

【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9月24日 (2009.9.24)

【公表番号】特表2009-504739(P2009-504739A)

【公表日】平成21年2月5日 (2009.2.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-005

【出願番号】特願2008-526995(P2008-526995)

【国際特許分類】

C 07 D 231/56 (2006.01)

A 61 K 31/416 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/20 (2006.01)

A 61 P 25/22 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/26 (2006.01)

A 61 P 25/34 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 231/56 C S P C

A 61 K 31/416

A 61 K 31/454

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/496

A 61 P 25/00 1 0 1

A 61 P 25/28

A 61 P 9/00

A 61 P 1/04

A 61 P 25/08

A 61 P 25/16

A 61 P 25/20

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 25/26

A 61 P 25/34

A 61 P 25/14

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月3日 (2009.8.3)

【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

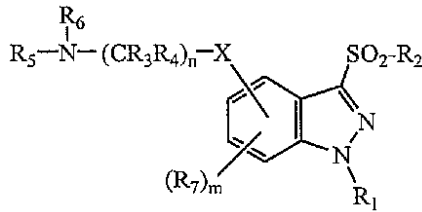
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



(I)

[ 式中、

X は、O、S、NR、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>Y、CH<sub>2</sub>Z、CO、CONR または NRCO であり、

Y は、O、S または NR であり、

Z は、CO であり、

X が CH<sub>2</sub> である場合、n は、0、または 1、2、3、4、5 もしくは 6 の整数であり、

X が、CH<sub>2</sub>Z、CO または NRCO である場合、n は、1、2、3、4、5 または 6 の整数であり、

X が、O、S、NR、CH<sub>2</sub>Y または CONR である場合、n は、2、3、4、5 または 6 の整数であり、

R は、H または置換されていてもよいアルキル基であり、

R<sub>1</sub> は、H、またはそれぞれ置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり、

R<sub>2</sub> は、置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基、または橋頭に N 原子を有し、N、O もしくは S から選択される 1、2 もしくは 3 個の追加のヘテロ原子を含有していてもよい置換されていてもよい 8 員から 13 員の二環系もしくは三環系であり、

R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は、それぞれ独立に、H または置換されていてもよいアルキル基であり、

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は、それぞれ独立に、H、またはそれぞれ置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であるか、R<sub>5</sub> と R<sub>6</sub> は、それらが結合している原子と一緒に、O、N または S から選択される追加のヘテロ原子を含有していてもよい置換されていてもよい 3 員から 7 員環を形成していてもよく、

R<sub>7</sub> は、ハロゲン、CN、OR<sub>8</sub>、CO<sub>2</sub>R<sub>9</sub>、CONR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>、またはそれぞれ置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり、

m は、0、1、2 または 3 の整数であり、

R<sub>8</sub> は、H、COR<sub>12</sub>、またはそれぞれ置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル、アリールもしくはヘテロアリール基であり、

R<sub>9</sub> は、H、またはそれぞれ置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、アリールもしくはヘテロアリール基であり、

R<sub>10</sub> および R<sub>11</sub> は、それぞれ独立に、H または置換されていてもよいアルキル基であり、

R<sub>12</sub> は、置換されていてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、シクロアルキル、シクロヘテロ

アルキル、アリールまたはヘテロアリール基である ]、またはその立体異性体もしくは薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2】

X が、O、NR または  $CH_2$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が O である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

n が 2 または 3 である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

$R_2$  が、置換されていてもよいアリールもしくはヘテロアリール基、または橋頭に N 原子を有し、N、O もしくは S から選択された 1、2 もしくは 3 個の追加のヘテロ原子を含有してもよい、置換されていてもよい 8 員から 13 員の二環系もしくは三環系である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

$R_2$  が、置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたはイミダゾチアゾリル基である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R_5$  および  $R_6$  が、それぞれ独立に、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

