ブチル , メチレン , アリルおよびベンジルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 8】

2 個の R³ 置換基が一緒になってエチレンを形成している請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 9】

R³ がメチルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 0】

r が 0 , 1 または 2 である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 1】

置換されていてもよい A r が

a) フェニル , 5 - , 6 - , 7 - , 8 - ベンゾ - 1 , 4 - ジオキサニル , 4 - , 5 - , 6 - , 7 - ベンゾ - 1 , 3 - ジオキソリル , 4 - , 5 - , 6 - , 7 - インドリニル , 4 - , 5 - , 6 - , 7 - イソインドリニル , 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 , 5 , 6 もしくは 7 - イル , 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 4 , 5 , 6 もしくは 7 - イル ,

b) フラニル , オキサゾリル , イソオキサゾリル , 1 , 2 , 3 - オキサジアゾリル , 1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル , 1 , 2 , 5 - オキサジアゾリル , 1 , 3 , 4 - オキサジアゾリル , チオフェニル , チアゾリル , イソチアゾリル , ピロリル , イミダゾリル , ピラゾリル , 1 , 2 , 3 - トリアゾリル , 1 , 2 , 4 - トリアゾリル ,

c) ピリジニル , ピリジニル - N - オキサイド , ピラジニル , ピリミジニル , ピリダジニル , および

d) ビフェニルおよび 4 - テトラゾリルフェニル

から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 2】

置換されていてもよい A r がフェニル , ピリジル , チオフェン - 2 - イルおよびチオフェン - 3 - イルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 3】

A r がフェニル , 2 - メトキシフェニル , 3 - メトキシフェニル , 4 - メトキシフェニル , 2 - メチルフェニル , 3 - メチルフェニル , 4 - メチルフェニル , 4 - エチルフェニル , 2 - クロロフェニル , 3 - クロロフェニル , 4 - クロロフェニル , 2 - フルオロフェニル , 3 - フルオロフェニル , 4 - フルオロフェニル , 2 - ブロモフェニル , 3 - ブロモフェニル , 4 - ブロモフェニル , 2 - トリフルオロメチルフェニル , 3 - トリフルオロメチルフェニル , 4 - トリフルオロメチルフェニル , 3 - トリフルオロメトキシフェニル , 4 - トリフルオロメトキシフェニル , 3 - シアノフェニル , 4 - シアノフェニル , 3 - ア

セチルフェニル， 4 - アセチルフェニル， 3， 4 - ジフルオロフェニル， 3， 4 - ジクロロフェニル， 2， 3 - ジフルオロフェニル， 2， 3 - ジクロロフェニル， 2， 4 - ジフルオロフェニル， 2， 4 - ジクロロフェニル， 3 - ニトロフェニル， 4 - ニトロフェニル， 3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル， 3 - フルオロ - 4 - クロロフェニル， ベンゾ [1， 3] ジオキソール - 4 もしくは 5 - イル， 3 - ヒドロキシフェニル， 4 - ヒドロキシフェニル， 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルフェニル， 4 - ヒドロキシ - 3 - フルオロフェニル， 3， 4 - ジヒドロキシフェニル， 4 - ジメチルアミノフェニル， 4 - カルバモイルフェニル， 4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル， 2 - フェノキシフェニル， フラン - 2 - イル， フラン - 3 - イル， 5 - メチル - フラン - 2 - イル， チオフエン - 2 - イル， チオフエン - 3 - イル， 5 - クロロチオフエン - 2 - イル， 5 - メチルチオフエン - 2 - イル， 5 - クロロチオフエン - 3 - イル， 5 - メチルチオフエン - 3 - イル， オキサゾール - 2 - イル， 4， 5 - ジメチル - オキサゾール - 2 - イル， チアゾール - 2 - イル， 3 H - [1， 2， 3] トリアゾール - 4 - イル， 2 H - ピラゾール - 3 - イル， 1 H - ピラゾール - 4 - イル， 4 - ピリジル， 5 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル， 4' - クロロピフェニルおよび 4 - テトラゾリルフェニルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 4】

場合により置換されていてもよい A L K がメチレン， エチレン， プロピレン， ブチレン， s - ブチレン， t - ブチレン， ペンチレン， 1 - エチルプロピレン， 2 - エチルプロピレン， 2 - エチルブチレン， イソプロピレン， ブト - 3 - エニレン， イソブチレン， 3 - メチルブチレン， アリレン， プロボ - 2 - イニレン， シクロプロピレン， シクロブチレン， シクロペンチレン， シクロヘキシレンおよびシクロヘブチレンから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 5】

A L K がメチレン， ヒドロキシメチレン， フルオロメチレン， ジフルオロメチレン， トリフルオロメチルメチレン， 2， 2， 2 - トリフルオロ - 1 - トリフルオロメチル - エチレン， メトキシカルボニルメチル， メチルカルバモイルメチル， エチレン， 2 - ジメチルアミノエチレン， 2 - シアノエチレン， 2 - メトキシエチレン， 1 - カルボキシ - エチレン， プロピレン， 3 - メトキシカルボニルプロピレン， 3 - カルボキシプロピレン， イソプロピレン， 1 - フルオロ - 1 - メチル - エチレン， 1 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチレン， 1 - カルボキシ - 1 - メチル - エチレン， 1 - エチルプロピレン， 2 - エチルプロピレン， ブチレン， t - ブチレン， s - ブチレン， イソブチレン， 4 - ヒドロキシブチレン， 4 - メトキシカルボニルブチレン， 4 - カルボキシブチレン， 2 - エチルブチレン， イソブチレン， 3 - メチルブチレン， プロボ - 2 - イニレン， ブト - 3 - エニレン， ペンチレン， 5 - ヒドロキシペンチレン， シクロプロピレン， シクロブチレン， シクロペンチレン， シクロペンテニレン， 3， 3 - ジフルオロシクロペンチレン， 3 - ヒドロキシ - シクロヘキシレン， 4 - フルオロシクロヘキシレン， 4， 4 - ジフルオロシクロヘキシレンおよび 1 - メチル - シクロプロピレンから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 6】

置換されていてもよい C Y C が水素であるか或は下記：

- i) フェニル， 5 - ， 6 - ， 7 - ， 8 - ベンゾ - 1， 4 - ジオキサンニル， 4 - ， 5 - ， 6 - ， 7 - ベンゾ - 1， 3 - ジオキソリル， 4 - ， 5 - ， 6 - ， 7 - インドリニル， 4 - ， 5 - ， 6 - ， 7 - イソインドリニル， 1， 2， 3， 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4， 5， 6 もしくは 7 - イル， 1， 2， 3， 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 4， 5， 6 もしくは 7 - イル，
- i i) フラニル， オキサゾリル， イソオキサゾリル， 1， 2， 3 - オキサジアゾリル， 1， 2， 4 - オキサジアゾリル， 1， 2， 5 - オキサジアゾリル， 1， 3， 4 - オキサジアゾリル， チオフエニル， チアゾリル， イソチアゾリル， ピロリル， イミダゾリル， ピラゾリル， 1， 2， 3 - トリアゾリル， 1， 2， 4 - トリアゾリル，
- i i i) ピリジニル， ピリジニル - N - オキサイド， ピラジニル， プリミジニル， プリダジニルおよび

i v) ピロリニル, ピロリジニル, ピラゾリニル, ピペリジニル, ホモピペリジニル, アゼパニル, テトラヒドロフラニル, テトラヒドロピラニル, ピペラジニル, モルホリニル, チオモルホリニルおよびピペリジノニル、

から成る群から選択される環系である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 27】

置換されていてもよい C Y C が水素, フェニル, チオフェン - 2 - イル, チオフェン - 3 - イル, フラン - 2 - イル, フラン - 3 - イル, ピリジニル, ピペリジン - 1, 2, 3 もしくは 4 - イル, 2 - ピロリン - 2, 3, 4 もしくは 5 - イル, 3 - ピロリン - 2 もしくは 3 - イル, 2 - ピラゾリン - 3, 4 もしくは 5 - イル, テトラヒドロフラン - 3 - イル, テトラヒドロピラン - 4 - イル, モルホリン - 2, 3 もしくは 4 - イル, チオモルホリン - 2, 3 もしくは 4 - イル, ピペラジン - 1, 2, 3 もしくは 4 - イル, ピロリジン - 1, 2 もしくは 3 - イルおよびホモピペリジニルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 28】

