

【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】令和1年11月28日(2019.11.28)

【公表番号】特表2018-538253(P2018-538253A)

【公表日】平成30年12月27日(2018.12.27)

【年通号数】公開・登録公報2018-050

【出願番号】特願2018-522572(P2018-522572)

【国際特許分類】

C 0 7 D	401/14	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/36	(2006.01)
A 6 1 P	25/32	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
C 0 7 D	403/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/541	(2006.01)
C 0 7 D	498/08	(2006.01)
C 0 7 D	491/107	(2006.01)
C 0 7 D	413/14	(2006.01)
C 0 7 D	405/14	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)
C 0 7 D	498/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/538	(2006.01)
A 6 1 K	31/5513	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	31/4525	(2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)
 A 6 1 K 31/135 (2006.01)
 A 6 1 K 31/381 (2006.01)
 A 6 1 K 31/165 (2006.01)
 A 6 1 K 31/137 (2006.01)
 A 6 1 K 31/55 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5517 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4985 (2006.01)
 A 6 1 K 31/197 (2006.01)
 A 6 1 K 31/195 (2006.01)
 A 6 1 K 31/53 (2006.01)
 A 6 1 K 33/24 (2019.01)
 A 6 1 K 31/19 (2006.01)
 C 0 7 D 409/14 (2006.01)
 C 0 7 D 495/04 (2006.01)
 C 0 7 D 243/38 (2006.01)
 C 0 7 D 215/22 (2006.01)
 C 0 7 D 417/12 (2006.01)
 C 0 7 D 307/87 (2006.01)
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)
 C 0 7 D 333/20 (2006.01)
 C 0 7 D 243/20 (2006.01)
 C 0 7 D 243/24 (2006.01)
 C 0 7 D 223/26 (2006.01)
 C 0 7 D 253/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 25/32
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 27/02
 C 0 7 D 403/14

A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/541	
C 0 7 D	498/08	
C 0 7 D	491/107	
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	487/04	1 4 4
C 0 7 D	498/04	1 1 2 T
C 0 7 D	498/04	1 0 5
A 6 1 K	31/538	
C 0 7 D	487/04	1 4 0
C 0 7 D	471/04	1 0 6 C
A 6 1 K	31/5513	
A 6 1 K	31/551	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/343	
A 6 1 K	31/4525	
A 6 1 K	31/138	
A 6 1 K	31/135	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/165	
A 6 1 K	31/137	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/5517	
A 6 1 K	31/4985	
A 6 1 K	31/197	
A 6 1 K	31/195	
A 6 1 K	31/53	
A 6 1 K	33/24	
A 6 1 K	31/19	
C 0 7 D	409/14	
C 0 7 D	495/04	1 0 8
C 0 7 D	243/38	
C 0 7 D	215/22	
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	307/87	
C 0 7 D	405/12	
C 0 7 D	333/20	
C 0 7 D	243/20	
C 0 7 D	243/24	
C 0 7 D	223/26	
C 0 7 D	253/06	

【手続補正書】

【提出日】令和1年10月16日(2019.10.16)

【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

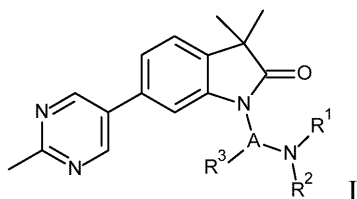
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

