

【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2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-516290(P2007-516290A)

【公表日】平成19年6月21日(2007.6.21)

【年通号数】公開・登録公報2007-023

【出願番号】特願2006-547263(P2006-547263)

【国際特許分類】

C 07 C 257/14 (2006.01)
A 61 K 31/155 (2006.01)
C 07 D 295/14 (2006.01)
A 61 K 31/4453 (2006.01)
C 07 D 213/58 (2006.01)
A 61 K 31/4406 (2006.01)
C 07 D 209/24 (2006.01)
A 61 K 31/404 (2006.01)
A 61 K 31/4409 (2006.01)
A 61 K 31/4402 (2006.01)
C 07 D 211/14 (2006.01)
A 61 K 31/445 (2006.01)
C 07 D 295/20 (2006.01)
A 61 K 31/495 (2006.01)
C 07 D 241/04 (2006.01)
A 61 K 31/277 (2006.01)
C 07 D 333/20 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
C 07 D 279/22 (2006.01)
A 61 K 31/542 (2006.01)
C 07 D 233/26 (2006.01)
A 61 K 31/4164 (2006.01)
C 07 D 215/48 (2006.01)
A 61 K 31/47 (2006.01)
C 07 D 333/24 (2006.01)
A 61 K 31/381 (2006.01)
A 61 K 31/36 (2006.01)
A 61 K 31/5375 (2006.01)
A 61 K 31/40 (2006.01)
C 07 D 207/327 (2006.01)
C 07 D 209/86 (2006.01)
A 61 K 31/403 (2006.01)
C 07 D 215/06 (2006.01)
A 61 P 3/00 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 3/06 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 257/14 C S P
A 6 1 K 31/155
C 0 7 D 295/14 A
A 6 1 K 31/4453
C 0 7 D 213/58
A 6 1 K 31/4406
C 0 7 D 209/24
A 6 1 K 31/404
A 6 1 K 31/4409
A 6 1 K 31/4402
C 0 7 D 211/14
A 6 1 K 31/445
C 0 7 D 295/20 A
A 6 1 K 31/495
C 0 7 D 241/04
A 6 1 K 31/277
C 0 7 D 333/20
A 6 1 K 31/497
C 0 7 D 279/22
A 6 1 K 31/542
C 0 7 D 233/26
A 6 1 K 31/4164
C 0 7 D 215/48
A 6 1 K 31/47
C 0 7 D 333/24
A 6 1 K 31/381
A 6 1 K 31/36
A 6 1 K 31/5375
A 6 1 K 31/40
C 0 7 D 207/327
C 0 7 D 209/86
A 6 1 K 31/403
C 0 7 D 215/06
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 9/12
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 405/12

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月11日(2007.12.11)

【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

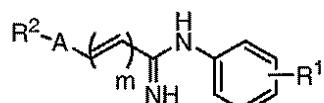
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式 I

【化 1】



式

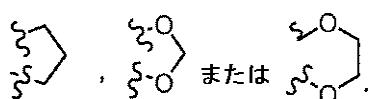
を有する化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、ここで、Aは、同じかまたは異なり得る1～4個の部分で必要に応じて置換されているアリーレンまたはヘテロアリーレンであり、各部分は、独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、-CF₃、-CN、-OCF₃、-OR¹¹、-(CR⁴R⁵)_pOR¹¹、-NR⁵R⁶、-(CR⁴R⁵)_pNR⁵R⁶、-C(O₂)R¹¹、-C(O)R¹¹、-C(O)NR⁵R⁶、-SR¹¹、-S(O₂)R¹¹、-S(O₂)NR⁵R⁶、-N(R⁵)S(O₂)R⁷、-N(R⁵)C(O)R⁷および-N(R⁵)C(O)NR⁵R⁶からなる群より選択され；

m は、 0 または 1 であり；

p は、1 ~ 4 であり；

R^1 は、水素、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、 $-NR^5R^6$ 、 $-SR^{1-1}$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ およびアルキルから独立して選択される 1 ~ 5 個の部分であるか、あるいは 2 つの隣接する R^1 部分は、結合して、