置換されていてもよい C Y C が水素, フェニル, ピリジル, チオフェン - 2 - イル, チオフェン - 3 - イル, テトラヒドロピラニル, フラン - 2 - イル, フラン - 3 - イル, テトラヒドロフラン - 3 - イルおよびピペリジニルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 29】

C Y C が水素, フェニル, 2 - メトキシフェニル, 3 - メトキシフェニル, 4 - メトキシフェニル, 2 - メチルフェニル, 3 - メチルフェニル, 4 - メチルフェニル, 4 - エチルフェニル, 2 - クロロフェニル, 3 - クロロフェニル, 4 - クロロフェニル, 2 - フルオロフェニル, 3 - フルオロフェニル, 4 - フルオロフェニル, 2 - ブロモフェニル, 3 - ブロモフェニル, 4 - ブロモフェニル, 2 - トリフルオロメチルフェニル, 3 - トリフルオロメチルフェニル, 4 - トリフルオロメチルフェニル, 3 - トリフルオロメトキシフェニル, 4 - トリフルオロメトキシフェニル, 2 - シアノフェニル, 3 - シアノフェニル, 4 - シアノフェニル, 3 - アセチルフェニル, 4 - アセチルフェニル, 3, 4 - ジフルオロフェニル, 3, 4 - ジクロロフェニル, 2, 3 - ジフルオロフェニル, 2, 3 - ジクロロフェニル, 2, 4 - ジフルオロフェニル, 2, 4 - ジクロロフェニル, 2, 6 - ジフルオロフェニル, 2, 6 - ジクロロフェニル, 2, 6 - ジメチルフェニル, 2, 4, 6 - トリフルオロフェニル, 2, 4, 6 - トリクロロフェニル, 3, 4, 5 - トリメトキシフェニル, 4 - フルオロ - 3 - メチルフェニル, 3 - ニトロフェニル, 4 - ニトロフェニル, 4 - メチル - 3 - フルオロフェニル, 3, 4 - ジメチルフェニル, 4 - メトキシ - 3 - フルオロフェニル, 4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル, 3 - アミノフェニル, 4 - アミノフェニル, 4 - カルボメトキシフェニル, 3 - メタンスルホニルアミノ - フェニル, 4 - メタンスルホニルアミノ - フェニル, 3 - ジメタンスルホニルアミノ - フェニル, 4 - ジメタンスルホニルアミノ - フェニル, チオフェン - 2 - イル, チオフェン - 3 - イル, 5 - クロロチオフェン - 2 - イル, ベンゾ [1, 3] ジオキソール - 4 もしくは 5 - イル, テトラヒドロフラン - 3 - イル, テトラヒドロピラン - 2, 3 もしくは 4 - イル, フラン - 2 - イル, フラン - 3 - イル, 5 - カルボキシエチル - フラン - 2 - イル, ピペリジニル, 3, 4 - ビスベンジルオキシフェニル, 2 - ヒドロキシフェニル, 3 - ヒドロキシフェニル, 4 - ヒドロキシフェニル, 4 - ヒドロキシ - 2 - メチルフェニル, 4 - ヒドロキシ - 3 - フルオロフェニル, 3, 4 - ジヒドロキシフェニル, 1 - ピペリジニル, 4 - ピペリジニルおよび 1 - メチル - 4 - ピペリジニルから成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 30】

2 - t - プチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - ピリド [4, 3 - d] ピリミジン;
2 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - ピリド [4, 3 - d] ピリミジン;

2 - s - ブチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

2 - s - ブチル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

2 - シクロブチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

2 - シクロブチル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - シクロプロピル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - (3 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 - メチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - [2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 6 - メチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - ベンゾニトリル ;

4 - [2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - ベンゾニトリル ;

2 - シクロペンチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - シクロペンチル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - シクロペンチル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (2 - シクロペンチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル) - ベンゾニトリル ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 6 - メチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

4 - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン 塩酸塩 ;

4 - (3 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (2 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - イソプロピル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
4 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソプロピル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソプロピル - 4 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソプロピル - 4 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソプロピル - 4 - (2 - フェノキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソブチル - 4 - チオフェン - 3 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソブチル - 4 - チオフェン - 2 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソブチル - 4 - ピリジン - 4 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - イソブチル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
4 - (4 - フルオロ - 3 - メチル - フェニル) - 2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
4 - (2 - イソブチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル) - ベンゾニトリル ;
2 - イソブチル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - s - ブチル - 4 - (2 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン塩酸塩 ;
2 - s - ブチル - 4 - (3 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - s - ブチル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - s - ブチル - 4 - (4 - トリフルオロメトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
2 - シクロペンチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;
2 - シクロペンチル - 4 - p - トリル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;
2 - シクロペンチル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;
4 - (2 - シクロペンチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン - 4 - イル) - ベンゾニトリル ;
4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン塩酸塩 ;
4 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;
2 - メチル - 4 - フェニル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

4 - (3 - クロロ - フェニル) - 2 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - ベンジル - 4 - p - トリル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - シクロペンチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 7 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - シクロペンチル - 7 - メチル - 4 - p - トリル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - シクロペンチル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 7 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - ベンジル - 7 - メチル - 4 - p - トリル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 7 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 7 - メチル - 9 - メチレン - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - d] アゼピン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - c] アゼピン塩酸塩 ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - c] アゼピン塩酸塩 ;

2 - イソプロピル - 4 - p - トリル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - c] アゼピン塩酸塩 ;

2 - イソプロピル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - c] アゼピン ;

2 - イソプロピル - 4 - フェニル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリミド [4 , 5 - c] アゼピン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - 1 , 3 , 6 - トリアザ - ベンゾシクロヘブテン塩酸塩 ;

2 , 7 - ジベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン塩酸塩 ;

2 , 7 - ジベンジル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン ;

2 , 7 - ジベンジル - 4 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン ;

2 , 7 - ジベンジル - 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン ;

7 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン ;

7 - ベンジル - 2 - イソプロピル - 4 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン ;

2 - ベンジル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン塩酸塩 ;

2 - ベンジル - 4 - p - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン塩酸塩 ;

[illegible]

2 - イソプロピル - 8 - メチル - 4 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド
 [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - イソプロピル - 8 - メチル - 4 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 5 , 6 ,
 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - イソプロピル - 8 - メチル - 4 - チオフェン - 3 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒ
 ドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピロロ
 [3 , 4 - d] ピリミジン塩酸塩 ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 7 - ピロリジン - 1 - イル - 5 ,
 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キナゾリン ;
 [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ
 - キナゾリン - 7 - イル] - メチル - アミン塩酸塩 ;
 [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ
 - キナゾリン - 6 - イル] - メチル - アミン塩酸塩 ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ -
 キナゾリン - 7 - オール ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ -
 キナゾリン ;
 (2 - ベンジル - 6 - p - トリル - ピリミジン - 4 - イルメチル) - ジメチル - アミン ;
 2 - ベンジル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - 6 - p - トリル - ピ
 リミジン ;
 [6 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - ピリミジン - 4 - イルメチル]
 - メチル - アミン ;
 2 - (2 - ベンジル - 6 - p - トリル - ピリミジン - 4 - イル) - エチルアミン ;
 [2 - (4 - フルオロ - ベンジル) - 4 - p - トリル - ピリミジン - 5 - イルメチル] -
 ジメチル - アミン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリ
 ド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - (3 , 3 - ジフルオロシクロペンチル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6
 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イル) - 5 , 6 ,
 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (2 - ビペリジン - 1 - イル - エチル) - 5 , 6
 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - (1 - フルオロ - 1 - メチル - エチル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6
 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 , 6 , 12 - トリアザ - トリシ
 クロ [7 . 2 . 1 . 0^{2,7}] ドデカ - 2 , 4 , 6 - トリエン ;
 7 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 - イソプロピル - 4 , 6 , 13 - トリアザ - トリシ
 クロ [8 . 2 . 1 . 0^{3,8}] トリデカ - 3 , 5 , 7 - トリエン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (テトラヒドロ - ピラン - 4 - イル) - 5 , 6 ,
 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (テトラヒドロ - ピラン - 3 - イル) - 5 , 6 ,
 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (2 - メトキシ - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テ
 トラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 ,
 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - プロパン - 2 - オール ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (1 - メチル - 1 - フェニル - エチル) - 5 , 6
 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - シクロペント - 3 - エニル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

