

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年3月21日(2008.3.21)

【公表番号】特表2007-522200(P2007-522200A)

【公表日】平成19年8月9日(2007.8.9)

【年通号数】公開・登録公報2007-030

【出願番号】特願2006-552710(P2006-552710)

【国際特許分類】

A 61 K 45/06 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/44 (2006.01)

A 61 K 31/437 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

【F I】

A 61 K 45/06

A 61 K 31/496

A 61 K 31/44

A 61 K 31/437

A 61 P 25/24

A 61 P 25/20

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月31日(2008.1.31)

【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】

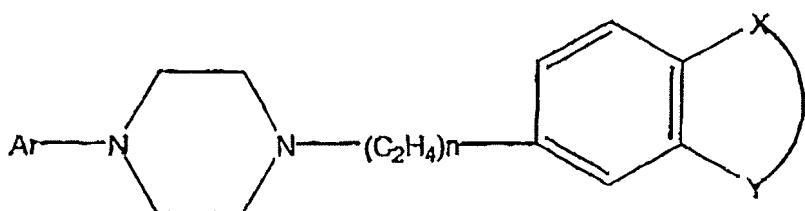
【請求項1】

(a) 非定型抗精神病薬、そのプロドラッグまたは非定型抗精神病薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩、(b) コルチコトロピン放出因子拮抗薬、そのプロドラッグ、または前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩、および場合により(c) 薬学的に許容できるビヒクル、担体または希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項2】

非定型抗精神病薬は、式Aによって表される化合物である請求項1に記載の組成物。

【化1】



A

[式中、Arは、ベンゾイソチアゾリルまたはそのオキシドもしくはジオキシドであり、各々は、1個のフルオロ、クロロ、トリフルオロメチル、メトキシ、シアノ、またはニ

トロによって場合により置換されており、

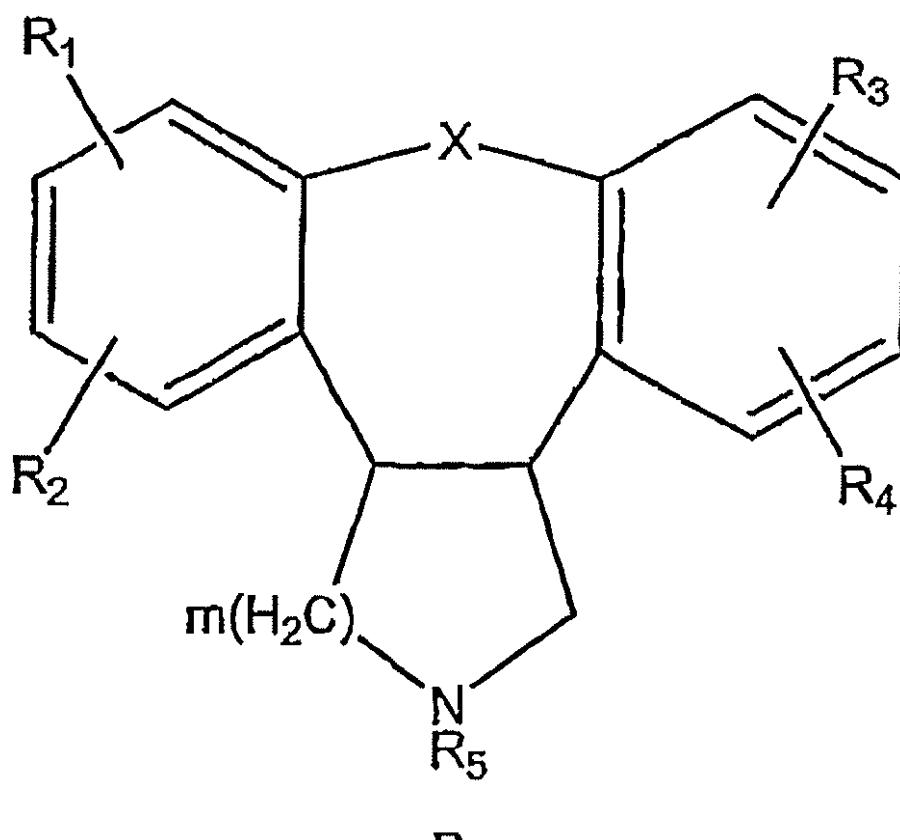
n は、1 または 2 であり、

X および Y は、それらが結合するフェニルと一緒に、ベンゾチアゾリル；2 - アミノベンゾチアゾリル；ベンゾイソチアゾリル；インダゾリル；2 - ヒドロキシンダゾリル；インドリル；1 ~ 3 個の (C_1 ~ C_3) アルキル、またはクロロ、フルオロもしくはフェニル(前記フェニルは、1 個のクロロまたはフルオロによって場合により置換されている)のうち 1 個によって場合により置換されているオキシインドリル；ベンゾオキサゾリル；2 - アミノベンゾオキサゾリル；ベンゾオキサゾロニル；2 - アミノベンゾオキサゾリニル；ベンゾチアゾロニル；ベンゾイミダゾロニル；またはベンゾトリアゾリルを形成する。】