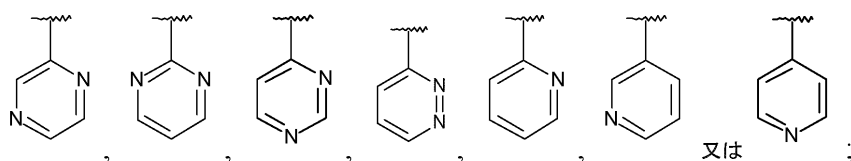
【化 1 2 7】



(式中、

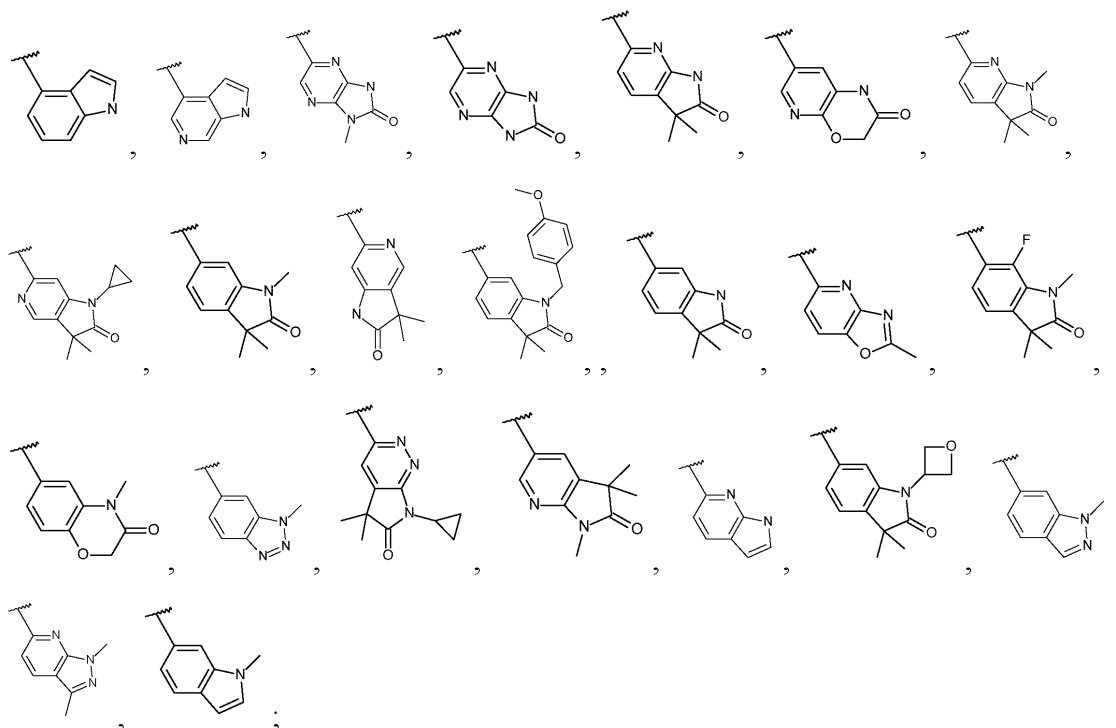
A は、フェニル、もしくは、以下：

【化 1 2 8】



から選択される、1もしくは2個のN原子を含有する6員のヘテロアリアル基であるか；
又は、アミン基 - NR¹R² は、基 A からの2個の隣接する炭素原子と一緒に、以下：

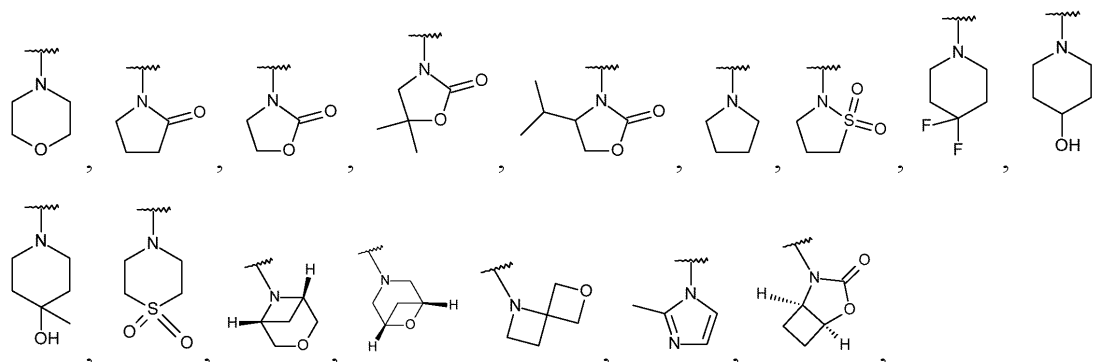
【化 1 2 9】



から選択される追加の縮合環を形成していてもよく；

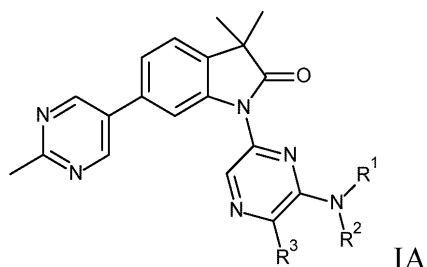
R¹ / R² は、互いに独立して、水素、C(O) - 低級アルキル、シクロアルキル、 - (

【化 1 3 0】

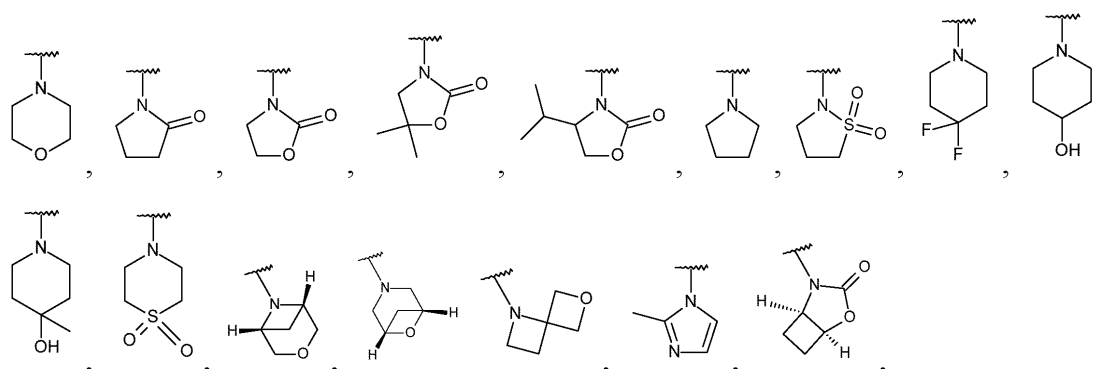


【請求項2】

【化 1 3 1】



【化 1 3 2】



かつ、式中、アミン基 NR^1R^2 はまた、p - 位にあってもよく、かつ R^3 は、メタ位に

あってもよい)

