

【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30年9月20日 (2018.9.20)

【公表番号】特表2017-524019(P2017-524019A)

【公表日】平成29年8月24日 (2017.8.24)

【年通号数】公開・登録公報2017-032

【出願番号】特願2017-508504(P2017-508504)

【国際特許分類】

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 249/08 5 3 7

A 6 1 K 31/4196

C 0 7 D 403/06 C S P

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/22

【手続補正書】

【提出日】平成30年8月13日 (2018.8.13)

【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

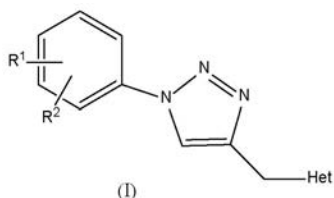
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

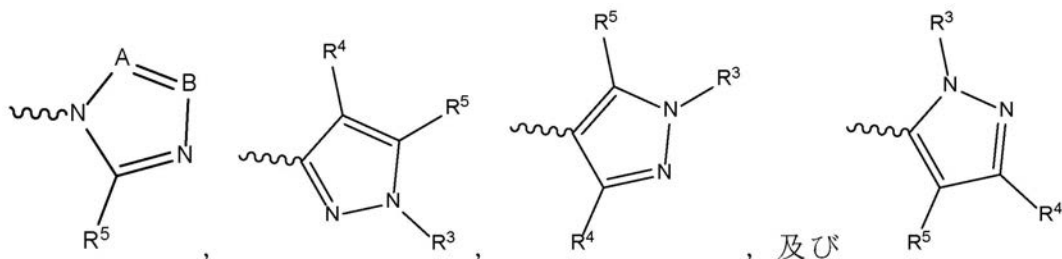
【化 1】



(式中、

H e t は、

【化 2】



から選択される複素環であり、

A 及び B は、各々独立に、N 又は C - R<sup>4</sup> から選択され、但し、A 及び B の少なくとも 1 つが C - R<sup>4</sup> であることを条件とし、

各 R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、独立に、水素；ハロゲン；直鎖状又は分枝状で、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> ~ 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> ~ 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 3 アルコキシ；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、- O - C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル；少なくとも 1 つのハロゲン原子で任意選択的に置換された、- S - C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル；少なくとも 1 つのハロゲン原子で任意選択的に置換された、- S O<sub>2</sub> - C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル；及び - S F<sub>5</sub> から選択され、あるいは

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は一緒になって、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、5 ~ 7 員の炭素環式化合物；あるいは、O、S 又は N から選択される 1 ~ 3 つのヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、5 ~ 7 員の複素環を形成し、

R<sup>3</sup> が、水素；ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> ~ 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 5 アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、- O - C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキルから選択され、かつ

各 R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> 基が、独立に、水素；アミノ；ハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> ~ 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 5 アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> ~ 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくと

も 1 つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 5$  アルコキシ；ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル；並びにヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、 $-O-C_3 \sim 6$  シクロアルキルから選択される) の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

【請求項 2】

$R^1$  及び  $R^2$  の少なくとも 1 つが水素ではない、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

【請求項 3】

$R^1$  及び  $R^2$  が水素ではない、請求項 2 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

【請求項 4】

$R^1$  及び  $R^2$  のいずれかが、フェニル環のメタ位又はパラ位にある、請求項 3 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

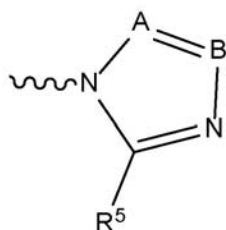
【請求項 5】

$R^1$  及び  $R^2$  の少なくとも 1 つが、F、Cl、Br、 $C_1 \sim 4$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、又は  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

【請求項 6】

Het が

【化 3】

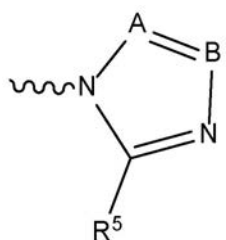


であり、A が、N 又は  $C - R^4$  であり；B が、 $C - R^4$  であり、かつ各  $R^4$  及び  $R^5$  基が、独立に、水素；アミノ；F、Cl；ハロゲン、ヒドロキシ、及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 3$  アルキル； $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ； $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル；並びに  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