【請求項 3】

非定型抗精神病薬は、式 B によって表される化合物、または薬学的に許容できるその塩である請求項 1 に記載の組成物。

【化 2】



[式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は各々、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_1 ~ C_6 アルキル基、アルキル基が 1 ~ 6 個の炭素原子を含むアルコキシもしくはアルキルチオ基、またはトリフルオロメチル基を表し、

R_5 は、水素、炭素原子が 1 ~ 6 個のアルキル基または炭素原子が 7 ~ 10 個のアラルキル基を表し、

m は、1 または 2 であり、

X は、酸素、イオウ、基 - $N(R_6)$ - または基 - CH_2 - を表し、

R_6 は、水素または C_1 ~ C_4 アルキル基を表す。】

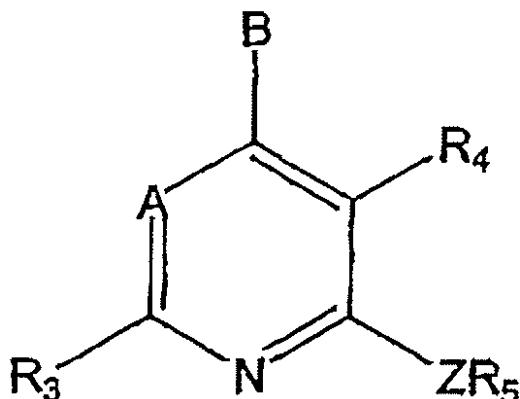
【請求項 4】

非定型抗精神病薬は、オランザピン、クロザピン、アリピプラゾール、クエチアピン、アミスルプリド、リスペリドン、セルチンドール、アセナピン、およびジプラシドンからなる群から選択される請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬は、下式の化合物である請求項 1 に記載の組成物。

【化 3】



[式中、

A は、C R₇ または N であり、

B は、N R₁ R₂、C R₁ R₂ R_{1~2}、C (= C R₂ R_{1~2}) R₁、N H C H R₁ R₂、O C H R₁ R₂、S C H R₁ R₂、C H R₂ O R_{1~2}、C H R₂ S R_{1~2}、C (S) R₂ または C (O) R₂ であり、

Z は、N H、O、S、N (C₁ ~ C₂ アルキル)、または C R_{1~3} R_{1~4} (R_{1~3} および R_{1~4} は、各々独立して、水素、トリフルオロメチル、または C₁ ~ C₄ アルキルであるか、あるいは R_{1~3} および R_{1~4} のうち 1 つは、シアノ、クロロ、ブロモ、ヨード、フルオロ、ヒドロキシ、O (C₁ ~ C₂ アルキル)、アミノ、N H (C₁ ~ C₂ アルキル) であってよく、あるいは C R_{1~3} R_{1~4} は、C = O またはシクロプロピルであってよい) であり、

R₁ は、ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C₁ ~ C₄ アルコキシ、O - C O - (C₁ ~ C₄ アルキル)、O - C O - N H (C₁ ~ C₄ アルキル)、O - C O - N (C₁ ~ C₄ アルキル) (C₁ ~ C₂ アルキル)、N H (C₁ ~ C₄ アルキル)、N (C₁ ~ C₂ アルキル) (C₁ ~ C₄ アルキル)、S (C₁ ~ C₄ アルキル)、N (C₁ ~ C₄ アルキル) C O (C₁ ~ C₄ アルキル)、N H C O (C₁ ~ C₄ アルキル)、C O O (C₁ ~ C₄ アルキル)、C O N H (C₁ ~ C₄ アルキル)、C O N (C₁ ~ C₄ アルキル) (C₁ ~ C₂ アルキル)、S (C₁ ~ C₄ アルキル)、C N、N O₂、S O (C₁ ~ C₄ アルキル)、S O₂ (C₁ ~ C₄ アルキル) からなる群から独立して選択される 1 個または 2 個の置換基 R₈ によって置換されていてもよい C₁ ~ C₆ アルキルであり、前記 C₁ ~ C₆ アルキルまたは C₁ ~ C₄ アルキルは、1 個の二重または三重結合を含んでいてもよい、

R₂ は、C₁ ~ C_{1~2} アルキル、アリールもしくは (C₁ ~ C₄ アルキレン) アリール (前記アリールは、フェニル、ナフチル、チエニル、ベンゾチエニル、ピリジル、キノリル、ピラジニル、ピリミジル、イミダゾリル、フラニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、イソチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、インドリル、またはベンゾオキサゾリルである)；3 ~ 8 員シクロアルキルもしくは (C₁ ~ C₆ アルキレン) シクロアルキル (前記シクロアルキルは、O、S または N - R₉ (R₉ は、水素または C₁ ~ C₄ アルキルである) のうち 1 個または 2 個を含んでいてもよい) であり、上記で定義した R₂ は、クロロ、フルオロ、もしくは C₁ ~ C₄ アルキルのうち 1 ~ 3 個、またはブロモ、ヨード、C₁ ~ C₆ アルコキシ、O - C O - (C₁ ~ C₆ アルキル)、O - C O - N (C₁ ~ C₄ アルキル) (C₁ ~ C₂ アルキル)、S (C₁ ~ C₆ アルキル)、C N、N O₂、S O (C₁ ~ C₄ アルキル)、もしくは S O₂