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び/もしくは光学異性体及び/もしくはその立体異性体。

【請求項 3】

化合物が、

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (6 - モルホリノピラジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - アミノピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (6 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (6 - (ピロリジン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

N - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキソインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) アセタミド

1 - (6 - (4, 4 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - (シクロプロピルアミノ) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - [6 - (2 - メトキシエチルアミノ) ピラジン - 2 - イル] - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドール - 2 - オン

1 - (6 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - (1, 1 - ジオキシドチオモルホリノ) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - (4 - ヒドロキシ - 4 - メチルピペリジン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - ((2 - メトキシエチル) (メチル) アミノ) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - ((1 R, 5 S) - 3 - オキサ - 6 - アザビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプタン - 6 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - (6 - オキサ - 1 - アザスピロ [3 . 3] ヘプタン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキソインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) オキサゾリジン - 2 - オン

1 - (6 - ((1 R, 5 S) - 6 - オキサ - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 1] ヘプタン - 3 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (6 - (オキセタン - 3 - イルアミノ) ピラジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 1 - (5 - メチル - 6 - モルホリノピラジン - 2 - イル) - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (6 - ((2 - メトキシエチル) アミノ) - 5 - メチルピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキソインドリン - 1 - イル) - 3 - メチルピラジン - 2 - イル) オキサゾリジン - 2 - オン

(R) - 3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) -

2 - オキシインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 4 - イソプロピルオキサゾリジン - 2 - オン

(S) - 3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 4 - イソプロピルオキサゾリジン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (5 - モルホリノピラジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

3, 3 - ジメチル - 1 - (5 - (2 - メチル - 1H - イミダゾール - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (5 - ((1R, 5S) - 3 - オキサ - 6 - アザビシクロ[3.1.1]ヘプタン - 6 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

1 - (5 - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

rac - (1S, 5R) - 4 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 2 - オキサ - 4 - アザビシクロ[3.2.0]ヘプタン - 3 - オン

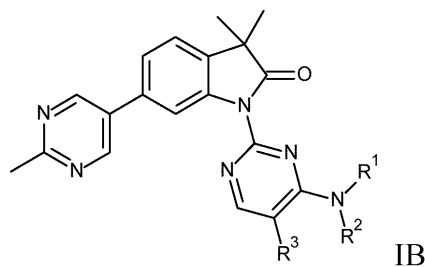
3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 5, 5 - ジメチルオキサゾリジン - 2 - オン、又は

1 - (6 - (1, 1 - ジオキシドイソチアゾリジン - 2 - イル) ピラジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オンである、請求項2記載の式IAの化合物。

【請求項4】

式IB:

【化133】

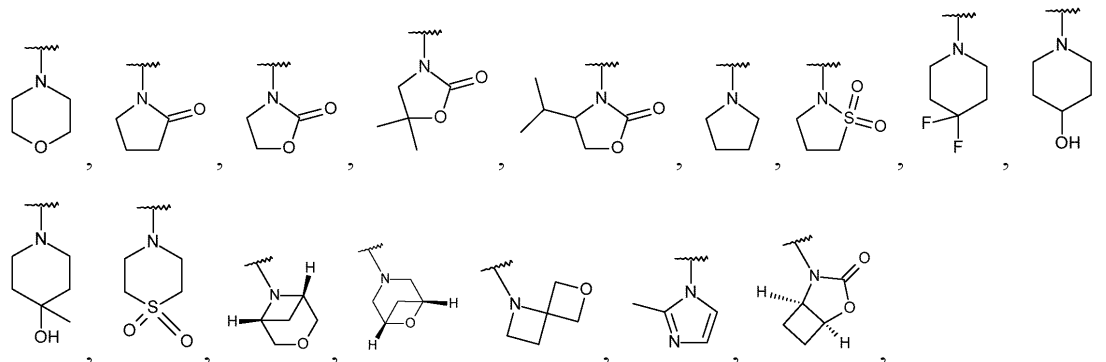


(式中、

R^1 / R^2 は、互いに独立して、水素、C(O) - 低級アルキル、シクロアルキル、 $-(CH_2)_2$ - 低級アルコキシ、低級アルキル、もしくはオキセタニルであるか；