【請求項 7】

Het が

【化 4】



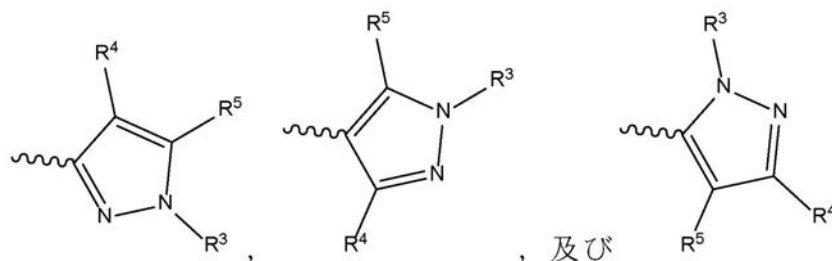
であり、A が、N 又は  $C - R^4$  であり；B が、 $C - R^4$  であり、かつ各 R は  $R^4$  及び  $R^5$  基が、独立に、水素；アミノ；F、Cl；ハロゲン、ヒドロキシ、及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ)

アルコキシから選択される少なくとも1つの基で任意選択的に置換された、 $C_{1-3}$  アルキル； $C_{1-3}$ （ハロ）アルコキシ； $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル；並びに  $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル -  $C_{1-3}$ （ハロ）アルキルから選択される、請求項3に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくはN - 酸化物。

【請求項8】

H e t が、

【化5】



から選択され、

各  $R^3$  は、独立に、水素；ハロゲン、ヒドロキシ、及び  $C_{1-3}$ （ハロ）アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_{1-3}$  アルキル； $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル；並びに  $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル -  $C_{1-3}$ （ハロ）アルキルから選択され、かつ

各  $R^4$  及び  $R^5$  基が、独立に、水素；アミノ；F、C l；ハロゲン、ヒドロキシ、及び  $C_{1-3}$ （ハロ）アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_{1-3}$  アルキル； $C_{1-3}$ （ハロ）アルコキシ； $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル及び  $C_{3-6}$ （ハロ）シクロアルキル -  $C_{1-3}$ （ハロ）アルキルから選択される、請求項1又は3に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくはN - 酸化物。

【請求項9】

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3, 5 - ジメチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - プロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - プロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - イソプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - エチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - エチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - イソプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - メチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - メチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3, 5 - ジシクロプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - シクロブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - シクロブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール；

[illegible]

[illegible]

[illegible]

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 ;  
 1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - ペンタフルオロ - スルファン - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - ペンタフルオロ - スルファン - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 及び  
 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。



## 【請求項 10】

4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3 - フルオロ - 5 - ジフルオロメチル - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3 - フルオロ - 4 - ジフルオロメチル - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - [4 - フルオロ - 3 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール; 及び

1 - (3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル) - 4 - (1 H - ピラゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

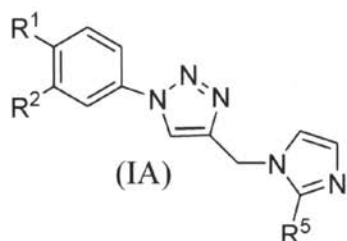
## 【請求項 11】

2 - (1 - ((1 - (4 - (ペンタフルオロ - 16 - スルファニル) フェニル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル)メチル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル)エタン - 1 - オールである、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 12】

式 (IA) :

## 【化 7】



で表される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 13】

1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (2 - プロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - (2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

4 - (2 - シクロブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール;

[illegible]

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - プロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - tert . ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - フルオロ - 3 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 及び

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロエチル ) - フェニル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 14】

1 - (4 - クロロ - 3 - メチル - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール;

1 - (3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール; 及び

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 15】

1 - (4 - クロロ - 3 - メチル - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 16】

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 17】

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 18】

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物

。

## 【請求項 19】

1 - (3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル) - 4 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

