

【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30年12月6日(2018.12.6)

【公表番号】特表2017-525697(P2017-525697A)

【公表日】平成29年9月7日(2017.9.7)

【年通号数】公開・登録公報2017-034

【出願番号】特願2017-507903(P2017-507903)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 215/22	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/4704	(2006.01)
A 61 K 31/498	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
A 61 P 31/06	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12	
C 07 D 215/22	C S P
C 07 D 401/14	
C 07 D 409/14	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/4704	
A 61 K 31/498	
A 61 K 31/497	
A 61 K 31/4725	
A 61 P 31/06	

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月29日(2018.10.29)

【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

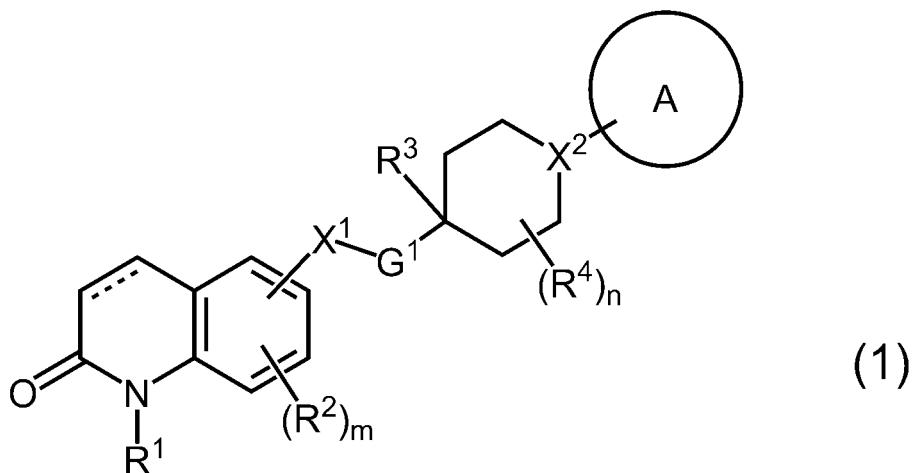
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)：

【化1】



[式中、

 $R^1$  は、

(1) 水素原子、

(2) 同一又は異なる1又は2の低級アルキル基を有していてもよいアミノ基、又は

(3) 低級アルキル基

を示し；

 $R^2$  は、

(1) ハロゲン原子、

(2) 同一又は異なる1又は2の低級アルキル基を有していてもよいアミノ基、

(3) 低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、又は

(5) ヒドロキシ基

を示し；

 $m$  は、0から3の整数を示し； $m$  が2又は3の場合、 $R^2$  はそれぞれ異なっていてもよく； $X^1$  は、 $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-N(R^5)-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$  又は  $-SO_2-$  を示し； $R^5$  は、

(1) 水素原子、

(2) 低級アルキル基、又は

(3) 低級アルカノイル基

を示し；

 $G^1$  は、低級アルキレン基を示し； $R^3$  は、

(1) 水素原子、

(2) カルボキシ基、

(3) ハロゲン原子、

(4) 1以上のヒドロキシ基を有していてもよい低級アルキル基、

(5) シアノ基、

(6) (a) 低級アルキル基、及び

(b)  $-C(=O)-R^6$ 

から独立して選ばれる1又は2の基を有していてもよいアミノ基、又は

(7)  $-O-R^7$ 

を示し；

 $R^6$  は、

(1) 低級アルコキシ基、又は

(2) 同一又は異なる1又は2の低級アルキル基を有していてもよいアミノ基を有していてもよい低級アルキル基を示し；

$R^7$  は、

(1) 水素原子、

(2) アミノ基、

(3) 低級アルカノイル基、又は

(4) 低級アルキル基

を示し；

$R^4$  は、

(1) 同一又は異なる1又は2の低級アルキル基を有していてもよいアミノ基、

(2) ハロゲン原子、

(3) シアノ基、

(4) 低級アルキル基、

(5) オキソ基、

(6)  $-O-R^8$ 、又は

(7)  $-O-C(=O)-R^9$

を示し；

$R^8$  は、

(1) 水素原子、

(2) 低級アルキル基、

(3)  $-PH(=O)OH$ 、又は

(4) 同一又は異なる1以上の低級アルコキシ基を有していてもよいベンジル基を示し；

$R^9$  は、

(1) 低級アルキル基、

(2)  $-G^2-COOH$ 、

(3) 同一又は異なる1又は2の低級アルキル基を有していてもよいアミノ基、

(4) 低級アルコキシ基、又は

(5) ピラジニル基

を示し；

$G^2$  は、低級アルキレン基を示し；

$n$  は、0から8の整数を示し；

$n$  が2以上の場合、 $R^4$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  及び  $G^2$  はそれぞれ互いに異なっていてもよく、同一の炭素原子上に置換してもよく；

