

【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 6 月 6 日 (2019.6.6)

【公表番号】特表 2018-519253 (P2018-519253A)

【公表日】平成 30 年 7 月 19 日 (2018.7.19)

【年通号数】公開・登録公報 2018-027

【出願番号】特願 2017-556818 (P2017-556818)

【国際特許分類】

C 07D 401/04 (2006.01)

C 07D 405/14 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

A 61K 31/444 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

A 61K 31/4545 (2006.01)

A 61K 31/5355 (2006.01)

A 61K 31/4709 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 25/32 (2006.01)

A 61P 25/36 (2006.01)

A 61P 25/30 (2006.01)

A 61K 31/497 (2006.01)

C 07D 413/14 (2006.01)

【F I】

C 07D 401/04 C S P

C 07D 405/14

A 61K 31/4439

C 07D 401/14

A 61K 31/444

A 61K 31/506

A 61K 31/4545

A 61K 31/5355

A 61K 31/4709

A 61P 25/00

A 61P 25/18

A 61P 25/24

A 61P 25/22

A 61P 25/28

A 61P 25/20

A 61P 25/14

A 61P 25/32

A 61P 25/36

A 61P 25/30

A 6 1 K 31/497

C 0 7 D 413/14

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月22日(2019.4.22)

【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

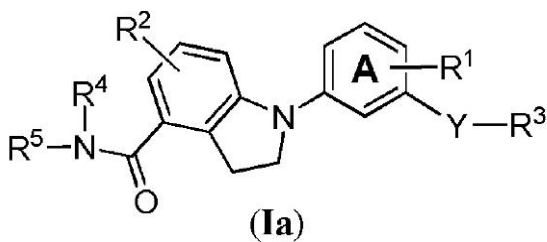
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I a) :

【化 1】



[式中、

Y は、 $-CH_2-$ 、 $-O-$ および $-S-$ から選択され；

環 A は、ピリジンジイルまたはピラジン - 2, 6 - ジイルであり；

 R^1 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり； R^2 は、H またはハロゲンであり；

R^3 は、アリーールまたはヘテロアリーールであり、ここで、各環は、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $C_1 \sim C_6$ アシルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、およびヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；該 $C_1 \sim C_6$ アルキルは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

 R^4 は、H であり；

R^5 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール - $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル - $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され；各基は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

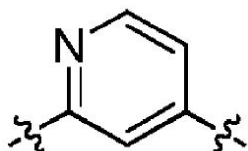
ここで、アリーールは、単環または 2 個の縮合環を含有することができ、少なくとも 1 個の環が芳香環である、6 ~ 10 個の炭素原子を含有する環系であり；ヘテロアリーールは、単環、2 個の縮合環または 3 個の縮合環を含んでいてよく、少なくとも 1 個の環が芳香環であり、少なくとも 1 個の環原子がヘテロ原子である、5 ~ 10 個の環原子を含有する環系である]

で示される化合物ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物および N - オキシドから選択される化合物。

【請求項 2】

環 A が

【化 2】

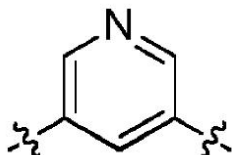


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

環 A が

【化 3】

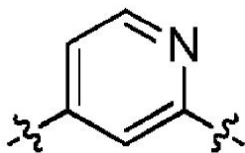


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

環 A が

【化 4】

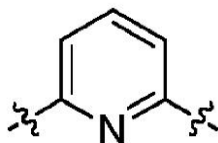


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

環 A が

【化 5】

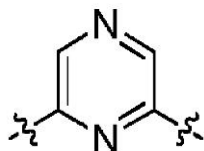


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

環 A が、式：

【化 6】



で示されるピラジン - 2, 6 - ジイルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が H または メチル である、請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 が H である、請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 9】

R^2 が H または フルオロ である、請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 10】

R^2 がHである、請求項1～8いずれか1項記載の化合物。

【請求項11】

R^3 が、アリールまたはヘテロアリールであり、ここで、各環が、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

R^3 が、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよいアリールであるか；または

R^3 が、クロロ、シアノ、フルオロ、メトキシ、メチル、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよいヘテロアリールであるか；または

R^3 が、1H-インドール-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル、ベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、フェニル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、キノリン-3-イル、およびキノリン-5-イルから選択され；ここで、各環が、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $C_1 \sim C_6$ アシルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、およびヒドロキシ- $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよく；ここで、該 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、およびオキソから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