(C₁ ~ C₄ アルキル) のうち 1 個によって独立して置換されていてもよく、前記 C₁ ~ C_{1~2} アルキルまたは C₁ ~ C₄ アルキレンは、1 個の二重または三重結合を含んでいてもよく、あるいは

N R₁ R₂ または C R₁ R₂ R_{1~1} は、1 個もしくは 2 個の二重結合または O もしくは S のうち 1 個もしくは 2 個を含んでいてもよい飽和 5 ~ 8 員炭素環式環を形成していてもよく、

R₃ は、メチル、エチル、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、メトキシ、O CF₃、メチルチオ、メチルスルホニル、CH₂OH または CH₂OCH₃ であり、

R₄ は、水素、C₁ ~ C₄ アルキル、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C₁ ~ C₄ アルコキシ、アミノ、ニトロ、NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、N (C₁ ~ C₄ アルキル) (C₁ ~ C₂ アルキル)、SO_n (C₁ ~ C₄ アルキル) (n は、0、1 または 2 である)、シアノ、ヒドロキシ、CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、CHO、または COO (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、前記 C₁ ~ C₄ アルキルは、1 個または 2 個の二重または三重結合を含んでいてもよく、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、NHCOCH₃、NH (C₁ ~ C₂ アルキル)、N (C₁ ~ C₂ アルキル)₂、COO (C₁ ~ C₄ アルキル)、CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₃ アルコキシ、C₁ ~ C₃ チオアルキル、フルオロ、クロロ、シアノまたはニトロのうち 1 個または 2 個によって置換されていてもよく、

R₅ は、フェニル、ナフチル、チエニル、ベンゾチエニル、ピリジル、キノリル、ピラジニル、ピリミジル、フラニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、またはインドリルであり、上記の基 R₅ のそれぞれは、フルオロ、クロロ、C₁ ~ C₆ アルキル、もしくは C₁ ~ C₆ アルコキシのうち 1 ~ 3 個、またはヒドロキシ、ヨード、ブロモ、ホルミル、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、アミノ、NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、N (C₁ ~ C₆) (C₁ ~ C₂ アルキル)、COOH、COO (C₁ ~ C₄ アルキル)、CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、SO₂NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、SO₂N (C₁ ~ C₄ アルキル) (C₁ ~ C₂ アルキル)、SO₂NH₂、NH SO₂ (C₁ ~ C₄ アルキル)、S (C₁ ~ C₆ アルキル)、もしくは SO₂ (C₁ ~ C₆ アルキル) のうち 1 個によって独立して置換されており、前記 C₁ ~ C₄ アルキルおよび C₁ ~ C₆ アルキルは、フルオロ、ヒドロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノまたはアセチルのうち 1 個または 2 個によって置換されていてもよく、

R₇ は、水素、C₁ ~ C₄ アルキル、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、ヒドロキシ、O (C₁ ~ C₄ アルキル)、C (O) (C₁ ~ C₄ アルキル)、または C (O) O (C₁ ~ C₄ アルキル) であり、C₁ ~ C₄ アルキル基は、1 個のヒドロキシ、クロロもしくはブロモ、または 1 ~ 3 個のフルオロで置換されていてもよく、

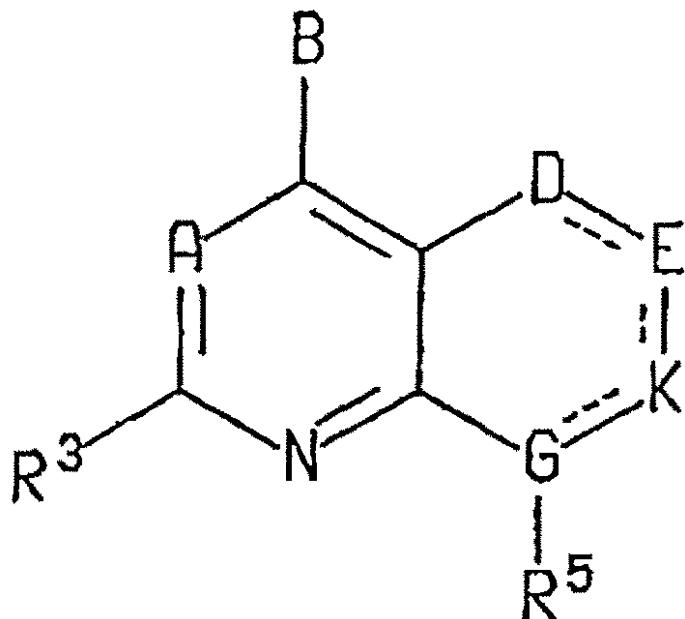
R_{1~1} は、水素、ヒドロキシ、フルオロ、またはメトキシであり、

R_{1~2} は、水素または C₁ ~ C₄ アルキルである。]