$X^2$  は、N又はCHを示し；

$X^2$  がCHの場合、そのHは $R^4$ で置換されていてもよく、該 $R^4$ は前記定義のとおりであるか又は他の $R^4$ と異なっていてもよく；

環Aは、

(1) 1以上の置換基を有していてもよいアリール基、又は

(2) 1以上の置換基を有していてもよい複素環基

を示し；

式：

【化2】

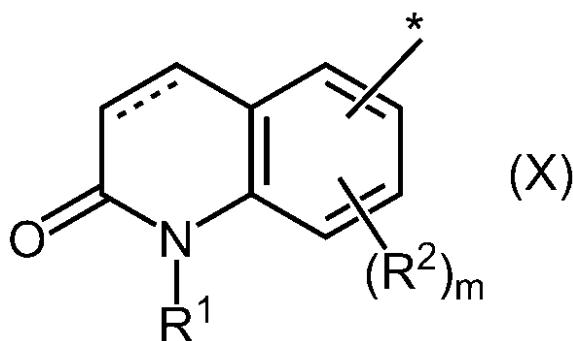
で表される部分は、単結合又は二重結合を示す。】

で表される化合物又はその塩。

【請求項2】

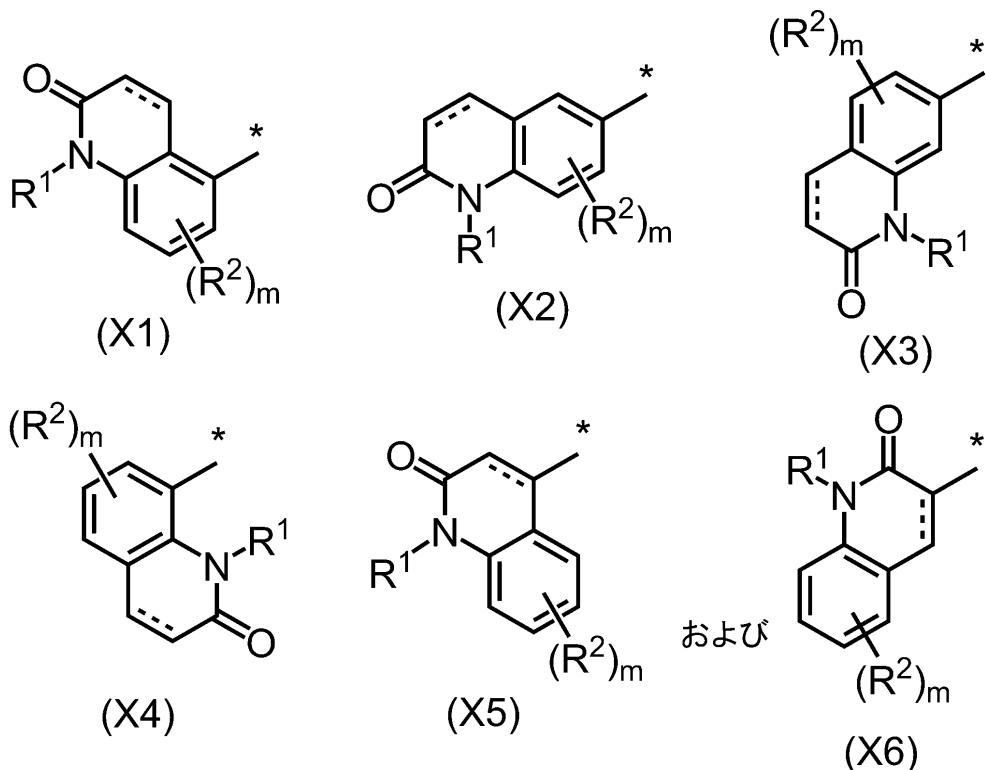
部分構造 (X) :