R^3 が、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $C_1 \sim C_6$ アシルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、およびヒドロキシ- $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよいフェニルであり；ここで、該 $C_1 \sim C_6$ アルキルが、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、およびオキソから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

R^3 が、1H-インドール-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル、ベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、キノリン-3-イル、およびキノリン-5-イルから選択され；ここで、各環が、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、およびハロゲンから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

R^3 が、1H-インドール-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール-5-イル、ベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、フェニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、キノリン-3-イル、およびキノリン-5-イルから選択され；ここで、各環が、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

R^3 が、1H-インドール-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、3,

4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[b][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、ベンゾ[d][1, 3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；ここで、各環が、クロロ、シアノ、フルオロ、メトキシ、メチル、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよいか；または

R³が、1 H - インドール - 4 - イル、2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、2 - クロロピリミジン - 5 - イル、2 - メトキシピリミジン - 5 - イル、3 - ((ジメチルアミノ)メチル)フェニル、3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[b][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、3, 5 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル、3 - アセトキシフェニル、3 - アセチル - 4 - フルオロフェニル、3 - アセチルフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - メトキシフェニル、3 - シアノ - 4 - フルオロフェニル、3 - シアノ - 5 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル)フェニル、3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - フルオロ - 5 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - アセチル - 3 - フルオロフェニル、4 - アセチルフェニル、4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル、4 - エトキシ - 3 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (ヒドロキシメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (メチルカルバモイル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル、4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジフルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - フルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、5 - クロロピリジン - 3 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、6 - シアノピリジン - 3 - イル、6 - フルオロ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル、6 - メトキシピリジン - 3 - イル、ベンゾ[d][1, 3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択されるか；または

R³が、3 - ((ジメチルアミノ)メチル)フェニル、3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、3 - アセトキシフェニル、3 - アセチル - 4 - フルオロフェニル、3 - アセチルフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - メトキシフェニル、3 - シアノ - 4 - フルオロフェニル、3 - シアノ - 5 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル)フェニル、3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - フルオロ - 5 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - アセチル - 3 - フルオロフェニル、4 - アセチルフェニル、4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル、4 - エトキシ - 3 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (ヒドロキシメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (メチルカルバモイル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル、4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、および 4 - メトキシ - 3 - メチルフェニルから選択されるか；ま

たは

R^3 が、1 H - インドール - 4 - イル、2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、2 - クロロピリミジン - 5 - イル、2 - メトキシピリミジン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[b][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジフルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - フルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、5 - クロロピリジン - 3 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、6 - シアノピリジン - 3 - イル、6 - フルオロ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル、6 - メトキシピリジン - 3 - イル、ベンゾ[d][1, 3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択される、請求項 1 ~ 10 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 12】

R^3 が、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよいフェニルである、請求項 1 ~ 10 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 13】

R^5 が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール - $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル - $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され；各基が、2 - ヒドロキシエトキシ、2 - ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

R^5 が、H、(オキセタン - 3 - イル)メチル、1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - ヒドロキシブタン - 2 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (イミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、3 - ヒドロキシプロピル、エチル、2 - ヒドロキシエチル、メチル、ピペリジン - 3 - イル、ピペリジン - 4 - イル、プロパン - 2 - イル、プロピル、ピリジン - 4 - イル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択され；各基が、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

R^5 が、H、(3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)メチル、(ジメチルアミノ)エチル、1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル、1, 3 - ジヒドロキシブタン - 2 - イル、1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル、1, 3 - ジメトキシプロパン - 2 - イル、1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル、2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2, 3 - ジヒドロキシプロピル、2 - アセトアミドエチル、2 - シアノエチル、2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、2 - フルオロエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジ

ン - 4 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、2 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシプロピル、2 - モルホリノエチル、2 - オキソピロリジン - 3 - イル、2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、3 - (ジメチルアミノ) - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - (メチルアミノ) - 3 - オキソプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロピル、6 - オキソピペリジン - 3 - イル、シアノメチル、メチル、ピリジン - 4 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択されるか；または

R⁵が、H、(2 R, 3 S) - 1, 3 - ジヒドロキシブタン - 2 - イル、(3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)メチル、(ジメチルアミノ)エチル、(R) - 2, 3 - ジヒドロキシプロピル、(R) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(R) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 2, 3 - ジヒドロキシプロピル、(S) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(S) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 3, 3, 3 - トリフルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル、1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル、1, 3 - ジメトキシプロパン - 2 - イル、1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル、2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - アセトアミドエチル、2 - シアノエチル、2 - フルオロエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - モルホリノエチル、3 - (ジメチルアミノ) - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - (メチルアミノ) - 3 - オキソプロピル、3 - ヒドロキシプロピル、6 - オキソピペリジン - 3 - イル、シアノメチル、メチル、およびピリジン - 4 - イルから選択される、