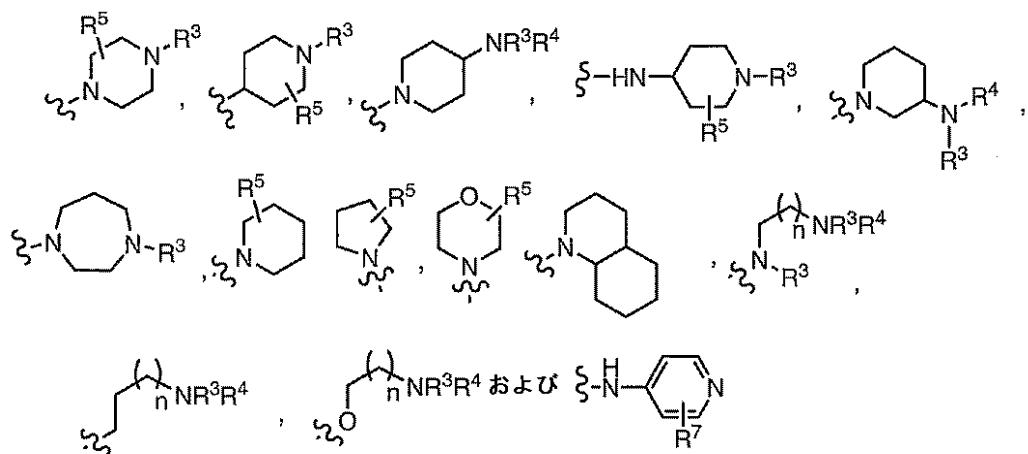
【化 2】



を形成し得：

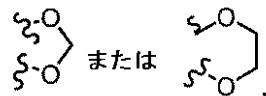
R^2 は、水素、ハロゲン、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、 $-NR^3R^4$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、アシル、アルキル、 R^8 - 置換アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、ヘテロシクリルアルキル。

【化 3】



から独立して選択される 1 ~ 5 個の部分であり、ここで、n は、1 ~ 3 であるか、あるいは、2 つの隣接する R² 部分は、結合して、

【化4】



を形成し得、

ここで、 R^2 についての該ヘテロアラルキル、ヘテロシクリルアルキル、アリールまたはヘテロアリールの各々は、同じかまたは異なり得る1~4個の部分で必要に応じて置換され得、各部分は、独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、アルキレニル、アラルキル、 $-C(O)H$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(R^4)=NOR^{1\ 1}$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{1\ 1}$ 、 $-CR^4R^5$ 、 $pOR^{1\ 1}$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $-CR^4R^5$ 、 pNR^5R^6 、 $-C(O_2)R^{1\ 1}$ 、 $-C(O)R^{1\ 1}$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-SR^{1\ 1}$ 、 $-S(O_2)R^{1\ 1}$ 、 $-S(O_2)NR^5R^6$ 、 $-N(R^5)S(O_2)R^7$ 、 $-N(R^5)C(O)R^7$ および $-N(R^5)C(O)NR^5R^6$ からなる群より選択され；

R^3 は、水素、アルキル、 $-C(O)R^{1\ 1}$ 、 $-SO_2R^{1\ 1}$ 、 $-C(O)$ アルコキシ、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキルまたはアラルキルであり、ここで、 R^3 についての該アルキル、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアラルキルまたはアラルキルの各々は、同じかまたは異なり得る1~4個の部分で必要に応じて置換され得、各部分は、独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OR^{1\ 1}$ 、 $-CR^4R^5$ 、 $pOR^{1\ 1}$ 、 $-NR^5R^6$ 、 $-CR^4R^5$ 、 pNR^5R^6 、 $-C(O_2)R^{1\ 1}$ 、 $-C(O)NR^5R^6$ 、 $-SR^{1\ 1}$ 、 $-S(O_2)R^{1\ 1}$ 、 $-S(O_2)NR^5R^6$ 、 $-N(R^5)S(O_2)R^7$ 、 $-N(R^5)C(O)R^7$ および $-N(R^5)C(O)NR^5R^6$ からなる群より選択され；

R^4 は、水素またはアルキルであり；

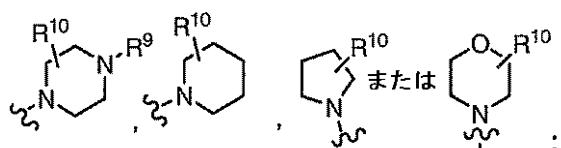
R^5 は、水素、アルキルまたはアリールであり、ここで、 R^5 についての該アルキルまたはアリールの各々は、非置換であるか、あるいは同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、ビニル、アルコキシ、 $-OCF_3$ 、アルコキシアルキル、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O-$ アルキル、 $-CF_3$ およびアルキルからなる群より選択され；

