

【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26年3月13日(2014.3.13)

【公表番号】特表2013-522165(P2013-522165A)

【公表日】平成25年6月13日(2013.6.13)

【年通号数】公開・登録公報2013-030

【出願番号】特願2012-541257(P2012-541257)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/06 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/4525 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 405/06 C S P

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 471/06

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 0 4 A

C 0 7 D 471/04 1 0 6 A

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/4525

A 6 1 K 31/55
 A 6 1 K 31/553
 A 6 1 K 31/498
 C 0 7 D 495/04 1 0 3
 A 6 1 P 25/18
 C 0 7 D 471/04 1 0 8 A

【手続補正書】

【提出日】平成26年1月23日(2014.1.23)

【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

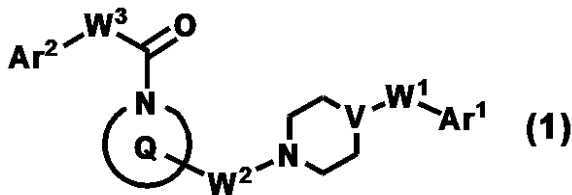
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式(1)で表される化合物またはその医薬上許容される塩。

【化 1】



[式中、 Ar^1 及び Ar^2 は、それぞれ独立して、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基または置換されていてもよいヘテロアリール基であり；

V は、 $\underline{CR^3}$ （ここにおいて、 R^3 は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり；

W^1 は、単結合、酸素原子、硫黄原子、 $-C(O)-$ または $-NR^2-$ （ここにおいて、 R^2 は、水素原子または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり、

V が CR^3 の場合のピペリジン環は、それぞれ独立して、置換可能な位置で、水酸基、ハロゲン基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基および C_{1-6} アルコキシ基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基で置換されていてもよく；

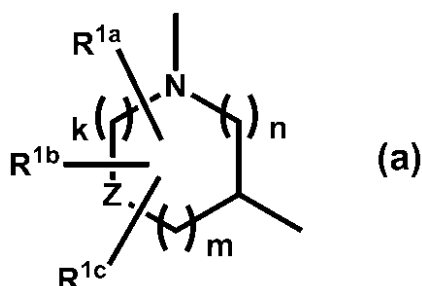
W^2 は、置換されていてもよいエチレン基であり；

W^3 は、単結合、酸素原子、硫黄原子、 $-NH-$ 、置換されていてもよいメチレン基、置換されていてもよいエチレン基、または $-CR^4=CR^5-$ （ここにおいて、 R^4 および R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり；

環 Q は、

下記式(a)

【化 2】



で表される基であり、ここにおいて、

n は 0 であり；

m は 0、1 または 2 であり；

k は 1、2 または 3 であり；

Z は単結合、メチレン基、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ または $-NR^{21}-$ （ここにおいて、 R^{21} は、水素原子または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり；

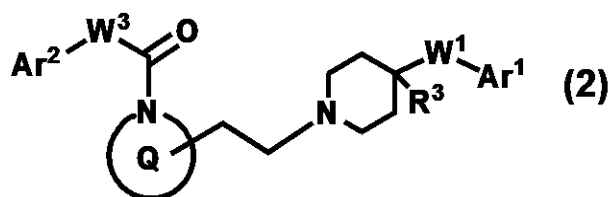
R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、それぞれ同一又は異なって、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシ基、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{7-14} アラルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールオキシ基、置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシ基、置換されていてもよい C_{7-14} アラルキルオキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニルアミノ基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニルアミノ基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、置換されていてもよいアミノカルボニルオキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアミノカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアミノスルホニルアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルスルホニルアミノ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールスルホニルアミノ基、置換されていてもよい飽和複素環スルホニルアミノ基、または置換されていてもよいヘテロアリールスルホニルアミノ基であるが、

あるいは、 R^{1a} および R^{1b} が連結し、これらが結合する炭素原子と一緒に、 C_{3-7} シクロアルキル環、または飽和複素環（ここに、該 C_{3-7} シクロアルキル環および飽和複素環は、水酸基、ハロゲン基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{6-10} アリール基、ヘテロアリール基および 4 員～7 員の飽和複素環基からなる群から選ばれる 1 つまたは同一もしくは異なる 2 つ以上の基で置換されていてもよい。）を形成してもよい。]