又は、 R^1 と R^2 は、それらが結合しているN原子と一緒に、基：

【化134】



を形成していてもよく、

R^3 は、水素又は低級アルキルであり；

かつ、式中、アミン基 NR^1R^2 及び R^3 は、他の位置にあってもよい）

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び／もしくは光学異性体及び／もしくはその立体異性体。

【請求項 5】

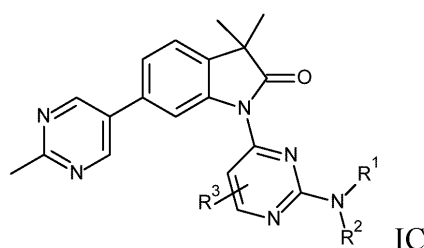
化合物が、

3,3-ジメチル-6-(2-メチルピリミジン-5-イル)-1-(4-モルホリノピリミジン-2-イル)インドリン-2-オンである、請求項 4 記載の式 I B の化合物。

【請求項 6】

式 I C：

【化 135】

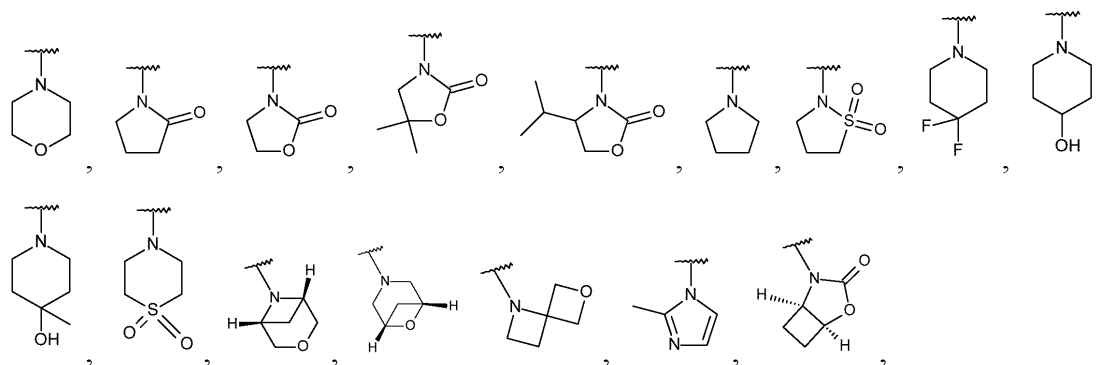


（式中、

R^1 / R^2 は、互いに独立して、水素、 $C(O)$ -低級アルキル、シクロアルキル、 $-(CH_2)_2$ -低級アルコキシ、低級アルキル、もしくはオキセタニルであるか；

又は、 R^1 と R^2 は、それらが結合している N 原子と一緒にあって、基：

【化 136】



を形成していてもよく、

R^3 は、水素又は低級アルキルであり；

かつ、式中、アミン基 NR^1R^2 は、他の位置にあってもよい）

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び／もしくは光学異性体及び／もしくはその立体異性体。

【請求項 7】

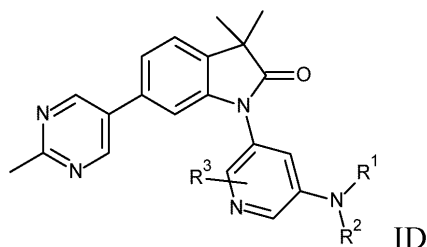
化合物が、

3,3-ジメチル-6-(2-メチルピリミジン-5-イル)-1-(2-モルホリノピリミジン-4-イル)インドリン-2-オンである、請求項 6 記載の式 I C の化合物。

【請求項 8】

式 I D：

【化 1 3 7】

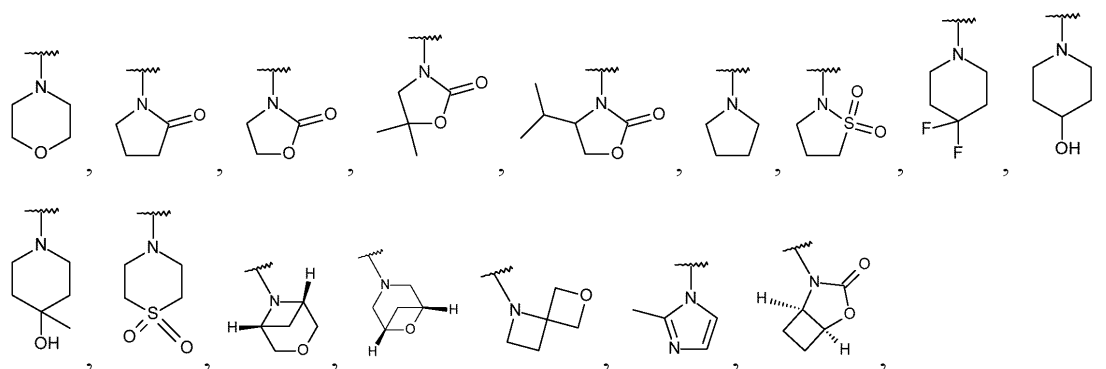


(式中、

R^1 / R^2 は、互いに独立して、水素、 $C(O)$ - 低級アルキル、シクロアルキル、 $-(CH_2)_2$ - 低級アルコキシ、低級アルキル、もしくはオキセタニルであるか；