【請求項 6】

前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬は、下式の化合物である請求項 1 に記載の組成物。

【化4】



[式中、破線は、任意選択の二重結合を表し、

Aは、窒素またはCR⁷であり、

Bは、-NR¹R²、-CR¹R²R¹⁰、-C(=CR²R¹¹)R¹、-NHCR¹R²R¹⁰、-OCR¹R²R¹⁰、-SCR¹R²R¹⁰、-CR²R¹⁰NHR¹、-CR²R¹⁰OR¹、-CR²R¹⁰SR¹または-COR²であり、

Gは、窒素またはCR⁴であり、それが結合しているすべての原子と単結合しているか、あるいは、Gは、炭素であり、Kと二重結合しており、

Kは、GまたはEと二重結合している場合、窒素またはCR⁶であるか、あるいは、Kは、両方の隣接環原子と単結合している場合、酸素、イオウ、C=O、C=S、CR⁶R¹²またはNR⁸であるか、あるいは、Kは、2原子のスペーサー（スペーサーの2個の環原子のうち一方は、酸素、窒素、イオウ、C=O、C=S、CR⁶R¹²、NR⁶またはCR⁶であり、他方は、CR⁶R¹²またはCR⁹である）であり、

DおよびEは、両方の隣接環原子と単結合している場合、各々独立して、C=O、C=S、イオウ、酸素、CR⁴R⁶またはNR⁸であるか、あるいは、隣接環原子と二重結合している場合、窒素またはCR⁴であり、

D、E、KおよびGを含む6または7員環は、1～3個の二重結合、酸素、窒素およびイオウから選択される0～2個のヘテロ原子、ならびに0～2個のC=OまたはC=S基を含んでいてもよく、そのような基の炭素原子は、環の一部であり、酸素およびイオウ原子は、環上の置換基であり、

R¹は、ヒドロキシ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C₁～C₄アルコキシ、CF₃、-C(=O)(C₁～C₄アルキル)、-C(=O)-O-(C₁～C₄アルキル)、-OC(=O)(C₁～C₄アルキル)、-OC(=O)N(C₁～C₄アルキル)(C₁～C₂アルキル)、-NHCO(C₁～C₄アルキル)、-COOH、-COO(C₁～C₄アルキル)、-CONH(C₁～C₄アルキル)、-CON(C₁～C₄アルキル)(C₁～C₂アルキル)、-S(C₁～C₄アルキル)、-CN、-NO₂、-SO(C₁～C₄アルキル)、-SO₂(C₁～C₄アルキル)、-SO₂NH(C₁～C₄アルキル)および-SO₂N(C₁～C₄アルキル)(C₁～C₂アルキル)から独立して選択される1個または2個の置換基で場合により置換されているC₁～C₆アルキルであり、上記のR¹基におけるC₁～C₄アルキル基の各々は、1個または2個の二重または三重結合を場合により含んでいてもよく、

R²は、1～3個の二重または三重結合を場合により含んでいてもよいC₁～C₁₂アルキル、アリールもしくは(C₁～C₄アルキレン)アリール（前記アリールおよび前記

(C₁ ~ C₄ アルキレン)アリールのアリール部分は、フェニル、ナフチル、チエニル、ベンゾチエニル、ピリジル、キノリル、ピラジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、フラニル、ベンゾフラニル、ベンゾチアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピロリル、インドリル、ピロロピリジル、オキサゾリルおよびベンゾオキサゾリルから選択される); C₃ ~ C₈ シクロアルキルもしくは(C₁ ~ C₆ アルキレン)(C₃ ~ C₈ シクロアルキル)(前記シクロアルキルおよび前記(C₁ ~ C₆ アルキレン)(C₃ ~ C₈ シクロアルキル)の5 ~ 8員シクロアルキル部分の炭素原子のうち1個または2個は、酸素もしくはイオウ原子またはNZ(Zは、水素、C₁ ~ C₄ アルキルまたはベンジルである)によって場合によりかつ独立して置き換えられていてもよい)であり、上記のR²基の各々は、クロロ、フルオロ、ヒドロキシおよびC₁ ~ C₄ アルキルから独立して選択される1 ~ 3個の置換基、またはC₁ ~ C₆ アルコキシ、-OC(=O)(C₁ ~ C₆ アルキル)、-OC(=O)N(C₁ ~ C₄ アルキル)(C₁ ~ C₂ アルキル)、-S(C₁ ~ C₆ アルキル)、アミノ、-NH(C₁ ~ C₂ アルキル)、-N(C₁ ~ C₂ アルキル)(C₁ ~ C₄ アルキル)、-N(C₁ ~ C₄ アルキル)-CO-(C₁ ~ C₄ アルキル)、-NHCO(C₁ ~ C₄ アルキル)、-COOH、-COO(C₁ ~ C₄ アルキル)、-CONH(C₁ ~ C₄ アルキル)、-CON(C₁ ~ C₄ アルキル)(C₁ ~ C₂ アルキル)、-SH、-CN、-NO₂、-SO(C₁ ~ C₄ アルキル)、-SO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、-SO₂NH(C₁ ~ C₄ アルキル)および-SO₂N(C₁ ~ C₄ アルキル)(C₁ ~ C₂ アルキル)から選択される1個の置換基で場合により置換されていてもよく、