【化3】



[式中、\*はX<sup>1</sup>への結合点であり、他の記号は請求項1に記載のとおりである]  
が以下の式(X1)～(X6)：

【化4】

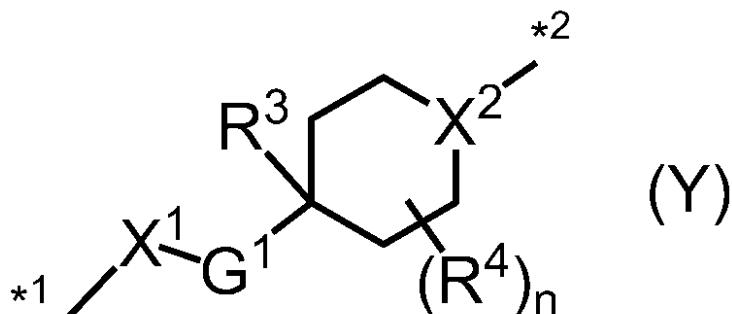


[式中、記号は請求項1に記載のとおりである]  
からなる群から選ばれる構造のいずれかである、請求項1記載の化合物又はその塩。

【請求項3】

部分構造 (Y) :

【化5】

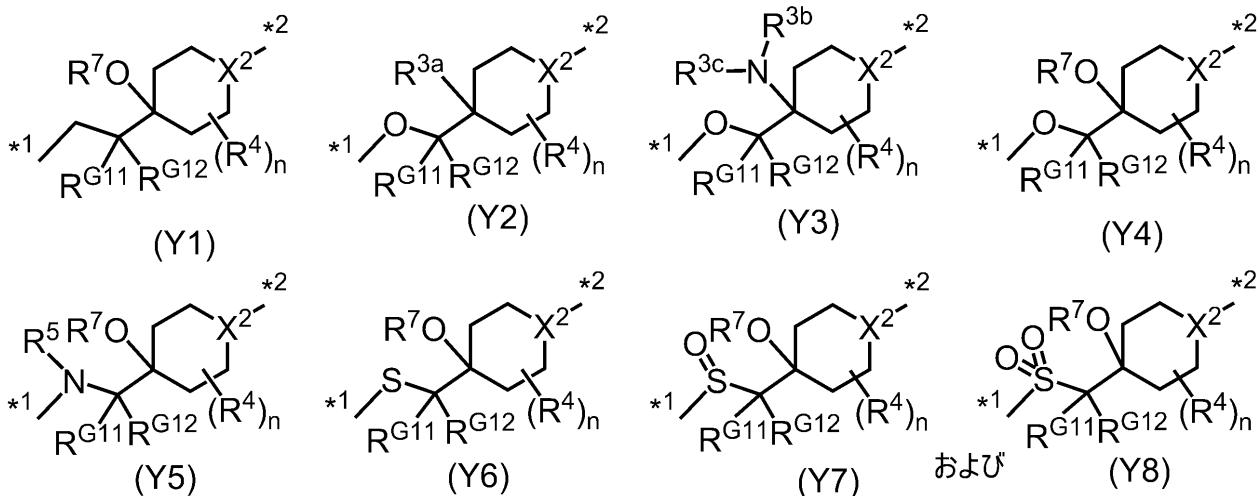


[式中、\*1は式(X)の部分構造への結合点であり、\*2は環Aへの結合点であり、他

の記号は請求項 1 に記載のとおりである]

が以下の式(Y1)~(Y8)：

【化 6】



[式中、 $R^3$  は (1) 水素原子、(2) カルボキシ、(3) ハロゲン原子、(4) 1 以上のヒドロキシを有していてもよい低級アルキル又は (5) シアノであり；

$R^3b$  および  $R^3c$  はそれぞれ独立して (1) 水素原子、(2) 低級アルキル又は(3)  $-C(=O)-R^6$  であり；

R<sup>G</sup><sub>1</sub> および R<sup>G</sup><sub>1</sub> 2 はそれぞれ独立して水素原子または低級アルキルであり；