3 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - シクロヘキサノール ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - ビペリジン - 4 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (1 - メチル - ビペリジン - 4 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

[4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - フェニル - メタノール ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (フルオロ - フェニル - メチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - (ジフルオロフェニル - メチル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - フェニル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (3 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - o - トリル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

3 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - ベンゾニトリル ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - トリフルオロメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - (1 - メチル - シクロプロピル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - 2 - メチル - プロピオン酸 ;

2 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 2 - イル] - プロピオン酸 ;

2 - (4 - フルオロ - シクロヘキシル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - (4 , 4 - ジフルオロシクロヘキシル) - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - フェネチル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - フラン - 2 - イル - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - イソプロピル - 4 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - フラン - 3 - イル - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (5 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - イソプロピル - 4 - オキサゾール - 2 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

4 - (4 , 5 - ジメチル - オキサゾール - 2 - イル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;

2 - イソプロピル - 4 - チアゾール - 2 - イル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - イソプロピル - 4 - (3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 4 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - イソプロピル - 4 - (2 H - ピラゾール - 3 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 2 - イソプロピル - 4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 , 6 - ジイソプロピル 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 6 - エチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 6 - シクロプロピル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 6 - シクロブチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 6 - シクロペンチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ;
 6 - ブチル - 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン ; および
 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - イソプロピル - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [4 , 3 - d] ピリミジンのクエン酸塩 .
 から成る群から選択される化合物。

【請求項 3 1】

前記製薬学的に受け入れられる塩が有効なアミノ付加塩である請求項 1 記載の化合物。

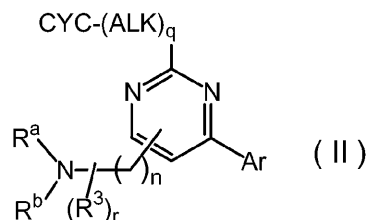
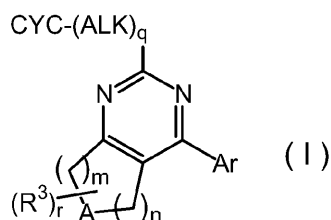
【請求項 3 2】

前記製薬学的に受け入れられる塩が臭化水素酸塩、塩酸塩、硫酸塩、重硫酸塩、硝酸塩、酢酸塩、しゅう酸塩、吉草酸塩、オレイン酸塩、パルミチン酸塩、ステアリン酸塩、ラウリン酸塩、ホウ酸塩、安息香酸塩、乳酸塩、燐酸塩、トシル酸塩、クエン酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、こはく酸塩、酒石酸塩、ナフチレート、メシル酸塩、グルコヘプトン酸塩、ラクチオピオネートおよびラウリルスルホン酸塩から成る群から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3 3】

製薬学的組成物であって、製薬学的に受け入れられる担体を含みかつ式 (I) または (I I) :

【化 2】



{ 式中、

m は、1 , 2 または 3 であり ;

n は、1 , 2 または 3 であり ;

ここで、m および n の両方が存在する場合、m + n は 2 に等しいか或はそれ以上から 4 に等しいかあるそれ以下であり ;

R^a および R^b は、独立して、- H , - C₁₋₇ アルキルまたは - C₃₋₇ シクロアルキルであるか、或は R^a と R^b が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モル

ホリニル，チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^a および R^b は各々独立して $-C_{1-4}$ アルキルにより置換されていてもよく；

q は、0 または 1 であり；

A は、 $>NR^1$ ， $>CHNR^cR^d$ ， $>CHOH$ または $-CH_2-$ であり、ここで、 R^1 は、 $-H$ ， $-C_{1-7}$ アルキル， $-C_{3-7}$ シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル，シクロアルキルまたはベンジルは各々 R^e により一置換、二置換または三置換されていてもよく；

R^e は、 $-C_{1-4}$ アルキル， $-C_{2-4}$ アルケニル， $-C_{2-4}$ アルキニル， $-C_{3-6}$ シクロアルキル，ハロ， $-CF_3$ ， $-OH$ ， $-OC_{1-4}$ アルキル， $-OCF_3$ ， $-N(R^f)R^g$ （ここで、 R^f および R^g は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は R^f と R^g が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル，ピロリジニル，モルホリニル，チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており）， $-C(O)N(R^f)R^g$ ， $-N(R^h)C(O)R^h$ ， $-N(R^h)SO_2C_{1-7}$ アルキル（ここで、 R^h は $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^h が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成しており）， $-S(O)_{0-2}-C_{1-4}$ アルキル， $-SO_2N(R^f)R^g$ ， $-SCF_3$ ， $-C(O)C_{1-4}$ アルキル， $-CN$ ， $-COOH$ および $-COOC_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され；

R^c および R^d は、独立して、 $-H$ ， $-C_{1-7}$ アルキル， $-C_{3-7}$ アルケニル， $-C_{3-7}$ アルキニル， $-C_{3-7}$ シクロアルキル， $-C_{1-7}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキルおよび $-C_{3-7}$ シクロアルキル C_{1-7} アルキルから成る群から選択されるか、或は R^c と R^d が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル，ピロリジニル，モルホリニル，チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^c および R^d は各々独立して R^e により置換されていてもよく；

R^3 は、各々が $-C_{1-3}$ アルキル， $-OH$ または ハロにより置換されていてもよい $-C_{1-4}$ アルキル， $-C_{1-4}$ アルケニルまたはベンジルであるか、或は 2 個の R^3 置換基と一緒にあって $-C_{1-3}$ アルキル， $-OH$ または ハロにより置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており；

r は、0 または $m+n+1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり；

A_r は、

a) フェニル [R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$ ， $-(CH_2)_{2-3}NH-$ ， $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$ ， $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$ ，または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル， $-C_{2-7}$ アルケニル， $-C_{2-7}$ アルキニル， $-C_{3-7}$ シクロアルキル，ハロ， $-CF_3$ ， $-OH$ ， $-OC_{1-7}$ アルキル， $-OCF_3$ ， $-OC_{3-7}$ アルケニル， $-OC_{3-7}$ アルキニル， $-N(R^j)R^k$ （ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである）， $-C(O)N(R^j)R^k$ ， $-N(R^j)C(O)R^k$ ， $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル， $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル， $-SO_2N(R^j)R^k$ ， $-SCF_3$ ， $-C(O)C_{1-6}$ アルキル， $-NO_2$ ， $-CN$ ， $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 5 個有し、炭素原子が結合点であり、1 個の炭素原子が $>O$ ， $>S$ ， $>NH$ または $>N(C_{1-4}アルキル)$ に置き換わっており、2 個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 6 個有し、炭素原子が結合点であり、1 または 2 個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル，フェノキシ，ピリジル，チオフェニル，オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に R^i で一置換、二置換または三置換され

ていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

A L K は、 $\underline{R^m}$ で一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン、 C_{2-7} アルケニレン、 C_{2-7} アルキニレン、 C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり；

R^m は、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OC_{1-7}$ アルキル、 $-OC_{3-7}$ シクロアルキル、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^p)R^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである)、 $-C(O)N(R^p)R^s$ 、 $-N(R^t)C(O)R^t$ 、 $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^t は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである)、 $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(R^p)R^s$ 、 $-SCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)C_{1-7}$ アルキル、 $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され；