$R_2$  がナフチルであり、n が 3 である、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

N, N - ジメチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン ;  
 N - メチル - N - { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] エチル } アミン ;  
 N, N - ジメチル - N - { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] エチル } アミン ;  
 { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] エチル } アミン ;  
 N, N - ジメチル - N - { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] エチル } アミン ;  
 N - { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] エチル } シクロプロパンアミン ;  
 N, N - ジメチル - N - { 3 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] プロピル } アミン ;  
 N - { 3 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] プロピル } シクロプロパンアミン ;  
 { 3 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] プロピル } アミン ;  
 { 4 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] ブチル } アミン ;  
 N - メチル - N - { 2 - [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] エチル } アミン ;  
 N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] エタン - 1 , 2 - ジアミン ;  
 N, N - ジメチル - 2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン ;  
 3 - ( フェニルスルホニル ) - 5 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - イン

ダゾール；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

N , N - ジメチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) シクロペンタンアミン；

5 - ( 2 - モルホリン - 4 - イルエトキシ ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール；

N - エチル - N - メチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) ブタン - 1 - アミン；

N ~ 1 ~ - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] - アラニンアミド；

N - エチル - 2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) プロパン - 2 - アミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) プロパン - 2 - アミン；

N - エチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - メチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

3 - ( 2 - アミノエチル ) - 1 - [ ( 2 , 5 - ジメトキシフェニル ) スルホニル ] - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - オン；

N , N - ジエチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) シクロプロパンアミン；

1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

( 2 S ) - 3 - メチル - N ~ 1 ~ - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] ブタン - 1 , 2 - ジアミン；

( 2 - { [ 1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エチル ) アミン；

N - ( 2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) シクロペンタンアミン；

3 - ( フェニルスルホニル ) - 5 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

N - メチル - 2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - メチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール -

7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 1 - メチル - 3 - (フェニルスルホニル) - 7 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ)  
 - 1 H - インダゾール;  
 (2 - {[ 1 - (3 - クロロベンジル) - 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) メチルアミン;  
 (2 - {[ 1 - (3 - クロロベンジル) - 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) エチルアミン;  
 1 - (3 - クロロベンジル) - 3 - (フェニルスルホニル) - 7 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 1 - (3 - クロロベンジル) - 5 - メトキシ - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 7 - (2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 N - メチル - 2 - {[ 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 (2 - {[ 1 - (3 - クロロベンジル) - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) エチルアミン;  
 (2 - {[ 1 - (3 - クロロベンジル) - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) メチルアミン;  
 N - エチル - 2 - {[ 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 N, N - ジエチル - 2 - {[ 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 N - (2 - {[ 3 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) ブタン - 1 - アミン;  
 3 - (フェニルスルホニル) - 7 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 3 - (フェニルスルホニル) - 7 - (2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 N, N - ジエチル - 2 - {[ 1 - メチル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 1 - メチル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 7 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 N - エチル - 2 - {[ 1 - メチル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 7 - (2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 7 - (2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ) - 1 H - インダゾール;  
 N - エチル - 2 - {[ 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 (2 - {[ 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) アミン;  
 (2 - {[ 1 - (3 - クロロベンジル) - 5 - フルオロ - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル] オキシ} エチル) - ジメチルアミン;  
 (2 - {[ 1 - ベンジル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ} エチル) メチルアミン;  
 (2 - {[ 1 - ベンジル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ} エチル) ジメチルアミン;  
 (2 - {[ 1 - ベンジル - 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ} エチル) エチルアミン;  
 N - メチル - 2 - {[ 3 - (1 - ナフチルスルホニル) - 1 H - インダゾール - 7 - イル

〕オキシ〕エタンアミン；

N, N - ジメチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エタンアミン；

5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

N, N - ジエチル - 2 - { [ 5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エタンアミン；

( 2 - { [ 5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エチル ) ジメチルアミン；

N - エチル - 2 - { [ 5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エタンアミン；

( 2 - { [ 1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) - ジメチルアミン；

N - メチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

N - エチル - N - メチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 3 - ピペリジン - 1 - イルプロボキシ ) - 1 H - インダゾール；

N, N - ジメチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

N, N - ジエチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

N - ( 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } プロピル ) ブタン - 1 - アミン；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イルプロボキシ ) - 1 H - インダゾール；