【請求項 2】

下記式 (2) で表される、請求項 1 に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【化 3】



[式中、 Ar^1 及び Ar^2 は、それぞれ独立して、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基または置換されていてもよいヘテロアリール基であり；

W^1 は、単結合または $-C(O)-$ であり；

W^3 は、単結合、置換されていてもよいメチレン基、置換されていてもよいエチレン基

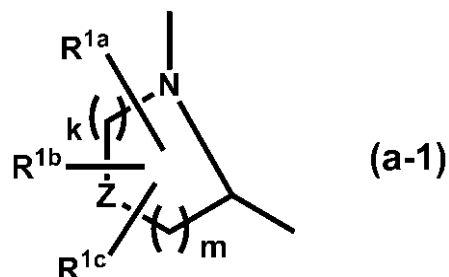
、または $-C R^4 = C R^5 -$ （ここにおいて、 R^4 および R^5 は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン原子または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり；

R^3 は、水素原子、水酸基、ハロゲン原子またはシアノ基であり；

環Qは、

下記式（a - 1）

【化4】



で表される基であり、ここにおいて、

m は0、1または2であり；

k は1、2または3であり；

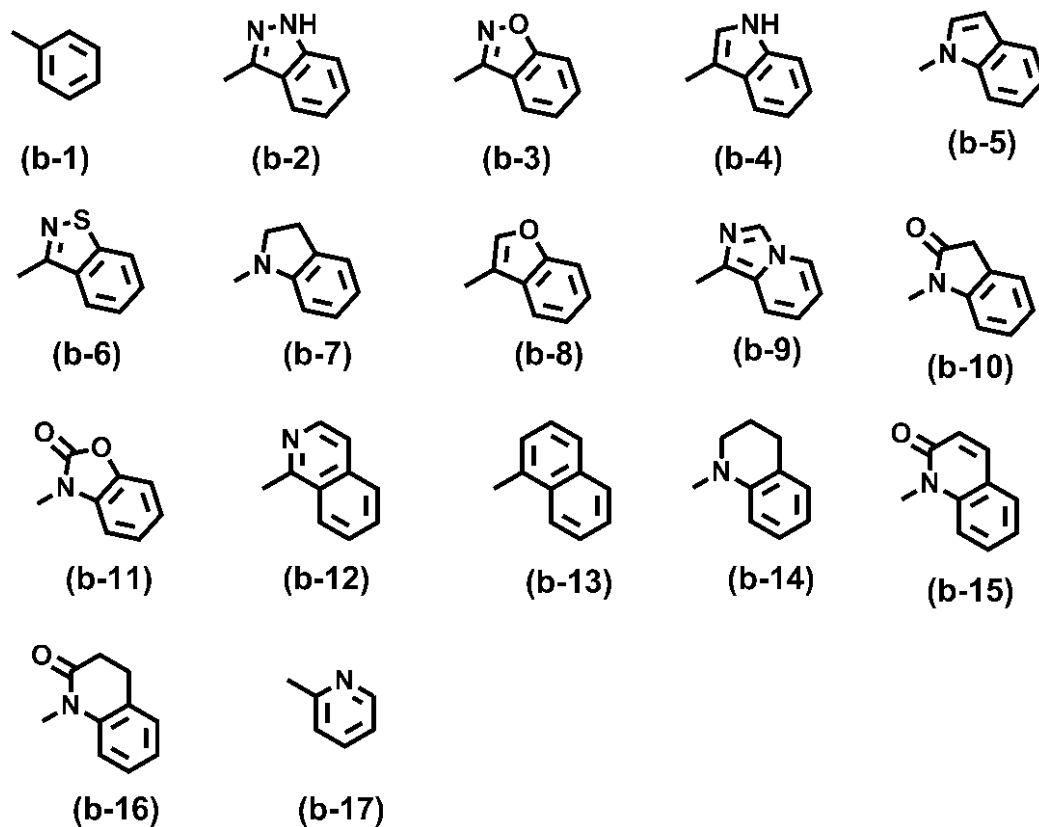
Z は単結合、メチレン基、酸素原子、または $-N R^{21} -$ （ここにおいて、 R^{21} は、水素原子または置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基である。）であり；

R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、請求項1に記載のものと同義である。]