又は、 R^1 と R^2 は、それらが結合している N 原子と一緒にあって、基：

【化 1 3 8】



を形成していてもよく、

R^3 は、水素又は低級アルキルであり；

かつ、式中、アミン基 $NR^1 R^2$ は、他の位置にあってもよい)

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び／もしくは光学異性体及び／もしくはその立体異性体。

【請求項 9】

化合物が、

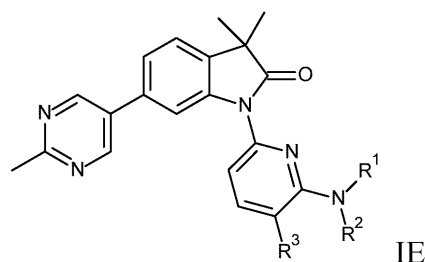
1 - (5 - アミノピリジン - 3 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン、又は

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (5 - モルホリノピリジン - 3 - イル) インドリン - 2 - オンである、請求項 8 記載の式 ID の化合物。

【請求項 10】

式 IE：

【化 1 3 9】

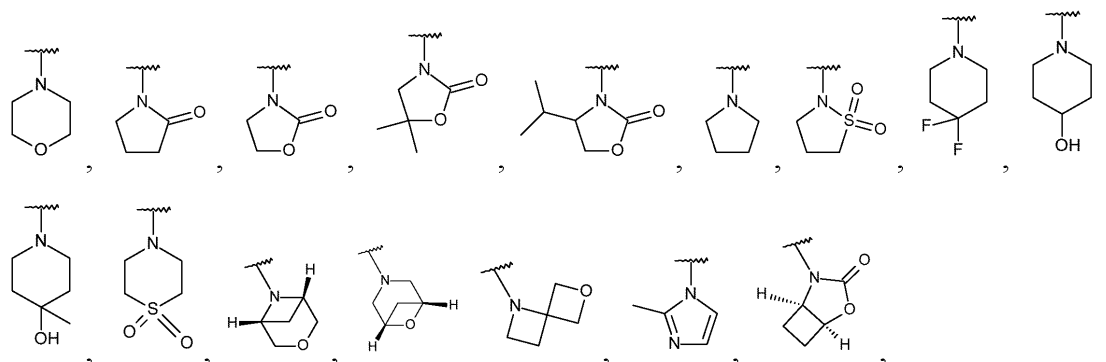


(式中、

R^1 / R^2 は、互いに独立して、水素、 $C(O)$ - 低級アルキル、シクロアルキル、 $-(CH_2)_2$ - 低級アルコキシ、低級アルキル、もしくはオキセタニルであるか；

$\text{CH}_2)_2$ - 低級アルコキシ、低級アルキル、もしくはオキセタニルであるか；
又は、 R^1 と R^2 は、それらが結合している N 原子と一緒にあって、基：

【化 1 4 0】



を形成していてもよく、

R^3 は、水素又は低級アルキルであり；

かつ、式中、アミン基 NR^1R^2 及び R^3 は、他の位置にあってもよい）

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び／もしくは光学異性体及び／もしくはその立体異性体。

【請求項 1 1】

化合物が、

3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (6 - モルホリノピリジン - 2 - イル) インドリン - 2 - オン

3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) ピリジン - 2 - イル) オキサゾリジン - 2 - オン

1 - (6 - アミノ - 5 - メチルピリジン - 2 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

N - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 3 - メチルピリジン - 2 - イル) アセタミド

3, 3 - ジメチル - 1 - (5 - メチル - 6 - モルホリノピリジン - 2 - イル) - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン、又は

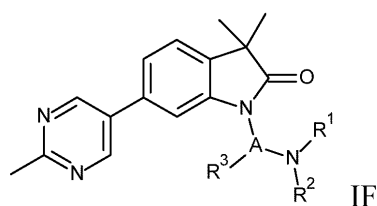
3 - (6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 3 - メチルピリジン - 2 - イル) オキサゾリジン - 2 - オン