C Y C は、 $-H$ であるか、或は

i) フェニル [$\underline{R^u}$ で一置換、二置換または三置換されていてもよい]、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}NH-$ 、 $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ アルキル) または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ アルキル) $(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-C_{1-7}$ アルキル、 $-C_{3-7}$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OC_{1-7}$ アルキル、 $-OC_{3-7}$ シクロアルキル、 $-O$ フェニル、 $-O$ ベンジル、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^v)R^w$ (ここで、 R^v および R^w は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して $-OH$ または $-C_{1-7}$ アルキルで置換されていてもよい)、 $-C(O)N(R^v)R^w$ 、 $-N(R^x)C(O)R^x$ 、 $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^x は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^x が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成している)、 $-N-(SO_2C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(R^v)R^w$ 、 $-SCF_3$ 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 5 個有し、炭素原子が結合点であり、1 個の炭素原子が $>O$ 、 $>S$ 、 $>NH$ または $>N(C_{1-4}$ アルキル) に置き換わっており、1 個以下の追加的炭素原子が場合により $-N=$ に置き換わっていてもよく、 $\underline{R^u}$ により一置換または二置換されていてもよい]；

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 6 個有し、炭素原子が結合点であり、1 または 2 個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 $\underline{R^u}$ により一置換または二置換されていてもよい]；および

i v) 4 から 8 員の非芳香複素環式環 [前記環は、 O 、 S 、 $-N=$ 、 $>NH$ および $>N(C_{1-4}$ アルキル) から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が 0、1 または 2 であり、二重結合の数が 0、1 または 2 であり、カルボニルである炭素員数が 0、1 または 2 であり、1 個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基 R^u の数が 0 から 5 であり、そして q が 0 の場合には、前記環の結合点は炭素原子である]；

から成る群から選択される環系であるが、但し

式 (I) 中、

(a) A L K がメチレン、エチレン、プロピレンまたはイソプロピレンであり、C Y C が $-H$ であり、A r がフェニルまたは一置換フェニルであり、 m が 2 であり、 n が 1 でありそして A が $>NR^1$ の時には R^1 が $-C_{1-4}$ アルキルでもベンジルでもなく；

(b) q が 0 であり、C Y C がフェニルであり、A r がフェニルまたは 3 - クロロフェニルであり、 m が 2 でありそして n が 1 の時には A が非置換 $-CH_2-$ ではなく；かつ

(c) q が 0 であり、C Y C が 2 - ピリジルであり、A r が 2 - ピリジルであり、 m が 2 でありそして n が 1 の時には A が非置換 $-CH_2-$ ではない；

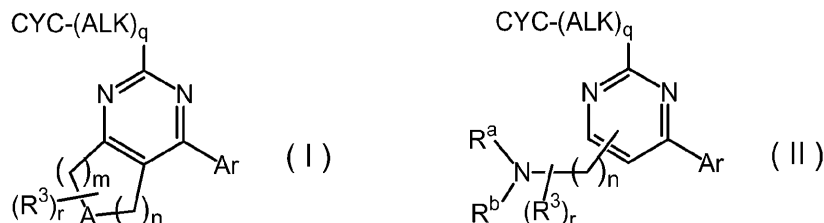
ことを条件とする}

で表される化合物ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも1種の化合物を治療的に有効な量で含有して成る製薬学的組成物。

【請求項34】

哺乳動物における睡眠障害、鬱／不安、全般性不安障害、統合失調症、双極性障害、精神異常、強迫障害、気分障害、心的外傷後ストレスおよび他のストレス関連障害、片頭痛、痛み、摂食障害、肥満、性的機能不全、代謝障害、ホルモンの失調、アルコール依存症、嗜癮障害、吐き気、炎症、中枢神経を介した高血圧、睡眠覚醒障害、時差ボケおよび日周期異常から成る群から選択されるCNS障害の治療または予防用の製薬学的製剤であって、式(I)または(II)：

【化3】



{ 式中、

mは、1, 2または3であり；

nは、1, 2または3であり；

ここで、mおよびnの両方が存在する場合、m + nは2に等しいか或はそれ以上から4に等しいかあるそれ以下であり；

R^aおよびR^bは、独立して、-H, -C₁₋₇アルキルまたは-C₃₋₇シクロアルキルであるか、或はR^aとR^bが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^aおよびR^bは各々独立して-C₁₋₄アルキルにより置換されていてもよく；

qは、0または1であり；

Aは、>NR¹, >CHNR^cR^d, >CHOHまたは-CH₂-であり、ここで、

R¹は、-H, -C₁₋₇アルキル, -C₃₋₇シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル, シクロアルキルまたはベンジルは各々R^eにより一置換、二置換または三置換されていてもよく；

R^eは、-C₁₋₄アルキル, -C₂₋₄アルケニル, -C₂₋₄アルキニル, -C₃₋₆シクロアルキル, ハロ, -CF₃, -OH, -OC₁₋₄アルキル, -OCF₃, -N(R^f)R^g(ここで、R^fおよびR^gは独立して-Hまたは-C₁₋₄アルキルであるか、或はR^fとR^gが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており), -C(O)N(R^f)R^g, -N(R^h)C(O)R^h, -N(R^h)SO₂C₁₋₇アルキル(ここで、R^hは-Hまたは-C₁₋₄アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個のR^hが結合しているアミドと一緒になってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成しており), -S(O)₀₋₂-C₁₋₄アルキル, -SO₂N(R^f)R^g, -SCF₃, -C(O)C₁₋₄アルキル, -CN, -COOHおよび-COOC₁₋₄アルキルから成る群から選択され；

R^cおよびR^dは、独立して、-H, -C₁₋₇アルキル, -C₃₋₇アルケニル, -C₃₋₇アルキニル, -C₃₋₇シクロアルキル, -C₁₋₇アルキルC₃₋₇シクロアルキルおよび-C₃₋₇シクロアルキルC₁₋₇アルキルから成る群から選択されるか、或はR^cとR^dが結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^cおよびR^dは各々独立してR^eにより置換されていてもよく；

R³は、各々が-C₁₋₃アルキル, -OHまたはハロにより置換されていてもよい-C₁₋₄アルキル, -C₁₋₄アルケニルまたはベンジルであるか、或は2個のR³置換基と一緒にな

って $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ または ハロ により置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており;

r は、0 または $m + n + 1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり;

Ar は、

a) フェニル $[R^i]$ で一置換、二置換または三置換されていてもよい、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ アルキル $)-$, または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ アルキル $)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{2-7}$ アルケニル, $-C_{2-7}$ アルキニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ アルケニル, $-OC_{3-7}$ アルキニル, $-N(R^j)R^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル, $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ アルキル, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される];

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 5 個有し、炭素原子が結合点であり、1 個の炭素原子が $>O$, $>S$, $>NH$ または $>N(C_{1-4}$ アルキル) に置き換わっており、2 個以下の追加炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい];

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 6 個有し、炭素原子が結合点であり、1 または 2 個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]; および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル, フェノキシ, ピリジル, チオフェニル, オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

ALK は、 R^m で一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン, C_{2-7} アルケニレン, C_{2-7} アルキニレン, C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり;

R^m は、ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^t は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ アルキル, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され;

CYC は、 $-H$ であるか、或は

i) フェニル $[R^u]$ により一置換、二置換または三置換されていてもよい、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ アルキル $)-$ または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ アルキル $)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, フェニル, ベンジル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-O$ フェニル, $-O$ ベンジル, $-OCF_3$, $-N(R^v)R^w$ (ここで、 R^v および R^w は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して $-OH$ または $-C_{1-7}$ アルキルで置換されていてもよい), $-C(O)N(R^v)R^w$, $-N(R^x)C(O)R^x$, $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^x は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^x が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成している), $-N-(SO_2C_{1-6}A$

ルキル)₂, -S(O)₀₋₂-C₁₋₆アルキル, -SO₂N(R^v)R^w, -SCF₃, -C(O)C₁₋₆アルキル, -NO₂, -CN, -COOHおよび-COOC₁₋₇アルキルから成る群から選択される];

i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が>O, >S, >NHまたは>N(C₁₋₄アルキル)に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が-N=に置き換わっていてもよく、R^uにより一置換または二置換されているもよい];