【請求項3】

$A r^1$ が下記式（b - 1）～（b - 17）：

【化5】



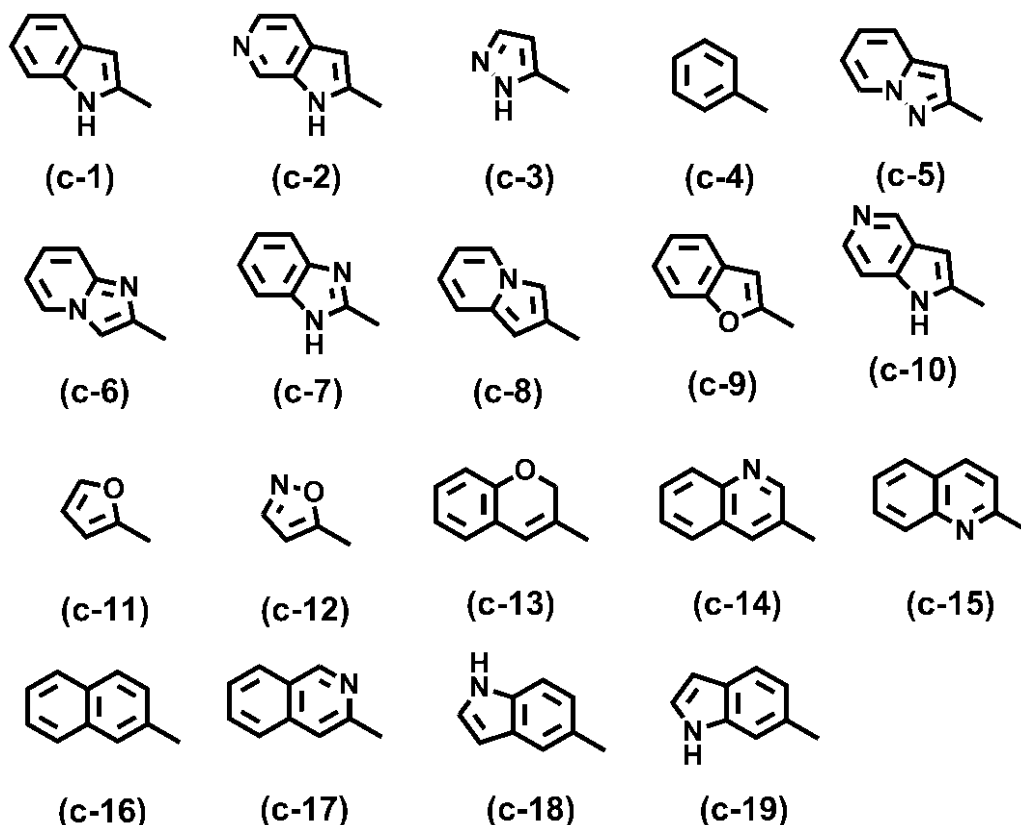
で表される基のいずれかであり、ここにおいて、式（b - 1）～（b - 17）で表される基の炭素原子はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基および C_{1-6} アルコキシ基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基により置換され

ていてもよい、請求項 1 又は 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 4】

Ar^2 が下記式 (c-1) ~ (c-19) :

【化 6】



で表される基のいずれかであり、

ここにおいて、式 (c-1) ~ (c-19) で表される基の炭素原子は、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシ基、置換されていてもよいアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{7-14} アラルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールオキシ基、置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニルアミノ基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルアミノ基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアミノカルボニルアミノ基、置換されていてもよいアミノスルホニルアミノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニル基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、

置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環オキシカルボニル基、置換されていてもよいアミノカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールスルホニル基、置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル基、置換されていてもよい飽和複素環スルホニルおよび置換されていてもよいアミノスルホニル基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基により置換されていてもよく；

式(c-1)～(c-19)で表される基のNHは、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{7-14} アラルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環オキシカルボニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニル基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニル基、置換されていてもよいアミノカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールスルホニル基、置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル基、置換されていてもよい飽和複素環スルホニルおよび置換されていてもよいアミノスルホニル基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基により置換されていてもよい、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項5】

式(c-1)～(c-19)で表される基の炭素原子が、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{7-14} アラルキル基、置換されていてもよいヘテロアリール C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルチオ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニル基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニル基、置換されていてもよいアミノカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールスルホニル基、置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル基、置換されていてもよい飽和複素環スルホニルおよび置換されていてもよいアミノスルホニル基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基で置換されていてもよく；

式(c-1)～(c-19)で表される基のNHが、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキルカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシカルボニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシカルボニル基、置換されていてもよい飽和