R^6 は、水素、アルキルまたはアリールであり、ここで、 R^6 についての該アルキルまたはアリールの各々は、非置換であるか、あるいは同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、ビニル、アルコキシ、 $-OCF_3$ 、アルコキシアルキル、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O-$ アルキル、 $-CF_3$ およびアルキルからなる群より選択され；

R^7 は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、アラルキルおよびヘテロアラルキルからなる群より選択され、ここで、 R^7 についての該アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキルおよびヘテロアラルキルの各々は非置換であるか、あるいは、同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^5$ 、 $-NR^5R^{1\ 0}$ 、 $-CH_2OR^5$ 、 $-C(O_2)R^5$ 、 $-C(O)NR^5R^{1\ 0}$ 、 $-C(O)R^5$ 、 $-SR^{1\ 0}$ 、 $-S(O_2)R^{1\ 0}$ 、 $-S(O_2)NR^5R^{1\ 0}$ 、 $-N(R^5)S(O_2)R^{1\ 0}$ 、 $-N(R^5)C(O)R^{1\ 0}$ および $-N(R^5)C(O)NR^5R^{1\ 0}$ からなる群より選択され；

R^8 は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-NR^3R^4$ 、

【化5】



であり、

R^9 は、水素、アルキル、 $-C(O)R^{11}$ 、 $-SO_2R^{11}$ 、アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、ヘテロアラルキルまたはアラルキルであり、ここで、 R^9 についての該アリール、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロアラルキルまたはアラルキルの各々は、非置換であるか、あるいは同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、ビニル、アルコキシ、 $-OCF_3$ 、アルコキシアルキル、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O-$ アルキル、 $-CF_3$ およびアルキルからなる群より選択され；

R^{10} は、水素、アルキルまたはアリールであり、ここで、 R^{10} についての該アルキルまたはアリールの各々は、非置換であるか、あるいは同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、ビニル、アルコキシ、 $-OCF_3$ 、アルコキシアルキル、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O-$ アルキル、 $-CF_3$ およびアルキルからなる群より選択され；そして

R^{11} は、アルキルまたはアリールであり、ここで、 R^{11} についての該アルキルまたはアリールの各々は、非置換であるか、あるいは同じかまたは異なり得る1~4個の部分で置換され得、各部分は、独立して、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、ビニル、アルコキシ、 $-OCF_3$ 、アルコキシアルキル、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O-$ アルキル、 $-CF_3$ およびアルキルからなる群より選択される。

化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

【請求項2】

Aが、フェニル、キノリニル、ナフチル、ピリジル、インドリルまたはチオフェニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

mが1である、請求項1に記載の化合物。

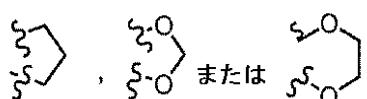
【請求項4】

mが0である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、 R^1 は、水素、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、 $-NR^5R^6$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ およびアルキルから独立して選択される1~5個の部分であるか、あるいは2つの隣接する R^1 部分は、結合して、

【化6】

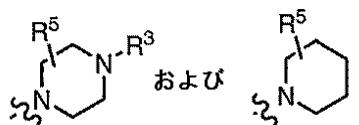


を形成し得る、化合物。

【請求項6】

R^2 が、独立して、ハロゲン、アルキル、 R^8 -置換アルキル、アリール、ヘテロアリール、

【化7】



から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R^3 が水素またはアルキルであり；そして

R^5 が水素またはアルキルである、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

R^3 がメチルまたは水素であり；そして

R^5 がメチルまたは水素である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

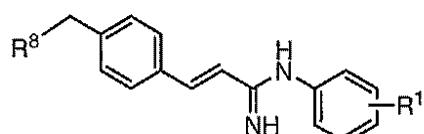
A が、フェニル、キノリニル、ナフチル、ピリジル、インドリルまたはチオフェニルであり；そして

m が0または1である、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

式

【化8】

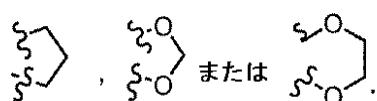


を有する、請求項1に記載の化合物であって、

ここで、

R^1 は、水素、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、 $-NR^5R^6$ 、 $-SR^{1-1}$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ およびアルキルから独立して選択される1~5個の部分であるか、あるいは2つの隣接する R^1 部分は、結合して、