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が-N=に置き換わっており、R^uにより一置換または二置換されているもよい]; および

i v) 4から8員の非芳香複素環式環 [前記環は、O, S, -N=, >NHおよび>N(C₁₋₄アルキル)から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が0, 1または2であり、二重結合の数が0, 1または2であり、カルボニルである炭素員数が0, 1または2であり、1個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基R^uの数が0から5であり、そしてqが0の場合には、前記環の結合点は炭素原子である];

から成る群から選択される環系である}

で表される化合物、ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも1種の化合物を有効成分として含んで成る、上記製剤。

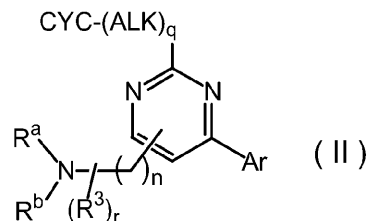
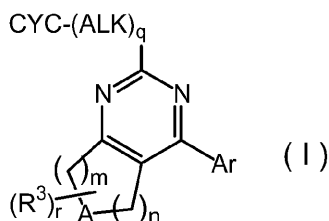
【請求項35】

CNS障害が鬱/不安、睡眠障害および日周期異常から成る群から選択される請求項34記載の製剤。

【請求項36】

哺乳動物における低血圧、抹消血管障害、心臓血管ショック、腎機能異常、胃運動性、下痢、痙攣性結腸、過敏性腸障害、虚血、敗血症性ショック、尿失禁、および胃腸および血管系に関連した他の障害から成る群から選択される病気または状態の治療または予防用の製薬学的製剤であって、式(I)または(II)：

【化4】



{式中、

mは、1, 2または3であり;

nは、1, 2または3であり;

ここで、mおよびnの両方が存在する場合、m+nは2に等しいか或はそれ以上から4に等しいかあるそれ以下であり;

R^aおよびR^bは、独立して、-H, -C₁₋₇アルキルまたは-C₃₋₇シクロアルキルであるか、或はR^aとR^bが結合している窒素と一緒になってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^aおよびR^bは各々独立して、-C₁₋₄アルキルにより置換されているもよく;

qは、0または1であり;

Aは、>NR¹, >CHNR^d, >CHOHまたは-CH₂-であり、ここで、

R¹は、-H, -C₁₋₇アルキル, -C₃₋₇シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル, シクロアルキルまたはベンジルは各々R^eにより一置換、二置換または三置換されているもよく;

R^eは、-C₁₋₄アルキル, -C₂₋₄アルケニル, -C₂₋₄アルキニル, -C₃₋₆シクロアル

キル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-4}$ アルキル, $-OCF_3$, $-N(R^f)R^g$ (ここで、 R^f および R^g は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は R^f と R^g が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており), $-C(O)N(R^f)R^g$, $-N(R^h)C(O)R^h$, $-N(R^h)SO_2C_{1-7}$ アルキル (ここで、 R^h は $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個の R^h が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成しており), $-S(O)_{0-2}-C_{1-4}$ アルキル, $-SO_2N(R^f)R^g$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-4}$ アルキル, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され;

R^c および R^d は、独立して、 $-H$, $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{3-7}$ アルケニル, $-C_{3-7}$ アルキニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, $-C_{1-7}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキルおよび $-C_{3-7}$ シクロアルキル C_{1-7} アルキルから成る群から選択されるか、或は R^c と R^d が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^c および R^d は各々独立して R^e により置換されていてもよく;

R^3 は、各々が $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ またはハロにより置換されていてもよい $-C_{1-4}$ アルキル, $-C_{1-4}$ アルケニルまたはベンジルであるか、或は2個の R^3 置換基と一緒にあって $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ またはハロにより置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており;

r は、0または $m+n+1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり;

Ar は、

a) フェニル [R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$, または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{2-7}$ アルケニル, $-C_{2-7}$ アルキニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ アルケニル, $-OC_{3-7}$ アルキニル, $-N(R^j)R^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル, $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ アルキル, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される];

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$, $>S$, $>NH$ または $>N(C_{1-4}アルキル)$ に置き換わっており、2個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい];

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]; および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル, フェノキシ, ピリジル, チオフェニル, オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

ALK は、 R^m により一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン, C_{2-7} アルケニレン, C_{2-7} アルキニレン, C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり;

R^m は、ハロ, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ アル

キル（ここで、 R^1 は - Hまたは - C_{1-7} アルキルである）、 $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(R^p)R^s$ 、 $-SCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)C_{1-7}$ アルキル、 $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され；

CYCは、- Hであるか、或は

i) フェニル [R^u により一置換、二置換または三置換されていてもよい、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}NH-$ 、 $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}$ アルキル)-または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}$ アルキル) $(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-C_{1-7}$ アルキル、 $-C_{3-7}$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OC_{1-7}$ アルキル、 $-OC_{3-7}$ シクロアルキル、 $-O$ フェニル、 $-O$ ベンジル、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^v)R^w$ （ここで、 R^v および R^w は独立して - Hまたは $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して $-OH$ または $-C_{1-7}$ アルキルにより置換されていてもよい）、 $-C(O)N(R^v)R^w$ 、 $-N(R^x)C(O)R^x$ 、 $-N(R^x)SO_2C_{1-6}$ アルキル（ここで、 R^x は - Hまたは $-C_{1-7}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個の R^x が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成している）、 $-N-(SO_2C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(R^v)R^w$ 、 $-SCF_3$ 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

ii) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$ 、 $>S$ 、 $>NH$ または $>N(C_{1-4}$ アルキル)に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]；

iii) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]；および

iv) 4から8員の非芳香複素環式環 [前記環は、 O 、 S 、 $-N=$ 、 $>NH$ および $>N(C_{1-4}$ アルキル)から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が0、1または2であり、二重結合の数が0、1または2であり、カルボニルである炭素員数が0、1または2であり、場合により1個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基 R^u の数が0から5であり、そしてqが0の場合には、前記環の結合点は炭素原子である]；

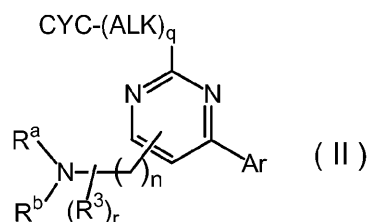
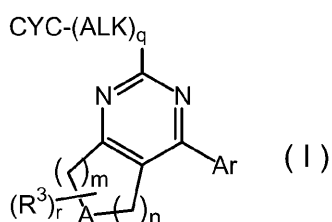
から成る群から選択される環系である}

で表される化合物ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも1種の化合物を有効成分として含んで成る、上記製剤。

【請求項37】

哺乳動物における緑内障、視神経炎、糖尿病性網膜症、網膜浮腫および加齢性黄斑変性症から成る群から選択される眼疾患の治療または予防用の製薬学的製剤であって、それに苦しんでいる哺乳動物に式(I)または(II)：

【化5】



{ 式中、

mは、1、2または3であり；

n は、1, 2 または 3 であり；

ここで、 m および n の両方が存在する場合、 $m + n$ は 2 に等しいか或はそれ以上から 4 に等しいかあるそれ以下であり；

R^a および R^b は、独立して、 $-H$ 、 $-C_{1-7}$ アルキルまたは $-C_{3-7}$ シクロアルキルであるか、或は R^a と R^b が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^a および R^b は各々独立して $-C_{1-4}$ アルキルにより置換されていてもよく；

q は、0 または 1 であり；

A は、 $>NR^1$ 、 $>CHNR^cR^d$ 、 $>CHOH$ または $-CH_2-$ であり、ここで、

R^1 は、 $-H$ 、 $-C_{1-7}$ アルキル、 $-C_{3-7}$ シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル、シクロアルキルまたはベンジルは各々 R^e により一置換、二置換または三置換されていてもよく；