複素環オキシカルボニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールカルボニル基、置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル基、置換されていてもよい飽和複素環カルボニル基、置換されていてもよいアミノカルボニル基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキルスルホニル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールスルホニル基、置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル基、置換されていてもよい飽和複素環スルホニル基および置換されていてもよいアミノスルホニル基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基で置換されていてもよい、請求項4に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項6】

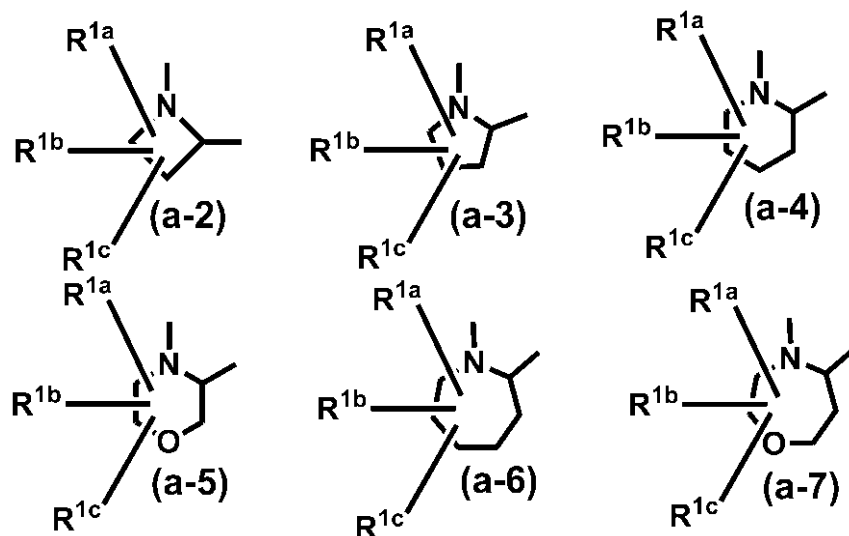
R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} が、それぞれ同一又は異なって、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、シアノ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{7-14} アラールキル基、置換されていてもよいヘテロアリール C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい飽和複素環 C_{1-4} アルキル基、置換されていてもよい C_{6-10} アリール基、置換されていてもよいヘテロアリール基、置換されていてもよい飽和複素環基、置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルコキシ基、置換されていてもよい C_{6-10} アリールオキシ基、置換されていてもよいヘテロアリールオキシ基、置換されていてもよい飽和複素環オキシ基、置換されていてもよい C_{7-14} アラールキルオキシ基、置換されていてもよい C_{1-6} アルキルカルボニルオキシ基、または置換されていてもよいアミノカルボニルオキシ基であるか、

あるいは、 R^{1a} および R^{1b} が連結し、これらが結合する炭素原子と一緒に、 C_{3-7} シクロアルキル環、または飽和複素環（該 C_{3-7} シクロアルキル環および飽和複素環は、水酸基、ハロゲン基およびシアノ基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基で置換されていてもよい。）を形成してもよい、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項7】

環Qが、下記式（a-2）～（a-7）：

【化7】

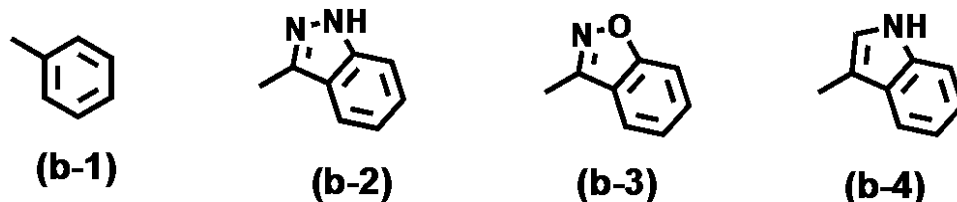


（ここにおいて、 R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、請求項6に記載のものと同義である。）
で表される環のいずれかである、請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項8】

$A r^1$ が下記式（b-1）～（b-4）：

【化 8】

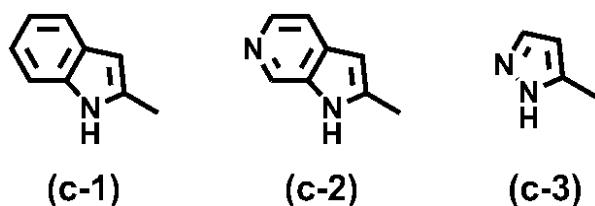


で表される基のいずれかであり、ここにおいて、該式で表される基の炭素原子はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、 C_{1-6} アルキル基および C_{1-6} アルコキシ基からなる群から選ばれる1つまたは同一もしくは異なる2つ以上の基により置換されていてもよい、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 9】