( 2 - { [ 5 - メトキシ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エチル ) メチルアミン；

( 2 - { [ 5 - メトキシ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エチル ) ジメチルアミン；

5 - メトキシ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

5 - メトキシ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

( 2 - { [ 1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エチル ) エチルアミン；

( 3 - { [ 1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } プロピル ) - ジエチルアミン；

1 - ( 3 - クロロベンジル ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 7 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イルプロボキシ ) - 1 H - インダゾール；

N - メチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

N, N - ジエチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } プロパン - 1 - アミン；

N - メチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N, N - ジメチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - イン

ダゾール - 5 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 N - エチル - N - メチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H  
 - インダゾール - 5 - イル] オキシ} エタン - アミン;  
 N - エチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾ  
 ル - 5 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 N , N - ジエチル - 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - イン  
 ダゾール - 5 - イル] オキシ} エタンアミン;  
 N - ( 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5  
 - イル] オキシ} エチル) プロパン - 2 - アミン;  
 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール;  
 { 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] プロピル }  
 アミン;  
 ( 2 - { [ 1 - メチル - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イ  
 ル] オキシ} エチル) アミン;  
 N - エチル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル  
 ] オキシ} プロパン - 1 - アミン;  
 N - イソプロピル - 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5  
 - イル] オキシ} プロパン - 1 - アミン;  
 N - ( 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ  
 } プロピル) シクロペンタンアミン;  
 5 - ( 3 - モルホリン - 4 - イルプロボキシ ) - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H  
 - インダゾール;  
 N - ( 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ  
 } プロピル) シクロプロパンアミン;  
 ( 3 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ }  
 プロピル) アミン;  
 N - メチル - 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル  
 ] オキシ} ブタン - 1 - アミン  
 N , N - ジメチル - 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5  
 - イル] オキシ} ブタン - 1 - アミン;  
 N - エチル - 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル  
 ] オキシ} ブタン - 1 - アミン;  
 N , N - ジエチル - 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5  
 - イル] オキシ} ブタン - 1 - アミン;  
 N - メチル - 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル  
 ] オキシ} - N - プロピルブタン - 1 - アミン;  
 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 4 - ピロリジン - 1 - イルブトキシ ) - 1 H -  
 インダゾール;  
 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 4 - ピペリジン - 1 - イルブトキシ ) - 1 H -  
 インダゾール;  
 ( 4 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] オキシ }  
 ブチル) アミン;  
 ( 2 - { [ 5 - フルオロ - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 -  
 イル] オキシ} エチル) メチルアミン;  
 5 - [ ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル ] - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル )  
 - 1 H - インダゾール;  
 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( ピペラジン - 1 - イルメチル ) - 1 H - インダ  
 ザール;  
 N - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル] メチル } エ