-NR¹R²またはCR¹R²R¹⁰は、飽和3 ~ 8員環から選択される環を形成していてもよく、その5 ~ 8員環は、1個または2個の二重結合を場合により含んでいてもよく、そのような5 ~ 8員環の環炭素原子のうち1個または2個は、酸素もしくはイオウ原子またはNZ²(Z²は、水素、ベンジルまたはC₁ ~ C₄ アルキルである)によって場合によりかつ独立して置き換えられていてもよく、

R³は、水素、C₁ ~ C₄ アルキル、-O(C₁ ~ C₄ アルキル)、クロロ、フルオロ、プロモ、ヨード、-S(C₁ ~ C₄ アルキル)または-SO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)であり、

各R⁸、R⁹およびR¹²は、水素およびC₁ ~ C₂ アルキルから独立して選択され、炭素原子と結合している各R⁴およびR⁶は、水素およびC₁ ~ C₆ アルキル、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、ヒドロキシ、ヒドロキシ(C₁ ~ C₂ アルキル)、トリフルオロメチル、シアノ、アミノ、ニトロ、-O(C₁ ~ C₄ アルキル)、-N(C₁ ~ C₄ アルキル)(C₁ ~ C₂ アルキル)、-CH₂SC₂H₃、-S(C₁ ~ C₄ アルキル)、-CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、-C(=O)Hまたは-C(=O)O(C₁ ~ C₄ アルキル)から独立して選択され、上記のR⁴およびR⁶基におけるC₁ ~ C₂ アルキル部分の各々は、1個の二重または三重結合を場合により含んでいてもよく、R⁶は、窒素原子と結合している場合、水素およびC₁ ~ C₄ アルキルから選択され、

R⁵は、置換フェニル、ナフチル、ピリジルまたはピリミジルであり、上記のR⁵基の各々は、2 ~ 4個の置換基R¹³(前記置換基のうち3個までは、クロロ、C₁ ~ C₆ アルキル、-O(C₁ ~ C₆ アルキル)および-(C₁ ~ C₆ アルキレン)O(C₁ ~ C₆ アルキル)から独立して選択されていてもよく、前記置換基のうち1個は、プロモ、ヨード、ホルミル、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、アミノ、-NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、-N(C₁ ~ C₂ アルキル)(C₁ ~ C₆ アルキル)、-C(=O)O(C₁ ~ C₄ アルキル)、-C(=O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、-COOH、-SO₂NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、-SO₂N(C₁ ~ C₂ アルキル)(C₁ ~ C₄ アルキル)、-SO₂NH₂、-NHSO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、-(C₀ ~ C₁ アルキレン)-S-(C₁ ~ C₂ アルキル)、-(C₀ ~ C₁ アルキレン)-SO-(C₁ ~ C₂ アルキル)、-(C₀ ~ C₁ アルキレン)-SO₂-(C₁ ~ C₂ アルキル)および-(C₁ ~ C₄ アルキレン)-OHから独立して選択されていてもよい)で置換されており、上記のR⁵基におけるC₁ ~ C₄ アルキルおよびC₁ ~ C₆ アルキル部分の各々は、フルオロ、ヒド

ロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノおよびアセチルから独立して選択される1個または2個の置換基で場合により置換されていてもよく、

R⁷は、水素、メチル、ハロ(例えば、クロロ、フルオロ、ヨードまたはブロモ)、ヒドロキシ、メトキシ、-C(=O)(C₁~C₂アルキル)、-C(=O)O(C₁~C₂アルキル)、ヒドロキシメチル、トリフルオロメチルまたはホルミルであり、

R¹⁰は、水素、ヒドロキシ、メトキシまたはフルオロであり、

R¹¹は、水素またはC₁~C₄アルキルであるが、

ただし、式IのD、E、KおよびGを含む環において、お互いに隣接する2個の二重結合が存在することはない。]

【請求項7】

前記CRF拮抗薬は、

4-(1-エチル-プロポキシ)-3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-ピリジン；

(3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-ピリジン-4-イル)-(1-エチル-プロピル)-アミン；

(3,6-ジメチル-2-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェノキシ)-ピリジン-4-イル)-(1-エチル-プロピル)-アミン；

5-(1-エチル-プロポキシ)-7-メチル-1-(2,6-ジメチル-4-クロロフェニル)-1-4-ジヒドロ-2H-3-オキサ-1,8-ジアザナフタレン；

ブチル-[2,5-ジメチル-7-(2,4,6-トリメチルフェニル)]-6,7-ジヒドロ-5H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン-4-イル]-エチル-アミノ；

4-(ブチル-エチルアミノ)-2,5-ジメチル-7-(2,4,6-トリメチルフェニル)-5,7-ジヒドロ-ピロロ[2,3-d]ピリミジン-6-オン；

4-(1-エチルプロポキシ)-2,5-ジメチル-6-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-ピリミジン；

N-ブチル-N-エチル-2,5-ジメチル-NN-(2,4,6-トリメチルフェニル)-ピリミジン-4,6-ジアミン；

[4-(1-エチル-プロポキシ)-3,6-ジメチル-ピリジン-2-イル]-(2,4,6-トリメチルフェニル)-アミン；

6-(エチル-プロピル-アミノ)-2,7-ジメチル-9-(2,4,6-トリメチルフェニル)-7,9-ジヒドロ-プリン-8-オン；

3-{(4-メチル-ベンジル)-[3,6-ジメチル-1-(2,4,6-トリメチルフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミノ}-プロパン-1-オール；