【化9】



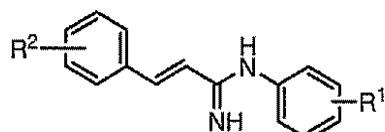
を形成し得；そして

R^9 、 R^{1-0} および R^{1-1} は、上で定義したとおりである、化合物。

【請求項11】

式

【化10】



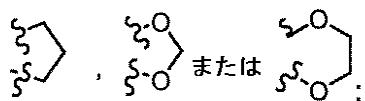
を有する、請求項1に記載の化合物であって、

ここで、

R^1 は、水素、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、 $-NR^5R^6$ 、 $-SR^{1-1}$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$

N、-NO₂ およびアルキルから独立して選択される1~5個の部分であるか、あるいは2つの隣接するR¹部分は、結合して、

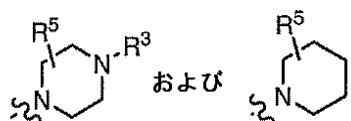
【化11】



を形成し得；

R² は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、-NR³R⁴、-OCF₃、-CF₃、-NO₂、アルキル、R⁸-置換アルキル、アリール、ヘテロアリール、

【化12】



から独立して選択される1~5個の部分であり、

ここで、R²についての該アルキル、アリールまたはヘテロアリールの各々は、同じかまたは異なり得る1~4個の部分で必要に応じて置換され得、各部分は、独立して、ハロゲン、アルキル、アリール、シクロアルキル、-CF₃、-CN、-OCF₃、-OR¹¹、-(CR⁴R⁵)_pOR¹¹、-NR⁵R⁶、-(CR⁴R⁵)_pNR⁵R⁶、-C(O₂)R¹¹、-C(O)R¹¹、-C(O)NR⁵R⁶、-SR¹¹、-S(O₂)R¹¹、-S(O₂)NR⁵R⁶、-N(R⁵)S(O₂)R⁷、-N(R⁵)C(O)R⁷および-N(R⁵)C(O)NR⁵R⁶からなる群より選択され；

pは、1~4であり；

R³は、水素またはアルキルであり；

R⁴は、水素またはアルキルであり；

R⁵は、水素またはアルキルであり；

R⁶は、水素、アルキルまたはアリールであり；

R⁷は、上で定義したとおりであり；そして

R¹¹は、アルキルまたはアリールである、

化合物。

【請求項12】

請求項1に記載の化合物であって、ここで、

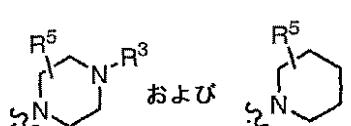
mが1であり；

Aがアリールまたはヘテロアリールであり；

R¹がハロゲンであり；

R²が、ハロゲン、-NR³R⁴、アリール、R⁸-置換アルキル、ヘテロアリール、

【化13】



から独立して選択される1個または2個の部分であり、

ここで、R²についての該アリールまたはヘテロアリールは、同じかまたは異なり得る1~4個の部分で必要に応じて置換され得、各部分は、独立して、-CNおよび-C(O)Hから選択され；