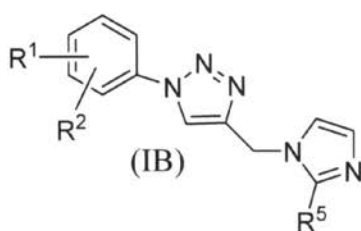
## 【請求項 20】

1 - (4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル) - 4 - (2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾールである、請求項 14 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 21】

式 (I B) :

## 【化 8】



で表される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

## 【請求項 2 2】

1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - プロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - クロロ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - ヒドロキシメチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 2 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - フルオロ - 2 - メトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - フルオロ - 2 - メトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - トリフルオロメトキシ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - シクロプロピル - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - メタンスルホニル - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - シクロプロピル - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 - ( 3 - メタンスルホニル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 - ( 3 - メタンスルホニル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - ペンタフルオロ - スルファン - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - フルオロ - 5 - ジフルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

[ 1 - [ [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) トリアゾール - 4 - イル ] メチル ] イミダゾール - 2 - イル ] - ( p - トリル ) メタノン ; 及び

2 - ( 1 - ( ( 1 - ( 4 - ( ペンタフルオロ - 16 - スルファニル ) フェニル ) - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) エタン - 1 - オール

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

#### 【請求項 2 3】

[ 1 - [ [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) トリアゾール - 4 - イル ] メチル ] イミダゾール - 2 - イル ] - ( p - トリル ) メタノン ; 及び

1 - [ [ 1 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) トリアゾール - 4 - イル ] メチル ] - 2 - メチル - ベンズイミダゾール

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

#### 【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項 2 5】

治療有効量の請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物、及び少なくとも 1 つの医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

#### 【請求項 2 6】

第 2 の活性成分を更に含む、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

#### 【請求項 2 7】

請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、

溶媒和物、多形体、若しくはN - 酸化物を含む、NMDA受容体の活動過多に関連する疾病、障害又は病気を治療するための医薬組成物。

【請求項28】

前記障害、疾病又は病気が、GluN2B受容体により媒介され、双極性障害、大鬱病性障害、治療抵抗性鬱病、産後鬱病、季節性感情障害、アルツハイマー病、パーキンソン病、ハンチントン舞蹈病、多発性硬化症、認知障害、頭部損傷、脊髄損傷、卒中、てんかん、ジスキネジア、筋萎縮性側索硬化症、細菌性若しくは慢性感染症に関連する神経変性、疼痛、糖尿病性神経障害、片頭痛、脳虚血、精神分裂症、脳炎、自閉症及び自閉症スペクトラム障害、記憶及び学習障害、強迫性障害、注意力欠陥活動過多障害(ADHD)、並びに中毒性疾患からなる群から選択される、請求項27に記載の医薬組成物。

【請求項29】

請求項1～23のいずれか一項に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、多形体、若しくはN - 酸化物を含む、GluN2B受容体により媒介される疾病、障害又は病気を治療するための医薬組成物。

【請求項30】

GluN2B受容体により媒介される前記障害、疾病又は病気が、治療抵抗性鬱病及び大鬱病性障害からなる群から選択される、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項31】

請求項1～23のいずれか一項に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、多形体、若しくはN - 酸化物を含み、それを必要とする患者における疾病、障害又は病気を治療するための医薬組成物。

【請求項32】

前記疾病又は障害が中枢神経系障害である、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項33】

前記疾病又は障害が神経若しくは精神障害である、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項34】

前記疾病又は障害が、(1)気分障害；(2)神経性、ストレス関連又は身体表現性障害；(3)心理的発育；(4)生理的攪乱及び身体的要因に関連する行動症候群；(5)錐体外路障害及び運動障害；(6)偶発性又は発作性；(7)疼痛；(8)神経変性形態、あるいは(9)脳血管疾患である、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項35】

前記神経性、ストレス関連又は身体表現性障害が、不安障害であり；前記偶発性又は発作性障害がてんかんであり；かつ前記脳血管疾患が急性脳血管疾患又は慢性脳血管疾患である、請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項36】

医薬の製造のための、請求項1～23のいずれか一項に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、多形体、若しくはN - 酸化物の使用。