ジエチル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

2-{ブチル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミノ}-エタノール；

ジブチル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

ブチル-エチル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

ブチル-エチル-[6-メチル-3-メチルスルホニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

ブチル-シクロプロピルメチル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

ジ-1-プロピル-[6-メチル-3-メチルスルファニル-1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]-アミン；

ジアリル - [6 - メチル - 3 - メチルスルファニル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 ブチル - エチル - [6 - クロロ - 3 - メチルスルファニル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 ブチル - エチル - [6 - メトキシ - 3 - メチルスルファニル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 プロピル - エチル - [3 , 6 - ジメチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
 4 - (1 - エチル - プロピル) - 6 - メチル - 3 - メチルスルファニル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン ;
 n - ブチル - エチル - [2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 ジ - n - プロピル - [2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 エチル - n - プロピル - [2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 ジエチル - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 n - ブチル - エチル - [2 , 5 , 6 - トリメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 2 - { N - n - ブチル - N - [2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミノ } - エタノール ;
 4 - (1 - エチル - プロピル) - 2 , 5 , 6 - トリメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン ;
 n - ブチル - エチル - [2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] アミン ;
 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジル - 4 - イル] - (1 - エチル - プロピル) アミン ;
 ブチル - [3 , 6 - ジメチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - b] ピリジン - 4 - イル] - エチルアミン ;
 [3 , 6 - ジメチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 , b] ピリジン - 4 - イル] - (1 - メトキシメチルプロピル) - アミン ;
 4 - (1 - メトキシメチルプロポキシ) - 3 , 6 - ジメチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - b] ピリジン ;
 (1 - エチルプロピル) - [3 , 5 , 6 - トリメチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 1 H - ピラゾロ [3 , 4 - b] ピリジン - 4 - イル] - アミン ;
 4 - (1 - エチルプロポキシ) - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン ;
 4 - (1 - エチルプロポキシ) - 2 , 5 , 6 - トリメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン ;
 4 - (1 - エチルプロポキシ) - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモフェニル) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン ;
 2 , 5 , 6 - トリメチル - 7 - (1 - プロピルブチル) - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェノキシ) - 7 H - ピロロ [2 , 3 - d] ピリミジン ;
 1 - (1 - エチルプロピル) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルアミノ) - 1 , 3 - ジヒドロ - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - オン ;
 9 - (1 - エチルプロピル) - 2 - メチル - 6 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルアミノ) - 7 , 9 - ジヒドロ - ブリン - 8 - オン ;
 1 - (1 - エチルプロピル) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェノキシ) - 1 , 3 - ジヒドロ - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - オン ;

1 - (1 - エチルプロピル) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェノキシ) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン ;
 1 - (1 - エチルプロピル) - 3 , 6 - ジメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェノキシ) - 1 , 3 - ジヒドロ - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - オン ;
 1 - (1 - エチルプロピル) - 3 , 6 - ジメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチルフェニルアミノ) - 1 , 3 - ジヒドロ - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - オン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 4 , 7 - ジメチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 4 - b] ピラジン - 3 - オン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 4 , 7 - ジメチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 4 - b] ピラジン - 3 - オン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 4 , 7 - ジメチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - b] ピラジン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [3 , 4 - b] ピラジン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 2 - オキソ - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - [1 , 6] ナフチリジン - 3 - カルボン酸メチルエステル ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 2 - オキソ - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - [1 , 6] ナフチリジン - 3 - カルボン酸イソプロピルエステル ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 H - [1 , 6] ナフチリジン - 2 - オン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - [1 , 6] ナフチリジン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 7 - メチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 3 - オキサ - 1 , 6 - ジアザ - ナフタレン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 4 , 7 - ジメチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 3 - オキサ - 1 , 6 - ジアザ - ナフタレン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 3 , 7 - ジメチル - 5 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 H - 3 - オキサ - [1 , 6] - ナフチリジン - 2 - オン ;
 1 - (1 - エチル - プロピル) - 3 , 3 , 6 - トリメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェノキシ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [3 , 2 - c] ピリジン ;
 7 - (1 - エチル - プロポキシ) - 5 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 [2 , 5 - ジメチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イル] - (1 - エチル - プロピル) - アミン ;
 (1 - エチル - プロピル) - [5 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イル] - アミン ;
 7 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 , 5 - ジメチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ;
 [2 , 5 - ジメチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イル] - エチル - プロピル - アミン ;
 [6 - プロモ - 5 - プロモメチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル] - (1 - エチル - プロピル) - アミン ;
 (1 - エチル - プロピル) - [5 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル] - アミン ;
 [6 - プロモ - 5 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル] - (1 - エチル - プロピル)