R³は、水素またはアルキルであり；

R⁴は、水素またはアルキルであり；そして

R⁵は、水素またはアルキルである、

化合物。

【請求項 1 3】

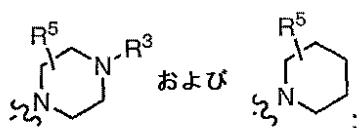
請求項 1 2 に記載の化合物であって、ここで、

A がフェニルであり；

R¹ がクロロであり；

R² が、インドリル、フェニル、R⁸-置換メチル、クロロ、N(エチル)₂、

【化 1 4】



からなる群より選択される 1 個または 2 個の部分であり、

R³ が水素またはメチルであり；そして

R⁵ が水素またはメチルである、

化合物。

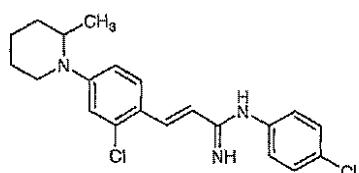
【請求項 1 4】

前記 R¹ が、親部分に対してパラ位にある、請求項 1 3 に記載の化合物。

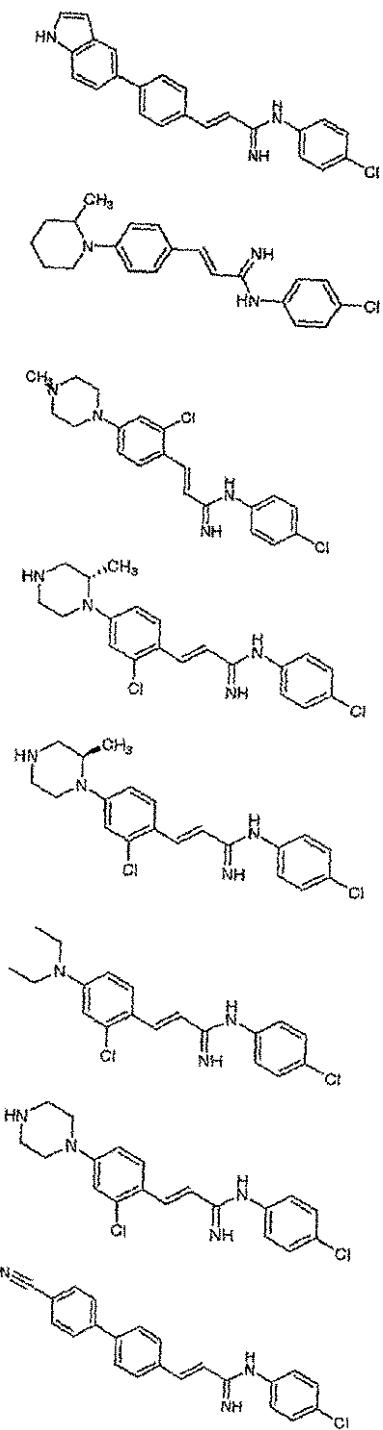
【請求項 1 5】

以下：

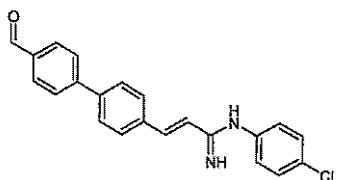
【化 1 5】



【化16】



【化17】

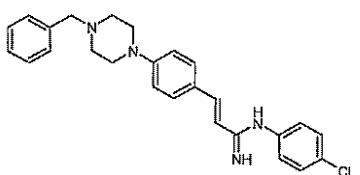
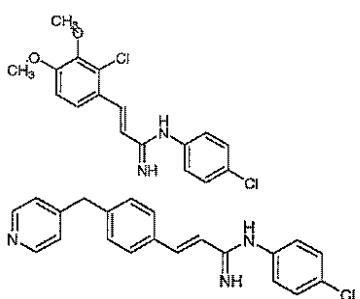
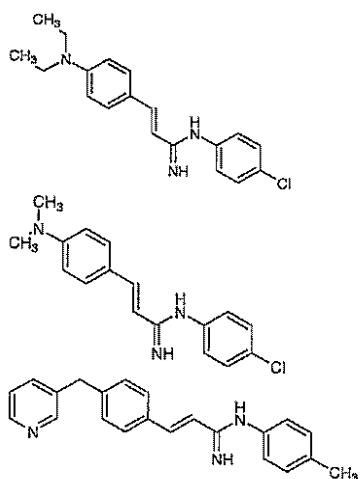


からなる群より選択される、式Iの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

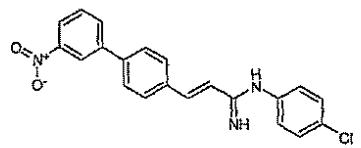
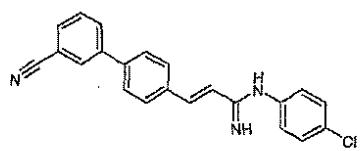
【請求項16】

以下：

【化18】



【化19】



からなる群より選択される、式Iの化合物、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物。

【請求項17】

代謝障害、摂食障害または糖尿病を処置するための組成物であって、治療有効量の少なくとも1つの請求項1に記載の化合物を含有する、組成物。

【請求項18】

代謝障害、摂食障害または糖尿病を処置するための組成物であって、治療有効量の少なく

とも 1 つの請求項 1 5 に記載の化合物を 含有 する、組成物。

【請求項 1 9】

前記摂食障害が、過食症である、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記代謝障害が、肥満である、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記摂食障害が、過食症である、請求項 1 8 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記代謝障害が、肥満である、請求項 1 8 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