【請求項37】

前記医薬が、NMDA受容体の活動過多に関連する疾病、障害又は病気を治療するためのものである、請求項36に記載の使用。

【請求項38】

前記医薬が、GluN2B受容体により媒介される疾病、障害又は病気を治療するためのものである、請求項36に記載の使用。

【請求項39】

GluN2B受容体により媒介される前記障害、疾病又は病気が、治療抵抗性鬱病及び大鬱病性障害からなる群から選択される、請求項38に記載の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0240

【補正方法】変更

## 【補正の内容】

## 【0240】

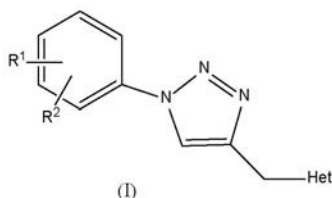
上述の明細書には本発明の原理が教示してあり、例証目的で本発明の特定の実施形態が述べられ、かつ例証目的で実施例が挙げてあるが、本発明の趣旨及び範囲から逸脱することなしに、下記の特許請求の範囲及びその等価物の範囲に入る様々な修正を施し得ることが理解されよう。

以下に、本願の当初の特許請求の範囲に記載された発明を付記する。

## [ 1 ]

式 ( I ) :

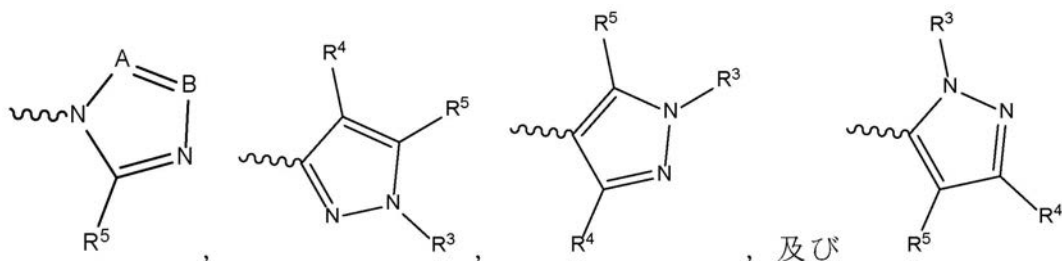
## 【化 1】



(式中、

H e t は、

## 【化 2】



から選択される複素環であり、

A 及び B は、各々独立に、N 又は C - R<sup>4</sup> から選択され、但し、A 及び B の少なくとも 1 つが C - R<sup>4</sup> であることを条件とし、

各 R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、独立に、水素；ハロゲン；直鎖状又は分枝状で、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> - 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> - 6 アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>3</sub> - 6 シクロアルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> - 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> - 3 アルコキシ；ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、- O - C<sub>3</sub> - 6 シクロアルキル；少なくとも 1 つのハロゲン原子で任意選択的に置換された、- S - C<sub>1</sub> - 3 アルキル；少なくとも 1 つのハロゲン原子で任意選択的に置換された、- S O<sub>2</sub> - C<sub>1</sub> - 3 アルキル；及び - S F<sub>5</sub> から選択され、あるいは

R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は一緒になって、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、5 ~ 7 員の炭素環式化合物；あるいは、O、S 又は N から選択される 1 ~ 3 つのヘテロ原子を含有し、ヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルキル及び C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、5 ~ 7 員の複素環を形成し、

R<sup>3</sup> が、水素；ハロゲン原子、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> - 3 (ハロ) アルコキシ及び C<sub>3</sub> - 6 (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換され



た、 $C_1 \sim 5$  アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $-O-C_3 \sim 6$  シクロアルキルから選択され、かつ

各  $R^4$  及び  $R^5$  基が、独立に、水素；アミノ；ハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ及び  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 5$  アルキル；ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ及び  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキルから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 5$  アルコキシ；ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル；並びにヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $-O-C_3 \sim 6$  シクロアルキル

から選択される) の化合物、又はそれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、若しくは N - 酸化物。

[ 2 ]

$R^1$  及び  $R^2$  の少なくとも1つが水素ではない、[ 1 ] に記載の化合物。

[ 3 ]

$R^1$  及び  $R^2$  が水素ではない、[ 2 ] に記載の化合物。

[ 4 ]