- メチル - アミン ;
7 - (1 - エチル - プロポキシ) - 5 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 H - [1 , 2 , 3] トリアゾロ [4 , 5 - b] ピリジン ;
4 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
(±) - 2 , 5 - ジメチル - 4 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ) - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 H - ピロロ - [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 , 5 - ジメチル - 4 - (S) - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルオキシ) - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 H - ピロロ - [3 , 2 - d] ピリミジン ;
2 , 5 - ジメチル - 4 - (1 - プロピル - プトキシ) - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
4 - sec - ブチルスルファニル - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 H - ピロロ [3 , 2 - d] ピリミジン ;
4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 , 6 - ジメチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
4 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン - 4 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 1 , 6 - ジメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
(1 - エチル - プロピル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン - 4 - イル] - アミン ;
4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 , 6 - ジメチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - オン ;
4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - オン ;
(ブチル - エチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(プロピル - エチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(ジエチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(1 - エチル - プロピル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - プロモ - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン ;
4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フ

ニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - オン ;
4 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - オン ;
(ブチル - エチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(プロピル - エチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(ジエチル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(1 - エチル - プロピル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;
(1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
4 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - キノリン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン - 4 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 1 , 6 - ジメチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
(1 - エチル - プロピル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - ブロモ - フェニル) - キノリン - 4 - イル] - アミン ;
4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 , 6 - ジメチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 5 , 8 - ジヒドロ - 6H - ピリド [2 , 3 - d] ジピリミジン - 7 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
4 - (1 - エチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - キノリン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;
5 - (1 - エチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン - 4 - オン ;
8 - (1 - エチル - プロポキシ) - 1 , 6 - ジメチル - 4 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;
(1 - エチル - プロピル) - [2 - メチル - 8 - (2 , 6 - ジメチル - 4 - クロロ - フェニル) - キノリン - 4 - イル] - アミン ;
8 - (1 - ヒドロキシメチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン

;

8 - (1 - ヒドロキシメチル - プロピルアミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;

8 - (1 - エチル - プロピルアミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;

8 - ジエチルアミノ - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;

8 - (エチル - プロピル - アミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;

8 - (ブチル - エチル - アミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 1H - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 2 - オン ;

8 - (1 - ヒドロキシメチル - プロポキシ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;

8 - (1 - ヒドロキシメチル - プロピルアミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;

8 - (1 - エチル - プロピル - アミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;

8 - (ブチル - エチル - アミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ピリド [2 , 3 - b] ピラジン ;

4 - (1 - ヒドロキシメチル - プロポキシ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

4 - (1 - ヒドロキシメチル - プロピルアミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

4 - (1 - エチル - プロピルアミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

4 - (ジエチルアミノ - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

4 - (エチル - プロピル - アミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

4 - (ブチル - エチル - アミノ) - 2 - メチル - 8 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - キノリン ;

5 - (1 - ヒドロキシメチル - プロポキシ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;

5 - (1 - ヒドロキシメチル - プロピルアミノ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;

5 - (1 - エチル - プロピルアミノ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;

5 - (ジエチルアミノ - 5 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;

5 - (エチル - プロピル - アミノ) - 7 - メチル - 1 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フェニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;

8 - (ブチル - エチル - アミノ) - 6 - メチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリメチル - フエ

ニル) - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 3 - オキサ - 1 , 8 - ジアザ - ナフタレン ;
 4 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (1 - (メトキシメチル) - 1 - (ナフト - 2 - イル) メチル) - N - プロピルアミノ] チアゾール ;
 4 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - メトキシイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - メチルイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (1 - メトキシカルボニルメチルインドール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾール ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - メトキシイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - クロロイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - メトキシイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (1 - メトキシナフト - 2 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾール ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - メトキシイソキノール - 5 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールのシュウ酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (2 - エトキシナフト - 1 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (2 , 3 - ジメチルナフト - 1 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (6 - ブロモ - 2 - メトキシナフト - 1 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (2 , 6 - ジメチルナフト - 1 - イル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (1 - (メトキシメチル) - 1 - (ナフト - 2 - イル) メチル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 4 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 - メチル - 2 - [N - (1 - (シクロプロピル) - 1 - (ナフト - 2 - イル) メチル) - N - プロピルアミノ] チアゾールの塩酸塩 ;
 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 7 (N - プロピル - N - シクロプロパンメチルアミノ) - ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 7 - (N - アリル - N - シクロプロパンメチルアミノ) - ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 2 - メチルチオ - 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 7 - (N , N - ジアリルアミノ) - ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 2 - メチルチオ - 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 7 - (N - ブチル - N - シクロプロパンメチル - アミノ) ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 2 - メチルチオ - 3 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 5 - メチル - 7 - (N - プロピル - N - シクロプロパンメチル - アミノ) ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 2 - メチル - 3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 7 - (N , N - ジプロピルアミノ) - ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン ;
 3 - [6 - (ジメチルアミノ) - 3 - ピリジニル - 2 , 5 - ジメチル - N , N - ジプロピルピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン - 7 - アミン ;
 3 - [6 - (ジメチルアミノ) - 4 - メチル - 3 - ピリジニル] - 2 , 5 - ジメチル - N , N - ジプロピル - ピラゾロ [2 , 3 - a] ピリミジン - 7 - アミン ;
 3 - (2 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 , 5 - ジメチル - 7 - (N - プロピル - N -