請求項 1 ~ 12 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 14】

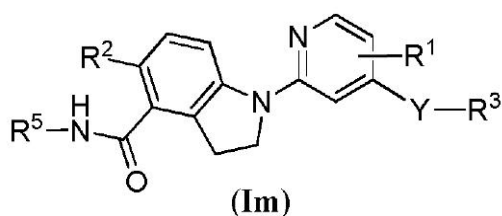
R⁵が、H、(オキセタン - 3 - イル)メチル、1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - ヒドロキシブタン - 2 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (イミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、3 - ヒドロキシプロピル、エチル、2 - ヒドロキシエチル、メチル、ピペリジン - 3 - イル、ピペリジン - 4 - イル、プロパン - 2 - イル、プロピル、ピリジン - 4 - イル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択され；各基が、2 - ヒドロキシエトキシ、2 - ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されている、

請求項 1 ~ 12 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 15】

式 (I m)：

【化 7】



[式中、

Y は、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-$ および $-\text{S}-$ から選択され；

R^1 は、H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

R^2 は、H またはハロゲンであり；

R^3 は、アリーールまたはヘテロアリーールであり、ここで、各環は、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

R^5 は、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、およびヒドロキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルから選択され；各基は、2-ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

Y は、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{O}-$ および $-\text{S}-$ から選択され；

R^1 は、H または $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり；

R^2 は、H またはハロゲンであり；

R^3 は、1H-インドール-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン-7-イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキサール-5-イル、ベンゾフラン-2-イル、ベンゾフラン-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、イソオキサゾール-4-イル、フェニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-5-イル、キノリン-3-イル、およびキノリン-5-イルから選択され；ここで、各環は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アシル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アシルオキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルカルボキサミド、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、シアノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、およびヒドロキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；ここで、該 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルは、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルアミノ、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ ジアルキルアミノ、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

R^5 は、H、(オキセタン-3-イル)メチル、1H-ピラゾール-4-イル、1-ヒドロキシブタン-2-イル、2-(1H-イミダゾール-1-イル)エチル、2-(1H-イミダゾール-5-イル)エチル、2-(イミダゾリジン-1-イル)エチル、2-(ピリジン-2-イル)エチル、2-(ピリジン-3-イル)エチル、2-(ピリジン-4-イル)エチル、2-(ピロリジン-1-イル)エチル、2-ヒドロキシプロピル、3-ヒドロキシプロパン-2-イル、3-ヒドロキシプロピル、エチル、2-ヒドロキシエチル、メチル、ペリジン-3-イル、ペリジン-4-イル、プロパン-2-イル、プロピル、ピリジン-4-イル、ピロリジン-3-イル、およびテトラヒドロフラン-3-イルから選択され；各基は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルカルボキサミド、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、シアノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルアミノ、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ ジアルキルアミノ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルコキシ、ヒドロキシ- $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

Y は、 $-CH_2-$ 、 $-O-$ および $-S-$ から選択され；

R^1 は H またはメチルであり；

R^2 は H またはフルオロであり；

R^3 は、1 H - インドール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[*b*][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、ベンゾ[*d*][1, 3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、フェニル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；ここで、各環は、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

R^5 は、H、(オキセタン - 3 - イル)メチル、1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - ヒドロキシブタン - 2 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (イミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、3 - ヒドロキシプロピル、エチル、2 - ヒドロキシエチル、メチル、ペリジン - 3 - イル、ペリジン - 4 - イル、プロパン - 2 - イル、プロピル、ピリジン - 4 - イル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択され；各基は、2 - ヒドロキシエトキシ、2 - ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

Y は、 $-CH_2-$ 、 $-O-$ および $-S-$ から選択され；

R^1 は H またはメチルであり；

R^2 は H またはフルオロであり；

R^3 は、1 H - インドール - 4 - イル、2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、2 - クロロピリミジン - 5 - イル、2 - メトキシピリミジン - 5 - イル、3 - ((ジメチルアミノ)メチル)フェニル、3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[*b*][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、3, 5 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル、3 - アセトキシフェニル、3 - アセチル - 4 - フルオロフェニル、3 - アセチルフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - メトキシフェニル、3 - シアノ - 4 - フルオロフェニル、3 - シアノ - 5 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル)フェニル、3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - フルオロ - 5 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - アセチル - 3 - フルオロフェニル、4 - アセチルフェニル、4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル、4 - エトキシ - 3 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (ヒドロキシメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (メチルカルバモイル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル、4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジフルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - フルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ

- 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、5 - クロロピリジン - 3 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、6 - シアノピリジン - 3 - イル、6 - フルオロ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル、6 - メトキシピリジン - 3 - イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；

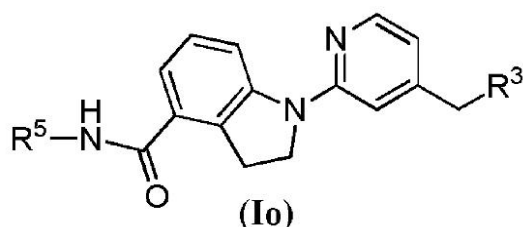
R⁵は、H、(2R,3S) - 1,3 - ジヒドロキシブタン - 2 - イル、(3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)メチル、(ジメチルアミノ)エチル、(R) - 2,3 - ジヒドロキシプロピル、(R) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(R) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 2,3 - ジヒドロキシプロピル、(S) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(S) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 3,3,3 - トリフルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル、1,3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル、1,3 - ジメトキシプロパン - 2 - イル、1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、2 - (1H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル、2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - アセトアミドエチル、2 - シアノエチル、2 - フルオロエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - モルホリノエチル、3 - (ジメチルアミノ) - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - (メチルアミノ) - 3 - オキソプロピル、3 - ヒドロキシプロピル、6 - オキソピペリジン - 3 - イル、シアノメチル、メチル、およびピリジン - 4 - イルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項16】

式(Io)：

【化8】



[式中、

R³は、アリールまたはヘテロアリールであり、ここで、各環は、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよく；

R⁵は、H、C₁~C₆アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール - C₁~C₆アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル - C₁~C₆アルキル、およびヒドロキシ - C₁~C₆アルキルから選択され；各基は、2 - ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、

オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、1 H - インドール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[*b*][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、ベンゾ[*d*][1, 3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、フェニル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；ここで、各環は、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $C_1 \sim C_6$ アシルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、およびヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキルから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；ここで、該 $C_1 \sim C_6$ アルキルは、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよく；

R^5 は、H、(オキセタン - 3 - イル)メチル、1 H - ピラゾール - 4 - イル、1 - ヒドロキシブタン - 2 - イル、2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1 H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (イミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、3 - ヒドロキシプロピル、エチル、2 - ヒドロキシエチル、メチル、ペリジン - 3 - イル、ペリジン - 4 - イル、プロパン - 2 - イル、プロピル、ピリジン - 4 - イル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択され；各基は、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim C_6$ ジアルキルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ - $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびオキソから独立して選択される 1 個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、1 H - インドール - 4 - イル、2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、2 - クロロピリミジン - 5 - イル、2 - メトキシピリミジン - 5 - イル、3 - ((ジメチルアミノ)メチル)フェニル、3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[*b*][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル、3, 5 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル、3 - アセトキシフェニル、3 - アセチル - 4 - フルオロフェニル、3 - アセチルフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - メトキシフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - メトキシフェニル、3 - シアノ - 4 - フルオロフェニル、3 - シアノ - 5 - フルオロフェニル、3 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル)フェニル、3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル、3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - フルオロ - 5 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - アセチル - 3 - フルオロフェニル、4 - アセチルフェニル、4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル、4 - クロロ - 3 - メトキシフェニル、4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル、4 - エトキシ - 3 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (ヒドロキシメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (メチルカルバモイル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシフェニル、4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル、4 - メトキシ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、4 - メトキシ - 3 - メチルフェニル、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル、5, 6 - ジフルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ - 6 - フルオロピリジン - 3 - イル、5 - クロロ

- 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、5 - クロロピリジン - 3 - イル、5 - フルオロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル、6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル、6 - シアノピリジン - 3 - イル、6 - フルオロ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル、6 - メトキシピリジン - 3 - イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；