肥満に関連する障害を処置するための組成物であって、治療有効量の少なくとも 1 つの請求項 1 に記載の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を 含有 する、組成物。

【請求項 2 4】

前記肥満に関連する障害が、ⅠⅠ型糖尿病、インスリン耐性、高脂血症または高血圧症の少なくとも 1 種である、請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

肥満に関連する障害を処置するための組成物であって、治療有効量の少なくとも 1 つの請求項 1 5 に記載の化合物、または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を 含有 する、組成物。

【請求項 2 6】

前記肥満に関連する障害が、ⅠⅠ型糖尿病、インスリン耐性、高脂血症または高血圧症の少なくとも 1 種である、請求項 2 5 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

強迫性障害、身体表現性障害、解離性障害、摂食障害、衝動調節障害、抜毛癖および自閉症からなる群より選択される障害を罹患したヒトを処置するための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項 1 に記載の化合物を 含有 する、組成物。

【請求項 2 8】

前記摂食障害が、拒食症、過食症および多食症からなる群より選択される、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

前記障害が、衝動調節障害であり、該衝動調節障害が、病的ギャンブル癖、強迫性購買および性的強迫からなる群より選択される、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 3 0】

強迫性障害、身体表現性障害、解離性障害、摂食障害、衝動調節障害、抜毛癖および自閉症からなる群より選択される障害を罹患したヒトを処置するための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項 1 5 に記載の化合物を 含有 する、組成物。

【請求項 3 1】

前記摂食障害が、拒食症、過食症および多食症からなる群より選択される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記障害が、衝動調節障害であり、該衝動調節障害が、病的ギャンブル癖、強迫性購買および性的強迫からなる群より選択される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

摂食障害を処置するための組成物であって、該組成物は、

ある量の第 1 の化合物であって、該第 1 の化合物は、請求項 1 に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第 1 の化合物；および

第 2 の化合物であって、該第 2 の化合物は、³アゴニスト、甲状腺ホルモン様剤、食欲抑制薬および NPY アンタゴニストからなる群より選択される肥満抑制薬および／または食欲抑制薬である、第 2 の化合物、

を含有し、

ここで、該第1の化合物および第2の化合物の量は、治療効果を生じる、組成物。

【請求項34】

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、治療有効量の：

第1の化合物であって、該第1の化合物は、請求項1に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第1の化合物；

第2の化合物であって、該第2の化合物は、³アゴニスト、甲状腺ホルモン様剤、食欲抑制薬およびNPYアンタゴニストからなる群より選択される肥満抑制薬および／または食欲抑制薬である、第2の化合物、ならびに

薬学的に受容可能なキャリア
を含む、薬学的組成物。

【請求項35】

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、治療有効量の：

第1の化合物であって、該第1の化合物は、請求項1に記載の化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物である、第1の化合物；

第2の化合物であって、該第2の化合物は、アルドースレダクターゼインヒビター、グリコーゲンホスホリラーゼインヒビター、ソルビトールデヒドロゲナーゼインヒビター、タンパク質チロシンホスファターゼ1Bインヒビター、ジペプチジルプロテアーゼインヒビター、インスリン、インスリン模倣物、メトホルミン、アカルボース、トログリタゾン、ロサグリタゾン、ピオグリタゾン、GW-1929、スルホニル尿素、グリバジド、グリブリドおよびクロルプロパミドからなる群より選択される、第2の化合物、ならびに

薬学的に受容可能なキャリア
を含む、薬学的組成物。

【請求項36】

少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて、治療有効量の少なくとも1つの請求項1に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項37】

少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアと組み合わせて、治療有効量の少なくとも1つの請求項15に記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項38】

少なくとも1つの請求項1に記載の化合物、および少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアを合わせる工程を包含する、薬学的組成物を作製するプロセス。

【請求項39】

少なくとも1つの請求項15に記載の化合物、および少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアを合わせる工程を包含する、薬学的組成物を作製するプロセス。

【請求項40】

ヒトD₁(hD₁)レセプターに対する前記化合物の結合親和性(Ki)が、ヒトD₅(hD₅)レセプターに対する該化合物の結合親和性(Ki)よりも大きく、[hD₅:Ki]/[hD₁:Ki]は、100よりも大きい、請求項1に記載の化合物。