である、請求項 1 0 記載の式 I E の化合物。

【請求項 1 2】

式 I F：

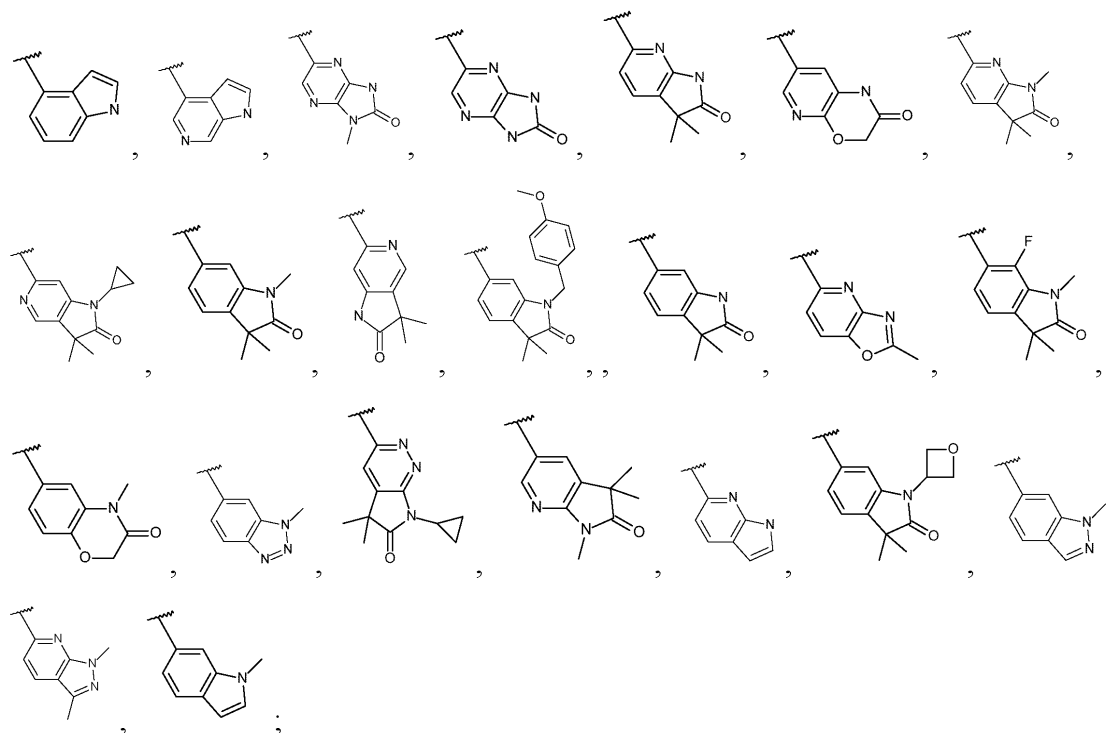
【化 1 4 1】



(式中、

アミン基 - NR^1R^2 は、 R^2 が水素である場合、式 I に記載されるとおりの基 A からの 2 個の隣接する炭素原子と一緒にあって、以下：

【化 1 4 2】



から選択される追加の縮合環を形成していてもよく；

R³ は、水素である）

で示される請求項 1 記載の化合物、

ならびに、その薬学的に許容し得る塩、ラセミ混合物、又はその対応するエナンチオマー及び／もしくは光学異性体及び／もしくはその立体異性体。

【請求項 1 3】

化合物が、

1 - (1H - インドール - 4 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン

3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (1H - ピロロ[2, 3 - c]ピリジン - 4 - イル) インドリン - 2 - オン

5 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ[4, 5 - b]ピラジン - 2 (3H) - オン

5 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 1H - イミダゾ[4, 5 - b]ピラジン - 2 (3H) - オン

6 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - 1H - ピロロ[2, 3 - b]ピリジン - 2 (3H) - オン

7 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 1H - ピリド[2, 3 - b][1, 4]オキサジン - 2 (3H) - オン

6 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 1 , 3 , 3 - トリメチル - 1H - ピロロ[2, 3 - b]ピリジン - 2 (3H) - オン

1 - シクロプロピル - 6 - (3 , 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 3 , 3 - ジメチル - 1H - ピロロ[3, 2 - c]ピリジン - 2 (3H) - オン