$R^{G-1-1}$  および  $R^{G-1-2}$  における炭素原子の総数は 0 ~ 5 であり；

他の記号は請求項 1 に記載のとおりである 1

#### 【請求項4】

環 A が：

- ( a ) ハロゲン原子；
  - ( b ) シアノ；
  - ( c ) ニトロ；
  - ( d ) ヒドロキシ；
  - ( e ) ( i ) ハロゲン原子、  
( i i ) ヒドロキシ、  
( i i i ) 低級アルコキシ、及び  
( i v ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよいアリールオキシから独立して選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい低級アルキル；
  - ( f ) ( i ) ハロゲン原子、  
( i i ) 同一又は異なる 1 以上の低級アルコキシを有していてもよい低級アルコキシ、  
( i i i ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよいアリールオキシ、  
( i v ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい同一又は異なる 1 以上の低級アルキルを有していてもよい複素環基、及び  
( v ) 同一又は異なる 1 又は 2 の低級アルキルを有していてもよいアミノから独立して選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい低級アルコキシ；
  - ( g ) 低級アルコキシカルボニル；
  - ( h ) 低級アルキルスルファニル；
  - ( i ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよいアリール；
  - ( j ) アリールオキシ；及び

( k ) ( i ) ハロゲン原子、

( i i ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい低級アルキル、及び

( i i i ) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい低級アルコキシ

から独立して選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよいアラルキルオキシ  
から独立して選ばれる 1 ~ 5 の置換基を有していてもよい、アリール又は複素環基である  
、請求項 1 ~ 3 のいずれか記載の化合物又はその塩。

【請求項 5】

R<sup>1</sup> が水素原子である、請求項 1 ~ 4 のいずれか記載の化合物又はその塩。

【請求項 6】

R<sup>2</sup> がハロゲン原子である、請求項 1 ~ 5 のいずれか記載の化合物又はその塩。

【請求項 7】

m が 0、1 又は 2 である、請求項 1 ~ 6 のいずれか記載の化合物又はその塩。

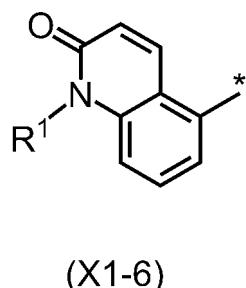
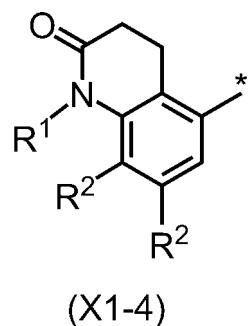
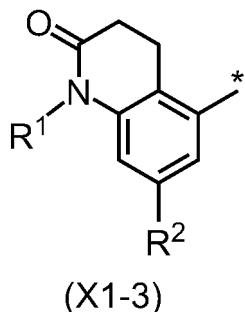
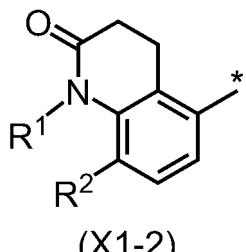
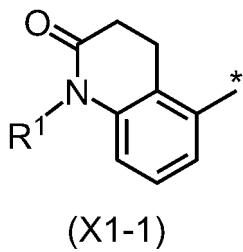
【請求項 8】

n が 0、1 又は 2 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか記載の化合物又はその塩。

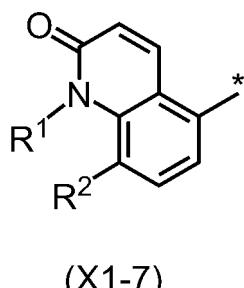
【請求項 9】

部分構造 ( X ) が式 ( X 1 - 1 )、( X 1 - 2 )、( X 1 - 3 )、( X 1 - 4 )、( X 1 - 6 ) 及び ( X 1 - 7 ) :

【化 7】



および



[ 式中、\* は X<sup>1</sup> への結合点であり ;

R<sup>1</sup> は水素原子であり ;