$R^1$  及び  $R^2$  のいずれかが、フェニル環のメタ位又はパラ位にある、[ 3 ] に記載の化合物。

[ 5 ]

$R^1$  及び  $R^2$  の少なくとも1つが、F、Cl、Br、 $C_1 \sim 4$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、又は  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシである、[ 1 ] に記載の化合物。

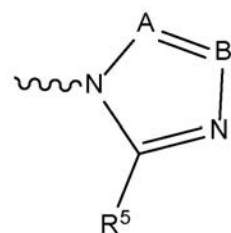
[ 6 ]

$R^1$  及び  $R^2$  の少なくとも1つが、F、Cl、Br、 $C_1 \sim 4$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ、 $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、 $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキル、又は  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシである、[ 2 ] に記載の化合物。

[ 7 ]

Het が

【化 3】



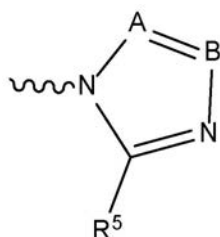
であり、A が、N 又は C -  $R^4$  であり；B が、C -  $R^4$  であり、かつ各  $R^4$  及び  $R^5$  基が、独立に、水素；アミノ；F 及び Cl から選択されるハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、及び  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシから選択される少なくとも1つの基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 3$  アルキル； $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルコキシ； $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル；並びに  $C_3 \sim 6$  (ハロ) シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$  (ハロ) アルキルから選択さ

れる、[ 1 ] に記載の化合物。

[ 8 ]

H e t が

【化 4】

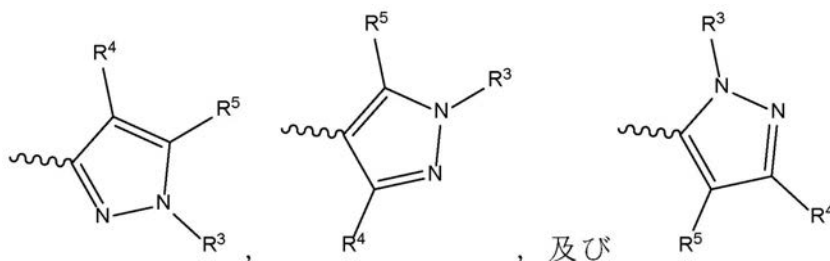


であり、A が、N 又は C - R<sup>4</sup> であり；B が、C - R<sup>4</sup> であり、かつ各 R は<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> 基が、独立に、水素；アミノ；F 及び C<sub>1</sub> から選択されるハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、及び C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシから選択される少なくとも 1 つの基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル；C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシ；C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル；並びに C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルキルから選択される、[ 3 ] に記載の化合物。

[ 9 ]

H e t が、

【化 5】



から選択され、

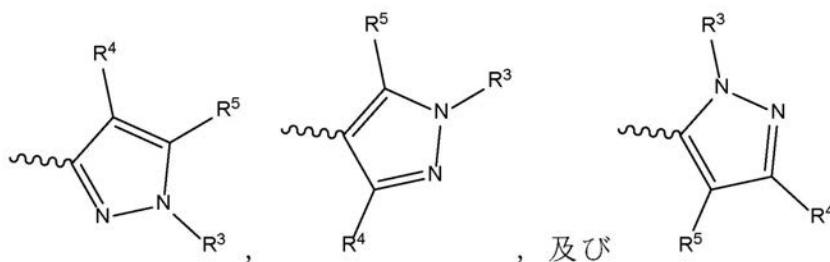
各 R<sup>3</sup> は、独立に、水素；ハロゲン、ヒドロキシ、及び / 又は C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル；C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル；並びに C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルキルから選択され、かつ

各 R<sup>4</sup> 及び R<sup>5</sup> 基が、独立に、水素；アミノ；F 及び C<sub>1</sub> から選択されるハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、及び C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル；C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシ；C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル及び C<sub>3</sub> ~ 6（ハロ）シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルキルから選択される、[ 1 ] に記載の化合物。

[ 10 ]