タン - 1 , 2 - ジアミン ;  
 N - メチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ]  
 プロパン - 1 - アミン ;  
 N , N - ジメチル - 4 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 -  
 イル ] ブタン - 1 - アミン ;  
 N , N - ジメチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 -  
 イル ] プロパン - 1 - アミン ;  
 N - エチル - N - メチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール  
 - 5 - イル ] プロパン - 1 - アミン ;  
 N - イソプロピル - 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 -  
 イル ] プロパン - 1 - アミン ;  
 N - エチル - N - メチル - 4 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール  
 - 5 - イル ] ブタン - 1 - アミン ;  
 ( 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] オキシ }  
 エチル ) アミン ;  
 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 3 - ピロリジン - 1 - イルプロピル ) - 1 H -  
 インダゾール ;  
 N - イソプロピル - 4 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 -  
 イル ] ブタン - 1 - アミン ;  
 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 5 - ( 4 - ピロリジン - 1 - イルブチル ) - 1 H - イン  
 ダゾール ;  
 N - エチル - 4 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ]  
 ブタン - 1 - アミン ;  
 5 - [ ( 3 - メチルピペラジン - 1 - イル ) メチル ] - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル )  
 - 1 H - インダゾール ;  
 5 - [ ( 3 , 5 - ジメチルピペラジン - 1 - イル ) メチル ] - 3 - ( 1 - ナフチルスルホ  
 ニル ) - 1 H - インダゾール ;  
 N - エチル - 3 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ]  
 プロパン - 1 - アミン ;  
 { 4 - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ] ブチル } ア  
 ミン ;  
 5 - [ 1 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) エチル ] - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニ  
 ル ) - 1 H - インダゾール ;  
 N , N , N ' - トリメチル - N ' - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダ  
 ザール - 5 - イル ] メチル } エタン - 1 , 2 - ジアミン ;  
 N , N - ジメチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5  
 - イル ] メトキシ } エタンアミン ;  
 5 - { [ ( 3 R ) - 3 - メチルピペラジン - 1 - イル ] メチル } - 3 - ( 1 - ナフチルス  
 ルホニル ) - 1 H - インダゾール ;  
 5 - { [ ( 3 S ) - 3 - メチルピペラジン - 1 - イル ] メチル } - 3 - ( 1 - ナフチルス  
 ルホニル ) - 1 H - インダゾール ;  
 ( 3 S ) - N - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ]  
 メチル } ピロリジン - 3 - アミン ;  
 ( 3 R ) - 1 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 5 - イル ]  
 メチル } ピロリジン - 3 - アミン ;  
 N - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] - 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - イン  
 ダゾール - 5 - カルボキサミド ;  
 2 - { [ 5 - フルオロ - 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ]  
 オキシ } エタンアミン ;  
 N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] - - アラニ



ンアミド；

N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] - 3 - ピペリジン - 1 - イルプロパンアミド；

N - 3 - , N - 3 - - ジメチル - N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] - - アラニンアミド；

2 - { [ 3 - ( フェニルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] - - アラニンアミド；

N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] エタン - 1 , 2 - ジアミン；

N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] - 3 - ピペリジン - 1 - イルプロパンアミド；

N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] エタン - 1 , 2 - ジアミン；

N<sup>3</sup> , N<sup>3</sup> - ジエチル - N - [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 7 - イル ] - - アラニンアミド；

N , N - ジメチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 4 - イル ] オキシ } エタンアミン；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 4 - ( 2 - ピペリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 4 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエトキシ ) - 1 H - インダゾール；

2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 4 - イル ] オキシ } エタンアミン；

N - メチル - 2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] オキシ } エタンアミン；

2 - { [ 3 - ( 1 - ナフチルスルホニル ) - 1 H - インダゾール - 6 - イル ] オキシ } エタンアミン；

から本質的になる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、その立体異性体および薬学的に許容されるその塩。

【請求項 10】

治療有効量の請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の式 I の化合物を含む、治療を必要とする患者の 5 - H T 6 受容体に関連する、または 5 - H T 6 受容体に影響される中枢神経系障害を治療するための組成物。

【請求項 11】

前記障害が、認知障害、発達障害または神経変性障害である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記障害が認知障害である、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記障害が、学習障害；注意欠陥障害；ダウン症候群、脆弱 X 症候群または自閉症からなる群から選択される、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記障害が卒中または頭部外傷である、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 15】

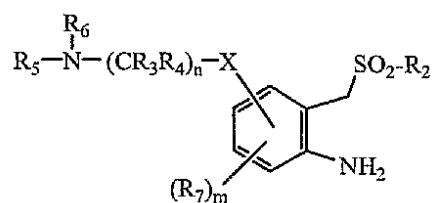
薬学的に許容される担体および有効量の請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の式 I の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 16】

請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の式 I の化合物を調製するためのプロセスであっ

て、該プロセスは、式 I I

【化 2】



(II)

の化合物〔式中、X、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、mおよびnは、式 I について上記した通りである〕

をNaNO<sub>2</sub>と酸の存在下で反応させて式 I の化合物（R<sub>1</sub>はHである）を得る工程、および

場合により、該化合物をR<sub>1</sub>-Hal（Halは、Cl、BrまたはIであり、R<sub>1</sub>は、それぞれ置換されていてもよいアルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基である）と反応させる工程

を含む、プロセス。