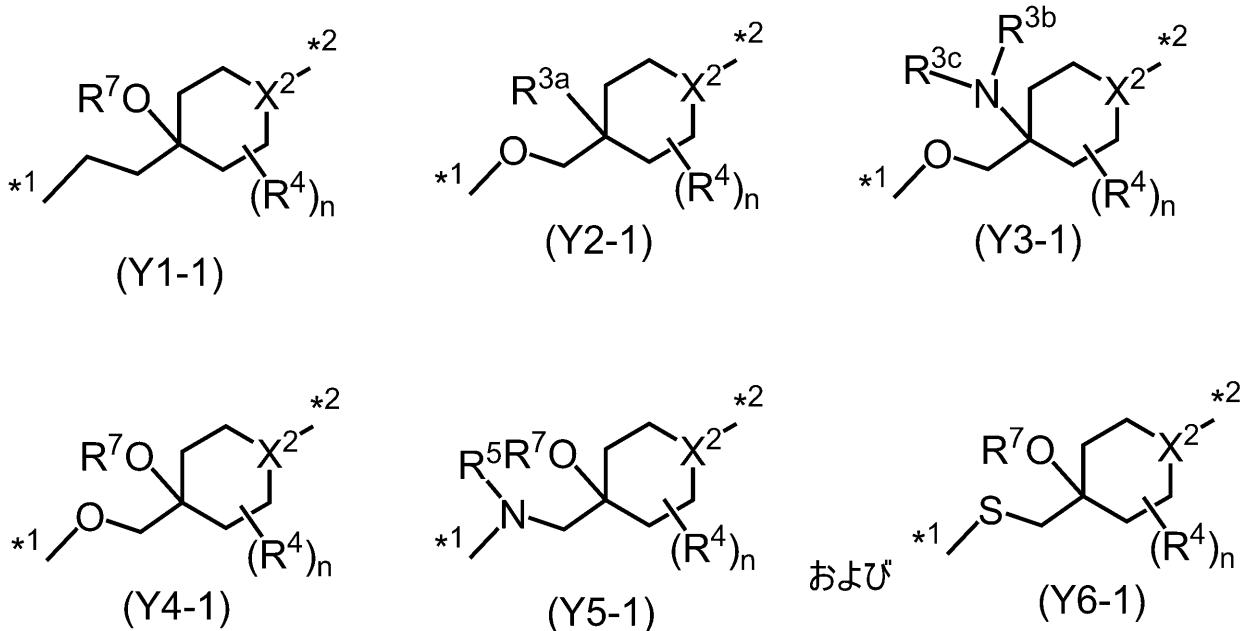
R<sup>2</sup> は ( 1 ) ハロゲン原子又は ( 2 ) 低級アルキルから選択される置換基であり ;

但し、R<sup>2</sup> が複数であってもよい場合、それぞれ互いに異なっていてもよい ]

からなる群から選ばれる式の構造であり、

部分構造 ( Y ) が式 ( Y 1 - 1 )、( Y 2 - 1 )、( Y 3 - 1 )、( Y 4 - 1 )、( Y 5 - 1 ) 及び ( Y 6 - 1 ) :

## 【化 8】



[ 式中、\*1 は式 (X) の部分構造への結合点であり；

\*2 は環 A への結合点であり；

R<sup>5</sup> は水素原子であり；

R<sup>3</sup><sup>a</sup> は(1)水素原子又は(2)ハロゲン原子であり；

R<sup>3</sup><sup>b</sup> および R<sup>3</sup><sup>c</sup> はそれぞれ水素原子であり；

R<sup>7</sup> は水素原子であり；

R<sup>4</sup> は(1)ハロゲン原子、(2)-O-R<sup>8</sup>、(3)-O-C(=O)-R<sup>9</sup> 又は(4)シアノから選択される置換基であり；

R<sup>8</sup> は(1)水素原子又は(2)低級アルキルであり；

R<sup>9</sup> は(1)低級アルキル又は(2)低級アルコキシであり；

n は 0 ~ 2 の整数であり；

n が 2 である場合、R<sup>4</sup>、R<sup>8</sup> 及び R<sup>9</sup> はそれぞれ互いに異なっていてもよく、同一の炭素原子上に置換してもよく；

X<sup>2</sup> は N 又は C H であり；

但し、X<sup>2</sup> が C H の場合、その H は R<sup>4</sup> で置換されてもよく、該 R<sup>4</sup> は前記定義のとおりであるか又は他の R<sup>4</sup> と異なっていてもよく；

環 A は：

(a) ハロゲン原子；

(b) (i) 1 以上のハロゲン原子及び (ii) 1 以上の低級アルコキシを有していてもよい、低級アルコキシ；又は

(c) 同一又は異なる 1 以上のハロゲン原子を有していてもよい同一又は異なる 1 以上の低級アルコキシを有していてもよいアラルキルオキシ

から独立して選ばれる 1 ~ 3 の置換基を有していてもよい、フェニルもしくはピリジル；又は

1 ~ 2 のハロゲン原子を有していてもよいキノリルである]