R^e は、 $-C_{1-4}$ アルキル、 $-C_{2-4}$ アルケニル、 $-C_{2-4}$ アルキニル、 $-C_{3-6}$ シクロアルキル、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OC_{1-4}$ アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-N(R^f)R^g$ (ここで、 R^f および R^g は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は R^f と R^g が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており)、 $-C(O)N(R^f)R^g$ 、 $-N(R^h)C(O)R^h$ 、 $-N(R^h)SO_2C_{1-7}$ アルキル (ここで、 R^h は $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^h が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成しており)、 $-S(O)_{0-2}C_{1-4}$ アルキル、 $-SO_2N(R^f)R^g$ 、 $-SCF_3$ 、 $-C(O)C_{1-4}$ アルキル、 $-CN$ 、 $-COOH$ および $-COOC_{1-4}$ アルキルから成る群から選択され；

R^c および R^d は、独立して、 $-H$ 、 $-C_{1-7}$ アルキル、 $-C_{3-7}$ アルケニル、 $-C_{3-7}$ アルキニル、 $-C_{3-7}$ シクロアルキル、 $-C_{1-7}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキルおよび $-C_{3-7}$ シクロアルキル C_{1-7} アルキルから成る群から選択されるか、或は R^c と R^d が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^c および R^d は各々独立して R^e により置換されていてもよく；

R^3 は、各々が $-C_{1-3}$ アルキル、 $-OH$ またはハロにより置換されていてもよい $-C_{1-4}$ アルキル、 $-C_{1-4}$ アルケニルまたはベンジルであるか、或は 2 個の R^3 置換基が一緒にあって $-C_{1-3}$ アルキル、 $-OH$ またはハロにより置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており；

r は、0 または $m + n + 1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり；

A_r は、

a) フェニル [R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい] か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}NH-$ 、 $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$ 、 $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4} \text{ アルキル})-$ 、または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4} \text{ アルキル})(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル、 $-C_{2-7}$ アルケニル、 $-C_{2-7}$ アルキニル、 $-C_{3-7}$ シクロアルキル、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OH$ 、 $-OC_{1-7}$ アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-OC_{3-7}$ アルケニル、 $-OC_{3-7}$ アルキニル、 $-N(R^j)R^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである)、 $-C(O)N(R^j)R^k$ 、 $-N(R^j)C(O)R^k$ 、 $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-S(O)_{0-2}C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2N(R^j)R^k$ 、 $-SCF_3$ 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 5 個有し、炭素原子が結合点であり、1 個の炭素原子が $>O$ 、 $>S$ 、 $>NH$ または $>N(C_{1-4} \text{ アルキル})$ に置き換わっており、2 個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 6 個有し、炭素原子が結合点であり、1 または 2 個

の炭素原子が - N = に置き換わっており、Rⁱにより一置換または二置換されていてもよい] ; および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル , フェノキシ , ピリジル , チオフェニル , オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に Rⁱにより一置換、二置換または三置換されていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

A L K は、R^mにより一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C₁₋₇アルキレン、C₂₋₇アルケニレン、C₂₋₇アルキニレン、C₃₋₇シクロアルキレンもしくはC₃₋₇シクロアルケニレンであり；

R^mは、ハロ、- CF₃、- OH、- OC₁₋₇アルキル、- OC₃₋₇シクロアルキル、- OCF₃、- N(R^p)R^s(ここで、R^pおよびR^sは独立して-Hまたは-C₁₋₇アルキルである)、- C(O)N(R^p)R^s、- N(R^t)C(O)R^t、- N(R^t)SO₂C₁₋₆アルキル(ここで、R^tは-Hまたは-C₁₋₇アルキルである)、- S(O)₀₋₂-C₁₋₆アルキル、- SO₂N(R^p)R^s、- SCF₃、- CN、- NO₂、- C(O)C₁₋₇アルキル、- COOHおよび- COOC₁₋₇アルキルから成る群から選択され；

C Y C は、- Hであるか、或は

i) フェニル [R^uにより一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が - OC₁₋₄アルキレンO-、- (CH₂)₂₋₃NH-、- (CH₂)₁₋₂NH(CH₂)-、- (CH₂)₂₋₃N(C₁₋₄アルキル)-または- (CH₂)₁₋₂N(C₁₋₄アルキル)(CH₂)-で二置換されていてもよく、ここで、R^uは、- C₁₋₇アルキル、- C₃₋₇シクロアルキル、フェニル、ベンジル、ハロ、- CF₃、- OH、- OC₁₋₇アルキル、- OC₃₋₇シクロアルキル、- Oフェニル、- Oベンジル、- OCF₃、- N(R^v)R^w(ここで、R^vおよびR^wは独立して-Hまたは-C₁₋₇アルキルであるか、或はR^vとR^wが結合している窒素と一緒になってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^vおよびR^wは各々独立して-OHまたは-C₁₋₇アルキルにより置換されていてもよい)、- C(O)N(R^v)R^w、- N(R^x)C(O)R^x、- N(R^x)SO₂C₁₋₆アルキル(ここで、R^xは-Hまたは-C₁₋₇アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個のR^xが結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成している)、- N-(SO₂C₁₋₆アルキル)₂、- S(O)₀₋₂-C₁₋₆アルキル、- SO₂N(R^v)R^w、- SCF₃、- C(O)C₁₋₆アルキル、- NO₂、- CN、- COOHおよび- COOC₁₋₇アルキルから成る群から選択される]；

i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が > O、> S、> NHまたは> N(C₁₋₄アルキル)に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が - N = に置き換わっていてもよく、R^uにより一置換または二置換されていてもよい]；

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が - N = に置き換わっており、R^uにより一置換または二置換されていてもよい] ; および

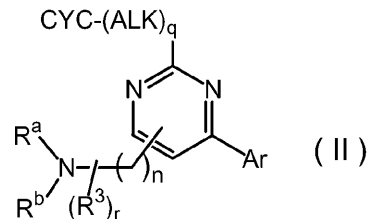
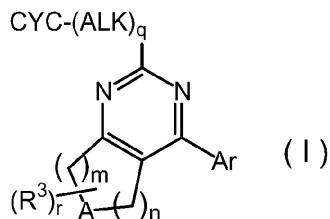
i v) 4から8員の非芳香複素環式環 [前記環は、O、S、- N =、> NHおよび> N(C₁₋₄アルキル)から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が0、1または2であり、二重結合の数が0、1または2であり、カルボニルである炭素員数が0、1または2であり、場合により1個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基R^uの数が0から5であり、そしてqが0の場合には、前記環の結合点は炭素原子である]；
から成る群から選択される環系である }

で表される化合物ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも1種の化合物を有効成分として含んで成る、上記製剤。

【請求項38】

哺乳動物における鬱／不安、睡眠覚醒障害、時差ボケ、片頭痛、尿失禁、胃運動性および過敏性腸障害から成る群から選択される病気または状態の治療または予防用の製薬学的製剤であって、式 (I) または (II) :

【化 6】



{ 式中、

m は、1, 2 または 3 であり；

n は、1, 2 または 3 であり；

ここで、m および n の両方が存在する場合、m + n は 2 に等しいか或はそれ以上から 4 に等しいかあるそれ以下であり；

R^a および R^b は、独立して、- H, - C₁₋₇ アルキルまたは - C₃₋₇ シクロアルキルであるか、或は R^a と R^b が結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^a および R^b は各々独立して - C₁₋₄ アルキルにより置換されていてもよく；

q は、0 または 1 であり；

A は、> NR¹, > CHNR^cR^d, > CHOH または - CH₂- であり、ここで、

R¹ は、- H, - C₁₋₇ アルキル, - C₃₋₇ シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル, シクロアルキルまたはベンジルは各々 R^eにより一置換、二置換または三置換されていてもよく；