1', 3, 3, 3', 3' - ペンタメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル)
 - [1, 6' - ビンドリン] - 2, 2' - ジオン
 1' - (4 - メトキシベンジル) - 3, 3, 3', 3' - テトラメチル - 6 - (2 - メ
 チルピリミジン - 5 - イル) - [1, 6' - ビンドリン] - 2, 2' - ジオン
 6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシイン
 ドリン - 1 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 1 H - ピロロ [3, 2 - c] ピリジン - 2 (3
 H) - オン
 3, 3, 3', 3' - テトラメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - [1
 , 6' - ビンドリン] - 2, 2' - ジオン
 3, 3 - ジメチル - 1 - (2 - メチルオキサゾロ [4, 5 - b] ピリジン - 5 - イル)
 - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン
 7' - フルオロ - 1', 3, 3, 3', 3' - ペンタメチル - 6 - (2 - メチルピリミ
 ジン - 5 - イル) - [1, 6' - ビンドリン] - 2, 2' - ジオン
 6 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシイン
 ドリン - 1 - イル) - 4 - メチル - 2 H - ベンゾ [b] [1, 4] オキサジン - 3 (4 H
) - オン
 3, 3 - ジメチル - 1 - (1 - メチル - 1 H - ベンゾ [d] [1, 2, 3] トリアゾー
 ル - 6 - イル) - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン
 7 - シクロプロピル - 3 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イ
 ル) - 2 - オキシインドリン - 1 - イル) - 5, 5 - ジメチル - 5 H - ピロロ [2, 3 -
 c] ピリダジン - 6 (7 H) - オン
 5 - (3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 2 - オキシイン
 ドリン - 1 - イル) - 1, 3, 3 - トリメチル - 1 H - ピロロ [2, 3 - b] ピリジン -
 2 (3 H) - オン
 3, 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1 - (1 H - ピロロ [2
 , 3 - b] ピリジン - 6 - イル) インドリン - 2 - オン
 3, 3, 3', 3' - テトラメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) - 1'
 - (オキセタン - 3 - イル) - [1, 6' - ビンドリン] - 2, 2' - ジオン
 3, 3 - ジメチル - 1 - (1 - メチル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) - 6 - (2 -
 メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン
 1 - (1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - 3,
 3 - ジメチル - 6 - (2 - メチルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オン、又は
 3, 3 - ジメチル - 1 - (1 - メチル - 1 H - インドール - 6 - イル) - 6 - (2 - メ
 チルピリミジン - 5 - イル) インドリン - 2 - オンである、請求項 12 記載の式 I F の化
 合物。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の式 I の化合物と、公知の市販の抗精神病薬、抗うつ薬、抗不安薬、又は気分安定剤との組み合わせ。

【請求項 15】

市販の抗精神病薬が、オランザピン (Zyprexa)、クロザピン (Clozaril)、リスペリドン (Risperdal)、アリピプラゾール (Abilify)、又はジブラシドンである、請求項 14 記載の組み合わせ。

【請求項 16】

市販の抗うつ薬が、シタロプラム (Celexa)、エスシタロプラム (Lexapro、Ciprallex)、パロキセチン (Paxil、Seroxat)、フルオキセチン (Prozac)、セルトラリン (Zoloft、Lustral)、デュロキセチン (Cymbalta)、ミルナシبران (Ixel、Savella)、ベンラファキシン (Effexor)、又はミルタザピン (Remeron) である、請求項 14 記載の組み合わせ。

【請求項 17】

市販の抗不安薬が、アルブラゾラム (Helex、Xanax、Xanor、Onax、Alprox、Restyl、T

afil、Paxal)、クロルジアゼボキシド(Librium、Risolid、Elenium)、クロナゼパム(Rivotril、Klonopin、Iktorivil、Paxam)、ジアゼパム(Antenex、Apaurin、Apzepam、Apozepam、Hexalid、Pax、Stesolid、Stedon、Valium、Vival、Valaxona)、エスタゾラム(ProSom)、エスゾピクロン(Lunesta)、ザレプロン(Sonata、Starnoc)、ゾルピデム(Ambien、Nytamel、Stilnoct、Stilnox、Zoldem、Zolnod)、プレガバリン(Lyrica)、又はガバペンチン(Fanatrex、Gabarone、Gralise、Neurontin、Nupentin)である、請求項14記載の組み合わせ。

【請求項18】

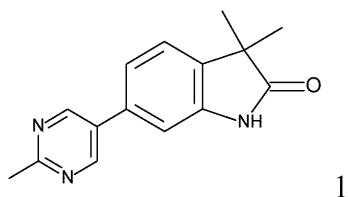
市販の気分安定剤が、カルバマゼピン(Tegretol)、ラモトリジン(Lamictal)、リチウム(Eskalith、Lithane、Lithobid)、及びバルプロ酸(Depakote)である、請求項14記載の組み合わせ。

【請求項19】

請求項1～13のいずれか一項に記載されるとおりの式Iの化合物の調製のためのプロセスであって、

a) 式：

【化143】



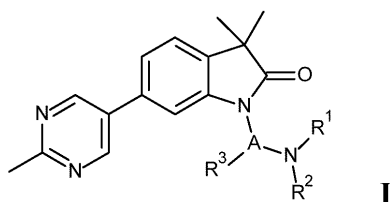
1

で示される化合物を、式：



で示される化合物と反応させて、式：

【化144】



I

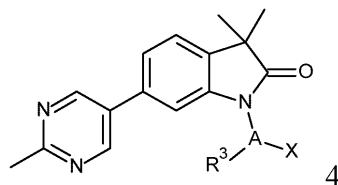
で示される化合物とし

(式中、Yは、Cl、Br、又はIであり、そして他の基は上記の意味を有する)、そして、

所望であれば、得られた化合物を薬学的に許容し得る酸付加塩に変換するか、又は、

b) 式4：

【化145】



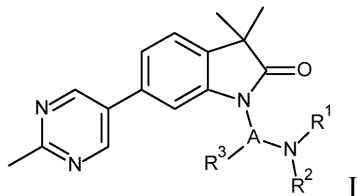
4

で示される化合物を、



と反応させて、式I：

【化 1 4 6】



で示される化合物とし

(式中、Xは、Cl、Br、又はIであり、そして他の基は上記の意味を有する)、そして、

所望であれば、得られた化合物を薬学的に許容し得る酸付加塩に変換する、プロセス。

【請求項 20】

請求項 19 に請求されるとおりのプロセスによって調製される、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 21】