からなる群から選ばれる式の構造である、請求項 1 記載の化合物又はその塩。

## 【請求項 10】

以下の化合物：

5-{{[4-アミノ-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[4-アミノ-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-クロロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[4-アミノ-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-クロロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-クロロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-エトキシ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-5-{{[1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-ブロモ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-7,8-ジフルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}キノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-5-{{[1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-フルオロ-5-{{[1-(2-フルオロ-4-{{[4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ}フェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-5-{{[1-[4-クロロ-2-フルオロ-5-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-7-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(2,4-ジクロロ-5-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-7-フルオロ-8-メチル-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-7-フルオロ-5-{{[4-ヒドロキシ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4R)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3S,4S)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4R)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3S,4S)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4R)-1-(3-ブロモ-6-クロロキノリン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4R)-1-(4-ブロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3S,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R,4S)-1-(4-ブロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-クロロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3R\*,4R\*)-1-(4-ブロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メチル}アミノ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-フルオロピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(3R\*,4R\*)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(3R,4S)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(3S,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(3S,4S)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシピペリジン-3-イルエチルカーボネート、

(3R,4R)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシピペリジン-3-イルアセテート、

5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メチル}スルファニル}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{2-[1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]エチル}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[trans-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,4-ジヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[cis-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-ヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(1R\*,2R\*,4R\*)-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[(1R,2R,4S)-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,2,4-トリヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

trans-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシシクロヘキサンカルボニトリル、及び

5-{{[trans-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-ヒドロキシ-4-メトキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン

からなる群から選ばれる、請求項1記載の化合物又はその塩。

### 【請求項11】

以下の化合物：

5-{{[4-アミノ-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[4-アミノ-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-クロロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[4-アミノ-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-クロロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[1-(4-クロロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

5-{{[1-(4-エトキシ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、

8-クロロ-5-{{[1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル

]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{1-(4-プロモ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-7,  
8-ジフルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}キ  
ノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-5-{{1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メ  
トキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-フルオロ-5-{{1-(2-フルオロ-4-{{4-(トリフルオロメトキシ)ベンジル]オキシ}フェ  
ニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-5-{{1-[4-クロロ-2-フルオロ-5-(2-メトキシエトキシ)フェニル]-4-ヒドロキ  
シピペリジン-4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-7-  
フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{1-(2,4-ジクロロ-5-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ  
}-7-フルオロ-8-メチル-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
8-クロロ-7-フルオロ-5-{{4-ヒドロキシ-1-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピペリジン-  
4-イル]メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3S,4S)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-  
イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3S,4S)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(3-プロモ-6-クロロキノリン-2-イル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-  
イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(4-プロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3S,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-  
イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4S)-1-(4-プロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-クロロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R\*,4R\*)-1-(4-プロモ-2-フルオロフェニル)-3,4-ジヒドロキシピペリジン-4-  
イル]メトキシ}-8-フルオロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メチル}アミ  
ノ)-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)ピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-  
ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-4-フルオロピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フ  
ルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R\*,4R\*)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-3-ヒドロキシピペリジン-4-イル]  
メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4S)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリ  
ジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3S,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリ  
ジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリ

ジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(3S,4S)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-3-フルオロ-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
(3R,4R)-1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシピペリジン-3-イルエチルカーボネート、  
(3R,4R)-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシピペリジン-3-イルアセテート、  
5-{{[1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]メチル}スルファニル}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{2-[1-(4-クロロ-2,6-ジフルオロフェニル)-4-ヒドロキシピペリジン-4-イル]エチル}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[trans-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,4-ジヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[cis-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-ヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(1R\*,2R\*,4R\*)-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
5-{{[(1R,2R,4S)-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1,2,4-トリヒドロキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン、  
trans-1-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-4-{{[(8-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-5-イル)オキシ]メチル}-4-ヒドロキシシクロヘキサンカルボニトリル、  
及び  
5-{{[trans-4-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-1-ヒドロキシ-4-メトキシシクロヘキシル]メトキシ}-8-フルオロ-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オン  
からなる群から選ばれる、請求項1記載の化合物。