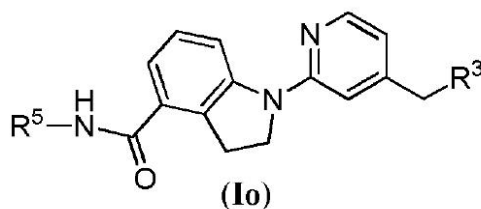
R⁵は、H、(2R,3S) - 1,3 - ジヒドロキシブタン - 2 - イル、(3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)メチル、(ジメチルアミノ)エチル、(R) - 2,3 - ジヒドロキシプロピル、(R) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(R) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(R) - 2 - ヒドロキシプロピル、(R) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(R) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 2,3 - ジヒドロキシプロピル、(S) - 2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、(S) - 2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、(S) - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 2 - オキソピロリジン - 3 - イル、(S) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル、(S) - 3,3,3 - トリフルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - 3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、(S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル、1,3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル、1,3 - ジメトキシプロパン - 2 - イル、1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピペリジン - 4 - イル、2 - (1H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル、2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - アセトアミドエチル、2 - シアノエチル、2 - フルオロエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - モルホリノエチル、3 - (ジメチルアミノ) - 2 - ヒドロキシプロピル、3 - (メチルアミノ) - 3 - オキソプロピル、3 - ヒドロキシプロピル、6 - オキソピペリジン - 3 - イル、シアノメチル、メチル、およびピリジン - 4 - イルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項17】

式(Io)：

【化9】



[式中、

R³は、1H - インドール - 4 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル、3,4 - ジヒドロ - 2H - ベンゾ[b][1,4]ジオキセピン - 7 - イル、ベンゾ[d][1,3]ジオキソール - 5 - イル、ベンゾフラン - 2 - イル、ベンゾフラン - 5 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、フェニル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、キノリン - 3 - イル、およびキノリン - 5 - イルから選択され；ここで、各環は、アセトキシ、アセチル、クロロ、シアノ、(ジメチルアミノ)メチル、エトキシ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルカルバモイル、トリフルオロメトキシ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよく；

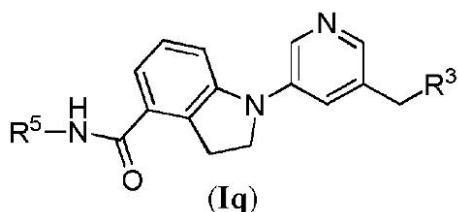
R^5 は、H、(オキセタン - 3 - イル)メチル、1H - ピラゾール - 4 - イル、1 - ヒドロキシブタン - 2 - イル、2 - (1H - イミダゾール - 1 - イル)エチル、2 - (1H - イミダゾール - 5 - イル)エチル、2 - (イミダゾリジン - 1 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル、2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル、2 - (ピロリジン - 1 - イル)エチル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル、3 - ヒドロキシプロピル、エチル、2 - ヒドロキシエチル、メチル、ピペリジン - 3 - イル、ピペリジン - 4 - イル、プロパン - 2 - イル、プロピル、ピリジン - 4 - イル、ピロリジン - 3 - イル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択され；各基は、2 - ヒドロキシエトキシ、2 - ヒドロキシエチル、アセトアミド、シアノ、ジメチルアミノ、フルオロ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、メトキシ、メチル、メチルアミノ、オキソ、およびトリフルオロメチルから独立して選択される1個以上の基で置換されているもよい]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項18】

式(Iq)：

【化10】



[式中、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されているもよいアリールであり；

R^5 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびヘテロシクリルから選択され； $C_1 \sim C_6$ アルキルは、ヒドロキシルで置換されているもよい；または

式中、

R^3 は、トリフルオロメチルで置換されているもよいフェニルであり；

R^5 は、H、メチル、エチル、およびテトラヒドロフラン-3-イルから選択され；エチルは、ヒドロキシルで置換されているもよい；または

式中、

R^3 は、3-(トリフルオロメチル)フェニルであり；

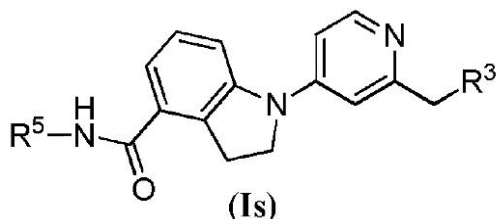
R^5 は、H、メチル、2 - ヒドロキシエチル、およびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項19】

式(Is)：

【化11】



[式中、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、およびハロゲンから独立して選択される1個以上の基で置換されているもよいアリールであり；

R^5 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、およびヘテロシクリルから選択され； $C_1 \sim C_6$ アルキルおよびヘテロシクリルは、各々、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシル、およびオキソから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、アセチル、メトキシ、トリフルオロメチル、クロロ、およびフルオロから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよいフェニルであり；