Ar^2 が下記式(c-1)~(c-3)：

【化 9】



で表される基のいずれかであり、ここにおいて、該式で表される基の炭素原子およびNHは、それぞれ請求項5に記載の置換基と同じ基により置換されていてもよい、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 10】

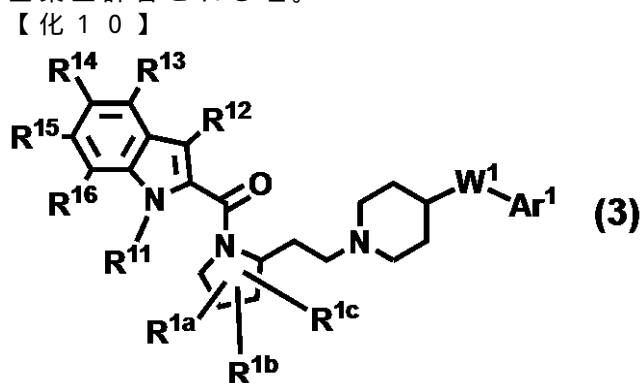
環Qが、請求項7に記載の式(a-3)で表される基である、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 11】

W^3 が単結合であり、VがCHである、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

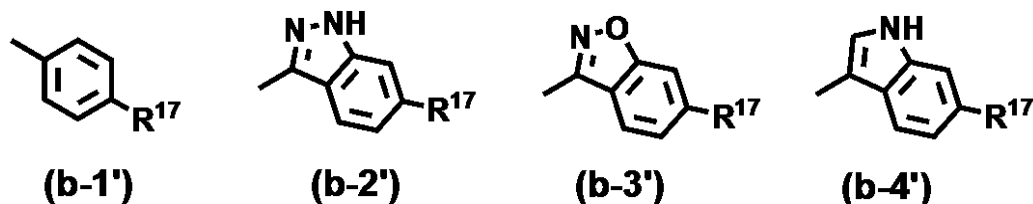
【請求項 12】

下記式(3)で表される、請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。



[式中、 Ar^1 は下記式(b-1')、式(b-2')、式(b-3')または式(b-4')]

【化 1 1】



(ここにおいて、R¹⁷は水素原子またはハロゲン原子である。)で表される基のいずれかであり；

W¹は、単結合または - C (O) - であり；

R^{1a}、R^{1b}およびR^{1c}は、請求項 6 に記載のものと同義であり；

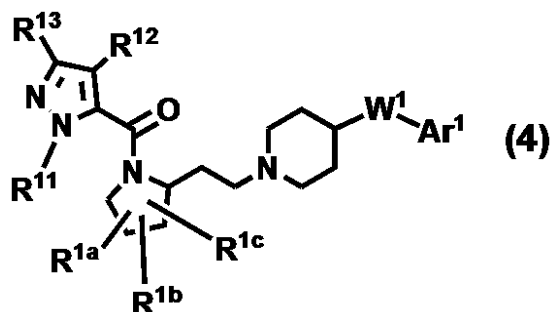
R¹¹は、請求項 5 に記載の式 (c - 1) で表される基の NH の置換基について記載のものと同義であり、

R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁵およびR¹⁶は、請求項 5 に記載の式 (c - 1) で表される基の炭素原子の置換基について記載のものと同義である。]

【請求項 1 3】

下記式 (4) で表される請求項 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【化 1 2】



[式中、Ar¹は請求項 1 2 に記載の式 (b - 1 ')、式 (b - 2 ')、式 (b - 3 ') または式 (b - 4 ') で表される基のいずれかであり；

W¹は、単結合または - C (O) - であり；

R^{1a}、R^{1b}およびR^{1c}は、請求項 6 に記載のものと同義であり；

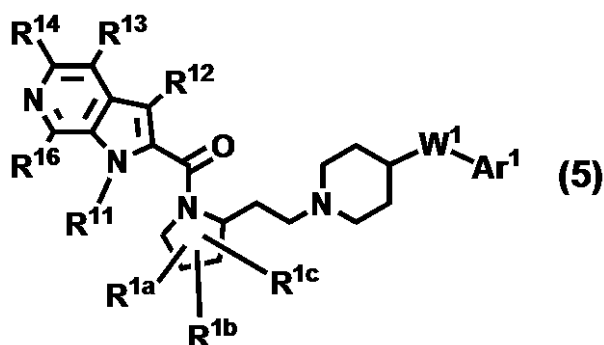
R¹¹は、請求項 5 に記載の式 (c - 3) で表される基の NH の置換基について記載のものと同義であり、