治療活性物質としての使用のための、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 22】

統合失調症の陽性症状(精神病)及び陰性症状、薬物乱用、アルコール及び薬物依存症、強迫性障害、認知障害、双極性障害、気分障害、大うつ病、治療抵抗性うつ病、不安障害、アルツハイマー病、自閉症、パーキンソン病、慢性疼痛、境界性パーソナリティ障害、神経変性疾患、睡眠障害、慢性疲労症候群、硬直、炎症性疾患、ぜんそく、ハンチントン病、ADHD、筋萎縮性側索硬化症、関節炎における作用、自己免疫疾患、ウイルス及び真菌感染症、心血管疾患、眼科疾患及び炎症性網膜疾患、ならびに平衡感覚障害、てんかん、及び併存性のてんかんを伴う神経発達障害に関連する CNS 疾患の処置のための、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に係る化合物及び治療上不活性な担体を含む医薬組成物。

【請求項 23】

統合失調症の陽性症状(精神病)及び陰性症状、薬物乱用、アルコール及び薬物依存症、強迫性障害、認知障害、双極性障害、気分障害、大うつ病、治療抵抗性うつ病、不安障害、アルツハイマー病、自閉症、パーキンソン病、慢性疼痛、境界性パーソナリティ障害、神経変性疾患、睡眠障害、慢性疲労症候群、硬直、炎症性疾患、ぜんそく、ハンチントン病、ADHD、筋萎縮性側索硬化症、関節炎における作用、自己免疫疾患、ウイルス及び真菌感染症、心血管疾患、眼科疾患及び炎症性網膜疾患、ならびに平衡感覚障害、てんかん、及び併存性のてんかんを伴う神経発達障害に関連する CNS 疾患の処置のための、請求項 1 に開示されるとおりの式 I の化合物の使用。

【請求項 24】

統合失調症の陽性症状(精神病)及び陰性症状、薬物乱用、アルコール及び薬物依存症、強迫性障害、認知障害、双極性障害、気分障害、大うつ病、治療抵抗性うつ病、不安障害、アルツハイマー病、自閉症、パーキンソン病、慢性疼痛、境界性パーソナリティ障害、神経変性疾患、睡眠障害、慢性疲労症候群、硬直、炎症性疾患、ぜんそく、ハンチントン病、ADHD、筋萎縮性側索硬化症、関節炎における作用、自己免疫疾患、ウイルス及び真菌感染症、心血管疾患、眼科疾患及び炎症性網膜疾患、ならびに平衡感覚障害、てんかん、及び併存性のてんかんを伴う神経発達障害に関連する CNS 疾患の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に請求されるとおりの式 I の化合物の使用。

【請求項 25】

統合失調症の陽性症状(精神病)及び陰性症状、薬物乱用、アルコール及び薬物依存症、強迫性障害、認知障害、双極性障害、気分障害、大うつ病、治療抵抗性うつ病、不安障害、アルツハイマー病、自閉症、パーキンソン病、慢性疼痛、境界性パーソナリティ障害、神経変性疾患、睡眠障害、慢性疲労症候群、硬直、炎症性疾患、ぜんそく、ハンチント

ン病、A D H D、筋萎縮性側索硬化症、関節炎における作用、自己免疫疾患、ウイルス及び真菌感染症、心血管疾患、眼科疾患及び炎症性網膜疾患、ならびに平衡感覚障害、てんかん、及び併存性のてんかんを伴う神経発達障害に関連するC N S疾患の処置における使用のための、請求項1～13のいずれか一項記載の化合物。

【請求項26】

統合失調症の陽性症状（精神病）及び陰性症状、薬物乱用、アルコール及び薬物依存症、強迫性障害、認知障害、双極性障害、気分障害、大うつ病、治療抵抗性うつ病、不安障害、アルツハイマー病、自閉症、パーキンソン病、慢性疼痛、境界性パーソナリティ障害、神経変性疾患、睡眠障害、慢性疲労症候群、硬直、炎症性疾患、ぜんそく、ハンチントン病、A D H D、筋萎縮性側索硬化症、関節炎における作用、自己免疫疾患、ウイルス及び真菌感染症、心血管疾患、眼科疾患及び炎症性網膜疾患、ならびに平衡感覚障害、てんかん、及び併存性のてんかんを伴う神経発達障害に関連するC N S疾患の処置のための方法であって、有効量の請求項1～13のいずれか一項に定義されたとおりの化合物を含む医薬組成物を投与することを含む方法に用いられる請求項1～13のいずれか一項に定義されたとおりの化合物を有効成分として含む医薬組成物。