R^5 は、H、エチル、ピロリジニル、およびテトラヒドロフラニルから選択され；エチルおよびピロリジニルは、各々、メトキシ、フルオロ、ヒドロキシル、およびオキソから独立して選択される1個以上の基で置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - アセチルフェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、および3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニルから選択され；

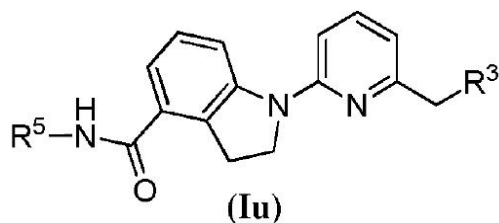
R^5 は、H、2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、2 - オキソピロリジン - 3 - イル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、2 - フルオロエチル、および2 - ヒドロキシアチルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項20】

式(Iu)：

【化12】



[式中、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されていてもよいアリールであり；

R^5 は、Hおよびヘテロシクリルから選択されるか；または

式中、

R^3 は、トリフルオロメチルで置換されていてもよいフェニルであり；

R^5 は、Hおよびテトラヒドロフラニルから選択されるか；または

式中、

R^3 は、3 - (トリフルオロメチル)フェニルであり；

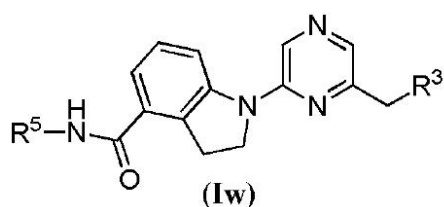
R^5 は、Hおよびテトラヒドロフラン - 3 - イルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項21】

式(Iw)：

【化13】



[式中、

R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されていてもよいアリールであり；

R^5 は、Hおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され； $C_1 \sim C_6$ アルキルは、ヒドロキシルで置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、トリフルオロメチルで置換されていてもよいフェニルであり；

R^5 は、Hおよびエチルから選択され；エチルは、ヒドロキシルで置換されていてもよい；または

式中、

R^3 は、3 - (トリフルオロメチル)フェニルであり；

R^5 は、Hおよび2 - ヒドロキシエチルから選択される]

で示される化合物ならびにその薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項22】

以下の化合物ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物および水和物から選択される、請求項1記載の化合物：

1 - (6 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

(S) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (6 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

(S) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (2 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

(S) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (2 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

(S) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - メチル - 1 - (5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

(S) - 3 - (4 - (テトラヒドロフラン - 3 - イルカルバモイル)インドリン - 1 - イル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン 1 - オキシド；

3 - (4 - カルバモイルインドリン - 1 - イル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン 1 - オキシド；

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3, 5 - ジフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3, 5 - ジフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3, 5 - ジフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - メチルインドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (6 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - メチル - 1 - (6 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン -

2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(S) - 1 - (4 - (3, 5 - ジフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (テトラヒドロフラン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - シアノエチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(R) - N - (2, 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(S) - N - (2, 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェノキシ)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェノキシ)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(R) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (シアノメチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)フェニルチオ)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(S) - N - (2, 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
(R) - N - (2, 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - (ジメチルアミノ)エチル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - (ジメチルアミノ)エチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (6 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピラジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (6 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピラジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - ((6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - ((6 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;
1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒド

ロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - (ジメチルアミノ)エチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((5 - クロロピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - ((5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((5, 6 - ジフルオロピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((6 - フルオロ - 5 - メチルピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((2 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 4 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((5 - クロロ - 6 - フルオロピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - アセチルベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - メトキシ - 3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - (メチルカルバモイル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - シアノ - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - アセチル - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - (ヒドロキシメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - (トリフルオロメトキシ)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - シアノ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 -

カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - フルオロ - 5 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((2 - メトキシピリミジン - 5 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((2 - クロロピリミジン - 5 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - アセチル - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - アセチルベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((2, 3 - ジヒドロベンゾフラン - 5 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - アセチル - 4 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - ((ジメチルアミノ)メチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (4 - アセチル - 3 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((5 - フルオロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((5 - クロロ - 6 - メトキシピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((6 - メトキシピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - ((6 - シアノピリジン - 3 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (4 - シアノ - 3 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド；

N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - モルホリノエチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ピロリジン - 1 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((3, 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ[b][1, 4]ジオキセピン - 7 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - メトキシ - 3 - メチルベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾ[d][1, 3]ジオキソール - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