H e t が、

【化 6】



から選択され、

各 R<sup>3</sup> は、独立に、水素；ハロゲン、ヒドロキシ、及び / 又は C<sub>1</sub> ~ 3（ハロ）アルコキシから選択される少なくとも 1 つの置換基で任意選択的に置換された、C<sub>1</sub> ~ 3 アルキ

ル； $C_3 \sim 6$ （ハロ）シクロアルキル；並びに $C_3 \sim 6$ （ハロ）シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$ （ハロ）アルキルから選択され、かつ

各 $R^4$ 及び $R^5$ 基が、独立に、水素；アミノ；F及びClから選択されるハロゲン；ハロゲン、ヒドロキシ、及び $C_1 \sim 3$ （ハロ）アルコキシから選択される少なくとも1つの置換基で任意選択的に置換された、 $C_1 \sim 3$ アルキル； $C_1 \sim 3$ （ハロ）アルコキシ； $C_3 \sim 6$ （ハロ）シクロアルキル；並びに $C_3 \sim 6$ （ハロ）シクロアルキル -  $C_1 \sim 3$ （ハロ）アルキルから選択される、[3]に記載の化合物。

[11]

[1]に記載の化合物であって、

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3, 5 - ジメチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - プロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - プロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - イソプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - エチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - エチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - イソプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - メチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - メチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3, 5 - ジシクロプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - シクロブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - シクロブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - シクロプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - シクロペンチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - シクロペンチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - シクロプロピル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (3 - トリフルオロメチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (2 - プロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

4 - (5 - tert - ブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

4 - (3 - tert - ブチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - 1H - [1, 2, 3] トリアゾール；

1 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - (5 - シクロブチル - 3 - メチル - [1, 2, 4]

] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 3 - シクロブチル - 5 - メチル - [ 1 , 2 , 4  
 ] トリアゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 - イルメ  
 チル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル )  
 - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル )  
 - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - クロロ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル )  
 - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - フェニル )  
 - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - ヒドロキシメチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ -  
 フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イル  
 メチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ -  
 フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - 4 - ( 3 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 4  
 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメ  
 チル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1 - イルメ  
 チル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - プロピル - イミダゾール - 1 - イル  
 メチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル - イミダゾール - 1 -  
 イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 , 4 - ジクロ  
 ロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェ  
 ニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - tert - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 , 4 - ジク  
 ロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - シクロブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ  
 - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 - ( 3 ,  
 4 - ジクロロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 , 4 - ジクロロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ - エチル ) - イミダ  
 ザール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - エチル - イミダゾール - 1  
 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - プロピル - イミダゾール -  
 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - シクロプロピル - イミダゾ  
 ール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 2 - ブチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオ  
 ロ - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;  
 4 - ( 3 , 5 - ジメチル - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - フェ

[illegible]

[illegible]

ゾール - 1 - イルメチル) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - イソプロピル -  
イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキ  
シ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ  
- エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミ  
ダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメトキシ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロ  
キシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール

;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - イミダ  
ゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - ヒドロキ  
シ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 5 - フルオロ - フェニル ) - 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロ  
- エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - ( 2 -  
メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - [ 3 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - エチル ) - 4 - フルオロ - フェニル ] - 4 - [ 2 -  
( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - イミダゾール - 1 - イルメチル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ]  
トリアゾール ;

4 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - ペンタフルオロ - ス  
ルファン - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - ペンタ  
フルオロ - スルファン - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 2 - メチル - 2 H - ピラゾール  
- 3 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 及び

1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフルオロメトキシ - フェニル ) - 4 - ( 2 - アミノ - イミダ  
ゾール - 1 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 並びに

それらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は N - 酸化物からなる群から選択される  
、化合物。

[ 1 2 ]

[ 1 ] に記載の化合物であって、

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - フルオロ - 5 - ジフ  
ルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 3 - フルオロ - 4 - ジフ  
ルオロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - ( 4 - クロロ - 3 - ジフル  
オロメチル - フェニル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ;

4 - ( 2 - アミノ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 1 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( 1  
, 1 - ジフルオロエチル ) - フェニル ] - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 及び