メチルオキシエチルアミノ) - ピラゾロ(2,3-a)ピリミジン;
 7-(N-ジエチルアミノ)-2,5-ジメチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル-[1,5-a]-ピラゾロピリミジン;
 7-(N-(3-シアノプロピル)-N-プロピルアミノ-2,5,ジメチル-3-(2,4-ジメチルフェニル)-[1,5-a]-ピラゾロピリミジン;
 [3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチル-フェノキシ)-ピリジン-4-イル]- (1-エチル-プロピル)-アミン;
 [2-(4-クロロ-2,6-ジメチル-フェノキシ)-3,6-ジメチル-ピリジン-4-イル]- (1-エチル-プロピル)-アミン;
 シクロプロピルメチル-[3-(2,4-ジメチル-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-プロピル-アミン;
 シクロプロピルメチル-[3-(2-メチル-4-クロロ-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-プロピル-アミン;
 シクロプロピルメチル-[3-(2,4-ジ-クロロ-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-プロピル-アミン;
 [3-(2-メチル-4-クロロ-フェニル)-2,5-ジメチル-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]-ジ-プロピル-アミン;
 [2,5-ジメチル-3-(2,4-ジメチル-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]- (1-エチル-プロピル)-アミン;
 [2,5-ジメチル-3-(2,4-ジクロロ-フェニル)-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン-7-イル]- (1-エチル-プロピル)-アミン; および
 4-(1-エチル-プロピルアミノ)-6-メチル-2-(2,4,6-トリメチル-フェノキシ)-ニコチン酸メチルエステル
 からなる群から選択される請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

コルチコトロピン放出因子拮抗薬は、
 4-(1-エチル-プロボキシ)-3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-ピリジン;
 (3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチル-フェノキシ)-ピリジン-4-イル)- (1-エチル-プロピル)-アミン;
 (3,6-ジメチル-2-(4-クロロ-2,6-ジメチル-フェノキシ)-ピリジン-4-イル)- (1-エチル-プロピル)-アミン;
 および5-(1-エチル-プロボキシ)-7-メチル-1-(2,6-ジメチル-4-クロロフェニル)-1,4-ジヒドロ-2H-3-オキサ-1,8-ジアザナフタレンからなる群から選択される請求項7に記載の組成物。

【請求項9】

非定型抗精神病薬は、ジブラシドンおよびアセナピンからなる群から選択される請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

哺乳類において気分障害もしくは状態、精神病性障害もしくは状態、またはそれらの組合せを治療するための医薬組成物であって、(a)非定型抗精神病薬、そのプロドラッグまたは非定型抗精神病薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩、および(b)コルチコトロピン放出因子拮抗薬、そのプロドラッグ、または前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩を投与するための医薬組成物であり、(a)および(b)は各々、薬学的に許容できるビヒクル、担体または希釈剤とともに、場合により、独立して、投与するための医薬組成物。

【請求項11】

コルチコトロピン放出因子拮抗薬は、
 4-(1-エチル-プロボキシ)-3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-ピリジン;

(3,6-ジメチル-2-(2,4,6-トリメチル-フェノキシ)-ピリジン-4-イル)-(1-エチル-プロピル)-アミン；

(3,6-ジメチル-2-(4-クロロ-2,6-ジメチル-フェノキシ)-ピリジン-4-イル)-(1-エチル-プロピル)-アミン；

および5-(1-エチル-プロポキシ)-7-メチル-1-(2,6-ジメチル-4-クロロフェニル)-1-4-ジヒドロ-2H-3-オキサ-1,8-ジアザナフタレンからなる群から選択される請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

非定型抗精神病薬は、ジプラシドンおよびアセナピンからなる群から選択される請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

非定型抗精神病薬およびコルチコトロピン放出因子拮抗薬は、同時に、または具体的に時刻を決めて投与される請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項14】

哺乳類において気分障害もしくは状態、精神病性障害もしくは状態、またはそれらの組合せに伴う抑うつ性症状を治療するための医薬組成物であって、その症状が、抑うつ気分、いらいら感、季節性感情障害効果、および概日リズム変化からなる群から選択される、(a)非定型抗精神病薬、そのプロドラッグまたは非定型抗精神病薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩、および(b)コルチコトロピン放出因子拮抗薬、そのプロドラッグ、または前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩を投与するための医薬組成物であり、(a)および(b)は各々、薬学的に許容できるビヒクリル、担体または希釈剤とともに、場合により、独立して、投与するための医薬組成物。

【請求項15】

コルチコトロピン放出因子拮抗薬、そのプロドラッグ、または前記コルチコトロピン放出因子拮抗薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩を含有する医薬組成物、組成物が入っているパッケージ、およびパッケージと場合により一体となった添付文書を含み、添付文書には、その医薬組成物を、非定型抗精神病薬、そのプロドラッグ、または前記非定型抗精神病薬もしくはそのプロドラッグの薬学的に許容できる塩を含有する医薬組成物と共に同時に、または具体的に時刻を決めて哺乳類に投与しなければならないと記述されているキット。