3 - ((2 - (4 - カルバモイルインドリン - 1 - イル)ピリジン - 4 - イル)メチル)フェニルアセテート ;

1 - (4 - (フラン - 2 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (フラン - 3 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

5 - フルオロ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

5 - フルオロ - N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペリジン - 4 - イル) - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - エトキシ - 3 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (キノリン - 3 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (キノリン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (4 - クロロ - 3 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3, 4 - ジフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロ

ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾフラン - 2 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - ((1 H - インドール - 4 - イル)メチル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

5 - フルオロ - 1 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 2 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 3 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシ - 2 - (ピリジン - 4 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (6 - オキソピペリジン - 3 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - アセトアミドエチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1 , 3 - ジメトキシプロパン - 2 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - ((2 R , 3 S) - 1 , 3 - ジヒドロキシブタン - 2 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル)エチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

5 - フルオロ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (1 , 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 5 - フルオロ - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - ト

(R) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 , 4 , 5 - トリフル

オロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - 5 - フルオロ - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (3 - メチル - 4 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - オキソピロリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (3 - (メチルアミノ) - 3 - オキソプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - (4 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - オキソピロリジン - 3 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (2 - (3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (2 - (3 - アセチルベンジル)ピリジン - 4 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (2 - (3 - クロロ - 5 - フルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (2 - (4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピリジン - 4 - イル) - N - (2 - ヒドロキシエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - フルオロエチル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - オキソピロリジン - 3 - イル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (2 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 4 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(S) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - 1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

(R) - N - (2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル) - 1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - フルオロエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - ((3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)メチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシベンジル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

N - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル) - 1 - (4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)ピリジン - 2 - イル)インドリン - 4 - カルボキサミド ;

1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ)エチル)インドリン - 4 - カルボキサミド ; および

1 - (4 - (ベンゾフラン - 5 - イルメチル)ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - フルオロエチル)インドリン - 4 - カルボキサミド。

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 2 2 いずれか 1 項記載の化合物および薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 2 2 いずれか 1 項記載の化合物および薬学的に許容される担体を混合する工程を含む、医薬組成物の調製方法。

【請求項 2 5】

個体における錐体外路障害または運動障害の治療または予防のための ; または

個体における精神病性障害の治療または予防のための ; または

個体における気分障害、うつ病性障害、または、双極性または関連障害の治療または予防のための ; または

個体における注意欠陥障害 (ADHD)、不安症、強迫性障害 (OCD)、または自閉症スペクトラム症の治療または予防のための ; または

個体におけるプロラクチン関連障害の治療または予防のための ; または

個体における神経認知障害の治療または予防のための；または

個体における外傷またはストレッサー関連障害；秩序破壊的・衝動制御・素行症；または睡眠覚醒障害の治療または予防のための；または

個体における物質関連障害、嗜癮性障害または行動障害の治療または予防のための；または

個体における前頭葉機能低下の治療または予防のための；または

個体における隆起漏斗系経路、中脳辺縁系経路、中間皮質系経路または黒質線条体系経路の異常の治療または予防のための；または

個体における線条体の活性を増加させるための；または

個体における皮質機能を向上させるための；または

個体における神経認知機能を向上させるための

請求項 2 3 記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

錐体外路障害または運動障害が、アカシジア、関連運動、アテトーシス、運動失調、パリスムス、ヘミパリスムス、舞蹈病、ハンチントン病、舞蹈アテトーシス、ジスキネジア、遅発性ジスキネジア、神経遮断薬誘導性ジスキネジア、ミオクロヌス、鏡像運動症、発作性運動誘発性ジスキネジア、下肢静止不能症候群、攣縮、常同運動症、常同症、チック症、トゥレット症候群、振戦、およびウィルソン病から選択されるか；または

錐体外路障害または運動障害が運動性障害であるか；または

錐体外路障害または運動障害が運動過剰性運動障害であるか；または

錐体外路障害または運動障害の治療または予防が錐体外路症候群の治療または予防を含むか；または

精神病性障害が、統合失調型パーソナリティ障害、妄想性障害、短期精神病性障害、統合失調症様障害、統合失調症、統合失調感情障害、および物質または医薬品誘発性精神病性障害から選択されるか；または