R^e は、- C₁₋₄ アルキル, - C₂₋₄ アルケニル, - C₂₋₄ アルキニル, - C₃₋₆ シクロアルキル, ハロ, - CF₃, - OH, - OC₁₋₄ アルキル, - OCF₃, - N(R^f)R^g (ここで、R^f および R^g は独立して - H または - C₁₋₄ アルキルであるか、或は R^f と R^g が結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており), - C(O)N(R^f)R^g, - N(R^h)C(O)R^h, - N(R^h)SO₂C₁₋₇ アルキル (ここで、R^h は - H または - C₁₋₄ アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^h が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成しており), - S(O)₀₋₂-C₁₋₄ アルキル, - SO₂N(R^f)R^g, - SCF₃, - C(O)C₁₋₄ アルキル, - CN, - COOH および - COOC₁₋₄ アルキルから成る群から選択され；

R^c および R^d は、独立して、- H, - C₁₋₇ アルキル, - C₃₋₇ アルケニル, - C₃₋₇ アルキニル, - C₃₋₇ シクロアルキル, - C₁₋₇ アルキル C₃₋₇ シクロアルキルおよび - C₃₋₇ シクロアルキル C₁₋₇ アルキルから成る群から選択されるか、或は R^c と R^d が結合している窒素と一緒になってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^c および R^d は各々独立して R^eにより置換されていてもよく；

R³ は、各々 が - C₁₋₃ アルキル, - OH または ハロにより置換されていてもよい - C₁₋₄ アルキル, - C₁₋₄ アルケニルまたはベンジルであるか、或は 2 個の R³ 置換基が一緒になって - C₁₋₃ アルキル, - OH または ハロにより置換されていてもよい C₂₋₅ アルキレンを形成しており；

r は、0 または m + n + 1 に等しいか或はそれ以下の整数であり；

Ar は、

a) フェニル [Rⁱにより一置換、二置換または三置換されていてもよいか、或は隣接して位置する炭素が - OC₁₋₄ アルキレン O -, - (CH₂)₂₋₃ NH -, - (CH₂)₁₋₂ NH(CH₂) -, - (CH₂)₂₋₃ N(C₁₋₄ アルキル) -, または - (CH₂)₁₋₂ N(C₁₋

$_4$ アルキル) (CH_2) - で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-\text{C}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{C}_{2-7}$ アルケニル、 $-\text{C}_{2-7}$ アルキニル、 $-\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、ハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OC}_{3-7}$ アルケニル、 $-\text{OC}_{3-7}$ アルキニル、 $-\text{N}(\text{R}^j)\text{R}^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-\text{H}$ または $-\text{C}_{1-4}$ アルキルである)、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^j)\text{R}^k$ 、 $-\text{N}(\text{R}^j)\text{C}(\text{O})\text{R}^k$ 、 $-\text{N}(\text{R}^j)\text{SO}_2\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_{0-2}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^j)\text{R}^k$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ および $-\text{COOC}_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>\text{O}$ 、 $>\text{S}$ 、 $>\text{NH}$ または $>\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)に置き換わっており、2個以下の追加的炭素原子が $-\text{N}=\text{}$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-\text{N}=\text{}$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル、フェノキシ、ピリジル、チオフェニル、オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

ALKは、 R^m により一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン、 C_{2-7} アルケニレン、 C_{2-7} アルキニレン、 C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり；

R^m は、ハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{OC}_{3-7}$ シクロアルキル、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{N}(\text{R}^p)\text{R}^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-\text{H}$ または $-\text{C}_{1-7}$ アルキルである)、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^p)\text{R}^s$ 、 $-\text{N}(\text{R}^t)\text{C}(\text{O})\text{R}^t$ 、 $-\text{N}(\text{R}^t)\text{SO}_2\text{C}_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^t は $-\text{H}$ または $-\text{C}_{1-7}$ アルキルである)、 $-\text{S}(\text{O})_{0-2}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^p)\text{R}^s$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{COOH}$ および $-\text{COOC}_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され；

CYCは、 $-\text{H}$ であるか、或は

i) フェニル [R^u により一置換、二置換または三置換されていてもよいか、或は隣接して位置する炭素が $-\text{OC}_{1-4}$ アルキレン $\text{O}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_{2-3}\text{NH}-$ 、 $-(\text{CH}_2)_{1-2}\text{NH}(\text{CH}_2)-$ 、 $-(\text{CH}_2)_{2-3}\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)-または $-(\text{CH}_2)_{1-2}\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル) (CH_2) - で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-\text{C}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、ハロ、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}_{1-7}$ アルキル、 $-\text{OC}_{3-7}$ シクロアルキル、 $-\text{O}$ フェニル、 $-\text{O}$ ベンジル、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{N}(\text{R}^v)\text{R}^w$ (ここで、 R^v および R^w は独立して $-\text{H}$ または $-\text{C}_{1-7}$ アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して $-\text{OH}$ または $-\text{C}_{1-7}$ アルキルにより置換されていてもよい)、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^v)\text{R}^w$ 、 $-\text{N}(\text{R}^x)\text{C}(\text{O})\text{R}^x$ 、 $-\text{N}(\text{R}^x)\text{SO}_2\text{C}_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^x は $-\text{H}$ または $-\text{C}_{1-7}$ アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個の R^x が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成している)、 $-\text{N}-(\text{SO}_2\text{C}_{1-6}\text{アルキル})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_{0-2}-\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^v)\text{R}^w$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{COOH}$ および $-\text{COOC}_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

ii) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>\text{O}$ 、 $>\text{S}$ 、 $>\text{NH}$ または $>\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が $-\text{N}=\text{}$ に置き換わっていてもよく、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]；

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を 6 個有し、炭素原子が結合点であり、1 または 2 個の炭素原子が - N = に置き換わっており、R^uにより一置換または二置換されていてもよい] ; および

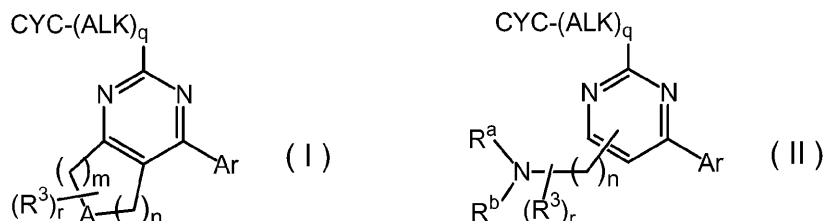
i v) 4 から 8 員の非芳香複素環式環 [前記環は、O, S, - N =, > N H および > N (C₁₋₄アルキル) から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員の数 0, 1 または 2 であり、二重結合の数 0, 1 または 2 であり、カルボニルである炭素員の数 0, 1 または 2 であり、場合により 1 個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基 R^u の数が 0 から 5 であり、そして q が 0 の場合には、前記環の結合点は炭素原子である] ; から成る群から選択される環系である }

で表される化合物ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも 1 種の化合物を有効成分として含んで成る、上記製剤。

【請求項 39】

哺乳動物における鬱 / 不安、全般性不安障害、統合失調症、双極性障害、精神異常、強迫障害、気分障害、心的外傷後ストレス、睡眠障害、性的機能不全、摂食障害、片頭痛、嗜癮障害および抹消血管障害から成る群から選択される病気または状態の治療または予防の製薬学的製剤であって、式 (I) または (II) :

【化 7】



{ 式中、

m は、1, 2 または 3 であり ;

n は、1, 2 または 3 であり ;

ここで、m および n の両方が存在する場合、m + n は 2 に等しいか或はそれ以上から 4 に等しいかあるそれ以下であり ;

R^a および R^b は、独立して、- H, - C₁₋₇アルキルまたは - C₃₋₇シクロアルキルであるか、或は R^a と R^b が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、R^a および R^b は各々独立して、- C₁₋₄アルキルにより置換されていてもよく ;

q は、0 または 1 であり ;

A は、> N R¹, > C H N R^c R^d, > C H O H または - C H₂ - であり、ここで、

R¹ は、- H, - C₁₋₇アルキル, - C₃₋₇シクロアルキルおよびベンジルから成る群から選択され、ここで、アルキル、シクロアルキルまたはベンジルは各々 R^eにより一置換、二置換または三置換されていてもよく ;