R¹²およびR¹³は、請求項 5 に記載の式 (c - 3) で表される基の炭素原子の置換基について記載のものと同義である。]

【請求項 1 4】

下記式 (5) で表される請求項 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【化 1 3】



[式中、 Ar^1 は請求項 12 に記載の式 (b - 1')、式 (b - 2')、式 (b - 3') または式 (b - 4') で表される基のいずれかであり；

W^1 は、単結合または -C(O)- であり；

R^{1a} 、 R^{1b} および R^{1c} は、請求項 6 に記載のものと同義であり；

R^{11} は、請求項 5 に記載の式 (c - 2) で表される基の NH の置換基について記載のものと同義であり、

R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、および R^{16} は、請求項 5 に記載の式 (c - 2) で表される基の炭素原子の置換基について記載のものと同義である。]

【請求項 15】

以下の群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその医薬上許容される塩：

(S)-(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(6-メチル-1H-インドール-2-イル)メタノン；

(S)-(6-フルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン；

(S)-(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(6-(トリフルオロメトキシ)-1H-インドール-2-イル)メタノン；

(S)-(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(6-イソプロピル-1H-インドール-2-イル)メタノン；

(S)-(5-フルオロ-4-メトキシ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン；

(S)-(3,6-ジフルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン；

(S)-(3-フルオロ-6-(トリフルオロメトキシ)-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン；

(S)-(3-フルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン；

((2S,5S)-2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)-5-メチルピロリジン-1-イル)(6-メチル-1H-インドール-2-イル)メタノン；

((2S,5S)-2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)-5-メチルピロリジン-1-イル)(6-(トリフルオロメチル)-1H-インドール-2-イル)メタノン；

((2S,5S)-2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)-5-メチルピロリジン-1-イル)(6-(トリフルオロメチルチオ)-1H-インドール-2-イル)メタノン；

(S)-(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(1-メチル-1H-インドール-5-イル)メタノンおよび

(S)-(2-(2-(4-(6-フルオロベンゾ[d]イソキサゾール-3-イル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(3-フェニル-1H-ピラゾール-5-イル)メタノン。

【請求項 16】

(S)-(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)(6-メチル-1H-インドール-2-イル)メタノンである化合物。

【請求項 17】

(S)-(6-フルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノンである化合物。

【請求項 18】

(S)-(5-フルオロ-4-メトキシ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノンである化合物。

【請求項 19】

(S)-(3,6-ジフルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノンである化合物。

【請求項 20】

(S)-(3-フルオロ-6-(トリフルオロメトキシ)-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノンである化合物。

【請求項 21】

(S)-(3-フルオロ-1H-インドール-2-イル)(2-(2-(4-(4-フルオロベンゾイル)ピペリジン-1-イル)エチル)ピロリジン-1-イル)メタノン 塩酸塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

【非特許文献1】S. Leucht et al. 著、The Lancet、2009年、373号、p31-41.

【非特許文献2】O. Agid et al. 著、Expert Opinion on Emerging Drugs、2008年、13(3)号、p479-495.

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0100

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0100】

「置換されていてもよいアミノ基」としては、例えば、アミノ、モノ-もしくはジ-置換されたアミノ、4員～7員の環状アミノが挙げられる。

「モノ-もしくはジ-置換されたアミノ」の置換基としては、例えば、置換されていてもよい C_{1-6} アルキル、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル、置換されていてもよい C_{3-7} シクロアルキル C_{1-4} アルキル、置換されていてもよい飽和複素環、置換されていてもよい C_{6-10} アリール、置換されていてもよいヘテロアリールからなる群から選択される同種または異種の1又は2個の基が挙げられる。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0143

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0143】

「 C_{6-10} アリールスルホニルアミノ基」の「 C_{6-10} アリール」部分は、前記「 C_{6-10} アリール基」と同一である。好ましくは、炭素数6のアリールスルホニルアミノ基である。具体例としては、ベンゼンスルホニルアミノが挙げられる。