精神病性障害の治療または予防が統合失調症の陽性症状の治療または予防を含むか；または

精神病性障害の治療または予防が統合失調症の陰性症状の治療または予防を含むか；または

精神病性障害が、妄想、幻覚、解体型思考、著しく解体した運動行動または異常な運動行動、および陰性症状から選択される統合失調症スペクトラムドメインを含むか；または

精神病性障害がカタトニアによって特徴付けられるか；または

うつ病性障害が大うつ病性障害であるか；または

双極性または関連障害が、双極性障害 I 型、双極性障害 I I 型、気分循環性障害、物質または医薬品誘発性双極性および関連障害、および別の医学的症状に起因する双極性および関連障害から選択されるか；または

不安症が、分離不安症、選択的無言症、特定恐怖症、社会不安症、パニック症、広場恐怖症、全般不安症、物質または医薬品誘発性不安症、および別の医学的症状に起因する不安症から選択されるか；または

プロラクチン関連障害が高プロラクチン血症であるか；または

神経認知障害が、譫妄、大神経認知障害、および小神経認知障害から選択されるか；または

神経認知障害が、健忘症、認知症、および譫妄から選択されるか；または

外傷またはストレッサー関連障害が心的外傷後ストレス障害（PTSD）であるか；または

物質が、アルコール、カフェイン、大麻、幻覚薬、吸入剤、オピオイド、鎮静薬、睡眠薬、抗不安薬、刺激薬、およびタバコから選択されるか；または

前頭葉機能低下が、統合失調症、注意欠陥多動障害（ADHD）、双極性障害、および大うつ病性障害から選択される少なくとも 1 つの障害に関連するか；または

皮質機能が、実行機能、注意力、および記憶から選択されるか；または

神経認知機能が、複雑性注意、実行機能、学習および記憶、言語、知覚運動、および社会的認知から選択される少なくとも1つのドメインである、
請求項25記載の医薬組成物。

【請求項27】

運動性障害が、発達性協調運動症、常同運動症、およびチック症から選択されるか；または

運動過剰性運動障害が、ハンチントン病、ウイルソン病、下肢静止不能症候群、脳卒中後作用、および歯状核赤核淡蒼球ルイ体萎縮症から選択されるか；または

陽性症状が、妄想、幻覚、解体型思考、および著しく解体した運動行動または異常な運動行動から選択されるか；または

陰性症状が、感情表出の低下、意欲消失、アロギー、快感消失、および反社会性から選択される、

請求項26記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0181

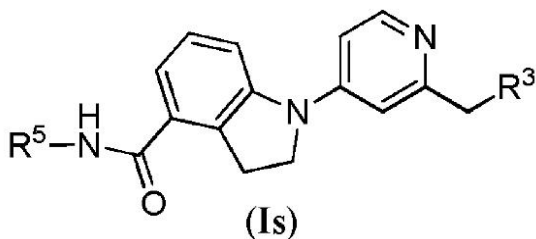
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0181】

本発明の一の態様は、式(Is)：

【化26】



[式中、

R³は、3-(トリフルオロメチル)フェニル、3-アセチルフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-5-フルオロフェニル、4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル、および3-フルオロ-4-メトキシフェニルから選択され；

R⁵は、H、2-フルオロ-3-ヒドロキシプロピル、2-ヒドロキシ-3-メトキシプロピル、2-オキソピロリジン-3-イル、2-ヒドロキシプロピル、3-フルオロ-2-ヒドロキシプロピル、テトラヒドロフラン-3-イル、2-フルオロエチル、および2-ヒドロキシエチルから選択される]

で示される化合物ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN-オキシドに関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0488

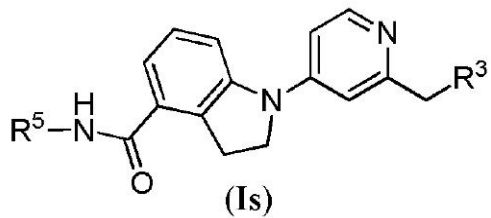
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0488】

x l i x) 式(Is)：

【化 5 4】



[式中、

R^3 は、3 - (トリフルオロメチル)フェニル、3 - アセチルフェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、3 - クロロ - 5 - フルオロフェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル、および3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニルから選択され；

R^5 は、H、2 - フルオロ - 3 - ヒドロキシプロピル、2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシプロピル、2 - オキソピロリジン - 3 - イル、2 - ヒドロキシプロピル、3 - フルオロ - 2 - ヒドロキシプロピル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、2 - フルオロエチル、および2 - ヒドロキシエチルから選択される]

で示される化合物ならびにそれらの薬学的に許容される塩、溶媒和物、水和物およびN - オキシドから選択される、i)に記載の化合物。