R^e は、- C₁₋₄アルキル, - C₂₋₄アルケニル, - C₂₋₄アルキニル, - C₃₋₆シクロアルキル, ハロ, - C F₃, - O H, - O C₁₋₄アルキル, - O C F₃, - N (R^f) R^g (ここで、R^f および R^g は独立して - H または - C₁₋₄アルキルであるか、或は R^f と R^g が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており), - C (O) N (R^f) R^g, - N (R^h) C (O) R^h, - N (R^h) S O₂ C₁₋₇アルキル (ここで、R^h は - H または - C₁₋₄アルキルであるか、或は同じ置換基内の 2 個の R^h が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の 4 員から 6 員環を形成しており), - S (O)₀₋₂ - C₁₋₄アルキル, - S O₂ N (R^f) R^g, - S C F₃, - C (O) C₁₋₄アルキル, - C N, - C O O H および - C O O C₁₋₄アルキルから成る群から選択され ;

R^c および R^d は、独立して、- H, - C₁₋₇アルキル, - C₃₋₇アルケニル, - C₃₋₇アル

キニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, $-C_{1-7}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキルおよび $-C_{3-7}$ シクロアルキル C_{1-7} アルキルから成る群から選択されるか、或は R^e と R^d が結合している窒素と一緒にあってピペリジニル, ピロリジニル, モルホリニル, チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^e および R^d は各々独立して R^e により置換されていてもよく；

R^3 は、各々が $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ またはハ口により置換されていてもよい $-C_{1-4}$ アルキル, $-C_{1-4}$ アルケニルまたはベンジルであるか、或は2個の R^3 置換基と一緒にあって $-C_{1-3}$ アルキル, $-OH$ またはハ口により置換されていてもよい C_{2-5} アルキレンを形成しており；

r は、0または $m+n+1$ に等しいか或はそれ以下の整数であり；

A_r は、

a) フェニル [R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$, または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^i は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{2-7}$ アルケニル, $-C_{2-7}$ アルキニル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, ハ口, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OCF_3$, $-OC_{3-7}$ アルケニル, $-OC_{3-7}$ アルキニル, $-N(R^j)R^k$ (ここで、 R^j および R^k は独立して $-H$ または $-C_{1-4}$ アルキルである), $-C(O)N(R^j)R^k$, $-N(R^j)C(O)R^k$, $-N(R^j)SO_2C_{1-6}$ アルキル, $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^j)R^k$, $-SCF_3$, $-C(O)C_{1-6}$ アルキル, $-NO_2$, $-CN$, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

b) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$, $>S$, $>NH$ または $>N(C_{1-4}アルキル)$ に置き換わっており、2個以下の追加的炭素原子が $-N=$ に置き換わっていてもよく、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；

c) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が $-N=$ に置き換わっており、 R^i により一置換または二置換されていてもよい]；および

d) フェニルまたはピリジル [フェニル, フェノキシ, ピリジル, チオフェニル, オキサゾリルおよびテトラゾリルから成る群から選択される置換基で置換されており、ここで、結果としてもたらされた置換された部分は、更に R^i により一置換、二置換または三置換されていてもよい]

から成る群から選択されるアリールもしくはヘテロアリール環であり、

ALK は、 R^m で一置換、二置換または三置換されていてもよい分枝もしくは非分枝の C_{1-7} アルキレン, C_{2-7} アルケニレン, C_{2-7} アルキニレン, C_{3-7} シクロアルキレンもしくは C_{3-7} シクロアルケニレンであり；

R^m は、ハ口, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-OCF_3$, $-N(R^p)R^s$ (ここで、 R^p および R^s は独立して $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-C(O)N(R^p)R^s$, $-N(R^t)C(O)R^t$, $-N(R^t)SO_2C_{1-6}$ アルキル (ここで、 R^t は $-H$ または $-C_{1-7}$ アルキルである), $-S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル, $-SO_2N(R^p)R^s$, $-SCF_3$, $-CN$, $-NO_2$, $-C(O)C_{1-7}$ アルキル, $-COOH$ および $-COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択され；

CYC は、 $-H$ であるか、或は

i) フェニル [R^u により一置換、二置換または三置換されていてもよい]か、或は隣接して位置する炭素が $-OC_{1-4}$ アルキレン $O-$, $-(CH_2)_{2-3}NH-$, $-(CH_2)_{1-2}NH(CH_2)-$, $-(CH_2)_{2-3}N(C_{1-4}アルキル)-$ または $-(CH_2)_{1-2}N(C_{1-4}アルキル)(CH_2)-$ で二置換されていてもよく、ここで、 R^u は、 $-C_{1-7}$ アルキル, $-C_{3-7}$ シクロアルキル, フェニル, ベンジル, ハ口, $-CF_3$, $-OH$, $-OC_{1-7}$ アルキル, $-OC_{3-7}$ シクロアルキル, $-O$ フェニル, $-O$ ベンジル, $-OCF_3$, $-N(R^v)$

） R^w （ここで、 R^v および R^w は独立して - Hまたは - C_{1-7} アルキルであるか、或は R^v と R^w が結合している窒素と一緒になってピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、チオモルホリニルまたはピペラジニルを形成しており、ここで、 R^v および R^w は各々独立して場合により - OHまたは - C_{1-7} アルキルで置換されていてもよい）、- $C(O)N(R^v)R^w$ 、- $N(R^x)C(O)R^x$ 、- $N(R^x)SO_2C_{1-6}$ アルキル（ここで、 R^x は - Hまたは - C_{1-7} アルキルであるか、或は同じ置換基内の2個の R^x が結合しているアミドと一緒にあってその他の点では脂肪族の4員から6員環を形成している）、- $N(SO_2C_{1-6}アルキル)_2$ 、- $S(O)_{0-2}-C_{1-6}$ アルキル、- $SO_2N(R^v)R^w$ 、- SCF_3 、- $C(O)C_{1-6}$ アルキル、- NO_2 、- CN 、- $COOH$ および- $COOC_{1-7}$ アルキルから成る群から選択される]；

i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を5個有し、炭素原子が結合点であり、1個の炭素原子が $>O$ 、 $>S$ 、 $>NH$ または $>N(C_{1-4}アルキル)$ に置き換わっており、1個以下の追加的炭素原子が- $N=$ に置き換わっていてもよく、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]；

i i i) 単環式芳香炭化水素基 [環原子を6個有し、炭素原子が結合点であり、1または2個の炭素原子が- $N=$ に置き換わっており、 R^u により一置換または二置換されていてもよい]；および

i v) 4から8員の非芳香複素環式環 [前記環は、 O 、 S 、- $N=$ 、 $>NH$ および $>N(C_{1-4}アルキル)$ から成る群から選択される非隣接ヘテロ原子員数が0、1または2であり、二重結合の数が0、1または2であり、カルボニルである炭素員数が0、1または2であり、1個の炭素員がブリッジを形成していてもよく、置換基 R^u の数が0から5であり、そしてqが0の場合には、前記環の結合点は炭素原子である]；

から成る群から選択される環系である]

で表される化合物ならびに該化合物の鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、溶媒和物および製薬学的に受け入れられる塩、エステルおよびアミドの中の少なくとも1種の化合物を有効成分として含んで成る、上記製剤。

【請求項40】

PETまたはSPECTで検出可能なように同位体標識が付けられている請求項1記載の化合物。

【請求項41】

セロトニン媒介障害を調べるための検査キットであって、 ^{18}F 標識もしくは ^{11}C 標識を付けておいた請求項1記載の化合物を陽電子放出断層撮影(PET)分子プローブとして含んで成る、上記キット。

【請求項42】

{2-[2-t-ブチル-6-(4-フルオロフェニル)-ピリミジン-4-イル]-エチル}-メチル-アミンおよび{2-[2-t-ブチル-6-(4-フルオロ-フェニル)-ピリミジン-4-イル]-エチル}-ジメチル-アミンから成る群から選択される化合物。

【請求項43】

4-(4-フルオロ-フェニル)-2-イソプロピル-5,6,7,8-テトラヒドロ-ピリド[4,3-d]ピリミジンまたはこれの製薬学的に受け入れられる塩である化合物。