1 - ( 3 - ジフルオロメチル - 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - ( 1 H - ピラゾール -  
3 - イルメチル ) - 1 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール ; 並びに

それらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は N - 酸化物からなる群から選択される  
、化合物。

[ 1 3 ]

[ 1 ] に記載の化合物であって、

[ 1 - [ [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) トリアゾール - 4 - イル ] メチル ] イミダゾー

ル - 2 - イル ] - ( p - トリル ) メタノン ;

1 - [ [ 1 - ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) トリアゾール - 4 - イル ] メチル ] - 2 -  
メチル - ベンズイミダゾール ; 及び

2 - ( 1 - ( ( 1 - ( 4 - ( ペンタフルオロ - 1 6 - スルファニル ) フェニル ) - 1 H  
- 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル ) メチル ) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) エ  
タン - 1 - オール ; 並びに

それらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は N - 酸化物からなる群から選択される  
、化合物。

[ 1 4 ]

治療有効量の [ 1 ] に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、  
若しくは N - 酸化物、及び少なくとも 1 つの医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成  
物。

[ 1 5 ]

第 2 の活性成分を更に含む、[ 1 4 ] に記載の医薬組成物。

[ 1 6 ]

治療有効量の [ 1 ] に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、  
多形体、若しくは N - 酸化物を必要とする患者に投与することを含む、NMDA 受容体の  
活動過多に関連する疾病、障害又は病気を治療する方法。

[ 1 7 ]

G 1 u N 2 B 受容体により媒介される前記障害、疾病又は病気が、双極性障害、大鬱病  
性障害、治療抵抗性鬱病、産後鬱病、季節性感情障害、アルツハイマー病、パーキンソン  
病、ハンチントン舞蹈病、多発性硬化症、認知障害、頭部損傷、脊髄損傷、卒中、てんか  
ん、ジスキネジア、筋萎縮性側索硬化症、細菌性若しくは慢性感染症に関連する神経変性  
、疼痛、糖尿病性神経障害、片頭痛、脳虚血、精神分裂症、脳炎、自閉症及び自閉症スペ  
クトラム障害、記憶及び学習障害、強迫性障害、注意力欠陥活動過多障害 ( ADHD ) 、  
並びに中毒性疾患からなる群から選択される、[ 1 6 ] に記載の方法。

[ 1 8 ]

治療有効量の [ 1 ] に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩、溶媒和物、  
多形体、若しくは N - 酸化物を必要とする患者に投与することを含む、G 1 u N 2 B 受容  
体により媒介される疾病、障害又は病気の治療方法。

[ 1 9 ]

G 1 u N 2 B 受容体により媒介される前記障害、疾病又は病気が、治療抵抗性鬱病及び  
大鬱病性障害からなる群から選択される、[ 1 8 ] に記載の方法。

[ 2 0 ]

前記患者に、治療有効量の [ 1 ] に記載の化合物、又はこれらの医薬的に許容される塩  
、溶媒和物、多形体、若しくは N - 酸化物を投与することを含む、それを必要とする患者  
における疾病、障害又は病気を治療する方法。

[ 2 1 ]

前記疾病又は障害が中枢神経系障害である、[ 2 0 ] に記載の方法。

[ 2 2 ]

前記疾病又は障害が神経若しくは精神障害である、[ 2 0 ] に記載の方法。

[ 2 3 ]

前記疾病又は障害が、( 1 ) 気分障害 ; ( 2 ) 神経性、ストレス関連又は身体表現性障  
害 ; ( 3 ) 心理的発育 ; ( 4 ) 生理的攪乱及び身体的要因に関連する行動症候群 ;

( 5 ) 錐体外路障害及び運動障害 ; ( 6 ) 偶発性又は発作性 ; ( 7 ) 疼痛 ; ( 8 ) 神経  
変性形態、あるいは ( 9 ) 脳血管疾患である、[ 2 0 ] に記載の方法。

[ 2 4 ]

前記神経性、ストレス関連又は身体表現性障害が、不安障害であり ; 前記偶発性又は発  
作性障害がてんかんであり ; かつ前記脳血管疾患が急性脳血管疾患又は慢性脳血管疾患で  
ある、[ 2 3 ] に記載の方法。



